

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 特 許 公 報(B2)

(11) 特許番号

特許第4542338号
(P4542338)

(45) 発行日 平成22年9月15日(2010.9.15)

(24) 登録日 平成22年7月2日(2010.7.2)

(51) Int.Cl.		F I	
C O 7 D 231/56	(2006.01)	C O 7 D 231/56	C S P F
C O 7 D 401/12	(2006.01)	C O 7 D 401/12	
C O 7 D 403/04	(2006.01)	C O 7 D 403/04	
C O 7 D 403/12	(2006.01)	C O 7 D 403/12	
C O 7 D 405/12	(2006.01)	C O 7 D 405/12	

請求項の数 21 (全 163 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号	特願2003-532052 (P2003-532052)
(86) (22) 出願日	平成14年9月19日 (2002.9.19)
(65) 公表番号	特表2005-512967 (P2005-512967A)
(43) 公表日	平成17年5月12日 (2005.5.12)
(86) 国際出願番号	PCT/EP2002/010534
(87) 国際公開番号	W02003/028720
(87) 国際公開日	平成15年4月10日 (2003.4.10)
審査請求日	平成17年8月9日 (2005.8.9)
(31) 優先権主張番号	09/962, 162
(32) 優先日	平成13年9月26日 (2001.9.26)
(33) 優先権主張国	米国 (US)

(73) 特許権者	506305540
	ファイザー イタリア ソシエタ ア レ スポンサビリタ リミタータ イタリア ラティナ ヴィア イソソツォ 7 1
(74) 代理人	100127926
	弁理士 結田 純次
(74) 代理人	100105290
	弁理士 三輪 昭次
(74) 代理人	100140132
	弁理士 竹林 則幸
(74) 代理人	100091731
	弁理士 高木 千嘉
(74) 代理人	100096666
	弁理士 室伏 良信

最終頁に続く

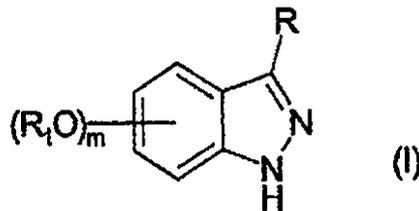
(54) 【発明の名称】 キナーゼ阻害因子として活性なアミノインダゾール誘導体、それらの製造方法及びそれらを含むする医薬組成物

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I) :

【化 1】



[式中、

R は、- N H C O R ' 又は - N H C O N H R ' [式中、R ' は、

直鎖又は分枝鎖 C₁ - C₆アルキル (ここで、前記アルキルは、場合によって、= O、アルキル、フェニルカルボニルアミノ、場合によってフェニルにより置換されたアルコキシ、場合によってアルキルにより置換されたフェノキシ及びフェニルからなる群より選択される基により置換されることができ)、

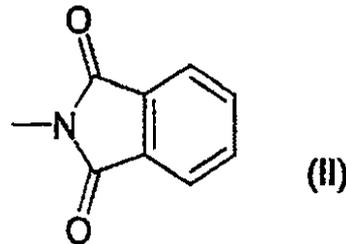
C₃ - C₆シクロアルキル又はシクロアルキル C₁ - C₆アルキル、

アリール又はアリール C₁ - C₆アルキル (ここで、前記アリールは、フェニル、1, 2 - メチレンジオキシフェニル、 - 又は - ナフチル、フリル、チエニル、オキサゾリ

ル、イソキサゾリル、キノリニル及びイソキノリニルからなる群から選択され、前記アリアルは、場合によって、ハロゲン、アルキル、過フッ化アルキル、アルキルカルボニル、アルコキシカルボニル、ジアルキルアミノ、場合によってハロゲンにより置換されたアルコキシ、フェニル、アルキルチオ及びアルキルカルボニルアミノからなる群より選択される基により置換されることができ、そして前記アルキルは、場合によって、アルキルフェニルスルホニルアミノにより置換されることができ、

ヘテロシクリル又はヘテロシクリル $C_1 - C_6$ アルキル（ここで、前記ヘテロシクリルは、ピロリジン及びピペリジンからなる群より選択され、アルキルカルボニルにより置換されているものとする）から選択される]から成る群より選択されるか；若しくはRは、下記の式(II)：

【化2】



のフタルイミド基であり、

R_1 は、インダゾール環の5又は6位に位置し、

直鎖又は分枝鎖 $C_1 - C_6$ アルキル（ここで、前記アルキルは、場合によって、ハロゲン、アルキル、フェニル、フェニルにより置換されたアミノカルボニル、アルコキシカルボニル、フェニルカルボニル（前記フェニルは、ハロゲン、アルコキシ、過フッ化アルキル又はピロリジンにより置換されているものとする）、アルキルカルボニル、ジアルキルアミノ、フェニルにより置換されたアルコキシ及びアルキルカルボニルアミノにより置換されたフェノキシからなる群より選択される基により置換されることができ、

$C_2 - C_6$ アルケニル又はアルキニル（ここで、前記アルケニルは、場合によって、フェニルにより置換されることができ、

$C_3 - C_6$ シクロアルキル又はシクロアルキル $C_1 - C_6$ アルキル、

アリアル又はアリアル $C_1 - C_6$ アルキル（ここで、前記アリアルは、フェニル、9,10-ジヒドロアントラセニル、オキサゾリル、イソキサゾリル、ベンゾチエニル、チエニル、チアゾリル及びイソチアゾリルからなる群より選択され、前記アリアルは、場合によって、=O、ハロゲン、シアノ、ニトロ、過フッ化アルキル、アルキル及び場合によってハロゲンにより置換されていてもよいアルコキシからなる群より選択される基により置換されることができ、そして前記アルキルは、場合によって、アルコキシカルボニル及びフェニルカルボニルからなる群より選択される基により置換されることができ、

ヘテロシクリル又はヘテロシクリル $C_1 - C_6$ アルキル（ここで、前記ヘテロシクリルは、ピロリジン、ピペリジン及びテトラヒドロフランからなる群から選択され、場合によって、=O、フェニル及びアルキルからなる群より選択される基により置換されることができ、

mは1である]

によって表わされる、アミノインダゾール誘導体又は医薬適合性のその塩。

【請求項2】

式中、Rが-NHCOR'基であり、R'、 R_1 及びmが請求項1で定義したとおりである、請求項1に記載の式(I)の化合物。

【請求項3】

式中、 R_1 が、 $C_1 - C_6$ アルキル（ここで、前記アルキルは、場合によって、ハロゲン、アルキル、フェニル、フェニルにより置換されたアミノカルボニル、アルコキシカルボニル、フェニルカルボニル（前記フェニルは、ハロゲン、アルコキシ、過フッ化アルキル

10

20

30

40

50

又はピロリジンにより置換されているものとする)、アルキルカルボニル、ジアルキルアミノ、フェニルにより置換されたアルコキシ及びアルキルカルボニルアミノにより置換されたフェノキシからなる群より選択される基により置換されることができ、

$C_3 - C_6$ シクロアルキル又はシクロアルキル $C_1 - C_6$ アルキル、

アリール又はアリール $C_1 - C_6$ アルキル(ここで、前記アリールは、フェニル、9, 10 - ジヒドロアントラセニル、オキサゾリル、イソキサゾリル、ベンゾチエニル、チエニル、チアゾリル及びイソチアゾリルからなる群より選択され、前記アリールは、場合によって、=O、ハロゲン、シアノ、ニトロ、過フッ化アルキル、アルキル及び場合によってハロゲンにより置換されていてもよいアルコキシからなる群より選択される基により置換されることができ、そして前記アルキルは、場合によって、アルコキシカルボニル及びフェニルカルボニルからなる群より選択される基により置換されることができ、

10

ヘテロシクリル又はヘテロシクリル $C_1 - C_6$ アルキル(ここで、前記ヘテロシクリルは、ピロリジン、ピペリジン及びテトラヒドロフランからなる群から選択され、場合によって、=O、フェニル及びアルキルからなる群より選択される基により置換されることができ)から選択され、

R' が、 $C_1 - C_6$ アルキル(ここで、前記アルキルは、場合によって、=O、アルキル、フェニルカルボニルアミノ、場合によってフェニルにより置換されたアルコキシ、場合によってアルキルにより置換されたフェノキシ及びフェニルからなる群より選択される基により置換されることができ)、

$C_3 - C_6$ シクロアルキル又はシクロアルキル $C_1 - C_6$ アルキル、

20

アリール又はアリール $C_1 - C_6$ アルキル(ここで、前記アリールは、フェニル、1, 2 - メチレンジオキシフェニル、 $-$ 又は $-$ ナフチル、フリル、チエニル、オキサゾリル、イソキサゾリル、キノリニル及びイソキノリニルからなる群から選択され、前記アリールは、場合によって、ハロゲン、アルキル、過フッ化アルキル、アルキルカルボニル、アルコキシカルボニル、ジアルキルアミノ、場合によってハロゲンにより置換されたアルコキシ、フェニル、アルキルチオ及びアルキルカルボニルアミノからなる群より選択される基により置換されることができ、そして前記アルキルは、場合によって、アルキルフェニルスルホニルアミノにより置換されることができ)、

ヘテロシクリル又はヘテロシクリル $C_1 - C_6$ アルキル(ここで、前記ヘテロシクリルは、ピロリジン及びピペリジンからなる群より選択され、アルキルカルボニルにより置換されているものとする)から選択される、請求項2に記載の式(I)の化合物。

30

【請求項4】

式中、 R が $-NHCONHR'$ であり、 R' 、 R_1 及び m が請求項1で定義したとおりである、請求項1に記載の式(I)の化合物。

【請求項5】

式中、 R_1 が、 $C_1 - C_6$ アルキル(ここで、前記アルキルは、場合によって、ハロゲン、アルキル、フェニル、フェニルにより置換されたアミノカルボニル、アルコキシカルボニル、フェニルカルボニル(前記フェニルは、ハロゲン、アルコキシ、過フッ化アルキル又はピロリジンにより置換されているものとする)、アルキルカルボニル、ジアルキルアミノ、フェニルにより置換されたアルコキシ及びアルキルカルボニルアミノにより置換されたフェノキシからなる群より選択される基により置換されることができ、

40

$C_3 - C_6$ シクロアルキル又はシクロアルキル $C_1 - C_6$ アルキル、

アリール又はアリール $C_1 - C_6$ アルキル(ここで、前記アリールは、フェニル、9, 10 - ジヒドロアントラセニル、オキサゾリル、イソキサゾリル、ベンゾチエニル、チエニル、チアゾリル及びイソチアゾリルからなる群より選択され、前記アリールは、場合によって、=O、ハロゲン、シアノ、ニトロ、過フッ化アルキル、アルキル及び場合によってハロゲンにより置換されていてもよいアルコキシからなる群より選択される基により置換されることができ、そして前記アルキルは、場合によって、アルコキシカルボニル及びフェニルカルボニルからなる群より選択される基により置換されることができ、

ヘテロシクリル又はヘテロシクリル $C_1 - C_6$ アルキル(ここで、前記ヘテロシクリル

50

は、ピロリジン、ピペリジン及びテトラヒドロフランからなる群から選択され、場合によって、=O、フェニル及びアルキルからなる群より選択される基により置換されることができ）から選択され、

R'が、C₁-C₆アルキル（ここで、前記アルキルは、場合によって、=O、アルキル、フェニルカルボニルアミノ、場合によってフェニルにより置換されたアルコキシ、場合によってアルキルにより置換されたフェノキシ及びフェニルからなる群より選択される基により置換されることができ）、

C₃-C₆シクロアルキル又はシクロアルキルC₁-C₆アルキル、

アリール又はアリールC₁-C₆アルキル（ここで、前記アリールは、フェニル、1, 2-メチレンジオキシフェニル、
-又は-ナフチル、フリル、チエニル、オキサゾリル、イソキサゾリル、キノリニル及びイソキノリニルからなる群から選択され、前記アリールは、場合によって、ハロゲン、アルキル、過フッ化アルキル、アルキルカルボニル、アルコキシカルボニル、ジアルキルアミノ、場合によってハロゲンにより置換されたアルコキシ、フェニル、アルキルチオ及びアルキルカルボニルアミノからなる群より選択される基により置換されることができ、そして前記アルキルは、場合によって、アルキルフェニルスルホニルアミノにより置換されることができ）、

ヘテロシクリル又はヘテロシクリルC₁-C₆アルキル（ここで、前記ヘテロシクリルは、ピロリジン及びピペリジンからなる群より選択され、アルキルカルボニルにより置換されているものとする）から選択される、請求項4に記載の式(I)の化合物。

【請求項6】

式中、Rが式(II)のフタルイミド基であり、R₁及びmが請求項1で定義したとおりである、請求項1に記載の式(I)の化合物。

【請求項7】

式中、R₁が、

C₂-C₆アルケニル（ここで、前記アルケニルは、場合によって、フェニルにより置換されることができ）

C₃-C₆アルキニル、

アリール又はアリールC₁-C₆アルキル（ここで、前記アリールは、フェニル、9, 10-ジヒドロアントラセニル、オキサゾリル、イソキサゾリル、ベンゾチエニル、チエニル、チアゾリル及びイソチアゾリルからなる群より選択され、前記アリールは、場合によって、=O、ハロゲン、シアノ、ニトロ、過フッ化アルキル、アルキル及び場合によってハロゲンにより置換されていてもよいアルコキシからなる群より選択される基により置換されることができ、そして前記アルキルは、場合によって、アルコキシカルボニル及びフェニルカルボニルからなる群より選択される基により置換されることができ）、

ヘテロシクリル又はヘテロシクリルC₁-C₆アルキル（ここで、前記ヘテロシクリルは、ピロリジン、ピペリジン及びテトラヒドロフランからなる群から選択され、場合によって、=O、フェニル及びアルキルからなる群より選択される基により置換されることができ）から選択される請求項6に記載の式(I)の化合物。

【請求項8】

1)メチル2-({ 3-[アニリノカルボニル]アミノ } - 1H-インダゾール-5-イル)オキシ)ブタノエート;

2)N-ベンジル-N'-[5-(2-ピロリジン-1-イルエトキシ)-1H-インダゾール-3-イル]尿素;

3)メチル2-[(3-{[(ベンジルアミノ)カルボニル]アミノ}-1H-インダゾール-5-イル)オキシ]ブタノエート;

4)N-イソプロピル-N'-{5-[(2-オキソ-1-フェニルピロリジン-3-イル)オキシ]-1H-インダゾール-3-イル}尿素;

5)2-[(3-{[(イソプロピルアミノ)カルボニル]アミノ}-1H-インダゾール-5-イル)オキシ]-N-フェニルプロパンアミド;

6)メチル2-[(3-{[(イソプロピルアミノ)カルボニル]アミノ}-1H-イ

10

20

30

40

50

ンダゾール - 5 - イル) オキシ] ブタノエート ;

7) N - イソプロピル - N' - { 5 - [2 - (4 - メチル - 1 , 3 - チアゾール - 5 - イル) エトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素 ;

8) N - [5 - (ブト - 3 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - イソプロピル尿素 ;

9) メチル 2 - ({ 3 - [(3 - フェニルプロパノイル) アミノ] - 1 H - インダゾール - 5 - イル } オキシ) ブタノエート ;

10) N - { 5 - [(2 - オキソ - 1 - フェニルピロリジン - 3 - イル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } シクロプロパンカルボキサミド ;

11) メチル 2 - ({ 3 - [(シクロプロピルカルボニル) アミノ] - 1 H - インダゾール - 5 - イル } オキシ) ブタノエート ; 10

12) 2 - (4 - tert - ブチルフェノキシ) - N - [5 - (2 - ピロリジン - 1 - イル) エトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル] アセトアミド ;

13) 2 - (4 - メトキシフェニル) - N - [5 - (2 - ピロリジン - 1 - イル) エトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル] アセトアミド ;

14) メチル 2 - [(3 - { [(4 - メトキシフェニル) アセチル] アミノ } - 1 H - インダゾール - 5 - イル) オキシ] ブタノエート ;

15) N - イソプロピル - N' - { 6 - [(2 - オキソ - 1 - フェニルピロリジン - 3 - イル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素 ;

16) N - { 6 - [(2 - メチルベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } シクロプロパンカルボキサミド ; 20

17) N - { 6 - [(2 - オキソ - 1 - フェニルピロリジン - 3 - イル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } シクロプロパンカルボキサミド ;

18) メチル 2 - ({ 3 - [(シクロプロピルカルボニル) アミノ] - 1 H - インダゾール - 6 - イル } オキシ) ブタノエート ;

19) メチル 2 - ({ 3 - [(3 - クロロベンジル) アミノ] - 1 H - インダゾール - 6 - イル } オキシ) ブタノエート ;

20) N - ベンジル - N' - (5 - ヒドロキシ - 2 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素 ;

21) N - (5 - ヒドロキシ - 2 H - インダゾール - 3 - イル) - N' - イソプロピル尿素 ; 30

22) 2 - (4 - tert - ブチルフェノキシ) - N - (5 - ヒドロキシ - 2 H - インダゾール - 3 - イル) アセトアミド ;

23) N - (5 - ヒドロキシ - 2 H - インダゾール - 3 - イル) - 2 - (4 - メトキシフェニル) アセトアミド ;

24) N - (6 - ヒドロキシ - 2 H - インダゾール - 3 - イル) - N' - フェニル尿素 ;

25) N - (6 - ヒドロキシ - 2 H - インダゾール - 3 - イル) - 3 - フェニルプロパンアミド ;

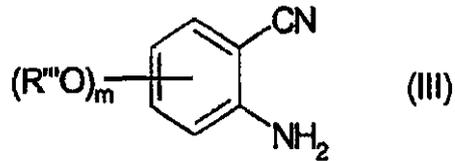
26) N - (6 - ヒドロキシ - 2 H - インダゾール - 3 - イル) シクロプロパンカルボキサミド 40

から成る群より選択される、場合により医薬適合性の塩の形態の化合物。

【請求項 9】

a) 式 (III) :

【化3】

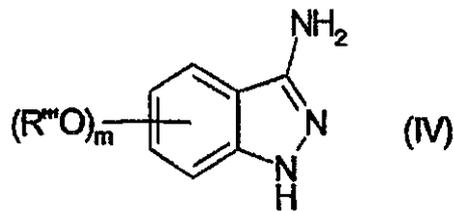


[式中、mは請求項1で定義したとおりであり、存在する場合R'''はメチル又はベンジル基である]

の2-アミノベンゾニトリル誘導体を、酸性条件下で、塩化第一スズの存在下に亜硝酸ナトリウムと反応させて、式(IV)：

10

【化4】

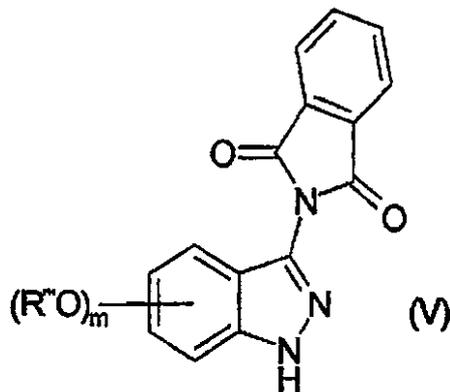


の化合物を得ること、

20

b) 式(IV)の化合物を無水フタル酸と反応させて、式(V)：

【化5】

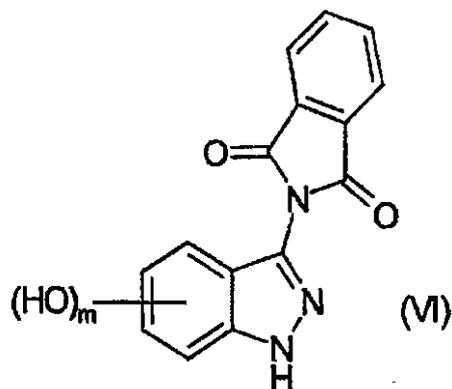


30

の化合物を得ること、

c) 式(V)の化合物を適切なエーテル開裂剤と反応させて、式(VI)：

【化6】



40

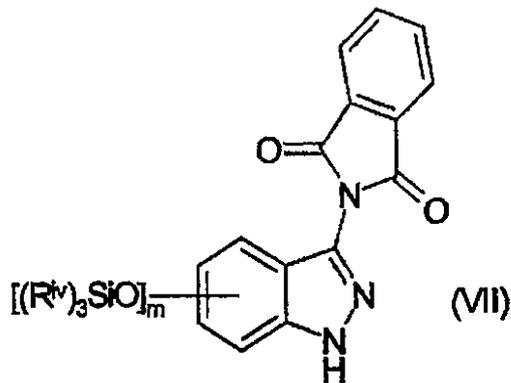
の対応するヒドロキシ誘導体を得ること、

d) 式(VI)の化合物を適切なシリル化剤(R^{iv})₃SiZ [式中、各々のR^{iv}は、同じか又は異なる、直鎖又は分枝鎖C₁-C₄アルキル基であり、Zはハロゲン原子である] と

50

反応させて、式 (VII) :

【化 7】

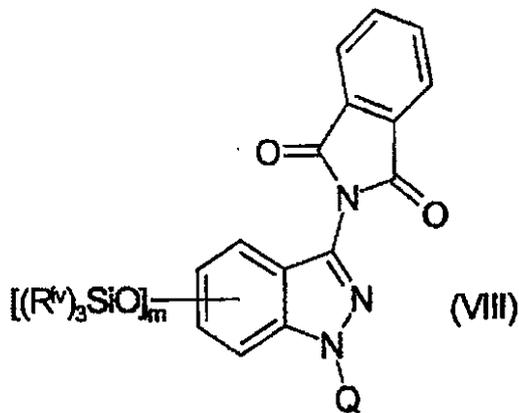


10

の化合物を得ること、

e) 式 (VII) の化合物を適切なインダゾール窒素保護剤と反応させるか、あるいは、適切なポリマー樹脂上に支持して、式 (VIII) :

【化 8】



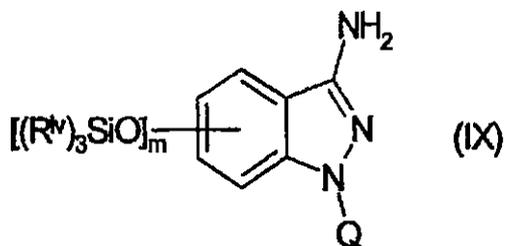
20

[式中、Q は前記保護基であるか又は支持樹脂を表わす]

の化合物を得ること、

f) 式 (VIII) の化合物をヒドラジン-水和物と反応させて、式 (IX) :

【化 9】

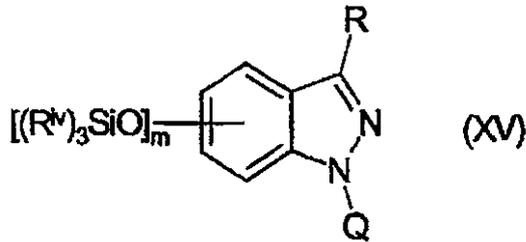


40

の化合物を得ること及び下記の段階 g . 1) に従って式 (IX) の化合物を反応させること

g . 1) 式 $R' - COZ$ (XI) 又は $R' - NCO$ (XII) [式中、 R' は請求項 1 で定義したとおりであり、 Z はハロゲン原子又は適切な脱離基を表わす] の適切な試薬と反応させて、式 (XV) :

【化10】

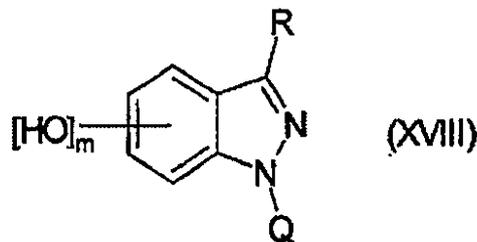


[式中、Rは、-NHCO R'又は-NHCONHR'基である]
の化合物を得ること、

10

h) 式(XV)の前記化合物のいずれかをフッ化テトラブチルアンモニウムと反応させて、式(XVIII)：

【化11】



20

の化合物を得ること、

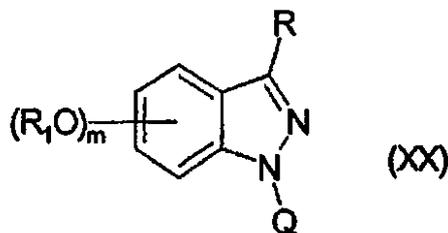
i) 式(XVIII)の化合物を、式：



[式中、R₁は請求項1で定義したとおりであり、Zはハロゲン原子、適切な脱離基又はヒドロキシである]

の誘導体と反応させて、式(XX)：

【化12】



30

の化合物を得ること、

j) 式(XX)の化合物を脱保護するか、あるいは、ポリマー樹脂を開裂して、式(I)の所望化合物を得ること、及び所望する場合はいつでも、それを式(I)のもう1つ別の化合物及び/又は医薬適合性のその塩に変換すること

を含む、請求項1で定義した式(I)の化合物及び医薬適合性のその塩[式中、Rは請求項1で定義したとおりであるが、但し式(II)のフタルイミド基以外である]を調製するための製造方法。

40

【請求項10】

式(III)の化合物が、2-アミノ-4-メトキシ-ベンゾニトリル又は2-アミノ-5-ベンジルオキシ-ベンゾニトリルである、請求項9に記載の製造方法。

【請求項11】

段階a)を塩酸の存在下で実施する、請求項9に記載の製造方法。

【請求項12】

段階d)において、シリル化剤がtert-ブチル-ジメチル-シリルクロリドである、請求項9に記載の製造方法。

【請求項13】

50

段階 e) において、式 (VII) のインダゾール誘導体をクロロ - トリチルクロリドポリマー樹脂上に支持する、請求項 9 に記載の製造方法。

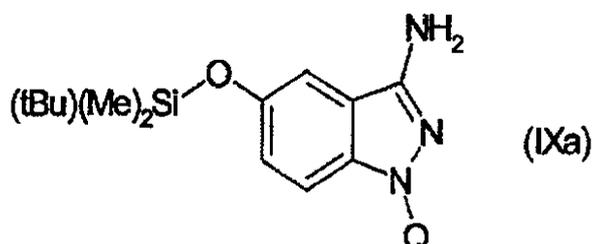
【請求項 14】

請求項 9 に記載の製造方法の段階 h)、 i) 及び j) に従って、請求項 9 で定義した式 (VIII) の化合物を反応させることを含む、請求項 1 で定義したとおりであって、式中、R が式 (II) のフタルイミド基である、式 (I) の化合物を調製するための製造方法。

【請求項 15】

最初に式 (IXa) :

【化 13】



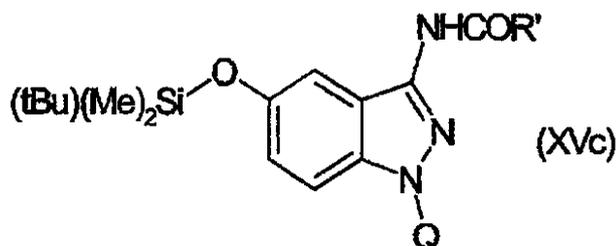
10

の化合物を、塩化ベンゾイル、1,3 - ベンゾジオキソール - 5 - カルボニルクロリド、1 - ナフトイルクロリド、2 - フロイルクロリド、4 - ジメチルアミノ - ベンゾイルクロリド、4 - (トリフルオロメチル) ベンゾイルクロリド、3,5 - ジクロロベンゾイルクロリド、ベンジルオキシアセチルクロリド、4 - tert - プチルベンゾイルクロリド、3,4 - ジメトキシベンゾイルクロリド、2 - フルオロベンゾイルクロリド、4 - (トリフルオロメトキシ) ベンゾイルクロリド、1 - アセチルイソニコトイルクロリド、2 - フェノキシプロピオニルクロリド、4 - tert - プチルフェノキシアセチルクロリド、メトキシアセチルクロリド、塩化馬尿酸、4 - プロモベンゾイルクロリド、4 - フルオロベンゾイルクロリド、4 - n - プトキシベンゾイルクロリド、3 - クロロ - 4 - フルオロベンゾイルクロリド、2 - エトキシ - 1 - ナフトイルクロリド、3 - クロロチオフエン - 2 - カルボニルクロリド、3,5 - ジメチルイソキサゾール - 4 - カルボニルクロリド、4 - エチルベンゾイルクロリド、2 - n - プロピル - n - バレロイルクロリド、3,5 - ジメトキシベンゾイルクロリド、(s) - N - トシル - フェニルアラニルクロリド、m - アニソイルクロリド、塩化シクロプロパンカルボニル、塩化フェニルアセチル、3 - クロロベンゾイルクロリド、4 - メトキシフェニルアセチルクロリド及びヒドロシナモイルクロリドからなる群より選択される式 (XI) の化合物の各々 1 つと反応させて、式 (XVc) :

20

30

【化 14】



40

の複数の化合物を入手し、次に式 (XVc) の誘導体の各々を、請求項 9 に記載の製造方法の段階 h) に従ってフッ化テトラブチルアンモニウムと反応させ、次に 2 - プロモ - 2 - フェニルアセトフェノン、臭化ベンジル、2 - メチルベンジルプロミド、 - プロモ - m - キシレン、2 - プロモ - 2',5' - ジメトキシアセトフェノン、4 - メトキシフェナシルプロミド、2 - プロモ - 4' - フェニルアセトフェノン、1 - プロモピナコロン、臭化プロパギル、1 - プロモ - 3 - メチル - 2 - プテン、臭化アリル、シナミルプロミド、2 - フルオロベンジルプロミド、2,6 - ジフルオロベンジルプロミド、2 - クロロベンジルプロミド、4 - クロロフェナシルプロミド、2 - シアノベンジルプロミド、4 - ニ

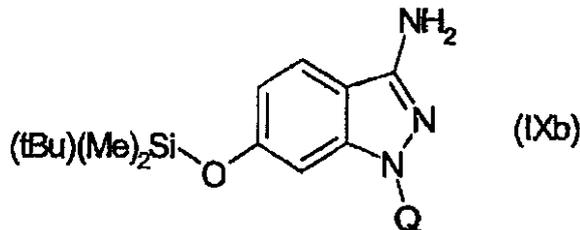
50

トロベンジルブロミド、3,5-ジフルオロベンジルブロミド、2,4-ビス(トリフルオロメチル)ベンジルブロミド、2-ブロモ-n-フェニルプロピオンアミド、メチル-ブロモフェニルアセテート、2-(トリフルオロメチル)ベンジルブロミド、3-ブロモシクロヘキセン、1-ブロモ-2-フルオロエタン、1-ブロモ-3-フルオロプロパン、3,4-ジクロロベンジルブロミド、2-(プロモメチル)アントラキノン、4-ブロモ-2-フルオロベンジルブロミド、4-フルオロ-2-(トリフルオロメチル)ベンジルブロミド、2,3,6-トリフルオロベンジルブロミド、2,4,5-トリフルオロベンジルブロミド、3-(トリフルオロメトキシ)ベンジルブロミド、4-(トリフルオロメチル)フェナシルブロミド、3-(プロモメチル)-5-クロロベンゾ[b]チオフェン、2-(ジフルオロメトキシ)ベンジルブロミド、1-ブロモ-2-ブチン、1-ブロモ-2-ペンチン、(+/-)-3-ブロモ-1-フェニル-2-ピロリジノン、-ブロモ-4-(1-ピロリジノ)アセトフェノン、ベンジル2-ブロモエチルエーテル、3,5-ジメトキシベンジルブロミド、4-(プロモメチル)-3,5-ジメチルイソキサゾール、3-メチルベンジルアルコール、シクロペンタノール、3-メトキシベンジルアルコール、メタノール、4-フルオロ-1-ブタノール、4-フェニル-2-ブタノール、3-ジメチルアミノ-1-プロパノール、(2-ヒドロキシエチル)シクロプロパン、シクロペンタンメタノール、1,2,3,6-テトラヒドロベンジルアルコール、2-(3-チエニル)エタノール、6-メチル-2-ヘプタノール、1-メチル-2-ピロリジンエタノール、2-メチル-1-プロパノール、1-(2-ヒドロキシエチル)ピロリジン、5-ベンジルオキシ-1-ペンタノール、1-ヘキサノール、4-メチル-5-チアゾールエタノール、3-ブチン-1-オール、n-(2-ヒドロキシエチル)ピペリジン、テトラヒドロフルフリルアルコール及び4'-(2-ヒドロキシエトキシ)アセトアニリドからなる群より選択される式(XIX)の誘導体の各々1つと反応させること、及びその後請求項9に記載の製造方法の段階j)に従って操作することを含む請求項1で定義した式(I)の化合物及び医薬適合性のその塩の製造方法。

【請求項16】

最初に式(IXb)：

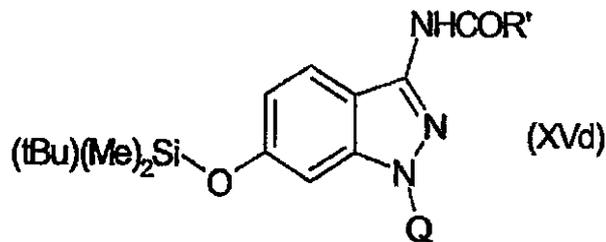
【化15】



の化合物を、塩化ベンゾイル、1,3-ベンゾジオキソール-5-カルボニルクロリド、1-ナフトイルクロリド、2-フロイルクロリド、4-ジメチルアミノ-ベンゾイルクロリド、4-(トリフルオロメチル)ベンゾイルクロリド、3,5-ジクロロベンゾイルクロリド、ベンジルオキシアセチルクロリド、4-tert-ブチルベンゾイルクロリド、3,4-ジメトキシベンゾイルクロリド、2-フルオロベンゾイルクロリド、4-(トリフルオロメトキシ)ベンゾイルクロリド、1-アセチルイソニコトイルクロリド、2-フェノキシプロピオニルクロリド、4-tert-ブチルフェノキシアセチルクロリド、メトキシアセチルクロリド、塩化馬尿酸、4-ブロモベンゾイルクロリド、4-フルオロベンゾイルクロリド、4-n-ブトキシベンゾイルクロリド、3-クロロ-4-フルオロベンゾイルクロリド、2-エトキシ-1-ナフトイルクロリド、3-クロロチオフェン-2-カルボニルクロリド、3,5-ジメチルイソキサゾール-4-カルボニルクロリド、4-エチルベンゾイルクロリド、2-n-プロピル-n-バレロイルクロリド、3,5-ジメトキシベンゾイルクロリド、(s)-N-トシル-フェニルアラニルクロリド、m-アニソイルクロリド、塩化シクロプロパンカルボニル、塩化フェニルアセチル、3-クロロベンゾイルクロリド、4-メトキシフェニルアセチルクロリド及びヒドロシナモイル

クロリドからなる群より選択される式 (XI) の化合物の各々 1 つと反応させて、式 (XV d)

【化 16】



10

の複数の化合物を入手し、次に式 (XV d) の誘導体の各々を、請求項 9 に記載の製造方法の段階 h) に従ってフッ化テトラブチルアンモニウムと反応させ、次に 2 - プロモ - 2 - フェニルアセトフェノン、臭化ベンジル、2 - メチルベンジルブロミド、 - プロモ - m - キシレン、2 - プロモ - 2', 5' - ジメトキシアセトフェノン、4 - メトキシフェナシルブロミド、2 - プロモ - 4' - フェニルアセトフェノン、1 - プロモピナコロン、臭化プロパギル、1 - プロモ - 3 - メチル - 2 - プテン、臭化アリル、シンナミルブロミド、2 - フルオロベンジルブロミド、2, 6 - ジフルオロベンジルブロミド、2 - クロロベンジルブロミド、4 - クロロフェナシルブロミド、2 - シアノベンジルブロミド、4 - ニトロベンジルブロミド、3, 5 - ジフルオロベンジルブロミド、2, 4 - ビス(トリフルオロメチル)ベンジルブロミド、2 - プロモ - n - フェニルプロピオンアミド、メチル -

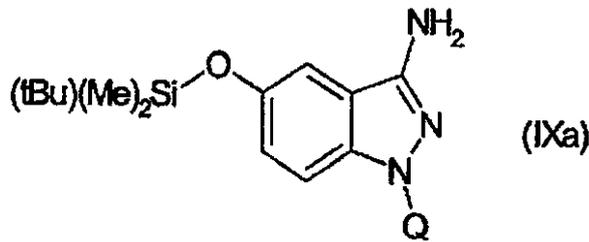
20
30
40

プロモフェニルアセテート、2 - (トリフルオロメチル)ベンジルブロミド、3 - プロモシクロヘキセン、1 - プロモ - 2 - フルオロエタン、1 - プロモ - 3 - フルオロプロパン、3, 4 - ジクロロベンジルブロミド、2 - (プロモメチル)アントラキノン、4 - プロモ - 2 - フルオロベンジルブロミド、4 - フルオロ - 2 - (トリフルオロメチル)ベンジルブロミド、2, 3, 6 - トリフルオロベンジルブロミド、2, 4, 5 - トリフルオロベンジルブロミド、3 - (トリフルオロメトキシ)ベンジルブロミド、4 - (トリフルオロメチル)フェナシルブロミド、3 - (プロモメチル) - 5 - クロロベンゾ [b] チオフェン、2 - (ジフルオロメトキシ)ベンジルブロミド、1 - プロモ - 2 - プチン、1 - プロモ - 2 - ベンチン、(+ / -) - 3 - プロモ - 1 - フェニル - 2 - ピロリジノン、 - プロモ - 4 - (1 - ピロリジノ)アセトフェノン、ベンジル 2 - プロモエチルエーテル、3, 5 - ジメトキシベンジルブロミド、4 - (プロモメチル) - 3, 5 - ジメチルイソキサゾール、3 - メチルベンジルアルコール、シクロペンタノール、3 - メトキシベンジルアルコール、メタノール、4 - フルオロ - 1 - ブタノール、4 - フェニル - 2 - ブタノール、3 - ジメチルアミノ - 1 - プロパノール、(2 - ヒドロキシエチル)シクロプロパン、シクロペンタンメタノール、1, 2, 3, 6 - テトラヒドロベンジルアルコール、2 - (3 - チエニル)エタノール、6 - メチル - 2 - ヘプタノール、1 - メチル - 2 - ピロリジンエタノール、2 - メチル - 1 - プロパノール、1 - (2 - ヒドロキシエチル)ピロリジン、5 - ベンジルオキシ - 1 - ペンタノール、1 - ヘキサノール、4 - メチル - 5 - チアゾールエタノール、3 - プチン - 1 - オール、n - (2 - ヒドロキシエチル)ピペリジン、テトラヒドロフルフリルアルコール及び 4' - (2 - ヒドロキシエトキシ)アセトアニリドからなる群より選択される式 (XIX) の誘導体の各々 1 つと反応させること、及びその後請求項 9 に記載の製造方法の段階 j) に従って操作することを含む請求項 1 で定義した式 (I) の化合物及び医薬適合性のその塩の製造方法。

【請求項 17】

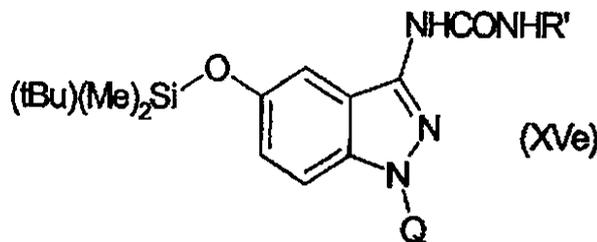
最初に式 (IX a) :

【化 17】



の化合物を、3-メトキシフェニルイソシアネート、p-トリルイソシアネート、3-クロロフェニルイソシアネート、4-ビフェニルイソシアネート、4-アセチルフェニルイソシアネート、イソシアヌ酸ベンゾイル、イソシアヌ酸イソプロピル、2,4-ジメチルフェニルイソシアネート、2-(ジフルオロメトキシ)フェニルイソシアネート、4-フルオロベンジルイソシアネート、n-ブチルイソシアネート、2,3,4-トリフルオロフェニルイソシアネート、3,5-ジメトキシフェニルイソシアネート、2-(メチルチオ)フェニルイソシアネート、3-(トリフルオロメチル)フェニルイソシアネート、2-フルオロフェニルイソシアネート、2-フェニルエチルイソシアネート、4-メトキシフェニルイソシアネート、3,4-(メチレンジオキシ)フェニルイソシアネート、3-カルボメトキシフェニルイソシアネート、イソシアヌ酸フェニル及びイソシアヌ酸ベンジルからなる群より選択される式(XII)の化合物の各々1つと反応させて、式(XVe)：

【化 18】



の複数の化合物を入手し、次に式(XVe)の誘導体の各々を、請求項9記載の製造方法の段階h)に従ってフッ化テトラブチルアンモニウムと反応させ、次に2-ブロモ-2-フェニルアセトフェノン、臭化ベンジル、2-メチルベンジルブロミド、-ブロモ-m-キシレン、2-ブロモ-2',5'-ジメトキシアセトフェノン、4-メトキシフェナシルブロミド、2-ブロモ-4'-フェニルアセトフェノン、1-ブロモピナコロン、臭化プロパギル、1-ブロモ-3-メチル-2-ブテン、臭化アリル、シンナミルブロミド、2-フルオロベンジルブロミド、2,6-ジフルオロベンジルブロミド、2-クロロベンジルブロミド、4-クロロフェナシルブロミド、2-シアノベンジルブロミド、4-ニトロベンジルブロミド、3,5-ジフルオロベンジルブロミド、2,4-ビス(トリフルオロメチル)ベンジルブロミド、2-ブロモ-n-フェニルプロピオンアミド、メチル-ブロモフェニルアセテート、2-(トリフルオロメチル)ベンジルブロミド、3-プロモシクロヘキセン、1-ブロモ-2-フルオロエタン、1-ブロモ-3-フルオロプロパン、3,4-ジクロロベンジルブロミド、2-(プロモメチル)アントラキノン、4-ブロモ-2-フルオロベンジルブロミド、4-フルオロ-2-(トリフルオロメチル)ベンジルブロミド、2,3,6-トリフルオロベンジルブロミド、2,4,5-トリフルオロベンジルブロミド、3-(トリフルオロメトキシ)ベンジルブロミド、4-(トリフルオロメチル)フェナシルブロミド、3-(プロモメチル)-5-クロロベンゾ[b]チオフェン、2-(ジフルオロメトキシ)ベンジルブロミド、1-ブロモ-2-ブチン、1-ブロモ-2-ペンチン、(+/-)-3-ブロモ-1-フェニル-2-ピロリジノン、-ブロモ-4-(1-ピロリジノ)アセトフェノン、ベンジル2-ブロモエチルエーテル、3,5-ジメトキシベンジルブロミド、4-(プロモメチル)-3,5-ジメチルイソキサゾール、3-メチルベンジルアルコール、シクロペンタノール、3-メトキシベンジルアルコー

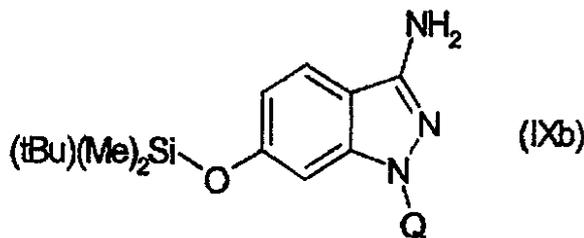
ル、メタノール、4-フルオロ-1-ブタノール、4-フェニル-2-ブタノール、3-ジメチルアミノ-1-プロパノール、(2-ヒドロキシエチル)シクロプロパン、シクロペンタンメタノール、1,2,3,6-テトラヒドロベンジルアルコール、2-(3-チエニル)エタノール、6-メチル-2-ヘプタノール、1-メチル-2-ピロリジンエタノール、2-メチル-1-プロパノール、1-(2-ヒドロキシエチル)ピロリジン、5-ベンジルオキシ-1-ペンタノール、1-ヘキサノール、4-メチル-5-チアゾールエタノール、3-ブチン-1-オール、n-(2-ヒドロキシエチル)ピペリジン、テトラヒドロフルフリルアルコール及び4'-(2-ヒドロキシエトキシ)アセトアニリドからなる群より選択される式(XIX)の誘導体の各々1つと反応させること、及びその後請求項9記載の製造方法の段階j)に従って操作することを含む請求項1で定義した式(I)の化合物及び医薬適合性のその塩の製造方法。

10

【請求項18】

最初に式(IXb)：

【化19】

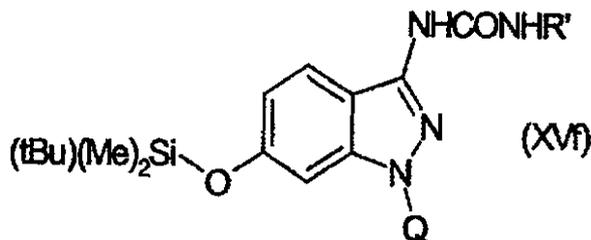


20

の化合物を、3-メトキシフェニルイソシアネート、p-トリルイソシアネート、3-クロロフェニルイソシアネート、4-ピフェニルイソシアネート、4-アセチルフェニルイソシアネート、イソシアヌ酸ベンゾイル、イソシアヌ酸イソプロピル、2,4-ジメチルフェニルイソシアネート、2-(ジフルオロメトキシ)フェニルイソシアネート、4-フルオロベンジルイソシアネート、n-ブチルイソシアネート、2,3,4-トリフルオロフェニルイソシアネート、3,5-ジメトキシフェニルイソシアネート、2-(メチルチオ)フェニルイソシアネート、3-(トリフルオロメチル)フェニルイソシアネート、2-フルオロフェニルイソシアネート、2-フェニルエチルイソシアネート、4-メトキシフェニルイソシアネート、3,4-(メチレンジオキシ)フェニルイソシアネート、3-カルボメトキシフェニルイソシアネート、イソシアヌ酸フェニル及びイソシアヌ酸ベンジルからなる群より選択される式(XII)の化合物の各々1つと反応させて、式(XVf)：

【化20】

30



40

の複数の化合物を入手し、次に式(XVf)の誘導体の各々を、請求項9に記載の製造方法の段階h)に従ってフッ化テトラブチルアンモニウムと反応させ、次に2-プロモ-2-フェニルアセトフェノン、臭化ベンジル、2-メチルベンジルプロミド、-プロモ-m-キシレン、2-プロモ-2',5'-ジメトキシアセトフェノン、4-メトキシフェナシルプロミド、2-プロモ-4'-フェニルアセトフェノン、1-プロモピナコロン、臭化プロパギル、1-プロモ-3-メチル-2-ブテン、臭化アリル、シンナミルプロミド、2-フルオロベンジルプロミド、2,6-ジフルオロベンジルプロミド、2-クロロベンジルプロミド、4-クロロフェナシルプロミド、2-シアノベンジルプロミド、4-ニトロベンジルプロミド、3,5-ジフルオロベンジルプロミド、2,4-ビス(トリフルオロメチル)ベンジルプロミド、2-プロモ-n-フェニルプロピオンアミド、メチル-

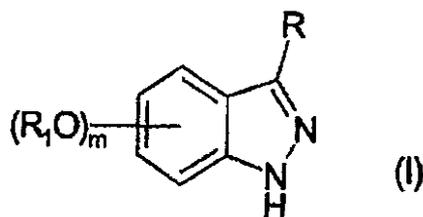
50

ブロモフェニルアセテート、2 - (トリフルオロメチル)ベンジルブロミド、3 - ブロモシクロヘキセン、1 - ブロモ - 2 - フルオロエタン、1 - ブロモ - 3 - フルオロプロパン、3,4 - ジクロロベンジルブロミド、2 - (プロモメチル)アントラキノン、4 - ブロモ - 2 - フルオロベンジルブロミド、4 - フルオロ - 2 - (トリフルオロメチル)ベンジルブロミド、2,3,6 - トリフルオロベンジルブロミド、2,4,5 - トリフルオロベンジルブロミド、3 - (トリフルオロメトキシ)ベンジルブロミド、4 - (トリフルオロメチル)フェナシルブロミド、3 - (プロモメチル) - 5 - クロロベンゾ [b] チオフェン、2 - (ジフルオロメトキシ)ベンジルブロミド、1 - ブロモ - 2 - プチン、1 - ブロモ - 2 - ペンチン、(+ / -) - 3 - ブロモ - 1 - フェニル - 2 - ピロリジノン、 - ブロモ - 4 - (1 - ピロリジノ) アセトフェノン、ベンジル 2 - ブロモエチルエーテル、3,5 - ジメトキシベンジルブロミド、4 - (プロモメチル) - 3,5 - ジメチルイソキサゾール、3 - メチルベンジルアルコール、シクロペンタノール、3 - メトキシベンジルアルコール、メタノール、4 - フルオロ - 1 - ブタノール、4 - フェニル - 2 - ブタノール、3 - ジメチルアミノ - 1 - プロパノール、(2 - ヒドロキシエチル) シクロプロパン、シクロペンタンメタノール、1,2,3,6 - テトラヒドロベンジルアルコール、2 - (3 - チエニル) エタノール、6 - メチル - 2 - ヘプタノール、1 - メチル - 2 - ピロリジンエタノール、2 - メチル - 1 - プロパノール、1 - (2 - ヒドロキシエチル) ピロリジン、5 - ベンジルオキシ - 1 - ペンタノール、1 - ヘキサノール、4 - メチル - 5 - チアゾールエタノール、3 - プチン - 1 - オール、n - (2 - ヒドロキシエチル) ピペリジン、テトラヒドロフルフリルアルコール及び 4 ' - (2 - ヒドロキシエトキシ) アセトアニリドからなる群より選択される式 (XIX) の誘導体の各々 1 つと反応させること、及びその後請求項 9 記載の製造方法の段階 j) に従って操作することを含む請求項 1 で定義した式 (I) の化合物及び医薬適合性のその塩の製造方法。

【請求項 19】

式 (I) :

【化 21】



[式中、

R は、- NHCO R' 又は - NHCONHR' [式中、R' は、

直鎖又は分枝鎖 C₁ - C₆ アルキル (ここで、前記アルキルは、場合によって、= O、アルキル、フェニルカルボニルアミノ、場合によってフェニルにより置換されたアルコキシ、場合によってアルキルにより置換されたフェノキシ及びフェニルからなる群より選択される基により置換されることができ、

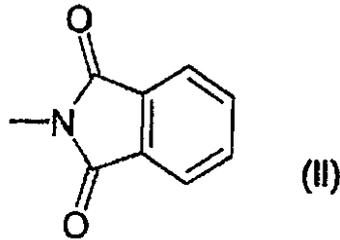
C₃ - C₆ シクロアルキル又はシクロアルキル C₁ - C₆ アルキル、

アリール又はアリール C₁ - C₆ アルキル (ここで、前記アリールは、フェニル、1,2 - メチレンジオキシフェニル、 - 又は - ナフチル、フリル、チエニル、オキサゾリル、イソキサゾリル、キノリニル及びイソキノリニルからなる群から選択され、前記アリールは、場合によって、ハロゲン、アルキル、過フッ化アルキル、アルキルカルボニル、アルコキシカルボニル、ジアルキルアミノ、場合によってハロゲンにより置換されたアルコキシ、フェニル、アルキルチオ及びアルキルカルボニルアミノからなる群より選択される基により置換されることができ、そして前記アルキルは、場合によって、アルキルフェニルスルホニルアミノにより置換されることができ、

ヘテロシクリル又はヘテロシクリル C₁ - C₆ アルキル (ここで、前記ヘテロシクリルは、ピロリジン及びピペリジンからなる群より選択され、アルキルカルボニルにより置換

されているものとする)から選択される基である]から成る群より選択されるか;若しくはRは、下記の式(II):

【化22】



10

のフタルイミド基であり、

R₁は、インダゾール環の5又は6位に位置し、

直鎖又は分枝鎖C₁-C₆アルキル(ここで、前記アルキルは、場合によって、ハロゲン、アルキル、フェニル、フェニルにより置換されたアミノカルボニル、アルコキシカルボニル、フェニルカルボニル(前記フェニルは、ハロゲン、アルコキシ、過フッ化アルキル又はピロリジンにより置換されているものとする)、アルキルカルボニル、ジアルキルアミノ、フェニルにより置換されたアルコキシ及びアルキルカルボニルアミノにより置換されたフェノキシからなる群より選択される基により置換されることができ、

C₂-C₆アルケニル又はアルキニル(ここで、前記アルケニルは、場合によって、フェニルにより置換されることができ、

20

C₃-C₆シクロアルキル又はシクロアルキルC₁-C₆アルキル、

アリール又はアリールC₁-C₆アルキル(ここで、前記アリールは、フェニル、9,10-ジヒドロアントラセニル、オキサゾリル、イソキサゾリル、ベンゾチエニル、チエニル、チアゾリル及びイソチアゾリルからなる群より選択され、前記アリールは、場合によって、=O、ハロゲン、シアノ、ニトロ、過フッ化アルキル、アルキル及び場合によってハロゲンにより置換されていてもよいアルコキシからなる群より選択される基により置換されることができ、そして前記アルキルは、場合によって、アルコキシカルボニル及びフェニルカルボニルからなる群より選択される基により置換されることができ、

ヘテロシクリル又はヘテロシクリルC₁-C₆アルキル(ここで、前記ヘテロシクリルは、ピロリジン、ピペリジン及びテトラヒドロフランからなる群から選択され、場合によって、=O、フェニル及びアルキルからなる群より選択される基により置換されることができ)から選択される基を表わし;

30

mは1である]

によって表わされる2又はそれ以上のアミノインダゾール誘導体又は医薬適合性のその塩のライブラリー。

【請求項20】

N-(5-ヒドロキシ-2H-インダゾール-3-イル)-3-フェニルプロパンアミド、

N-(5-ヒドロキシ-2H-インダゾール-3-イル)シクロプロパンカルボキサミド、

40

3-クロロ-N-(5-ヒドロキシ-2H-インダゾール-3-イル)ベンズアミド、

N-(6-ヒドロキシ-2H-インダゾール-3-イル)-N'-イソプロピル尿素、

2-(4-tert-ブチルフェノキシ)-N-(6-ヒドロキシ-2H-インダゾール-3-イル)アセトアミド、

N-(6-ヒドロキシ-2H-インダゾール-3-イル)-2-(4-メトキシフェニル)アセトアミド、

3-クロロ-N-(6-ヒドロキシ-2H-インダゾール-3-イル)ベンズアミド、

N-(5-ヒドロキシ-2H-インダゾール-3-イル)-N'-イソプロピル尿素、

N-(5-ヒドロキシ-1H-インダゾール-3-イル)-N'-(4-メチルフェニル)尿素、

50

N - (5 - ヒドロキシ - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - N' - (2 - フェニルエチル) 尿素、
 N - (5 - ヒドロキシ - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - N' - (4 - メトキシフェニル) 尿素、
 N - (5 - ヒドロキシ - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - N' (3 - メトキシフェニル) 尿素、
 N - (3 - クロロフェニル) - N' - (5 - ヒドロキシ - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素、
 N - (4 - アセチルフェニル) - N' - (5 - ヒドロキシ - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素、
 N - { 2 - [(5 - ヒドロキシ - 1 H - インダゾール - 3 - イル) アミノ] - 2 - オキソエチル } ベンズアミド、
 N - (3 , 5 - ジメトキシフェニル) - N' - (5 - ヒドロキシ - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素、
 N - (5 - ヒドロキシ - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - N' - [3 - (トリフルオロメチル) フェニル] 尿素、
 N - (1 , 1' - ビフェニル - 4 - イル) - N' - (5 - ヒドロキシ - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素、
 N - ベンジル - N' - (6 - ヒドロキシ - 2 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素、
 N - (5 - ヒドロキシ - 2 H - インダゾール - 3 - イル) - N' - フェニル尿素、
 N - { 5 - [(2 - オキソ - 1 - フェニルピロリジン - 3 - イル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 3 - フェニルプロパンアミド、
 N - { 5 - [(3 - メチルブタ - 2 - エン - 1 - イル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 3 - フェニルプロパンアミド、
 N - フェニル - 2 - ({ 3 - [(3 - フェニルプロパノイル) アミノ] - 1 H - インダゾール - 5 - イル } オキシ) プロパンアミド、
 N - (5 - { 2 - オキソ - 2 - [4 - (ピロリジン - 1 - イル) フェニル] エトキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 3 - フェニルプロパンアミド、
 N - { 5 - [(2 - メチルベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } シクロプロパンカルボキサミド、
 N - { 5 - [(3 , 4 - ジクロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } シクロプロパンカルボキサミド、
 N - { 5 - [(3 - メチルブタ - 2 - エン - 1 - イル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } シクロプロパンカルボキサミド、
 N - (5 - { [1 - オキソ - 1 - (フェニルアミノ) プロパン - 2 - イル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) シクロプロパンカルボキサミド、
 2 - (4 - tert - ブチルフェノキシ) - N - { 5 - [(2 - オキソ - 1 - フェニルピロリジン - 3 - イル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } アセトアミド、
 2 - (4 - tert - ブチルフェノキシ) - N - { 5 - [(3 - メチルブタ - 2 - エン - 1 - イル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } アセトアミド、
 2 - [(3 - { [(4 - tert - ブチルフェノキシ) アセチル] アミノ } - 1 H - インダゾール - 5 - イル) オキシ] - N - フェニルプロパンアミド、
 メチル 2 - [(3 - { [(4 - tert - ブチルフェノキシ) アセチル] アミノ } - 1 H - インダゾール - 5 - イル) オキシ] ブタノエート、
 2 - (4 - メトキシフェニル) - N - { 5 - [(2 - メチルベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } アセトアミド、
 2 - (4 - メトキシフェニル) - N - { 5 - [(2 - オキソ - 1 - フェニルピロリジン - 3 - イル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } アセトアミド、
 2 - (4 - メトキシフェニル) - N - { 5 - [(3 - メチルブタ - 2 - エン - 1 - イル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } アセトアミド、

10

20

30

40

50

2 - [(3 - { [(4 - メトキシフェニル) アセチル] アミノ } - 1 H - インダゾール
 - 5 - イル) オキシ] - N - フェニルプロパンアミド、
 メチル [(3 - { [(4 - メトキシフェニル) アセチル] アミノ } - 1 H - インダゾール - 5 - イル) オキシ] (フェニル) アセテート、
 2 - (4 - メトキシフェニル) - N - (5 - { 2 - オキソ - 2 - [4 - (ピロリジン - 1 - イル) フェニル] エトキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) アセトアミド、
 3 - クロロ - N - { 5 - [(2 - オキソ - 1 - フェニルピロリジン - 3 - イル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、
 N - { 6 - [(2 - メチルベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 3 - フェニルプロパンアミド、
 N - { 6 - [2 - (ビフェニル - 4 - イル) - 2 - オキソエトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 3 - フェニルプロパンアミド、
 N - { 6 - [(3 , 4 - ジクロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 3 - フェニルプロパンアミド、
 N - { 6 - [(2 - オキソ - 1 - フェニルピロリジン - 3 - イル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 3 - フェニルプロパンアミド、
 N - { 6 - [(3 - メチルブタ - 2 - エン - 1 - イル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 3 - フェニルプロパンアミド、
 N - { 6 - [2 - (4 - クロロフェニル) - 2 - オキソエトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 3 - フェニルプロパンアミド、
 N - { 6 - [2 - (2 , 5 - ジメトキシフェニル) - 2 - オキソエトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 3 - フェニルプロパンアミド、
 N - フェニル - 2 - ({ 3 - [(3 - フェニルプロパノイル) アミノ] - 1 H - インダゾール - 6 - イル } オキシ) プロパンアミド、
 メチル 2 - ({ 3 - [(3 - フェニルプロパノイル) アミノ] - 1 H - インダゾール - 6 - イル } オキシ) ブタノエート、
 N - [6 - (2 - オキソ - 1 , 2 - ジフェニルエトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 3 - フェニルプロパンアミド、
 メチル フェニル ({ 3 - [(3 - フェニルプロパノイル) アミノ] - 1 H - インダゾール - 6 - イル } オキシ) アセテート、
 N - (6 - { 2 - オキソ - 2 - [4 - (ピロリジン - 1 - イル) フェニル] エトキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 3 - フェニルプロパンアミド、
 N - { 6 - [2 - (ビフェニル - 4 - イル) - 2 - オキソエトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } シクロプロパンカルボキサミド、
 N - { 6 - [(3 , 4 - ジクロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } シクロプロパンカルボキサミド、
 N - { 6 - [(3 - メチルブタ - 2 - エン - 1 - イル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } シクロプロパンカルボキサミド、
 N - { 6 - [2 - (4 - クロロフェニル) - 2 - オキソエトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } シクロプロパンカルボキサミド、
 N - { 6 - [2 - (2 , 5 - ジメトキシフェニル) - 2 - オキソエトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } シクロプロパンカルボキサミド、
 N - (6 - { [1 - オキソ - 1 - (フェニルアミノ) プロパン - 2 - イル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) シクロプロパンカルボキサミド、
 N - [6 - (2 - オキソ - 1 , 2 - ジフェニルエトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] シクロプロパンカルボキサミド、
 メチル ({ 3 - [(シクロプロピルカルボニル) アミノ] - 1 H - インダゾール - 6 - イル } オキシ) (フェニル) アセテート、
 N - (6 - { 2 - オキソ - 2 - [4 - (ピロリジン - 1 - イル) フェニル] エトキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) シクロプロパンカルボキサミド、

10

20

30

40

50

- 2 - (4 - tert - ブチルフェノキシ) - N - { 6 - [(2 - オキソ - 1 - フェニルピロリジン - 3 - イル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } アセトアミド、
- 2 - (4 - tert - ブチルフェノキシ) - N - { 6 - [(3 - メチルブタ - 2 - エン - 1 - イル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } アセトアミド、
- 2 - [(3 - { [(4 - tert - ブチルフェノキシ) アセチル] アミノ } - 1 H - インダゾール - 6 - イル) オキシ] - N - フェニルプロパンアミド、
- メチル 2 - [(3 - { [(4 - tert - ブチルフェノキシ) アセチル] アミノ } - 1 H - インダゾール - 6 - イル) オキシ] ブタノエート、
- 2 - (4 - メトキシフェニル) - N - { 6 - [(2 - オキソ - 1 - フェニルピロリジン - 3 - イル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } アセトアミド、
- 2 - (4 - メトキシフェニル) - N - { 6 - [(3 - メチルブタ - 2 - エン - 1 - イル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } アセトアミド、
- N - { 6 - [2 - (4 - クロロフェニル) - 2 - オキソエトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 2 - (4 - メトキシフェニル) アセトアミド、
- 2 - [(3 - { [(4 - メトキシフェニル) アセチル] アミノ } - 1 H - インダゾール - 6 - イル) オキシ] - N - フェニルプロパンアミド、
- メチル 2 - [(3 - { [(4 - メトキシフェニル) アセチル] アミノ } - 1 H - インダゾール - 6 - イル) オキシ] ブタノエート、
- 2 - (4 - メトキシフェニル) - N - [6 - (2 - オキソ - 1 , 2 - ジフェニルエトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] アセトアミド、
- 3 - クロロ - N - { 6 - [(2 - メチルベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、
- 3 - クロロ - N - { 6 - [(3 , 4 - ジクロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、
- 3 - クロロ - N - { 6 - [(2 - オキソ - 1 - フェニルピロリジン - 3 - イル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、
- 3 - クロロ - N - { 6 - [2 - (4 - クロロフェニル) - 2 - オキソエトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、
- 3 - クロロ - N - { 6 - [2 - (2 , 5 - ジメトキシフェニル) - 2 - オキソエトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、
- 3 - クロロ - N - (6 - { [1 - オキソ - 1 - (フェニルアミノ) プロパン - 2 - イル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) ベンズアミド、
- 3 - クロロ - N - [6 - (2 - オキソ - 1 , 2 - ジフェニルエトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] ベンズアミド、
- メチル [(3 - { [(3 - クロロフェニル) カルボニル] アミノ } - 1 H - インダゾール - 6 - イル) オキシ] (フェニル) アセテート、
- 3 - クロロ - N - (6 - { 2 - オキソ - 2 - [4 - (ピロリジン - 1 - イル) フェニル] エトキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) ベンズアミド、
- 3 - メトキシ - N - { 5 - [(3 - メチルベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、
- 3 - メトキシ - N - { 5 - [(3 - メチルブタ - 2 - エン - 1 - イル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、
- 3 - メトキシ - N - { 5 - [(2 - オキソ - 1 - フェニルピロリジン - 3 - イル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、
- N - { 5 - [(3 , 4 - ジクロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 3 - メトキシベンズアミド、
- 3 - メトキシ - N - (5 - { [(2 E) - 3 - フェニルプロパ - 2 - エン - 1 - イル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) ベンズアミド、
- 3 - メトキシ - N - { 6 - [(3 - メチルベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、

10

20

30

40

50

3 - メトキシ - N - { 6 - [(3 - メチルブタ - 2 - エン - 1 - イル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、

3 - メトキシ - N - { 6 - [(2 - オキソ - 1 - フェニルピロリジン - 3 - イル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、

N - { 6 - [(3 , 4 - ジクロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 3 - メトキシベンズアミド、

N - [6 - (2 - オキソ - 1 , 2 - ジフェニルエトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] ベンズアミド、

メチル 2 - ({ 3 - [(フェニルアセチル) アミノ] - 1 H - インダゾール - 6 - イル } オキシ) ブタノエート、

N - (6 - { 2 - オキソ - 2 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] エトキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 2 - フェニルアセトアミド、

N - { 6 - [(5 - クロロ - 1 - ベンゾチオフェン - 3 - イル) メトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 2 - フェニルアセトアミド、

N - [6 - (3 , 3 - ジメチル - 2 - オキソプトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 2 - フェニルアセトアミド、

N - { 5 - [2 - (4 - メトキシフェニル) - 2 - オキソエトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 2 - フェニルアセトアミド、

N - フェニル - 2 - ({ 3 - [(フェニルアセチル) アミノ] - 1 H - インダゾール - 5 - イル } オキシ) プロパンアミド、

N - { 5 - [(3 - メチルブタ - 2 - エン - 1 - イル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、

N - [5 - (シクロヘキサ - 2 - エン - 1 - イルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] ベンズアミド、

N - { 5 - [(2 - オキソ - 1 - フェニルピロリジン - 3 - イル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、

N - [5 - (プロパ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] ベンズアミド、

N - [6 - (プロパ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] ベンズアミド、

N - { 5 - [(3 , 4 - ジクロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、

N - { 6 - [(3 , 4 - ジクロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、

N - { 5 - [(2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、

N - { 6 - [(2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、

N - { 5 - [(4 - プロモ - 2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、

N - { 6 - [(4 - プロモ - 2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、

N - [5 - (アリルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] ベンズアミド、

N - { 5 - [(3 , 5 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、

N - { 6 - [(3 , 5 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、

N - (5 - { [3 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) ベンズアミド、

N - { 5 - [(3 , 5 - ジメトキシベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、

10

20

30

40

50

- ル}ベンズアミド、
 N - { 6 - [(3 , 5 - ジメトキシベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イ
 ル } ベンズアミド、
 N - { 5 - [(2 , 4 , 5 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3
 - イル } ベンズアミド、
 N - { 6 - [(2 , 4 , 5 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3
 - イル } ベンズアミド、
 N - (5 - { [2 - (ジフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール
 - 3 - イル) ベンズアミド、
 N - (6 - { [2 - (ジフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール 10
 - 3 - イル) ベンズアミド、
 N - [5 - (ペンタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] ベンズア
 ミド、
 N - { 6 - [(9 , 10 - ジオキソ - 9 , 10 - ジヒドロアントラセン - 2 - イル) メト
 キシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、
 N - { 5 - [(9 , 10 - ジオキソ - 9 , 10 - ジヒドロアントラセン - 2 - イル) メト
 キシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、
 N - [5 - (ブタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] ベンズアミ
 ド、
 N - { 5 - [(4 - ニトロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベン 20
 ズアミド、
 N - { 5 - [(2 - シアノベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベン
 ズアミド、
 N - { 5 - [(3 , 5 - ジメチルイソオキサゾール - 4 - イル) メトキシ] - 1 H - イン
 ダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、
 N - { 6 - [(2 , 6 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イ
 ル } ベンズアミド、
 N - { 5 - [(2 , 6 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イ
 ル } ベンズアミド、
 N - (5 - { [2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール 30
 - 3 - イル) ベンズアミド、
 N - [5 - (2 - フルオロエトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] ベンズアミド
 、
 N - (5 - { [2 , 4 - ビス (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - イン
 ダゾール - 3 - イル) ベンズアミド、
 N - { 5 - [(2 - クロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベン
 ズアミド、
 N - { 5 - [(2 , 3 , 6 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3
 - イル } ベンズアミド、
 N - (5 - { [4 - フルオロ - 2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H 40
 - インダゾール - 3 - イル) ベンズアミド
 N - [5 - (3 - フルオロプロボキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] ベンズアミ
 ド、
 N - { 6 - [2 - (ベンジルオキシ) エトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベ
 ンズアミド、
 N - [5 - (プロパ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 1 , 3
 - ベンゾジオキソール - 5 - カルボキサミド、
 N - [6 - (プロパ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 1 , 3
 - ベンゾジオキソール - 5 - カルボキサミド、
 N - [5 - (ベンジルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 1 , 3 - ベンゾジ 50

- オキソール - 5 - カルボキサミド、
 N - [6 - (ベンジルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 1, 3 - ベンゾジ
 オキソール - 5 - カルボキサミド、
 N - { 5 - [(3, 4 - ジクロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 1, 3 - ベンゾジ
 オキソール - 5 - カルボキサミド、
 N - { 5 - [(2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 1, 3 - ベンゾジ
 オキソール - 5 - カルボキサミド、
 N - { 6 - [(2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 1, 3 - ベンゾジ
 オキソール - 5 - カルボキサミド、
 N - { 5 - [(4 - ブロモ - 2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 1, 3 - ベンゾジ
 オキソール - 5 - カルボキサミド、
 N - { 6 - [(4 - ブロモ - 2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 1, 3 - ベンゾジ
 オキソール - 5 - カルボキサミド、
 N - [5 - (アリルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 1, 3 - ベンゾジ
 オキソール - 5 - カルボキサミド、
 N - { 5 - [(3, 5 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 1, 3 - ベンゾジ
 オキソール - 5 - カルボキサミド、
 N - { 6 - [(3, 5 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 1, 3 - ベンゾジ
 オキソール - 5 - カルボキサミド、
 N - (5 - { [3 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 1, 3 - ベンゾジ
 オキソール - 5 - カルボキサミド、
 N - (6 - { [3 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 1, 3 - ベンゾジ
 オキソール - 5 - カルボキサミド、
 N - { 5 - [(3, 5 - ジメトキシベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 1, 3 - ベンゾジ
 オキソール - 5 - カルボキサミド、
 N - { 6 - [(3, 5 - ジメトキシベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 1, 3 - ベンゾジ
 オキソール - 5 - カルボキサミド、
 N - { 5 - [(2, 4, 5 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 1, 3 - ベンゾジ
 オキソール - 5 - カルボキサミド、
 N - (5 - { [2 - (ジフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 1, 3 - ベンゾジ
 オキソール - 5 - カルボキサミド、
 N - (6 - { [2 - (ジフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 1, 3 - ベンゾジ
 オキソール - 5 - カルボキサミド、
 N - [5 - (ペンタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 1, 3 - ベンゾジ
 オキソール - 5 - カルボキサミド、
 N - { 6 - [(9, 10 - ジオキソ - 9, 10 - ジヒドロアントラセン - 2 - イル) メトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 1, 3 - ベンゾジ
 オキソール - 5 - カルボキサミド、
 N - { 5 - [(9, 10 - ジオキソ - 9, 10 - ジヒドロアントラセン - 2 - イル) メトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 1, 3 - ベンゾジ
 オキソール - 5 - カルボキサミド、
 N - [5 - (ブタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 1, 3 - ベンゾジ
 オキソール - 5 - カルボキサミド、
 N - { 5 - [(4 - ニトロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 1, 3 - ベンゾジ
 オキソール - 5 - カルボキサミド、
 N - { 5 - [(2 - シアノベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 1, 3 - ベンゾジ
 オキソール - 5 - カルボキサミド、
 N - { 5 - [(3, 5 - ジメチルイソオキサゾール - 4 - イル) メトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 1, 3 - ベンゾジ
 オキソール - 5 - カルボキサミド、
 N - { 6 - [(2, 6 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 1, 3 - ベンゾジ
 オキソール - 5 - カルボキサミド、

- ル} - 1, 3 - ベンゾジオキソール - 5 - カルボキサミド、
 N - { 5 - [(2, 6 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イ
 ル} - 1, 3 - ベンゾジオキソール - 5 - カルボキサミド、
 N - (5 - { [2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール
 - 3 - イル) - 1, 3 - ベンゾジオキソール - 5 - カルボキサミド、
 N - [5 - (2 - フルオロエトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 1, 3 - ベ
 ンゾジオキソール - 5 - カルボキサミド、
 N - (5 - { [2, 4 - ビス (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - イン
 ダゾール - 3 - イル) - 1, 3 - ベンゾジオキソール - 5 - カルボキサミド、
 N - { 5 - [(2 - クロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 1 10
 , 3 - ベンゾジオキソール - 5 - カルボキサミド、
 N - { 5 - [(2, 3, 6 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3
 - イル } - 1, 3 - ベンゾジオキソール - 5 - カルボキサミド、
 N - (5 - { [4 - フルオロ - 2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H
 - インダゾール - 3 - イル) - 1, 3 - ベンゾジオキソール - 5 - カルボキサミド、
 N - [5 - (3 - フルオロプロポキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 1, 3 -
 ベンゾジオキソール - 5 - カルボキサミド、
 N - { 6 - [2 - (ベンジルオキシ) エトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } -
 1, 3 - ベンゾジオキソール - 5 - カルボキサミド、
 N - [5 - (プロパ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 1 - ナ 20
 フトアミド、
 N - [6 - (プロパ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 1 - ナ
 フトアミド、
 N - [5 - (ベンジルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 1 - ナフトアミド
 、
 N - [6 - (ベンジルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 1 - ナフトアミド
 、
 N - { 5 - [(3, 4 - ジクロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル
 } - 1 - ナフトアミド、
 N - { 5 - [(2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 30
 1 - ナフトアミド、
 N - { 6 - [(2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } -
 1 - ナフトアミド、
 N - { 5 - [(4 - プロモ - 2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール -
 3 - イル } - 1 - ナフトアミド、
 N - [5 - (アリルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 1 - ナフトアミド、
 N - [6 - (アリルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 1 - ナフトアミド、
 N - { 5 - [(3, 5 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イ
 ル} - 1 - ナフトアミド、
 N - { 6 - [(3, 5 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イ 40
 ル} - 1 - ナフトアミド、
 N - (5 - { [3 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾー
 ル - 3 - イル) - 1 - ナフトアミド、
 N - (6 - { [3 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾー
 ル - 3 - イル) - 1 - ナフトアミド、
 N - { 5 - [(3, 5 - ジメトキシベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イ
 ル} - 1 - ナフトアミド、
 N - { 6 - [(3, 5 - ジメトキシベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イ
 ル} - 1 - ナフトアミド、
 N - { 5 - [(2, 4, 5 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 50

- イル } - 1 - ナフトアミド、
N - (5 - { [2 - (ジフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール
- 3 - イル) - 1 - ナフトアミド、
N - (6 - { [2 - (ジフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール
- 3 - イル) - 1 - ナフトアミド、
N - [5 - (ペンタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 1 - ナフトアミド、
N - [6 - (ペンタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 1 - ナフトアミド、
N - [5 - (プタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 1 - ナフトアミド、
N - { 5 - [(4 - ニトロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 1 - ナフトアミド、
N - { 5 - [(2 - シアノベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 1 - ナフトアミド、
N - { 5 - [(3 , 5 - ジメチルイソオキサゾール - 4 - イル) メトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 1 - ナフトアミド、
N - { 6 - [(2 , 6 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 1 - ナフトアミド、
N - { 5 - [(2 , 6 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 1 - ナフトアミド、
N - (5 - { [2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 1 - ナフトアミド、
N - [5 - (2 - フルオロエトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 1 - ナフトアミド、
N - (5 - { [2 , 4 - ビス (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 1 - ナフトアミド、
N - { 5 - [(2 - クロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 1 - ナフトアミド、
N - { 5 - [(2 , 3 , 6 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 1 - ナフトアミド、
N - (5 - { [4 - フルオロ - 2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 1 - ナフトアミド、
N - [5 - (3 - フルオロプロポキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 1 - ナフトアミド、
N - { 6 - [2 - (ベンジルオキシ) エトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 1 - ナフトアミド、
N - [5 - (プロパ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 2 - フルアミド、
N - [6 - (プロパ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 2 - フルアミド、
N - [5 - (ベンジルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 2 - フルアミド、
N - [6 - (ベンジルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 2 - フルアミド、
N - { 5 - [(3 , 4 - ジクロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 2 - フルアミド、
N - { 6 - [(3 , 4 - ジクロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 2 - フルアミド、
N - { 5 - [(2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 2 - フルアミド、
N - { 6 - [(2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } -

10

20

30

40

50

- 2 - フルアミド、
 N - { 5 - [(4 - プロモ - 2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 2 - フルアミド、
 N - { 6 - [(4 - プロモ - 2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 2 - フルアミド、
 N - [5 - (アリルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 2 - フルアミド、
 N - [6 - (アリルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 2 - フルアミド、
 N - { 5 - [(3, 5 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 2 - フルアミド、
 N - { 6 - [(3, 5 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 2 - フルアミド、
 N - (5 - { [3 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 2 - フルアミド、
 N - (6 - { [3 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 2 - フルアミド、
 N - { 5 - [(3, 5 - ジメトキシベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 2 - フルアミド、
 N - { 6 - [(3, 5 - ジメトキシベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 2 - フルアミド、
 N - { 5 - [(2, 4, 5 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 2 - フルアミド、
 N - (5 - { [2 - (ジフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 2 - フルアミド、
 N - (6 - { [2 - (ジフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 2 - フルアミド、
 N - [5 - (ペンタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 2 - フルアミド、
 N - { 6 - [(9, 10 - ジオキソ - 9, 10 - ジヒドロアントラセン - 2 - イル) メトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 2 - フルアミド、
 N - { 5 - [(9, 10 - ジオキソ - 9, 10 - ジヒドロアントラセン - 2 - イル) メトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 2 - フルアミド、
 N - [5 - (ブタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 2 - フルアミド、
 N - { 5 - [(4 - ニトロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 2 - フルアミド、
 N - { 5 - [(2 - シアノベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 2 - フルアミド、
 N - { 5 - [(3, 5 - ジメチルイソオキサゾール - 4 - イル) メトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 2 - フルアミド、
 N - { 6 - [(2, 6 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 2 - フルアミド、
 N - { 5 - [(2, 6 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 2 - フルアミド、
 N - (5 - { [2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 2 - フルアミド、
 N - [5 - (2 - フルオロエトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 2 - フルアミド、
 N - (5 - { [2, 4 - ビス (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 2 - フルアミド、
 N - { 5 - [(2 - クロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 2

- フルアミド、
N - { 5 - [(2 , 3 , 6 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 2 - フルアミド、
- N - (5 - { [4 - フルオロ - 2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 2 - フルアミド、
- N - [5 - (3 - フルオロプロポキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 2 - フルアミド、
- N - { 6 - [2 - (ベンジルオキシ) エトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 2 - フルアミド、
- 4 - (ジメチルアミノ) - N - [5 - (プロパ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] ベンズアミド、
- 4 - (ジメチルアミノ) - N - [6 - (プロパ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] ベンズアミド、
- N - [5 - (ベンジルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 4 - (ジメチルアミノ) ベンズアミド、
- N - [6 - (ベンジルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 4 - (ジメチルアミノ) ベンズアミド、
- N - { 5 - [(3 , 4 - ジクロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 4 - (ジメチルアミノ) ベンズアミド、
- 4 - (ジメチルアミノ) - N - { 5 - [(2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、
- 4 - (ジメチルアミノ) - N - { 6 - [(2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、
- N - { 5 - [(4 - プロモ - 2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 4 - (ジメチルアミノ) ベンズアミド、
- N - { 6 - [(4 - プロモ - 2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 4 - (ジメチルアミノ) ベンズアミド、
- N - [5 - (アリルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 4 - (ジメチルアミノ) ベンズアミド、
- N - [6 - (アリルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 4 - (ジメチルアミノ) ベンズアミド、
- N - { 5 - [(3 , 5 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 4 - (ジメチルアミノ) ベンズアミド、
- N - { 6 - [(3 , 5 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 4 - (ジメチルアミノ) ベンズアミド、
- 4 - (ジメチルアミノ) - N - (5 - { [3 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) ベンズアミド、
- 4 - (ジメチルアミノ) - N - (6 - { [3 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) ベンズアミド、
- N - { 5 - [(3 , 5 - ジメトキシベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 4 - (ジメチルアミノ) ベンズアミド、
- N - { 6 - [(3 , 5 - ジメトキシベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 4 - (ジメチルアミノ) ベンズアミド、
- 4 - (ジメチルアミノ) - N - { 6 - [(2 , 4 , 5 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、
- N - (5 - { [2 - (ジフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 4 - (ジメチルアミノ) ベンズアミド、
- N - (6 - { [2 - (ジフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 4 - (ジメチルアミノ) ベンズアミド、
- 4 - (ジメチルアミノ) - N - [5 - (ペンタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] ベンズアミド、

- ール - 3 - イル] ベンズアミド、
 4 - (ジメチルアミノ) - N - { 6 - [(9 , 1 0 - ジオキソ - 9 , 1 0 - ジヒドロアン
 トラセン - 2 - イル) メトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、
 4 - (ジメチルアミノ) - N - { 5 - [(9 , 1 0 - ジオキソ - 9 , 1 0 - ジヒドロアン
 トラセン - 2 - イル) メトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、
 N - [5 - (ブタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 4 - (ジ
 メチルアミノ) ベンズアミド、
 4 - (ジメチルアミノ) - N - { 5 - [(4 - ニトロベンジル) オキシ] - 1 H - イン
 ダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、
 N - { 5 - [(2 - シアノベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 4
 - (ジメチルアミノ) ベンズアミド、
 4 - (ジメチルアミノ) - N - { 5 - [(3 , 5 - ジメチルイソオキサゾール - 4 - イ
 ル) メトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、
 N - { 6 - [(2 , 6 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イ
 ル } - 4 - (ジメチルアミノ) ベンズアミド、
 4 - (ジメチルアミノ) - N - [5 - (2 - フルオロエトキシ) - 1 H - インダゾール
 - 3 - イル] ベンズアミド、
 4 - (ジメチルアミノ) - N - [5 - (3 - フルオロプロポキシ) - 1 H - インダゾー
 ル - 3 - イル] ベンズアミド、
 N - { 6 - [2 - (ベンジルオキシ) エトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } -
 4 - (ジメチルアミノ) ベンズアミド、
 N - [5 - (プロパ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 4 - (ト
 リフルオロメチル) ベンズアミド、
 N - [6 - (プロパ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 4 - (ト
 リフルオロメチル) ベンズアミド、
 N - [5 - (ベンジルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 4 - (トリフルオ
 ロメチル) ベンズアミド、
 N - [6 - (ベンジルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 4 - (トリフルオ
 ロメチル) ベンズアミド、
 N - { 5 - [(3 , 4 - ジクロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル
 } - 4 - (トリフルオロメチル) ベンズアミド、
 N - { 6 - [(3 , 4 - ジクロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル
 } - 4 - (トリフルオロメチル) ベンズアミド、
 N - { 5 - [(2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } -
 4 - (トリフルオロメチル) ベンズアミド、
 N - { 6 - [(2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } -
 4 - (トリフルオロメチル) ベンズアミド、
 N - { 5 - [(4 - ブロモ - 2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール -
 3 - イル } - 4 - (トリフルオロメチル) ベンズアミド、
 N - { 6 - [(4 - ブロモ - 2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール -
 3 - イル } - 4 - (トリフルオロメチル) ベンズアミド、
 N - [5 - (アリルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 4 - (トリフルオロ
 メチル) ベンズアミド、
 N - [6 - (アリルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 4 - (トリフルオロ
 メチル) ベンズアミド、
 N - { 5 - [(3 , 5 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イ
 ル } - 4 - (トリフルオロメチル) ベンズアミド、
 N - { 6 - [(3 , 5 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イ
 ル } - 4 - (トリフルオロメチル) ベンズアミド、
 N - (5 - { [3 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾー

10

20

30

40

50

- ル - 3 - イル) - 4 - (トリフルオロメチル) ベンズアミド、
 N - (6 - { [3 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 4 - (トリフルオロメチル) ベンズアミド、
 N - { 5 - [(3 , 5 - ジメトキシベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 4 - (トリフルオロメチル) ベンズアミド、
 N - { 6 - [(3 , 5 - ジメトキシベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 4 - (トリフルオロメチル) ベンズアミド、
 N - { 5 - [(2 , 4 , 5 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 4 - (トリフルオロメチル) ベンズアミド、
 N - { 6 - [(2 , 4 , 5 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 4 - (トリフルオロメチル) ベンズアミド、
 N - (5 - { [2 - (ジフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 4 - (トリフルオロメチル) ベンズアミド、
 N - [5 - (ペンタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 4 - (トリフルオロメチル) ベンズアミド、
 N - [6 - (ペンタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 4 - (トリフルオロメチル) ベンズアミド、
 N - { 6 - [(9 , 10 - ジオキソ - 9 , 10 - ジヒドロアントラセン - 2 - イル) メトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 4 - (トリフルオロメチル) ベンズアミド、
 N - [5 - (ブタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 4 - (トリフルオロメチル) ベンズアミド、
 N - { 5 - [(2 - シアノベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 4 - (トリフルオロメチル) ベンズアミド、
 N - { 5 - [(3 , 5 - ジメチルイソオキサゾール - 4 - イル) メトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 4 - (トリフルオロメチル) ベンズアミド、
 N - { 6 - [(2 , 6 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 4 - (トリフルオロメチル) ベンズアミド、
 N - { 5 - [(2 , 6 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 4 - (トリフルオロメチル) ベンズアミド、
 4 - (トリフルオロメチル) - N - (5 - { [2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) ベンズアミド、
 N - [5 - (2 - フルオロエトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 4 - (トリフルオロメチル) ベンズアミド、
 N - (5 - { [2 , 4 - ビス (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 4 - (トリフルオロメチル) ベンズアミド、
 N - { 5 - [(2 - クロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 4 - (トリフルオロメチル) ベンズアミド、
 N - { 5 - [(2 , 3 , 6 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 4 - (トリフルオロメチル) ベンズアミド、
 N - (5 - { [4 - フルオロ - 2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 4 - (トリフルオロメチル) ベンズアミド、
 N - [5 - (3 - フルオロプロポキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 4 - (トリフルオロメチル) ベンズアミド、
 N - { 6 - [2 - (ベンジルオキシ) エトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 4 - (トリフルオロメチル) ベンズアミド、
 3 , 5 - ジクロロ - N - [5 - (プロパ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] ベンズアミド、
 3 , 5 - ジクロロ - N - [6 - (プロパ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] ベンズアミド、
 N - [5 - (ベンジルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 3 , 5 - ジクロロ

10

20

30

40

50

ベンズアミド、

N - [6 - (ベンジルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 3, 5 - ジクロロベンズアミド、

3, 5 - ジクロロ - N - { 5 - [(3, 4 - ジクロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、

3, 5 - ジクロロ - N - { 5 - [(2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、

3, 5 - ジクロロ - N - { 6 - [(2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、

N - { 5 - [(4 - プロモ - 2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 3, 5 - ジクロロベンズアミド、

10

N - [5 - (アリルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 3, 5 - ジクロロベンズアミド、

N - [6 - (アリルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 3, 5 - ジクロロベンズアミド、

3, 5 - ジクロロ - N - { 5 - [(3, 5 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、

3, 5 - ジクロロ - N - { 6 - [(3, 5 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、

3, 5 - ジクロロ - N - (5 - { [3 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) ベンズアミド、

20

3, 5 - ジクロロ - N - (6 - { [3 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) ベンズアミド、

3, 5 - ジクロロ - N - { 5 - [(3, 5 - ジメトキシベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、

3, 5 - ジクロロ - N - { 6 - [(3, 5 - ジメトキシベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、

3, 5 - ジクロロ - N - { 5 - [(2, 4, 5 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、

3, 5 - ジクロロ - N - (5 - { [2 - (ジフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) ベンズアミド、

30

3, 5 - ジクロロ - N - (6 - { [2 - (ジフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) ベンズアミド、

3, 5 - ジクロロ - N - [5 - (ペンタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] ベンズアミド、

3, 5 - ジクロロ - N - { 6 - [(9, 10 - ジオキソ - 9, 10 - ジヒドロアントラセン - 2 - イル) メトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、

N - [5 - (ブタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 3, 5 - ジクロロベンズアミド、

3, 5 - ジクロロ - N - { 5 - [(4 - ニトロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、

40

3, 5 - ジクロロ - N - { 5 - [(2 - シアノベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、

3, 5 - ジクロロ - N - { 5 - [(3, 5 - ジメチルイソオキサゾール - 4 - イル) メトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、

3, 5 - ジクロロ - N - { 6 - [(2, 6 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、

3, 5 - ジクロロ - N - { 5 - [(2, 6 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、

3, 5 - ジクロロ - N - (5 - { [2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } -

50

- 1 H - インダゾール - 3 - イル) ベンズアミド、
 3, 5 - ジクロロ - N - [5 - (2 - フルオロエトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] ベンズアミド、
 N - (5 - { [2, 4 - ビス (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 3, 5 - ジクロロベンズアミド、
 3, 5 - ジクロロ - N - { 5 - [(2 - クロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、
 3, 5 - ジクロロ - N - { 5 - [(2, 3, 6 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、
 3, 5 - ジクロロ - N - (5 - { [4 - フルオロ - 2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) ベンズアミド、
 3, 5 - ジクロロ - N - [5 - (3 - フルオロプロポキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] ベンズアミド、
 N - { 6 - [2 - (ベンジルオキシ) エトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 3, 5 - ジクロロベンズアミド、
 2 - (ベンジルオキシ) - N - [5 - (プロパ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] アセトアミド、
 2 - (ベンジルオキシ) - N - [6 - (プロパ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] アセトアミド、
 2 - (ベンジルオキシ) - N - [5 - (ベンジルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] アセトアミド、
 2 - (ベンジルオキシ) - N - { 5 - [(3, 4 - ジクロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } アセトアミド、
 2 - (ベンジルオキシ) - N - { 5 - [(2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } アセトアミド、
 2 - (ベンジルオキシ) - N - { 5 - [(4 - プロモ - 2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } アセトアミド、
 2 - (ベンジルオキシ) - N - { 6 - [(4 - プロモ - 2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } アセトアミド、
 N - [5 - (アリルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 2 - (ベンジルオキシ) アセトアミド、
 N - [6 - (アリルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 2 - (ベンジルオキシ) アセトアミド、
 2 - (ベンジルオキシ) - N - { 5 - [(3, 5 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } アセトアミド、
 2 - (ベンジルオキシ) - N - { 6 - [(3, 5 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } アセトアミド、
 2 - (ベンジルオキシ) - N - (5 - { [3 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) アセトアミド、
 2 - (ベンジルオキシ) - N - (6 - { [3 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) アセトアミド、
 2 - (ベンジルオキシ) - N - { 5 - [(3, 5 - ジメトキシベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } アセトアミド、
 2 - (ベンジルオキシ) - N - { 6 - [(3, 5 - ジメトキシベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } アセトアミド、
 2 - (ベンジルオキシ) - N - { 5 - [(2, 4, 5 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } アセトアミド、
 2 - (ベンジルオキシ) - N - { 6 - [(2, 4, 5 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } アセトアミド、
 2 - (ベンジルオキシ) - N - (5 - { [2 - (ジフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ

- シ} - 1 H - インダゾール - 3 - イル) アセトアミド、
 2 - (ベンジルオキシ) - N - (6 - { [2 - (ジフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) アセトアミド、
 2 - (ベンジルオキシ) - N - [5 - (ペンタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] アセトアミド、
 2 - (ベンジルオキシ) - N - [6 - (ペンタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] アセトアミド、
 2 - (ベンジルオキシ) - N - { 5 - [(9, 10 - ジオキソ - 9, 10 - ジヒドロアントラセン - 2 - イル) メトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } アセトアミド、
 2 - (ベンジルオキシ) - N - [5 - (ブタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] アセトアミド、
 2 - (ベンジルオキシ) - N - { 5 - [(4 - ニトロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } アセトアミド、
 2 - (ベンジルオキシ) - N - { 5 - [(2 - シアノベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } アセトアミド、
 2 - (ベンジルオキシ) - N - { 5 - [(3, 5 - ジメチルイソオキサゾール - 4 - イル) メトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } アセトアミド、
 2 - (ベンジルオキシ) - N - { 6 - [(2, 6 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } アセトアミド、
 2 - (ベンジルオキシ) - N - { 5 - [(2, 6 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } アセトアミド、
 2 - (ベンジルオキシ) - N - (5 - { [2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) アセトアミド、
 2 - (ベンジルオキシ) - N - [5 - (2 - フルオロエトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] アセトアミド、
 2 - (ベンジルオキシ) - N - (5 - { [2, 4 - ビス (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) アセトアミド、
 2 - (ベンジルオキシ) - N - { 5 - [(2 - クロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } アセトアミド、
 2 - (ベンジルオキシ) - N - { 5 - [(2, 3, 6 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } アセトアミド、
 2 - (ベンジルオキシ) - N - (5 - { [4 - フルオロ - 2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) アセトアミド、
 2 - (ベンジルオキシ) - N - [5 - (3 - フルオロプロポキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] アセトアミド、
 2 - (ベンジルオキシ) - N - { 6 - [2 - (ベンジルオキシ) エトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } アセトアミド、
 4 - tert - ブチル - N - [5 - (プロパ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] ベンズアミド、
 4 - tert - ブチル - N - [6 - (プロパ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] ベンズアミド、
 N - [5 - (ベンジルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 4 - tert - ブチルベンズアミド、
 N - [6 - (ベンジルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 4 - tert - ブチルベンズアミド、
 4 - tert - ブチル - N - { 5 - [(3, 4 - ジクロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、
 4 - tert - ブチル - N - { 6 - [(3, 4 - ジクロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、
 4 - tert - ブチル - N - { 5 - [(2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - イン

- ダゾール - 3 - イル}ベンズアミド、
 4 - tert - ブチル - N - { 6 - [(2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - イン
 ダゾール - 3 - イル}ベンズアミド、
 N - { 5 - [(4 - プロモ - 2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール -
 3 - イル} - 4 - tert - ブチルベンズアミド、
 N - { 6 - [(4 - プロモ - 2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール -
 3 - イル} - 4 - tert - ブチルベンズアミド、
 N - [5 - (アリルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 4 - tert - ブチ
 ルベンズアミド、
 N - [6 - (アリルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 4 - tert - ブチ 10
 ルベンズアミド、
 4 - tert - ブチル - N - { 5 - [(3, 5 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H
 - インダゾール - 3 - イル}ベンズアミド、
 4 - tert - ブチル - N - { 6 - [(3, 5 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H
 - インダゾール - 3 - イル}ベンズアミド、
 4 - tert - ブチル - N - (5 - { [3 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル] オキ
 シ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) ベンズアミド、
 4 - tert - ブチル - N - (6 - { [3 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル] オキ
 シ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) ベンズアミド、
 4 - tert - ブチル - N - { 5 - [(3, 5 - ジメトキシベンジル) オキシ] - 1 H 20
 - インダゾール - 3 - イル}ベンズアミド、
 4 - tert - ブチル - N - { 6 - [(3, 5 - ジメトキシベンジル) オキシ] - 1 H
 - インダゾール - 3 - イル}ベンズアミド、
 4 - tert - ブチル - N - { 5 - [(2, 4, 5 - トリフルオロベンジル) オキシ] -
 1 H - インダゾール - 3 - イル}ベンズアミド
 4 - tert - ブチル - N - { 6 - [(2, 4, 5 - トリフルオロベンジル) オキシ] -
 1 H - インダゾール - 3 - イル}ベンズアミド、
 4 - tert - ブチル - N - (5 - { [2 - (ジフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ
 } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) ベンズアミド、
 4 - tert - ブチル - N - (6 - { [2 - (ジフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ 30
 } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) ベンズアミド、
 4 - tert - ブチル - N - [5 - (ペンタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾー
 ル - 3 - イル] ベンズアミド、
 4 - tert - ブチル - N - [6 - (ペンタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾー
 ル - 3 - イル] ベンズアミド、
 4 - tert - ブチル - N - { 6 - [(9, 10 - ジオキソ - 9, 10 - ジヒドロアント
 ラセン - 2 - イル) メトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル}ベンズアミド、
 4 - tert - ブチル - N - { 5 - [(9, 10 - ジオキソ - 9, 10 - ジヒドロアント
 ラセン - 2 - イル) メトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル}ベンズアミド、
 4 - tert - ブチル - N - [5 - (ブタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール 40
 - 3 - イル] ベンズアミド、
 4 - tert - ブチル - N - { 5 - [(4 - ニトロベンジル) オキシ] - 1 H - インダ
 ザール - 3 - イル}ベンズアミド、
 4 - tert - ブチル - N - { 5 - [(2 - シアノベンジル) オキシ] - 1 H - インダ
 ザール - 3 - イル}ベンズアミド、
 4 - tert - ブチル - N - { 5 - [(3, 5 - ジメチルイソオキサゾール - 4 - イル
) メトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル}ベンズアミド、
 4 - tert - ブチル - N - { 6 - [(2, 6 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H
 - インダゾール - 3 - イル}ベンズアミド、
 4 - tert - ブチル - N - { 5 - [(2, 6 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H 50

- インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、
 4 - tert - ブチル - N - (5 - { [2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) ベンズアミド、
 4 - tert - ブチル - N - [5 - (2 - フルオロエトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] ベンズアミド、
 N - (5 - { [2, 4 - ビス (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 4 - tert - ブチルベンズアミド、
 4 - tert - ブチル - N - { 5 - [(2 - クロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、
 4 - tert - ブチル - N - { 5 - [(2, 3, 6 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、
 4 - tert - ブチル - N - (5 - { [4 - フルオロ - 2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) ベンズアミド、
 4 - tert - ブチル - N - [5 - (3 - フルオロプロポキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] ベンズアミド、
 N - { 6 - [2 - (ベンジルオキシ) エトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 4 - tert - ブチルベンズアミド、
 3, 4 - ジメトキシ - N - [5 - (プロパ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] ベンズアミド、
 3, 4 - ジメトキシ - N - [6 - (プロパ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] ベンズアミド、
 N - [5 - (ベンジルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 3, 4 - ジメトキシベンズアミド、
 N - { 5 - [(3, 4 - ジクロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 3, 4 - ジメトキシベンズアミド、
 N - { 6 - [(3, 4 - ジクロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 3, 4 - ジメトキシベンズアミド、
 N - { 5 - [(2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 3, 4 - ジメトキシベンズアミド、
 N - { 6 - [(2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 3, 4 - ジメトキシベンズアミド、
 N - { 5 - [(4 - プロモ - 2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 3, 4 - ジメトキシベンズアミド、
 N - { 6 - [(4 - プロモ - 2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 3, 4 - ジメトキシベンズアミド、
 N - [5 - (アリルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 3, 4 - ジメトキシベンズアミド、
 N - { 5 - [(3, 5 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 3, 4 - ジメトキシベンズアミド、
 N - { 6 - [(3, 5 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 3, 4 - ジメトキシベンズアミド、
 3, 4 - ジメトキシ - N - (5 - { [3 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) ベンズアミド、
 3, 4 - ジメトキシ - N - (6 - { [3 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) ベンズアミド、
 N - { 5 - [(3, 5 - ジメトキシベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 3, 4 - ジメトキシベンズアミド、
 3, 4 - ジメトキシ - N - { 5 - [(2, 4, 5 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、
 3, 4 - ジメトキシ - N - { 6 - [(2, 4, 5 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1

10

20

30

40

50

- H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、
 N - (5 - { [2 - (ジフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール
 - 3 - イル) - 3 , 4 - ジメトキシベンズアミド、
 N - (6 - { [2 - (ジフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール
 - 3 - イル) - 3 , 4 - ジメトキシベンズアミド、
 3 , 4 - ジメトキシ - N - [5 - (ペンタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール
 - 3 - イル] ベンズアミド、
 3 , 4 - ジメトキシ - N - [6 - (ペンタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール
 - 3 - イル] ベンズアミド、
 N - [5 - (ブタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 3 , 4 - 10
 ジメトキシベンズアミド、
 3 , 4 - ジメトキシ - N - { 5 - [(4 - ニトロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾ
 ール - 3 - イル } ベンズアミド、
 N - { 5 - [(2 - シアノベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 3
 , 4 - ジメトキシベンズアミド、
 N - { 6 - [(2 , 6 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イ
 ル } - 3 , 4 - ジメトキシベンズアミド、
 N - { 5 - [(2 , 6 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イ
 ル } - 3 , 4 - ジメトキシベンズアミド、
 3 , 4 - ジメトキシ - N - (5 - { [2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } 20
 - 1 H - インダゾール - 3 - イル) ベンズアミド、
 N - [5 - (2 - フルオロエトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 3 , 4 - ジ
 メトキシベンズアミド、
 N - (5 - { [2 , 4 - ビス (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - イン
 ダゾール - 3 - イル) - 3 , 4 - ジメトキシベンズアミド、
 N - { 5 - [(2 - クロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 3
 , 4 - ジメトキシベンズアミド、
 3 , 4 - ジメトキシ - N - { 5 - [(2 , 3 , 6 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1
 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、
 N - (5 - { [4 - フルオロ - 2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H 30
 - インダゾール - 3 - イル) - 3 , 4 - ジメトキシベンズアミド、
 N - [5 - (3 - フルオロプロポキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 3 , 4 -
 ジメトキシベンズアミド、
 N - { 6 - [2 - (ベンジルオキシ) エトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } -
 3 , 4 - ジメトキシベンズアミド、
 N - [5 - (ベンジルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 2 - フルオロベン
 ズアミド、
 N - [6 - (ベンジルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 2 - フルオロベン
 ズアミド、
 N - { 5 - [(3 , 4 - ジクロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル 40
 } - 2 - フルオロベンズアミド、
 N - { 6 - [(3 , 4 - ジクロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル
 } - 2 - フルオロベンズアミド、
 2 - フルオロ - N - { 5 - [(2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール
 - 3 - イル } ベンズアミド、
 2 - フルオロ - N - { 6 - [(2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール
 - 3 - イル } ベンズアミド、
 N - { 5 - [(4 - プロモ - 2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール -
 3 - イル } - 2 - フルオロベンズアミド、
 N - { 6 - [(4 - プロモ - 2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 50

- 3 - イル} - 2 - フルオロベンズアミド、
 N - [5 - (アリルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 2 - フルオロベンズアミド、
 N - { 6 - [(3 , 5 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 2 - フルオロベンズアミド、
 2 - フルオロ - N - (5 - { [3 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) ベンズアミド、
 2 - フルオロ - N - (6 - { [3 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) ベンズアミド、
 2 - フルオロ - N - { 5 - [(2 , 4 , 5 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、
 2 - フルオロ - N - { 6 - [(2 , 4 , 5 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、
 N - (6 - { [2 - (ジフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 2 - フルオロベンズアミド、
 2 - フルオロ - N - [6 - (ペンタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] ベンズアミド、
 N - { 6 - [(9 , 10 - ジオキソ - 9 , 10 - ジヒドロアントラセン - 2 - イル) メトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 2 - フルオロベンズアミド、
 N - [5 - (ブタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 2 - フルオロベンズアミド、
 2 - フルオロ - N - { 5 - [(4 - ニトロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、
 N - { 5 - [(2 - シアノベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 2 - フルオロベンズアミド、
 N - { 5 - [(3 , 5 - ジメチルイソオキサゾール - 4 - イル) メトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 2 - フルオロベンズアミド、
 N - { 6 - [(2 , 6 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 2 - フルオロベンズアミド、
 N - { 5 - [(2 , 6 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 2 - フルオロベンズアミド、
 2 - フルオロ - N - (5 - { [2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) ベンズアミド、
 2 - フルオロ - N - [5 - (2 - フルオロエトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] ベンズアミド、
 N - (5 - { [2 , 4 - ビス (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 2 - フルオロベンズアミド、
 N - { 5 - [(2 - クロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 2 - フルオロベンズアミド、
 2 - フルオロ - N - { 5 - [(2 , 3 , 6 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、
 2 - フルオロ - N - (5 - { [4 - フルオロ - 2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) ベンズアミド、
 2 - フルオロ - N - [5 - (3 - フルオロプロポキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] ベンズアミド、
 N - { 6 - [2 - (ベンジルオキシ) エトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 2 - フルオロベンズアミド、
 N - [5 - (プロパ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 4 - (トリフルオロメトキシ) ベンズアミド、
 N - [5 - (ベンジルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 4 - (トリフルオ

- ロメトキシ)ベンズアミド、
 N - [6 - (ベンジルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 4 - (トリフルオ
 ロメトキシ)ベンズアミド、
 N - { 5 - [(3 , 4 - ジクロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル
 } - 4 - (トリフルオロメトキシ)ベンズアミド、
 N - { 6 - [(3 , 4 - ジクロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル
 } - 4 - (トリフルオロメトキシ)ベンズアミド、
 N - { 5 - [(2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } -
 4 - (トリフルオロメトキシ)ベンズアミド、
 N - { 5 - [(4 - ブロモ - 2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 10
 3 - イル } - 4 - (トリフルオロメトキシ)ベンズアミド、
 N - { 6 - [(4 - ブロモ - 2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール -
 3 - イル } - 4 - (トリフルオロメトキシ)ベンズアミド、
 N - [5 - (アリルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 4 - (トリフルオロ
 メトキシ)ベンズアミド、
 N - { 5 - [(3 , 5 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イ
 ル } - 4 - (トリフルオロメトキシ)ベンズアミド、
 N - { 6 - [(3 , 5 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イ
 ル } - 4 - (トリフルオロメトキシ)ベンズアミド、
 4 - (トリフルオロメトキシ) - N - (5 - { [3 - (トリフルオロメトキシ)ベンジ
 ル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) ベンズアミド、 20
 N - { 5 - [(3 , 5 - ジメトキシベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イ
 ル } - 4 - (トリフルオロメトキシ)ベンズアミド、
 N - { 6 - [(3 , 5 - ジメトキシベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イ
 ル } - 4 - (トリフルオロメトキシ)ベンズアミド、
 N - { 5 - [(2 , 4 , 5 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3
 - イル } - 4 - (トリフルオロメトキシ)ベンズアミド、
 N - { 6 - [(2 , 4 , 5 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3
 - イル } - 4 - (トリフルオロメトキシ)ベンズアミド、
 N - (5 - { [2 - (ジフルオロメトキシ)ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール 30
 - 3 - イル) - 4 - (トリフルオロメトキシ)ベンズアミド、
 N - (6 - { [2 - (ジフルオロメトキシ)ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール
 - 3 - イル) - 4 - (トリフルオロメトキシ)ベンズアミド、
 N - [5 - (ペンタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 4 - (ト
 リフルオロメトキシ)ベンズアミド、
 N - { 5 - [(9 , 10 - ジオキソ - 9 , 10 - ジヒドロアントラセン - 2 - イル) メト
 キシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 4 - (トリフルオロメトキシ)ベンズアミド
 、
 N - [5 - (ブタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 4 - (ト
 リフルオロメトキシ)ベンズアミド、 40
 N - { 5 - [(4 - ニトロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 4
 - (トリフルオロメトキシ)ベンズアミド、
 N - { 5 - [(2 - シアノベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 4
 - (トリフルオロメトキシ)ベンズアミド、
 N - { 5 - [(3 , 5 - ジメチルイソオキサゾール - 4 - イル) メトキシ] - 1 H - イン
 ダゾール - 3 - イル } - 4 - (トリフルオロメトキシ)ベンズアミド、
 N - { 6 - [(2 , 6 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イ
 ル } - 4 - (トリフルオロメトキシ)ベンズアミド、
 N - { 5 - [(2 , 6 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イ
 ル } - 4 - (トリフルオロメトキシ)ベンズアミド、 50

- 4 - (トリフルオロメトキシ) - N - (5 - { [2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) ベンズアミド、
 N - [5 - (2 - フルオロエトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 4 - (トリフルオロメトキシ) ベンズアミド、
 N - (5 - { [2, 4 - ビス(トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 4 - (トリフルオロメトキシ) ベンズアミド、
 N - { 5 - [(2 - クロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 4 - (トリフルオロメトキシ) ベンズアミド、
 N - { 5 - [(2, 3, 6 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 4 - (トリフルオロメトキシ) ベンズアミド、
 N - (5 - { [4 - フルオロ - 2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 4 - (トリフルオロメトキシ) ベンズアミド、
 N - [5 - (3 - フルオロプロボキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 4 - (トリフルオロメトキシ) ベンズアミド、
 N - { 6 - [2 - (ベンジルオキシ) エトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 4 - (トリフルオロメトキシ) ベンズアミド、
 1 - アセチル - N - [5 - (プロパ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] ピペリジン - 4 - カルボキサミド、
 1 - アセチル - N - [5 - (ベンジルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] ピペリジン - 4 - カルボキサミド、
 1 - アセチル - N - { 5 - [(3, 4 - ジクロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ピペリジン - 4 - カルボキサミド、
 1 - アセチル - N - [5 - (ペンタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] ピペリジン - 4 - カルボキサミド、
 1 - アセチル - N - { 5 - [(9, 10 - ジオキソ - 9, 10 - ジヒドロアントラセン - 2 - イル) メトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ピペリジン - 4 - カルボキサミド、
 1 - アセチル - N - [5 - (ブタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] ピペリジン - 4 - カルボキサミド、
 1 - アセチル - N - { 6 - [(2, 6 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ピペリジン - 4 - カルボキサミド、
 1 - アセチル - N - (5 - { [2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) ピペリジン - 4 - カルボキサミド、
 1 - アセチル - N - (5 - { [2, 4 - ビス(トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) ピペリジン - 4 - カルボキサミド、
 1 - アセチル - N - { 6 - [2 - (ベンジルオキシ) エトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ピペリジン - 4 - カルボキサミド、
 2 - フェノキシ - N - [5 - (プロパ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] プロパンアミド、
 2 - フェノキシ - N - [6 - (プロパ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] プロパンアミド、
 N - [5 - (ベンジルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 2 - フェノキシプロパンアミド、
 N - { 5 - [(3, 4 - ジクロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 2 - フェノキシプロパンアミド、
 N - { 6 - [(3, 4 - ジクロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 2 - フェノキシプロパンアミド、
 N - { 5 - [(2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 2 - フェノキシプロパンアミド、
 N - { 6 - [(2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } -

- 2 - フェノキシプロパンアミド、
 N - { 5 - [(4 - プロモ - 2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 2 - フェノキシプロパンアミド、
 N - { 6 - [(4 - プロモ - 2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 2 - フェノキシプロパンアミド、
 N - [5 - (アリルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 2 - フェノキシプロパンアミド、
 N - { 5 - [(3 , 5 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 2 - フェノキシプロパンアミド、
 N - { 6 - [(3 , 5 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 2 - フェノキシプロパンアミド、
 2 - フェノキシ - N - (5 - { [3 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) プロパンアミド、
 2 - フェノキシ - N - (6 - { [3 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) プロパンアミド、
 N - { 5 - [(3 , 5 - ジメトキシベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 2 - フェノキシプロパンアミド、
 N - { 6 - [(3 , 5 - ジメトキシベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 2 - フェノキシプロパンアミド、
 2 - フェノキシ - N - { 5 - [(2 , 4 , 5 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } プロパンアミド、
 2 - フェノキシ - N - { 6 - [(2 , 4 , 5 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } プロパンアミド、
 N - (5 - { [2 - (ジフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 2 - フェノキシプロパンアミド、
 N - (6 - { [2 - (ジフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 2 - フェノキシプロパンアミド、
 N - [6 - (ペンタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 2 - フェノキシプロパンアミド、
 N - { 5 - [(9 , 10 - ジオキソ - 9 , 10 - ジヒドロアントラセン - 2 - イル) メトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 2 - フェノキシプロパンアミド、
 N - [5 - (ブタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 2 - フェノキシプロパンアミド、
 N - { 5 - [(4 - ニトロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 2 - フェノキシプロパンアミド、
 N - { 5 - [(2 - シアノベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 2 - フェノキシプロパンアミド、
 N - { 5 - [(3 , 5 - ジメチルイソオキサゾール - 4 - イル) メトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 2 - フェノキシプロパンアミド、
 N - { 6 - [(2 , 6 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 2 - フェノキシプロパンアミド、
 N - { 5 - [(2 , 6 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 2 - フェノキシプロパンアミド、
 2 - フェノキシ - N - (5 - { [2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) プロパンアミド、
 N - [5 - (2 - フルオロエトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 2 - フェノキシプロパンアミド、
 N - (5 - { [2 , 4 - ビス (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 2 - フェノキシプロパンアミド、
 N - { 5 - [(2 - クロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 2

- フェノキシプロパンアミド、
- 2 - フェノキシ - N - { 5 - [(2 , 3 , 6 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } プロパンアミド、
- N - (5 - { [4 - フルオロ - 2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 2 - フェノキシプロパンアミド、
- N - [5 - (3 - フルオロプロポキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 2 - フェノキシプロパンアミド、
- N - { 6 - [2 - (ベンジルオキシ) エトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 2 - フェノキシプロパンアミド、
- 2 - (4 - tert - ブチルフェノキシ) - N - [5 - (プロパ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] アセトアミド、
- 2 - (4 - tert - ブチルフェノキシ) - N - [6 - (プロパ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] アセトアミド、
- N - [5 - (ベンジルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 2 - (4 - tert - ブチルフェノキシ) アセトアミド、
- N - [6 - (ベンジルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 2 - (4 - tert - ブチルフェノキシ) アセトアミド、
- 2 - (4 - tert - ブチルフェノキシ) - N - { 5 - [(3 , 4 - ジクロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } アセトアミド、
- 2 - (4 - tert - ブチルフェノキシ) - N - { 5 - [(2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } アセトアミド、
- 2 - (4 - tert - ブチルフェノキシ) - N - { 6 - [(2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } アセトアミド、
- N - { 5 - [(4 - プロモ - 2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 2 - (4 - tert - ブチルフェノキシ) アセトアミド、
- N - { 6 - [(4 - プロモ - 2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 2 - (4 - tert - ブチルフェノキシ) アセトアミド、
- N - [5 - (アリルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 2 - (4 - tert - ブチルフェノキシ) アセトアミド、
- 2 - (4 - tert - ブチルフェノキシ) - N - { 5 - [(3 , 5 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } アセトアミド、
- 2 - (4 - tert - ブチルフェノキシ) - N - (5 - { [3 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) アセトアミド、
- 2 - (4 - tert - ブチルフェノキシ) - N - (6 - { [3 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) アセトアミド、
- 2 - (4 - tert - ブチルフェノキシ) - N - { 5 - [(3 , 5 - ジメトキシベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } アセトアミド、
- 2 - (4 - tert - ブチルフェノキシ) - N - { 6 - [(3 , 5 - ジメトキシベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } アセトアミド、
- 2 - (4 - tert - ブチルフェノキシ) - N - { 5 - [(2 , 4 , 5 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } アセトアミド、
- 2 - (4 - tert - ブチルフェノキシ) - N - (5 - { [2 - (ジフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) アセトアミド、
- 2 - (4 - tert - ブチルフェノキシ) - N - (6 - { [2 - (ジフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) アセトアミド、
- 2 - (4 - tert - ブチルフェノキシ) - N - [5 - (ペンタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] アセトアミド、
- 2 - (4 - tert - ブチルフェノキシ) - N - [6 - (ペンタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] アセトアミド、
- 2 - (4 - tert - ブチルフェノキシ) - N - { 6 - [(9 , 10 - ジオキソ - 9 , 1

- 0 - ジヒドロアントラセン - 2 - イル)メトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル}アセトアミド、
 2 - (4 - tert - ブチルフェノキシ) - N - {5 - [(9, 10 - ジオキソ - 9, 10 - ジヒドロアントラセン - 2 - イル)メトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル}アセトアミド、
 2 - (4 - tert - ブチルフェノキシ) - N - (5 - {[2 - (トリフルオロメチル)ベンジル]オキシ} - 1 H - インダゾール - 3 - イル)アセトアミド、
 N - [5 - (ベンジルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 2 - メトキシアセトアミド、
 N - {5 - [(4 - プロモ - 2 - フルオロベンジル)オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル} - 2 - メトキシアセトアミド、
 N - [5 - (アリルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 2 - メトキシアセトアミド、
 2 - メトキシ - N - (5 - {[3 - (トリフルオロメトキシ)ベンジル]オキシ} - 1 H - インダゾール - 3 - イル)アセトアミド、
 N - (5 - {[2 - (ジフルオロメトキシ)ベンジル]オキシ} - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 2 - メトキシアセトアミド、
 N - [5 - (ブタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 2 - メトキシアセトアミド、
 2 - メトキシ - N - {5 - [(4 - ニトロベンジル)オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル}アセトアミド、
 N - {5 - [(2 - シアノベンジル)オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル} - 2 - メトキシアセトアミド、
 N - {5 - [(3, 5 - ジメチルイソオキサゾール - 4 - イル)メトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル} - 2 - メトキシアセトアミド、
 N - {5 - [(2, 6 - ジフルオロベンジル)オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル} - 2 - メトキシアセトアミド、
 N - {5 - [(2 - フルオロベンジル)オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル} - 2 - メトキシアセトアミド、
 2 - メトキシ - N - (5 - {[2 - (トリフルオロメチル)ベンジル]オキシ} - 1 H - インダゾール - 3 - イル)アセトアミド、
 N - [5 - (2 - フルオロエトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 2 - メトキシアセトアミド、
 N - (5 - {[2, 4 - ビス(トリフルオロメチル)ベンジル]オキシ} - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 2 - メトキシアセトアミド、
 N - {5 - [(2 - クロロベンジル)オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル} - 2 - メトキシアセトアミド、
 2 - メトキシ - N - {5 - [(2, 3, 6 - トリフルオロベンジル)オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル}アセトアミド、
 N - (5 - {[4 - フルオロ - 2 - (トリフルオロメチル)ベンジル]オキシ} - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 2 - メトキシアセトアミド、
 N - [5 - (3 - フルオロプロポキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 2 - メトキシアセトアミド、
 N - [2 - ({5 - [(4 - ニトロベンジル)オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル}アミノ) - 2 - オキソエチル]ベンズアミド、
 N - [2 - ({5 - [(2 - シアノベンジル)オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル}アミノ) - 2 - オキソエチル]ベンズアミド、
 N - [2 - ({5 - [(3, 5 - ジメチルイソオキサゾール - 4 - イル)メトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル}アミノ) - 2 - オキソエチル]ベンズアミド、
 N - [2 - ({5 - [(2, 6 - ジフルオロベンジル)オキシ] - 1 H - インダゾール

- 3 - イル} アミノ) - 2 - オキソエチル] ベンズアミド、
 N - { 2 - オキソ - 2 - [(5 - { [2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ }
 - 1 H - インダゾール - 3 - イル) アミノ] エチル } ベンズアミド、
 N - (2 - { [5 - (2 - フルオロエトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] アミ
 ノ } - 2 - オキソエチル) ベンズアミド、
 N - { 2 - [(5 - { [2, 4 - ビス (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1
 H - インダゾール - 3 - イル) アミノ] - 2 - オキソエチル } ベンズアミド、
 N - [2 - ({ 5 - [(2 - クロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イ
 ル } アミノ) - 2 - オキソエチル] ベンズアミド、
 N - [2 - オキソ - 2 - ({ 5 - [(2, 3, 6 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1 10
 H - インダゾール - 3 - イル } アミノ) エチル] ベンズアミド、
 N - { 2 - [(5 - { [4 - フルオロ - 2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ
 } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) アミノ] - 2 - オキソエチル } ベンズアミド、
 N - (2 - { [5 - (3 - フルオロプロポキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] ア
 ミノ } - 2 - オキソエチル) ベンズアミド、
 N - [5 - (ベンジルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 4 - プロモベンズ
 アミド、
 4 - プロモ - N - { 5 - [(4 - プロモ - 2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - イン
 ダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、
 N - [5 - (アリルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 4 - プロモベンズア 20
 ミド、
 4 - プロモ - N - (5 - { [3 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H
 - インダゾール - 3 - イル) ベンズアミド、
 4 - プロモ - N - { 5 - [(2, 4, 5 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - イン
 ダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、
 4 - プロモ - N - (5 - { [2 - (ジフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H -
 インダゾール - 3 - イル) ベンズアミド、
 4 - プロモ - N - [5 - (ペンタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イ
 ル] ベンズアミド、
 4 - プロモ - N - [5 - (ブタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル 30
] ベンズアミド、
 4 - プロモ - N - { 5 - [(4 - ニトロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3
 - イル } ベンズアミド、
 4 - プロモ - N - { 5 - [(2 - シアノベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3
 - イル } ベンズアミド、
 4 - プロモ - N - { 5 - [(3, 5 - ジメチルイソオキサゾール - 4 - イル) メトキシ
] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、
 4 - プロモ - N - { 5 - [(2, 6 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾ
 ール - 3 - イル } ベンズアミド、
 4 - プロモ - N - { 5 - [(2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 40
 3 - イル } ベンズアミド、
 4 - プロモ - N - (5 - { [2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H -
 インダゾール - 3 - イル) ベンズアミド、
 4 - プロモ - N - [5 - (2 - フルオロエトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル]
 ベンズアミド、
 N - (5 - { [2, 4 - ビス (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - イン
 ダゾール - 3 - イル) - 4 - プロモベンズアミド、
 4 - プロモ - N - { 5 - [(2 - クロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3
 - イル } ベンズアミド、
 4 - プロモ - N - { 5 - [(2, 3, 6 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - イン 50

- ダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、
 4 - プロモ - N - (5 - { [4 - フルオロ - 2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) ベンズアミド、
 4 - プロモ - N - [5 - (3 - フルオロプロポキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] ベンズアミド、
 N - [5 - (ベンジルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 4 - フルオロベンズアミド、
 N - { 5 - [(4 - プロモ - 2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 4 - フルオロベンズアミド、
 N - [5 - (アリルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 4 - フルオロベンズアミド、
 4 - フルオロ - N - (5 - { [3 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) ベンズアミド、
 4 - フルオロ - N - { 5 - [(2 , 4 , 5 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、
 N - (5 - { [2 - (ジフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 4 - フルオロベンズアミド、
 4 - フルオロ - N - [5 - (ペンタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] ベンズアミド、
 N - [5 - (ブタ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 4 - フルオロベンズアミド、
 4 - フルオロ - N - { 5 - [(4 - ニトロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、
 N - { 5 - [(2 - シアノベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 4 - フルオロベンズアミド、
 N - { 5 - [(3 , 5 - ジメチルイソオキサゾール - 4 - イル) メトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 4 - フルオロベンズアミド、
 N - { 5 - [(2 , 6 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 4 - フルオロベンズアミド、
 4 - フルオロ - N - { 5 - [(2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、
 4 - フルオロ - N - (5 - { [2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) ベンズアミド、
 4 - フルオロ - N - [5 - (2 - フルオロエトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] ベンズアミド、
 N - (5 - { [2 , 4 - ビス (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 4 - フルオロベンズアミド、
 N - { 5 - [(2 - クロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 4 - フルオロベンズアミド、
 4 - フルオロ - N - { 5 - [(2 , 3 , 6 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、
 4 - フルオロ - N - (5 - { [4 - フルオロ - 2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) ベンズアミド、
 4 - フルオロ - N - [5 - (3 - フルオロプロポキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] ベンズアミド、
 N - [5 - (ベンジルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 4 - ブトキシベンズアミド、
 N - { 5 - [(4 - プロモ - 2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 4 - ブトキシベンズアミド、
 N - [5 - (アリルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 4 - ブトキシベンズ

アミド、

- 4 - ブトキシ - N - (5 - { [3 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) ベンズアミド、
- 4 - ブトキシ - N - { 5 - [(2, 4, 5 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、
- 4 - ブトキシ - N - (5 - { [2 - (ジフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) ベンズアミド、
- 4 - ブトキシ - N - [5 - (ペンタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] ベンズアミド、
- 4 - ブトキシ - N - [5 - (ブタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] ベンズアミド、
- 4 - ブトキシ - N - { 5 - [(4 - ニトロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、
- 4 - ブトキシ - N - { 5 - [(2 - シアノベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、
- 4 - ブトキシ - N - { 5 - [(3, 5 - ジメチルイソオキサゾール - 4 - イル) メトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、
- 4 - ブトキシ - N - { 5 - [(2, 6 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、
- 4 - ブトキシ - N - { 5 - [(2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、
- 4 - ブトキシ - N - (5 - { [2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) ベンズアミド、
- 4 - ブトキシ - N - [5 - (2 - フルオロエトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] ベンズアミド、
- N - (5 - { [2, 4 - ビス (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 4 - ブトキシベンズアミド、
- 4 - ブトキシ - N - { 5 - [(2 - クロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、
- 4 - ブトキシ - N - { 5 - [(2, 3, 6 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、
- 4 - ブトキシ - N - (5 - { [4 - フルオロ - 2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) ベンズアミド、
- 4 - ブトキシ - N - [5 - (3 - フルオロプロポキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] ベンズアミド、
- N - [5 - (ベンジルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 3 - クロロ - 4 - フルオロベンズアミド、
- N - { 5 - [(4 - プロモ - 2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 3 - クロロ - 4 - フルオロベンズアミド、
- N - [5 - (アリルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 3 - クロロ - 4 - フルオロベンズアミド、
- 3 - クロロ - 4 - フルオロ - N - (5 - { [3 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) ベンズアミド、
- 3 - クロロ - 4 - フルオロ - N - { 5 - [(2, 4, 5 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、
- 3 - クロロ - N - (5 - { [2 - (ジフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 4 - フルオロベンズアミド、
- 3 - クロロ - 4 - フルオロ - N - [5 - (ペンタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] ベンズアミド、
- N - [5 - (ブタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 3 - クロ

10

20

30

40

50

- ロ - 4 - フルオロベンズアミド、
 3 - クロロ - 4 - フルオロ - N - { 5 - [(4 - ニトロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、
 3 - クロロ - N - { 5 - [(2 - シアノベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 4 - フルオロベンズアミド、
 3 - クロロ - N - { 5 - [(3, 5 - ジメチルイソオキサゾール - 4 - イル) メトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 4 - フルオロベンズアミド、
 3 - クロロ - N - { 5 - [(2, 6 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 4 - フルオロベンズアミド、
 3 - クロロ - 4 - フルオロ - N - { 5 - [(2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、
 3 - クロロ - 4 - フルオロ - N - (5 - { [2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) ベンズアミド、
 3 - クロロ - 4 - フルオロ - N - [5 - (2 - フルオロエトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] ベンズアミド、
 N - (5 - { [2, 4 - ビス (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 3 - クロロ - 4 - フルオロベンズアミド、
 3 - クロロ - N - { 5 - [(2 - クロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 4 - フルオロベンズアミド、
 3 - クロロ - 4 - フルオロ - N - { 5 - [(2, 3, 6 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、
 3 - クロロ - 4 - フルオロ - N - (5 - { [4 - フルオロ - 2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) ベンズアミド、
 3 - クロロ - 4 - フルオロ - N - [5 - (3 - フルオロプロポキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] ベンズアミド、
 N - [5 - (ベンジルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 2 - エトキシ - 1 - ナフトアミド、
 N - { 5 - [(4 - プロモ - 2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 2 - エトキシ - 1 - ナフトアミド、
 N - [5 - (アリルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 2 - エトキシ - 1 - ナフトアミド、
 2 - エトキシ - N - (5 - { [3 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 1 - ナフトアミド、
 2 - エトキシ - N - { 5 - [(2, 4, 5 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 1 - ナフトアミド、
 N - (5 - { [2 - (ジフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 2 - エトキシ - 1 - ナフトアミド、
 2 - エトキシ - N - [5 - (ペンタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 1 - ナフトアミド、
 N - [5 - (ブタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 2 - エトキシ - 1 - ナフトアミド、
 2 - エトキシ - N - { 5 - [(4 - ニトロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 1 - ナフトアミド、
 N - { 5 - [(2 - シアノベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 2 - エトキシ - 1 - ナフトアミド、
 N - { 5 - [(3, 5 - ジメチルイソオキサゾール - 4 - イル) メトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 2 - エトキシ - 1 - ナフトアミド、
 N - { 5 - [(2, 6 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 2 - エトキシ - 1 - ナフトアミド、
 2 - エトキシ - N - { 5 - [(2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール

- 3 - イル} - 1 - ナフトアミド、
- 2 - エトキシ - N - (5 - { [2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ} - 1 H -
- インダゾール - 3 - イル) - 1 - ナフトアミド、
- 2 - エトキシ - N - [5 - (2 - フルオロエトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル
-] - 1 - ナフトアミド、
- N - (5 - { [2, 4 - ビス(トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ} - 1 H - イン
- ダゾール - 3 - イル) - 2 - エトキシナフタレン - 1 - カルボキサミド、
- N - { 5 - [(2 - クロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル} - 2
- エトキシナフタレン - 1 - カルボキサミド、
- 2 - エトキシ - N - { 5 - [(2, 3, 6 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - イン
- 10 ダゾール - 3 - イル} - 1 - ナフトアミド、
- 2 - エトキシ - N - (5 - { [4 - フルオロ - 2 - (トリフルオロメチル) ベンジル]
- オキシ} - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 1 - ナフトアミド、
- 2 - エトキシ - N - [5 - (3 - フルオロプロポキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イ
- ル] - 1 - ナフトアミド、
- N - [5 - (ベンジルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 3 - クロロチオフ
- ェン - 2 - カルボキサミド、
- N - [5 - (アリルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 3 - クロロチオフ
- ェン - 2 - カルボキサミド、
- 3 - クロロ - N - (5 - { [3 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ} - 1 H
- 20 - インダゾール - 3 - イル) チオフェン - 2 - カルボキサミド、
- 3 - クロロ - N - { 5 - [(2, 4, 5 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - イン
- ダゾール - 3 - イル} チオフェン - 2 - カルボキサミド、
- 3 - クロロ - N - (5 - { [2 - (ジフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ} - 1 H -
- インダゾール - 3 - イル) チオフェン - 2 - カルボキサミド、
- 3 - クロロ - N - [5 - (ペンタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イ
- ル] チオフェン - 2 - カルボキサミド、
- N - [5 - (ブタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 3 - クロ
- ロチオフェン - 2 - カルボキサミド、
- 3 - クロロ - N - { 5 - [(4 - ニトロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3
- 30 - イル} チオフェン - 2 - カルボキサミド、
- 3 - クロロ - N - { 5 - [(2 - シアノベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3
- イル} チオフェン - 2 - カルボキサミド、
- 3 - クロロ - N - { 5 - [(3, 5 - ジメチルイソオキサゾール - 4 - イル) メトキシ
-] - 1 H - インダゾール - 3 - イル} チオフェン - 2 - カルボキサミド、
- 3 - クロロ - N - { 5 - [(2, 6 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾ
- ール - 3 - イル} チオフェン - 2 - カルボキサミド、 3 - クロロ - N - { 5 - [(2 -
- フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル} チオフェン - 2 - カルボ
- キサミド、
- 3 - クロロ - N - (5 - { [2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ} - 1 H -
- 40 インダゾール - 3 - イル) チオフェン - 2 - カルボキサミド、
- 3 - クロロ - N - [5 - (2 - フルオロエトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル]
- チオフェン - 2 - カルボキサミド、
- N - (5 - { [2, 4 - ビス(トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ} - 1 H - イン
- ダゾール - 3 - イル) - 3 - クロロチオフェン - 2 - カルボキサミド、
- 3 - クロロ - N - { 5 - [(2 - クロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3
- イル} チオフェン - 2 - カルボキサミド、
- 3 - クロロ - N - { 5 - [(2, 3, 6 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - イン
- ダゾール - 3 - イル} チオフェン - 2 - カルボキサミド、
- 3 - クロロ - N - (5 - { [4 - フルオロ - 2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オ
- 50

- キシ} - 1 H - インダゾール - 3 - イル) チオフェン - 2 - カルボキサミド、
 3 - クロロ - N - [5 - (3 - フルオロプロポキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] チオフェン - 2 - カルボキサミド、
 N - [5 - (ベンジルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 3 , 5 - ジメチル
 イソオキサゾール - 4 - カルボキサミド、
 N - { 5 - [(4 - プロモ - 2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール -
 3 - イル } - 3 , 5 - ジメチルイソオキサゾール - 4 - カルボキサミド、
 N - [5 - (アリルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 3 , 5 - ジメチルイ
 ソオキサゾール - 4 - カルボキサミド、
 3 , 5 - ジメチル - N - (5 - { [3 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ }
 - 1 H - インダゾール - 3 - イル) イソオキサゾール - 4 - カルボキサミド、
 3 , 5 - ジメチル - N - { 5 - [(2 , 4 , 5 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1 H
 - インダゾール - 3 - イル } イソオキサゾール - 4 - カルボキサミド、
 N - (5 - { [2 - (ジフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール
 - 3 - イル) - 3 , 5 - ジメチルイソオキサゾール - 4 - カルボキサミド、
 3 , 5 - ジメチル - N - [5 - (ペンタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール -
 3 - イル] イソオキサゾール - 4 - カルボキサミド、
 N - [5 - (ブタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 3 , 5 -
 ジメチルイソオキサゾール - 4 - カルボキサミド、
 3 , 5 - ジメチル - N - { 5 - [(4 - ニトロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾー
 ル - 3 - イル } イソオキサゾール - 4 - カルボキサミド、
 N - { 5 - [(2 - シアノベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 3
 , 5 - ジメチルイソオキサゾール - 4 - カルボキサミド、
 N - { 5 - [(3 , 5 - ジメチルイソオキサゾール - 4 - イル) メトキシ] - 1 H - イン
 ダゾール - 3 - イル } - 3 , 5 - ジメチルイソオキサゾール - 4 - カルボキサミド、
 N - { 5 - [(2 , 6 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イ
 ル } - 3 , 5 - ジメチルイソオキサゾール - 4 - カルボキサミド、
 N - { 5 - [(2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } -
 3 , 5 - ジメチルイソオキサゾール - 4 - カルボキサミド、
 3 , 5 - ジメチル - N - (5 - { [2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } -
 1 H - インダゾール - 3 - イル) イソオキサゾール - 4 - カルボキサミド、
 N - [5 - (2 - フルオロエトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 3 , 5 - ジ
 メチルイソオキサゾール - 4 - カルボキサミド、
 N - (5 - { [2 , 4 - ビス (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - イン
 ダゾール - 3 - イル) - 3 , 5 - ジメチルイソオキサゾール - 4 - カルボキサミド、
 N - { 5 - [(2 - クロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 3
 , 5 - ジメチルイソオキサゾール - 4 - カルボキサミド、
 3 , 5 - ジメチル - N - { 5 - [(2 , 3 , 6 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1 H
 - インダゾール - 3 - イル } イソオキサゾール - 4 - カルボキサミド、
 N - (5 - { [4 - フルオロ - 2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H
 - インダゾール - 3 - イル) - 3 , 5 - ジメチルイソオキサゾール - 4 - カルボキサミド
 、
 N - [5 - (3 - フルオロプロポキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 3 , 5 -
 ジメチルイソオキサゾール - 4 - カルボキサミド、
 N - [5 - (ベンジルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 4 - エチルベンズ
 アミド、
 N - { 5 - [(4 - プロモ - 2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール -
 3 - イル } - 4 - エチルベンズアミド、
 N - [5 - (アリルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 4 - エチルベンズア
 ミド、

10

20

30

40

50

- 4 - エチル - N - (5 - { [3 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) ベンズアミド、
- 4 - エチル - N - { 5 - [(2 , 4 , 5 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、
- N - (5 - { [2 - (ジフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 4 - エチルベンズアミド、
- N - [5 - (ブタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 4 - エチルベンズアミド、
- 4 - エチル - N - { 5 - [(4 - ニトロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、
- N - { 5 - [(2 - シアノベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 4 - エチルベンズアミド、
- N - { 5 - [(3 , 5 - ジメチルイソオキサゾール - 4 - イル) メトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 4 - エチルベンズアミド、
- N - { 5 - [(2 , 6 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 4 - エチルベンズアミド、
- 4 - エチル - N - { 5 - [(2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、
- 4 - エチル - N - (5 - { [2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) ベンズアミド、
- 4 - エチル - N - [5 - (2 - フルオロエトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] ベンズアミド、
- N - (5 - { [2 , 4 - ビス (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 4 - エチルベンズアミド、
- N - { 5 - [(2 - クロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 4 - エチルベンズアミド、
- 4 - エチル - N - { 5 - [(2 , 3 , 6 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、
- 4 - エチル - N - (5 - { [4 - フルオロ - 2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) ベンズアミド、
- 4 - エチル - N - [5 - (3 - フルオロプロボキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] ベンズアミド、
- N - [5 - (ブタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 2 - プロピルペンタンアミド、
- N - { 5 - [(4 - ニトロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 2 - プロピルペンタンアミド、
- N - { 5 - [(2 - シアノベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 2 - プロピルペンタンアミド、
- N - { 5 - [(3 , 5 - ジメチルイソオキサゾール - 4 - イル) メトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 2 - プロピルペンタンアミド、
- 2 - プロピル - N - (5 - { [2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) ペンタンアミド、
- N - [5 - (2 - フルオロエトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 2 - プロピルペンタンアミド、
- N - { 5 - [(2 - クロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 2 - プロピルペンタンアミド、
- 2 - プロピル - N - { 5 - [(2 , 3 , 6 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ペンタンアミド、
- N - (5 - { [4 - フルオロ - 2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 2 - プロピルペンタンアミド、

N - [5 - (3 - フルオロプロポキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 2 - プロピルペンタンアミド、

N - [5 - (ベンジルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 3 , 5 - ジメトキシベンズアミド、

N - { 5 - [(4 - プロモ - 2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 3 , 5 - ジメトキシベンズアミド、

N - [5 - (アリルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 3 , 5 - ジメトキシベンズアミド、

3 , 5 - ジメトキシ - N - (5 - { [3 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) ベンズアミド、

3 , 5 - ジメトキシ - N - { 5 - [(2 , 4 , 5 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、

N - (5 - { [2 - (ジフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 3 , 5 - ジメトキシベンズアミド、

3 , 5 - ジメトキシ - N - [5 - (ペンタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] ベンズアミド、

N - [5 - (ブタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 3 , 5 - ジメトキシベンズアミド、

3 , 5 - ジメトキシ - N - { 5 - [(4 - ニトロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、

N - { 5 - [(2 - シアノベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 3 , 5 - ジメトキシベンズアミド、

N - { 5 - [(3 , 5 - ジメチルイソオキサゾール - 4 - イル) メトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 3 , 5 - ジメトキシベンズアミド、

N - { 5 - [(2 , 6 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 3 , 5 - ジメトキシベンズアミド、

N - { 5 - [(2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 3 , 5 - ジメトキシベンズアミド、

3 , 5 - ジメトキシ - N - (5 - { [2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) ベンズアミド、

N - [5 - (2 - フルオロエトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 3 , 5 - ジメトキシベンズアミド、

N - (5 - { [2 , 4 - ビス (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 3 , 5 - ジメトキシベンズアミド、

N - { 5 - [(2 - クロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 3 , 5 - ジメトキシベンズアミド、

3 , 5 - ジメトキシ - N - { 5 - [(2 , 3 , 6 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、

N - (5 - { [4 - フルオロ - 2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 3 , 5 - ジメトキシベンズアミド、

N - [5 - (3 - フルオロプロポキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 3 , 5 - ジメトキシベンズアミド、

N - [5 - (ベンジルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N - [(4 - メチルフェニル) スルホニル] - L - フェニルアラニンアミド、

N - { 5 - [(4 - プロモ - 2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N - [(4 - メチルフェニル) スルホニル] - L - フェニルアラニンアミド、

N - [5 - (アリルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N - [(4 - メチルフェニル) スルホニル] - L - フェニルアラニンアミド、

N - [(4 - メチルフェニル) スルホニル] - N - (5 - { [3 - (トリフルオロメト

10

20

30

40

50

キシ)ベンジル]オキシ}-1H-インダゾール-3-イル)-L-フェニルアラニンアミド、

N-[(4-メチルフェニル)スルホニル]-N-{5-[(2,4,5-トリフルオロベンジル)オキシ]-1H-インダゾール-3-イル}-L-フェニルアラニンアミド、

N-(5-{ [2-(ジフルオロメトキシ)ベンジル]オキシ}-1H-インダゾール-3-イル)-N-[(4-メチルフェニル)スルホニル]-L-フェニルアラニンアミド、

N-[(4-メチルフェニル)スルホニル]-N-[5-(ペンタ-2-イニルオキシ)-1H-インダゾール-3-イル]-L-フェニルアラニンアミド、

N-[5-(ブタ-2-イニルオキシ)-1H-インダゾール-3-イル]-N-[(4-メチルフェニル)スルホニル]-L-フェニルアラニンアミド、

N-[(4-メチルフェニル)スルホニル]-N-{5-[(4-ニトロベンジル)オキシ]-1H-インダゾール-3-イル}-L-フェニルアラニンアミド、

N-{5-[(2-シアノベンジル)オキシ]-1H-インダゾール-3-イル}-N-[(4-メチルフェニル)スルホニル]-L-フェニルアラニンアミド、

N-{5-[(3,5-ジメチルイソオキサゾール-4-イル)メトキシ]-1H-インダゾール-3-イル}-N-[(4-メチルフェニル)スルホニル]-L-フェニルアラニンアミド、

N-{5-[(2,6-ジフルオロベンジル)オキシ]-1H-インダゾール-3-イル}-N-[(4-メチルフェニル)スルホニル]-L-フェニルアラニンアミド、

N-{5-[(2-フルオロベンジル)オキシ]-1H-インダゾール-3-イル}-N-[(4-メチルフェニル)スルホニル]-L-フェニルアラニンアミド、

N-[(4-メチルフェニル)スルホニル]-N-(5-{ [2-(トリフルオロメチル)ベンジル]オキシ}-1H-インダゾール-3-イル)-L-フェニルアラニンアミド、

N-[5-(2-フルオロエトキシ)-1H-インダゾール-3-イル]-N-[(4-メチルフェニル)スルホニル]-L-フェニルアラニンアミド、

N-(5-{ [2,4-ビス(トリフルオロメチル)ベンジル]オキシ}-1H-インダゾール-3-イル)-N-[(4-メチルフェニル)スルホニル]-L-フェニルアラニンアミド、

N-{5-[(2-クロロベンジル)オキシ]-1H-インダゾール-3-イル}-N-[(4-メチルフェニル)スルホニル]-L-フェニルアラニンアミド、

N-[(4-メチルフェニル)スルホニル]-N-{5-[(2,3,6-トリフルオロベンジル)オキシ]-1H-インダゾール-3-イル}-L-フェニルアラニンアミド、

N-(5-{ [4-フルオロ-2-(トリフルオロメチル)ベンジル]オキシ}-1H-インダゾール-3-イル)-N-[(4-メチルフェニル)スルホニル]-L-フェニルアラニンアミド、

N-[5-(3-フルオロプロポキシ)-1H-インダゾール-3-イル]-N-[(4-メチルフェニル)スルホニル]-L-フェニルアラニンアミド、

N-{5-[(2-メチルベンジル)オキシ]-1H-インダゾール-3-イル}-N'-フェニル尿素、

N-{5-[(2-オキソ-1-フェニルピロリジン-3-イル)オキシ]-1H-インダゾール-3-イル}-N'-フェニル尿素、

2-({3-[(アニリノカルボニル)アミノ]-1H-インダゾール-5-イル}オキシ)-N-フェニルプロパンアミド、

N-ベンジル-N'-{5-[(2-メチルベンジル)オキシ]-1H-インダゾール-3-イル}尿素、

N-ベンジル-N'-{5-[(2-オキソ-1-フェニルピロリジン-3-イル)オキシ]-1H-インダゾール-3-イル}尿素、

10

20

30

40

50

2 - [(3 - { [(ベンジルアミノ) カルボニル] アミノ } - 1 H - インダゾール - 5 -
 - イル) オキシ] - N - フェニルプロパンアミド、
 メチル [(3 - { [(ベンジルアミノ) カルボニル] アミノ } - 1 H - インダゾール
 - 5 - イル) オキシ] (フェニル) アセテート、
 N - ベンジル - N' - { 5 - [2 - オキソ - 2 - (4 - ピロリジン - 1 - イルフェニル
) エトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、
 N - イソプロピル - N' - { 5 - [(2 - メチルベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾ
 ール - 3 - イル } 尿素、
 N - { 5 - [(3 , 4 - ジクロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル
 } - N' - イソプロピル尿素、
 1 - イソプロピル - 3 - { 5 - [2 - オキソ - 2 - (4 - ピロリジン - 1 - イル - フェ
 ニル) - エトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 尿素、
 2 - ({ 3 - [(アニリノカルボニル) アミノ] - 1 H - インダゾール - 6 - イル } オ
 キシ) - N - フェニルプロパンアミド、
 メチル 2 - ({ 3 - [(アニリノカルボニル) アミノ] - 1 H - インダゾール - 6 -
 イル } オキシ) ブタノエート、
 メチル ({ 3 - [(アニリノカルボニル) アミノ] - 1 H - インダゾール - 6 - イル }
 オキシ) (フェニル) アセテート、
 1 - { 6 - [2 - オキソ - 2 - (4 - ピロリジン - 1 - イル - フェニル) - エトキシ]
 - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 3 - フェニル - 尿素、
 N - ベンジル - N' - { 6 - [(2 - メチルベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール
 - 3 - イル } 尿素、
 N - ベンジル - N' - { 6 - [2 - (1 , 1' - ビフェニル - 4 - イル) - 2 - オキソエ
 トキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、
 N - ベンジル - N' - { 6 - [(3 , 4 - ジクロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾ
 ール - 3 - イル } 尿素、
 N - ベンジル - N' - { 6 - [(2 - オキソ - 1 - フェニルピロリジン - 3 - イル) オ
 キシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、
 N - ベンジル - N' - { 6 - [(3 - メチルブタ - 2 - エニル) オキシ] - 1 H - イン
 ダゾール - 3 - イル } 尿素、
 N - ベンジル - N' - { 6 - [2 - (4 - クロロフェニル) - 2 - オキソエトキシ] -
 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、
 N - ベンジル - N' - { 6 - [2 - (2 , 5 - ジメトキシフェニル) - 2 - オキソエトキ
 シ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、
 2 - [(3 - { [(ベンジルアミノ) カルボニル] アミノ } - 1 H - インダゾール - 6
 - イル) オキシ] - N - フェニルプロパンアミド、
 メチル 2 - [(3 - { [(ベンジルアミノ) カルボニル] アミノ } - 1 H - インダゾ
 ール - 6 - イル) オキシ] ブタノエート、
 N - ベンジル - N' - [6 - (2 - オキソ - 1 , 2 - ジフェニルエトキシ) - 1 H - イン
 ダゾール - 3 - イル] 尿素、
 メチル [(3 - { [(ベンジルアミノ) カルボニル] アミノ } - 1 H - インダゾール -
 6 - イル) オキシ] (フェニル) アセテート、
 N - ベンジル - N' - { 6 - [2 - オキソ - 2 - (4 - ピロリジン - 1 - イルフェニル
) エトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、
 N - イソプロピル - N' - { 6 - [(2 - メチルベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾ
 ール - 3 - イル } 尿素、
 N - { 6 - [(3 , 4 - ジクロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル
 } - N' - イソプロピル尿素、
 N - イソプロピル - N' - { 6 - [(3 - メチルブタ - 2 - エニル) オキシ] - 1 H -
 インダゾール - 3 - イル } 尿素、

10

20

30

40

50

1 - { 6 - [2 - (4 - クロロ - フェニル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 3 - イソプロピル - 尿素、

1 - { 6 - [2 - (2,5 - ジメトキシ - フェニル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 3 - イソプロピル - 尿素、

2 - [(3 - { [(イソプロピルアミノ) カルボニル] アミノ } - 1 H - インダゾール - 6 - イル) オキシ] - N - フェニルプロパンアミド、

メチル 2 - [(3 - { [(イソプロピルアミノ) カルボニル] アミノ } - 1 H - インダゾール - 6 - イル) オキシ] ブタノエート、

1 - イソプロピル - 3 - [6 - (2 - オキソ - 1, 2 - ジフェニル - エトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 尿素、

メチル [(3 - { [(イソプロピルアミノ) カルボニル] アミノ } - 1 H - インダゾール - 6 - イル) オキシ] (フェニル) アセテート、

N - { 5 - [(3 - メチルベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - フェニル尿素、

N - { 5 - [(3,4 - ジクロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - フェニル尿素、

N - { 6 - [(3 - メチルベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - フェニル尿素、

N - { 6 - [(3 - メチルブタ - 2 - エニル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - フェニル尿素、

N - { 6 - [(2 - オキソ - 1 - フェニルピロリジン - 3 - イル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - フェニル尿素、

N - { 6 - [(3,4 - ジクロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - フェニル尿素、

N - (3 - メトキシフェニル) - N' - [5 - (プロパ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] 尿素、

N - [5 - (ベンジルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - (3 - メトキシフェニル) 尿素、

N - { 5 - [(3,4 - ジクロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - (3 - メトキシフェニル) 尿素、

N - { 6 - [(3,4 - ジクロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - (3 - メトキシフェニル) 尿素、

N - { 5 - [(2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - (3 - メトキシフェニル) 尿素、

N - { 5 - [(4 - プロモ - 2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - (3 - メトキシフェニル) 尿素、

N - { 6 - [(4 - プロモ - 2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - (3 - メトキシフェニル) 尿素、

N - [5 - (アリルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - (3 - メトキシフェニル) 尿素、

N - [6 - (アリルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - (3 - メトキシフェニル) 尿素

N - { 5 - [(3,5 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - (3 - メトキシフェニル) 尿素、

N - { 6 - [(3,5 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - (3 - メトキシフェニル) 尿素、

N - (3 - メトキシフェニル) - N' - (5 - { [3 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素、

N - (3 - メトキシフェニル) - N' - (6 - { [3 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素、

10

20

30

40

50

N - { 5 - [(3 , 5 - ジメトキシベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イ
 ル } - N' - (3 - メトキシフェニル) 尿素、
 N - { 6 - [(3 , 5 - ジメトキシベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イ
 ル } - N' - (3 - メトキシフェニル) 尿素、
 N - (3 - メトキシフェニル) - N' - { 5 - [(2 , 4 , 5 - トリフルオロベンジル)
 オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、
 N - (5 - { [2 - (ジフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール
 - 3 - イル) - N' - (3 - メトキシフェニル) 尿素、
 N - (6 - { [2 - (ジフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール
 - 3 - イル) - N' - (3 - メトキシフェニル) 尿素、
 N - (3 - メトキシフェニル) - N' - [5 - (ペンタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H -
 インダゾール - 3 - イル] 尿素、
 N - { 6 - [(9 , 10 - ジオキソ - 9 , 10 - ジヒドロアントラセン - 2 - イル) メト
 キシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - (3 - メトキシフェニル) 尿素、
 N - [5 - (ブタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - (3
 - メトキシフェニル) 尿素、
 N - [6 - (ブタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - (3
 - メトキシフェニル) 尿素、
 N - (3 - メトキシフェニル) - N' - { 5 - [(4 - ニトロベンジル) オキシ] - 1
 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、
 N - { 5 - [(2 - シアノベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N'
 ' - (3 - メトキシフェニル) 尿素、
 N - { 5 - [(3 , 5 - ジメチルイソオキサゾール - 4 - イル) メトキシ] - 1 H - イン
 ダゾール - 3 - イル } - N' - (3 - メトキシフェニル) 尿素、
 N - { 6 - [(2 , 6 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イ
 ル } - N' - (3 - メトキシフェニル) 尿素、
 N - { 5 - [(2 , 6 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イ
 ル } - N' - (3 - メトキシフェニル) 尿素、
 N - (3 - メトキシフェニル) - N' - (5 - { [2 - (トリフルオロメチル) ベンジ
 ル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素、
 N - [5 - (2 - フルオロエトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - (3
 - メトキシフェニル) 尿素、
 N - (5 - { [2 , 4 - ビス (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - イン
 ダゾール - 3 - イル) - N' - (3 - メトキシフェニル) 尿素、
 N - { 5 - [(2 - クロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N'
 ' - (3 - メトキシフェニル) 尿素、
 N - (3 - メトキシフェニル) - N' - { 5 - [(2 , 3 , 6 - トリフルオロベンジル)
 オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、
 N - (5 - { [4 - フルオロ - 2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H
 - インダゾール - 3 - イル) - N' - (3 - メトキシフェニル) 尿素、
 N - [5 - (3 - フルオロプロポキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - (3
 - メトキシフェニル) 尿素、
 N - (4 - メチルフェニル) - N' - [5 - (プロパ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - イン
 ダゾール - 3 - イル] 尿素、
 N - [5 - (ベンジルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - (4 - メチ
 ルフェニル) 尿素、
 N - { 5 - [(3 , 4 - ジクロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル
 } - N' - (4 - メチルフェニル) 尿素、
 N - { 6 - [(3 , 4 - ジクロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル
 } - N' - (4 - メチルフェニル) 尿素、

10

20

30

40

50

- N - { 5 - [(2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - (4 - メチルフェニル) 尿素、
- N - { 6 - [(2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - (4 - メチルフェニル) 尿素、
- N - { 5 - [(4 - ブロモ - 2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - (4 - メチルフェニル) 尿素
- N - [5 - (アリルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - (4 - メチルフェニル) 尿素、
- N - { 6 - [(3, 5 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - (4 - メチルフェニル) 尿素、
- N - (4 - メチルフェニル) - N' - (5 - { [3 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素、
- N - (4 - メチルフェニル) - N' - (6 - { [3 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素、
- N - { 5 - [(3, 5 - ジメトキシベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - (4 - メチルフェニル) 尿素、
- N - (4 - メチルフェニル) - N' - { 5 - [(2, 4, 5 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、
- N - (5 - { [2 - (ジフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - N' - (4 - メチルフェニル) 尿素、
- N - (4 - メチルフェニル) - N' - [5 - (ペンタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] 尿素、
- N - { 6 - [(9, 10 - ジオキソ - 9, 10 - ジヒドロアントラセン - 2 - イル) メトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - (4 - メチルフェニル) 尿素、
- N - [5 - (ブタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - (4 - メチルフェニル) 尿素、
- N - (4 - メチルフェニル) - N' - { 5 - [(4 - ニトロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、
- N - { 5 - [(2 - シアノベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - (4 - メチルフェニル) 尿素、
- N - { 5 - [(3, 5 - ジメチルイソオキサゾール - 4 - イル) メトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - (4 - メチルフェニル) 尿素、
- N - { 6 - [(2, 6 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - (4 - メチルフェニル) 尿素、
- N - { 5 - [(2, 6 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - (4 - メチルフェニル) 尿素、
- N - (4 - メチルフェニル) - N' - (5 - { [2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素、
- N - [5 - (2 - フルオロエトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - (4 - メチルフェニル) 尿素、
- N - (5 - { [2, 4 - ビス (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - N' - (4 - メチルフェニル) 尿素、
- N - { 5 - [(2 - クロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - (4 - メチルフェニル) 尿素、
- N - (4 - メチルフェニル) - N' - { 5 - [(2, 3, 6 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、
- N - (5 - { [4 - フルオロ - 2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - N' - (4 - メチルフェニル) 尿素、
- N - [5 - (3 - フルオロプロポキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - (4 - メチルフェニル) 尿素、

10

20

30

40

50

N - (3 - クロロフェニル) - N' - [5 - (プロパ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] 尿素、

N - [5 - (ベンジルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - (3 - クロロフェニル) 尿素、

N - (3 - クロロフェニル) - N' - { 5 - [(2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、

N - { 5 - [(4 - ブロモ - 2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - (3 - クロロフェニル) 尿素、

N - [5 - (アリルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - (3 - クロロフェニル) 尿素、

10

N - (3 - クロロフェニル) - N' - { 5 - [(3, 5 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、

N - (3 - クロロフェニル) - N' - (5 - { [3 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素、

N - (3 - クロロフェニル) - N' - (6 - { [3 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素、

N - (3 - クロロフェニル) - N' - { 5 - [(3, 5 - ジメトキシベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、

N - (3 - クロロフェニル) - N' - { 6 - [(3, 5 - ジメトキシベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、

20

N - (3 - クロロフェニル) - N' - { 5 - [(2, 4, 5 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、

N - (3 - クロロフェニル) - N' - (5 - { [2 - (ジフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素、

N - (3 - クロロフェニル) - N' - (6 - { [2 - (ジフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素、

N - (3 - クロロフェニル) - N' - [5 - (ペンタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] 尿素、

N - (3 - クロロフェニル) - N' - { 6 - [(9, 10 - ジオキソ - 9, 10 - ジヒドロアントラセン - 2 - イル) メトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、

30

N - [5 - (ブタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - (3 - クロロフェニル) 尿素、

N - (3 - クロロフェニル) - N' - { 5 - [(4 - ニトロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、

N - (3 - クロロフェニル) - N' - { 5 - [(2 - シアノベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、

N - (3 - クロロフェニル) - N' - { 5 - [(3, 5 - ジメチルイソオキサゾール - 4 - イル) メトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、

N - (3 - クロロフェニル) - N' - { 6 - [(2, 6 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、

40

N - (3 - クロロフェニル) - N' - { 5 - [(2, 6 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、

N - (3 - クロロフェニル) - N' - (5 - { [2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素、

N - (3 - クロロフェニル) - N' - [5 - (2 - フルオロエトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] 尿素、

N - (5 - { [2, 4 - ビス (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - N' - (3 - クロロフェニル) 尿素、

N - { 5 - [(2 - クロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - (3 - クロロフェニル) 尿素、

50

N - (3 - クロロフェニル) - N' - { 5 - [(2 , 3 , 6 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、

N - (3 - クロロフェニル) - N' - (5 - { [4 - フルオロ - 2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素、

N - (3 - クロロフェニル) - N' - [5 - (3 - フルオロプロボキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] 尿素、

N - (1 , 1' - ビフェニル - 4 - イル) - N' - [5 - (プロパ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] 尿素、

N - [5 - (ベンジルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - (1 , 1' - ビフェニル - 4 - イル) 尿素、

10

N - (1 , 1' - ビフェニル - 4 - イル) - N' - { 5 - [(2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、

N - (1 , 1' - ビフェニル - 4 - イル) - N' - { 5 - [(4 - プロモ - 2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、

N - [5 - (アリルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - (1 , 1' - ビフェニル - 4 - イル) 尿素、

N - (1 , 1' - ビフェニル - 4 - イル) - N' - { 6 - [(3 , 5 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、

N - (1 , 1' - ビフェニル - 4 - イル) - N' - (5 - { [3 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素、

20

N - (1 , 1' - ビフェニル - 4 - イル) - N' - { 5 - [(3 , 5 - ジメトキシベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、

N - (1 , 1' - ビフェニル - 4 - イル) - N' - { 6 - [(3 , 5 - ジメトキシベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、

N - (1 , 1' - ビフェニル - 4 - イル) - N' - { 5 - [(2 , 4 , 5 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、

N - (1 , 1' - ビフェニル - 4 - イル) - N' - (5 - { [2 - (ジフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素、

N - (1 , 1' - ビフェニル - 4 - イル) - N' - (6 - { [2 - (ジフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素、

30

N - (1 , 1' - ビフェニル - 4 - イル) - N' - [5 - (ペンタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] 尿素、

N - (1 , 1' - ビフェニル - 4 - イル) - N' - [5 - (ブタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] 尿素、

N - (1 , 1' - ビフェニル - 4 - イル) - N' - { 5 - [(2 - シアノベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、

N - (1 , 1' - ビフェニル - 4 - イル) - N' - { 5 - [(3 , 5 - ジメチルイソオキサゾール - 4 - イル) メトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、

N - (1 , 1' - ビフェニル - 4 - イル) - N' - { 5 - [(2 , 6 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、

40

N - (1 , 1' - ビフェニル - 4 - イル) - N' - (5 - { [2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素、

N - (1 , 1' - ビフェニル - 4 - イル) - N' - [5 - (2 - フルオロエトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] 尿素、

N - (1 , 1' - ビフェニル - 4 - イル) - N' - (5 - { [2 , 4 - ビス (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素、

N - (1 , 1' - ビフェニル - 4 - イル) - N' - { 5 - [(2 - クロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、

N - (1 , 1' - ビフェニル - 4 - イル) - N' - { 5 - [(2 , 3 , 6 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、

50

N - (1 , 1' - ビフェニル - 4 - イル) - N' - (5 - { [4 - フルオロ - 2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素、
 N - (1 , 1' - ビフェニル - 4 - イル) - N' - [5 - (3 - フルオロプロポキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] 尿素、
 N - (4 - アセチルフェニル) - N' - [5 - (プロパ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] 尿素、
 N - (4 - アセチルフェニル) - N' - { 5 - [(2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、
 N - (4 - アセチルフェニル) - N' - [5 - (アリルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] 尿素、
 N - (4 - アセチルフェニル) - N' - [6 - (アリルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] 尿素、
 N - (4 - アセチルフェニル) - N' - (6 - { [3 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素、
 N - (4 - アセチルフェニル) - N' - { 5 - [(3 , 5 - ジメトキシベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、
 N - (4 - アセチルフェニル) - N' - { 6 - [(3 , 5 - ジメトキシベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、
 N - (4 - アセチルフェニル) - N' - (5 - { [2 - (ジフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素、
 N - (4 - アセチルフェニル) - N' - (6 - { [2 - (ジフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素、
 N - (4 - アセチルフェニル) - N' - [5 - (ペンタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] 尿素、
 N - (4 - アセチルフェニル) - N' - [6 - (ペンタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] 尿素、
 N - (4 - アセチルフェニル) - N' - [5 - (ブタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] 尿素、
 N - (4 - アセチルフェニル) - N' - { 5 - [(4 - ニトロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、
 N - (4 - アセチルフェニル) - N' - { 5 - [(2 - シアノベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、
 N - (4 - アセチルフェニル) - N' - { 5 - [(3 , 5 - ジメチルイソオキサゾール - 4 - イル) メトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、
 N - (4 - アセチルフェニル) - N' - { 6 - [(2 , 6 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、
 N - (4 - アセチルフェニル) - N' - { 5 - [(2 , 6 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、
 N - (4 - アセチルフェニル) - N' - (5 - { [2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素、
 N - (4 - アセチルフェニル) - N' - [5 - (2 - フルオロエトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] 尿素、
 N - (4 - アセチルフェニル) - N' - (5 - { [2 , 4 - ビス (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素、
 N - (4 - アセチルフェニル) - N' - { 5 - [(2 , 3 , 6 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、
 N - (4 - アセチルフェニル) - N' - (5 - { [4 - フルオロ - 2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素、
 N - (4 - アセチルフェニル) - N' - [5 - (3 - フルオロプロポキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] 尿素、

10

20

30

40

50

N - (4 - アセチルフェニル) - N' - { 6 - [2 - (ベンジルオキシ) エトキシ] -
 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、
 N - ベンゾイル - N' - [5 - (プロパ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール -
 3 - イル] 尿素、
 N - ベンゾイル - N' - [6 - (プロパ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール -
 3 - イル] 尿素、
 N - ベンゾイル - N' - [5 - (ベンジルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル]
 尿素、
 N - ベンゾイル - N' - [6 - (ベンジルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル]
 尿素、
 N - ベンゾイル - N' - { 5 - [(3 , 4 - ジクロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダ
 ザゾール - 3 - イル } 尿素、
 N - ベンゾイル - N' - { 6 - [(3 , 4 - ジクロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダ
 ザゾール - 3 - イル } 尿素、
 N - ベンゾイル - N' - { 5 - [(2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾ
 ール - 3 - イル } 尿素、
 N - ベンゾイル - N' - { 6 - [(2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾ
 ール - 3 - イル } 尿素、
 N - ベンゾイル - N' - { 5 - [(4 - ブロモ - 2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1
 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、
 N - [5 - (アリルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - ベンゾイル尿
 素、
 N - [6 - (アリルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - ベンゾイル尿
 素、
 N - ベンゾイル - N' - (6 - { [3 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ }
 - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素、
 N - ベンゾイル - N' - { 5 - [(3 , 5 - ジメトキシベンジル) オキシ] - 1 H - イン
 ダゾール - 3 - イル } 尿素、
 N - ベンゾイル - N' - { 6 - [(3 , 5 - ジメトキシベンジル) オキシ] - 1 H - イン
 ダゾール - 3 - イル } 尿素、
 N - ベンゾイル - N' - { 5 - [(2 , 4 , 5 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1 H
 - インダゾール - 3 - イル } 尿素、
 N - ベンゾイル - N' - (5 - { [2 - (ジフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } -
 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素、
 N - ベンゾイル - N' - (6 - { [2 - (ジフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } -
 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素、
 N - ベンゾイル - N' - [5 - (ペンタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール -
 3 - イル] 尿素、
 N - ベンゾイル - N' - [6 - (ペンタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール -
 3 - イル] 尿素、
 N - ベンゾイル - N' - { 6 - [(9 , 10 - ジオキソ - 9 , 10 - ジヒドロアントラセ
 ン - 2 - イル) メトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、
 N - ベンゾイル - N' - [5 - (ブタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3
 - イル] 尿素、
 N - ベンゾイル - N' - { 5 - [(4 - ニトロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾ
 ール - 3 - イル } 尿素、
 N - ベンゾイル - N' - { 5 - [(2 - シアノベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾ
 ール - 3 - イル } 尿素、
 N - ベンゾイル - N' - { 5 - [(3 , 5 - ジメチルイソオキサゾール - 4 - イル) メト
 キシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、

10

20

30

40

50

N - ベンゾイル - N' - { 6 - [(2 , 6 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、

N - ベンゾイル - N' - { 5 - [(2 , 6 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、

N - ベンゾイル - N' - (5 - { [2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素、

N - ベンゾイル - N' - [5 - (2 - フルオロエトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] 尿素、

N - ベンゾイル - N' - (5 - { [2 , 4 - ビス (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素、

10

N - ベンゾイル - N' - { 5 - [(2 - クロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、

N - ベンゾイル - N' - { 5 - [(2 , 3 , 6 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、

N - ベンゾイル - N' - (5 - { [4 - フルオロ - 2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素、

N - ベンゾイル - N' - [5 - (3 - フルオロプロボキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] 尿素、

N - ベンゾイル - N' - { 6 - [2 - (ベンジルオキシ) エトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、

20

N - イソプロピル - N' - [5 - (プロパ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] 尿素、

N - [5 - (ベンジルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - イソプロピル尿素、

N - { 5 - [(3 , 4 - ジクロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - イソプロピル尿素、

N - { 5 - [(2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - イソプロピル尿素、

N - { 6 - [(2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - イソプロピル尿素、

30

N - { 5 - [(4 - ブロモ - 2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - イソプロピル尿素、

N - [5 - (アリルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - イソプロピル尿素、

N - (5 - { [2 - (ジフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - N' - イソプロピル尿素、

N - { 5 - [(9 , 10 - ジオキソ - 9 , 10 - ジヒドロアントラセン - 2 - イル) メトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - イソプロピル尿素、

N - [5 - (ブタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - イソプロピル尿素、

40

N - イソプロピル - N' - { 5 - [(4 - ニトロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、

N - { 5 - [(2 - シアノベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - イソプロピル尿素、

N - { 5 - [(3 , 5 - ジメチルイソオキサゾール - 4 - イル) メトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - イソプロピル尿素、

N - { 6 - [(2 , 6 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - イソプロピル尿素、

N - { 5 - [(2 , 6 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - イソプロピル尿素、

50

N - イソプロピル - N' - (5 - { [2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ }
 - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素、
 N - [5 - (2 - フルオロエトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - イソ
 プロピル尿素、
 N - (5 - { [2, 4 - ビス (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - イン
 ダゾール - 3 - イル) - N' - イソプロピル尿素、
 N - { 5 - [(2 - クロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N
 ' - イソプロピル尿素、
 N - イソプロピル - N' - { 5 - [(2, 3, 6 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1
 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、 10
 N - [5 - (3 - フルオロプロポキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - イ
 ソプロピル尿素、
 N - (2, 4 - ジメチルフェニル) - N' - [5 - (プロパ - 2 - イニルオキシ) - 1 H
 - インダゾール - 3 - イル] 尿素、
 N - (2, 4 - ジメチルフェニル) - N' - [6 - (プロパ - 2 - イニルオキシ) - 1 H
 - インダゾール - 3 - イル] 尿素、
 N - [5 - (ベンジルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - (2, 4 -
 ジメチルフェニル) 尿素、
 N - { 5 - [(3, 4 - ジクロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル
 } - N' - (2, 4 - ジメチルフェニル) 尿素、 20
 N - (2, 4 - ジメチルフェニル) - N' - { 5 - [(2 - フルオロベンジル) オキシ]
 - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、
 N - { 5 - [(4 - プロモ - 2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール -
 3 - イル } - N' - (2, 4 - ジメチルフェニル) 尿素、
 N - { 6 - [(4 - プロモ - 2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール -
 3 - イル } - N' - (2, 4 - ジメチルフェニル) 尿素、
 N - [5 - (アリルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - (2, 4 - ジメ
 チルフェニル) 尿素、
 N - [6 - (アリルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - (2, 4 - ジメ
 チルフェニル) 尿素、 30
 N - (2, 4 - ジメチルフェニル) - N' - (6 - { [3 - (トリフルオロメトキシ) ベ
 ンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素、
 N - { 5 - [(3, 5 - ジメトキシベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イ
 ル } - N' - (2, 4 - ジメチルフェニル) 尿素、
 N - { 6 - [(3, 5 - ジメトキシベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イ
 ル } - N' - (2, 4 - ジメチルフェニル) 尿素、
 N - (5 - { [2 - (ジフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール
 - 3 - イル) - N' - (2, 4 - ジメチルフェニル) 尿素、
 N - (2, 4 - ジメチルフェニル) - N' - [5 - (ペンタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H
 - インダゾール - 3 - イル] 尿素、 40
 N - (2, 4 - ジメチルフェニル) - N' - [6 - (ペンタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H
 - インダゾール - 3 - イル] 尿素、
 N - (2, 4 - ジメチルフェニル) - N' - { 6 - [(9, 10 - ジオキソ - 9, 10 - ジ
 ヒドロアントラセン - 2 - イル) メトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、
 N - [5 - (ブタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - (2,
 4 - ジメチルフェニル) 尿素、
 N - (2, 4 - ジメチルフェニル) - N' - { 5 - [(4 - ニトロベンジル) オキシ] -
 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、
 N - { 5 - [(2 - シアノベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N
 ' - (2, 4 - ジメチルフェニル) 尿素、 50

N - { 5 - [(3 , 5 - ジメチルイソオキサゾール - 4 - イル) メトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - (2 , 4 - ジメチルフェニル) 尿素、
 N - { 6 - [(2 , 6 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - (2 , 4 - ジメチルフェニル) 尿素、
 N - { 5 - [(2 , 6 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - (2 , 4 - ジメチルフェニル) 尿素、
 N - (2 , 4 - ジメチルフェニル) - N' - (5 - { [2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素、
 N - (2 , 4 - ジメチルフェニル) - N' - [5 - (2 - フルオロエトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] 尿素、
 N - (5 - { [2 , 4 - ビス (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - N' - (2 , 4 - ジメチルフェニル) 尿素、
 N - { 5 - [(2 - クロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - (2 , 4 - ジメチルフェニル) 尿素、
 N - (2 , 4 - ジメチルフェニル) - N' - { 5 - [(2 , 3 , 6 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、
 N - (2 , 4 - ジメチルフェニル) - N' - (5 - { [4 - フルオロ - 2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素、
 N - (2 , 4 - ジメチルフェニル) - N' - [5 - (3 - フルオロプロポキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] 尿素、
 N - { 6 - [2 - (ベンジルオキシ) エトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - (2 , 4 - ジメチルフェニル) 尿素、
 N - [2 - (ジフルオロメトキシ) フェニル] - N' - [5 - (プロパ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] 尿素、
 N - [2 - (ジフルオロメトキシ) フェニル] - N' - [6 - (プロパ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] 尿素、
 N - [5 - (ベンジルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - [2 - (ジフルオロメトキシ) フェニル] 尿素、
 N - { 5 - [(3 , 4 - ジクロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - [2 - (ジフルオロメトキシ) フェニル] 尿素、
 N - [2 - (ジフルオロメトキシ) フェニル] - N' - { 5 - [(2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、
 N - { 5 - [(4 - プロモ - 2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - [2 - (ジフルオロメトキシ) フェニル] 尿素、
 N - { 6 - [(4 - プロモ - 2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - [2 - (ジフルオロメトキシ) フェニル] 尿素、
 N - [5 - (アリルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - [2 - (ジフルオロメトキシ) フェニル] 尿素、
 N - [6 - (アリルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - [2 - (ジフルオロメトキシ) フェニル] 尿素、
 N - { 6 - [(3 , 5 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - [2 - (ジフルオロメトキシ) フェニル] 尿素、
 N - [2 - (ジフルオロメトキシ) フェニル] - N' - (5 - { [3 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素、
 N - [2 - (ジフルオロメトキシ) フェニル] - N' - { 6 - [(3 , 5 - ジメトキシベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、
 N - [2 - (ジフルオロメトキシ) フェニル] - N' - { 5 - [(2 , 4 , 5 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、
 N - [2 - (ジフルオロメトキシ) フェニル] - N' - { 6 - [(2 , 4 , 5 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、

10

20

30

40

50

- N - (5 - { [2 - (ジフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - N' - [2 - (ジフルオロメトキシ) フェニル] 尿素、
- N - (6 - { [2 - (ジフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - N' - [2 - (ジフルオロメトキシ) フェニル] 尿素、
- N - [2 - (ジフルオロメトキシ) フェニル] - N' - [5 - (ペンタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] 尿素、
- N - [2 - (ジフルオロメトキシ) フェニル] - N' - [6 - (ペンタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] 尿素、
- N - [2 - (ジフルオロメトキシ) フェニル] - N' - { 5 - [(9 , 10 - ジオキソ - 9 , 10 - ジヒドロアントラセン - 2 - イル) メトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、 10
- N - [5 - (ブタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - [2 - (ジフルオロメトキシ) フェニル] 尿素、
- N - { 6 - [(2 , 6 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - [2 - (ジフルオロメトキシ) フェニル] 尿素、
- N - (4 - フルオロベンジル) - N' - [5 - (プロパ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] 尿素、
- N - [5 - (ベンジルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - (4 - フルオロベンジル) 尿素、
- N - [6 - (ベンジルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - (4 - フルオロベンジル) 尿素、 20
- N - { 5 - [(3 , 4 - ジクロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - (4 - フルオロベンジル) 尿素、
- N - { 6 - [(3 , 4 - ジクロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - (4 - フルオロベンジル) 尿素、
- N - (4 - フルオロベンジル) - N' - { 5 - [(2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、
- N - (4 - フルオロベンジル) - N' - { 6 - [(2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、
- N - { 5 - [(4 - プロモ - 2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - (4 - フルオロベンジル) 尿素、 30
- N - { 6 - [(4 - プロモ - 2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - (4 - フルオロベンジル) 尿素、
- N - [5 - (アリルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - (4 - フルオロベンジル) 尿素、
- N - (4 - フルオロベンジル) - N' - (6 - { [3 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素、
- N - { 5 - [(3 , 5 - ジメトキシベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - (4 - フルオロベンジル) 尿素、
- N - (4 - フルオロベンジル) - N' - { 5 - [(2 , 4 , 5 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、 40
- N - (5 - { [2 - (ジフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - N' - (4 - フルオロベンジル) 尿素、
- N - (6 - { [2 - (ジフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - N' - (4 - フルオロベンジル) 尿素、
- N - (4 - フルオロベンジル) - N' - [5 - (ペンタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] 尿素、
- N - (4 - フルオロベンジル) - N' - [6 - (ペンタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] 尿素、
- N - { 6 - [(9 , 10 - ジオキソ - 9 , 10 - ジヒドロアントラセン - 2 - イル) メト 50

- キシ] - 1H - インダゾール - 3 - イル} - N' - (4 - フルオロベンジル) 尿素、
 N - [5 - (ブタ - 2 - イニルオキシ) - 1H - インダゾール - 3 - イル] - N' - (4 - フルオロベンジル) 尿素、
 N - (4 - フルオロベンジル) - N' - {5 - [(4 - ニトロベンジル) オキシ] - 1H - インダゾール - 3 - イル} 尿素、
 N - {5 - [(2 - シアノベンジル) オキシ] - 1H - インダゾール - 3 - イル} - N' - (4 - フルオロベンジル) 尿素、
 N - {5 - [(3, 5 - ジメチルイソオキサゾール - 4 - イル) メトキシ] - 1H - インダゾール - 3 - イル} - N' - (4 - フルオロベンジル) 尿素、
 N - {6 - [(2, 6 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1H - インダゾール - 3 - イル} - N' - (4 - フルオロベンジル) 尿素、
 N - {5 - [(2, 6 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1H - インダゾール - 3 - イル} - N' - (4 - フルオロベンジル) 尿素、
 N - (4 - フルオロベンジル) - N' - (5 - {[2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ} - 1H - インダゾール - 3 - イル) 尿素、
 N - (4 - フルオロベンジル) - N' - [5 - (2 - フルオロエトキシ) - 1H - インダゾール - 3 - イル] 尿素、
 N - (5 - {[2, 4 - ビス(トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ} - 1H - インダゾール - 3 - イル) - N' - (4 - フルオロベンジル) 尿素、
 N - {5 - [(2 - クロロベンジル) オキシ] - 1H - インダゾール - 3 - イル} - N' - (4 - フルオロベンジル) 尿素、
 N - (4 - フルオロベンジル) - N' - {5 - [(2, 3, 6 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1H - インダゾール - 3 - イル} 尿素、
 N - (4 - フルオロベンジル) - N' - (5 - {[4 - フルオロ - 2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ} - 1H - インダゾール - 3 - イル) 尿素、
 N - (4 - フルオロベンジル) - N' - [5 - (3 - フルオロプロポキシ) - 1H - インダゾール - 3 - イル] 尿素、
 N - {6 - [2 - (ベンジルオキシ) エトキシ] - 1H - インダゾール - 3 - イル} - N' - (4 - フルオロベンジル) 尿素、
 N - ブチル - N' - [5 - (プロパ - 2 - イニルオキシ) - 1H - インダゾール - 3 - イル] 尿素、
 N - ブチル - N' - {5 - [(3, 4 - ジクロロベンジル) オキシ] - 1H - インダゾール - 3 - イル} 尿素、
 N - ブチル - N' - {5 - [(2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1H - インダゾール - 3 - イル} 尿素、
 N - ブチル - N' - {6 - [(2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1H - インダゾール - 3 - イル} 尿素、
 N - {5 - [(4 - プロモ - 2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1H - インダゾール - 3 - イル} - N' - ブチル尿素、
 N - {6 - [(4 - プロモ - 2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1H - インダゾール - 3 - イル} - N' - ブチル尿素、
 N - [5 - (アリルオキシ) - 1H - インダゾール - 3 - イル] - N' - ブチル尿素、
 N - ブチル - N' - {5 - [(3, 5 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1H - インダゾール - 3 - イル} 尿素、
 N - ブチル - N' - (6 - {[3 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ} - 1H - インダゾール - 3 - イル) 尿素、
 N - ブチル - N' - {5 - [(3, 5 - ジメトキシベンジル) オキシ] - 1H - インダゾール - 3 - イル} 尿素、
 N - ブチル - N' - {5 - [(2, 4, 5 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1H - インダゾール - 3 - イル} 尿素、

10

20

30

40

50

- N - ブチル - N' - (5 - { [2 - (ジフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素、
- N - ブチル - N' - (6 - { [2 - (ジフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素、
- N - ブチル - N' - [5 - (ペンタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] 尿素、
- N - ブチル - N' - [6 - (ペンタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] 尿素、
- N - ブチル - N' - { 5 - [(9 , 10 - ジオキソ - 9 , 10 - ジヒドロアントラセン - 2 - イル) メトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、
- N - ブチル - N' - [5 - (プタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] 尿素、
- N - ブチル - N' - { 5 - [(4 - ニトロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、
- N - ブチル - N' - { 5 - [(2 - シアノベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、
- N - ブチル - N' - { 5 - [(3 , 5 - ジメチルイソオキサゾール - 4 - イル) メトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、
- N - ブチル - N' - { 6 - [(2 , 6 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、
- N - ブチル - N' - { 5 - [(2 , 6 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、
- N - ブチル - N' - (5 - { [2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素、
- N - ブチル - N' - [5 - (2 - フルオロエトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] 尿素、
- N - (5 - { [2 , 4 - ビス (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - N' - ブチル 尿素、
- N - ブチル - N' - { 5 - [(2 - クロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、
- N - ブチル - N' - { 5 - [(2 , 3 , 6 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、
- N - ブチル - N' - (5 - { [4 - フルオロ - 2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素、
- N - ブチル - N' - [5 - (3 - フルオロプロポキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] 尿素、
- N - [5 - (プロパ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - (2 , 3 , 4 - トリフルオロフェニル) 尿素、
- N - [5 - (ベンジルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - (2 , 3 , 4 - トリフルオロフェニル) 尿素、
- N - [5 - (アリルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - (2 , 3 , 4 - トリフルオロフェニル) 尿素、
- N - { 5 - [(3 , 5 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - (2 , 3 , 4 - トリフルオロフェニル) 尿素、
- N - { 6 - [(3 , 5 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - (2 , 3 , 4 - トリフルオロフェニル) 尿素、
- N - (6 - { [3 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - N' - (2 , 3 , 4 - トリフルオロフェニル) 尿素、
- N - { 5 - [(2 , 4 , 5 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - (2 , 3 , 4 - トリフルオロフェニル) 尿素、

- N - (5 - { [2 - (ジフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - N' - (2, 3, 4 - トリフルオロフェニル) 尿素、
- N - (6 - { [2 - (ジフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - N' - (2, 3, 4 - トリフルオロフェニル) 尿素、
- N - [5 - (ペンタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - (2, 3, 4 - トリフルオロフェニル) 尿素、
- N - [6 - (ペンタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - (2, 3, 4 - トリフルオロフェニル) 尿素、
- N - { 6 - [(9, 10 - ジオキソ - 9, 10 - ジヒドロアントラセン - 2 - イル) メトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - (2, 3, 4 - トリフルオロフェニル) 尿素、
- N - [5 - (ブタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - (2, 3, 4 - トリフルオロフェニル) 尿素、
- N - { 6 - [(2, 6 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - (2, 3, 4 - トリフルオロフェニル) 尿素、
- N - { 6 - [2 - (ベンジルオキシ) エトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - (2, 3, 4 - トリフルオロフェニル) 尿素、
- N - (3, 5 - ジメトキシフェニル) - N' - [5 - (プロパ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] 尿素、
- N - (3, 5 - ジメトキシフェニル) - N' - [6 - (プロパ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] 尿素、
- N - [5 - (ベンジルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - (3, 5 - ジメトキシフェニル) 尿素、
- N - [6 - (ベンジルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - (3, 5 - ジメトキシフェニル) 尿素、
- N - { 5 - [(3, 4 - ジクロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - (3, 5 - ジメトキシフェニル) 尿素、
- N - (3, 5 - ジメトキシフェニル) - N' - { 5 - [(2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、
- N - (3, 5 - ジメトキシフェニル) - N' - { 6 - [(2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、
- N - { 5 - [(4 - プロモ - 2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - (3, 5 - ジメトキシフェニル) 尿素、
- N - { 6 - [(4 - プロモ - 2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - (3, 5 - ジメトキシフェニル) 尿素、
- N - [5 - (アリルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - (3, 5 - ジメトキシフェニル) 尿素、
- N - [6 - (アリルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - (3, 5 - ジメトキシフェニル) 尿素、
- N - { 5 - [(3, 5 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - (3, 5 - ジメトキシフェニル) 尿素、
- N - { 6 - [(3, 5 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - (3, 5 - ジメトキシフェニル) 尿素、
- N - (3, 5 - ジメトキシフェニル) - N' - (5 - { [3 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素、
- N - (3, 5 - ジメトキシフェニル) - N' - (6 - { [3 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素、
- N - { 5 - [(3, 5 - ジメトキシベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - (3, 5 - ジメトキシフェニル) 尿素、
- N - { 6 - [(3, 5 - ジメトキシベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - (3, 5 - ジメトキシフェニル) 尿素、

- ル} - N' - (3,5 - ジメトキシフェニル) 尿素、
 N - (5 - { [2 - (ジフルオロメトキシ)ベンジル] オキシ } - 1H - インダゾール - 3 - イル) - N' - (3,5 - ジメトキシフェニル) 尿素、
 N - (6 - { [2 - (ジフルオロメトキシ)ベンジル] オキシ } - 1H - インダゾール - 3 - イル) - N' - (3,5 - ジメトキシフェニル) 尿素、
 N - (3,5 - ジメトキシフェニル) - N' - [5 - (ペンタ - 2 - イニルオキシ) - 1H - インダゾール - 3 - イル] 尿素、
 N - (3,5 - ジメトキシフェニル) - N' - [6 - (ペンタ - 2 - イニルオキシ) - 1H - インダゾール - 3 - イル] 尿素、
 N - (3,5 - ジメトキシフェニル) - N' - {6 - [(9,10 - ジオキソ - 9,10 - ジヒドロアントラセン - 2 - イル)メトキシ] - 1H - インダゾール - 3 - イル} 尿素、
 N - (3,5 - ジメトキシフェニル) - N' - {5 - [(9,10 - ジオキソ - 9,10 - ジヒドロアントラセン - 2 - イル)メトキシ] - 1H - インダゾール - 3 - イル} 尿素、
 N - [5 - (ブタ - 2 - イニルオキシ) - 1H - インダゾール - 3 - イル] - N' - (3,5 - ジメトキシフェニル) 尿素、
 N - [6 - (ブタ - 2 - イニルオキシ) - 1H - インダゾール - 3 - イル] - N' - (3,5 - ジメトキシフェニル) 尿素、
 N - (3,5 - ジメトキシフェニル) - N' - {5 - [(4 - ニトロベンジル) オキシ] - 1H - インダゾール - 3 - イル} 尿素、
 N - {5 - [(2 - シアノベンジル) オキシ] - 1H - インダゾール - 3 - イル} - N' - (3,5 - ジメトキシフェニル) 尿素、
 N - (3,5 - ジメトキシフェニル) - N' - {5 - [(3,5 - ジメチルイソオキサゾール - 4 - イル)メトキシ] - 1H - インダゾール - 3 - イル} 尿素、
 N - {6 - [(2,6 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1H - インダゾール - 3 - イル} - N' - (3,5 - ジメトキシフェニル) 尿素、
 N - {5 - [(2,6 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1H - インダゾール - 3 - イル} - N' - (3,5 - ジメトキシフェニル) 尿素、
 N - (3,5 - ジメトキシフェニル) - N' - [5 - (2 - フルオロエトキシ) - 1H - インダゾール - 3 - イル] 尿素、
 N - (5 - { [2,4 - ビス(トリフルオロメチル)ベンジル] オキシ } - 1H - インダゾール - 3 - イル) - N' - (3,5 - ジメトキシフェニル) 尿素、
 N - {5 - [(2 - クロロベンジル) オキシ] - 1H - インダゾール - 3 - イル} - N' - (3,5 - ジメトキシフェニル) 尿素、
 N - (3,5 - ジメトキシフェニル) - N' - {5 - [(2,3,6 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1H - インダゾール - 3 - イル} 尿素、
 N - (3,5 - ジメトキシフェニル) - N' - (5 - { [4 - フルオロ - 2 - (トリフルオロメチル)ベンジル] オキシ } - 1H - インダゾール - 3 - イル) 尿素、
 N - (3,5 - ジメトキシフェニル) - N' - [5 - (3 - フルオロプロポキシ) - 1H - インダゾール - 3 - イル] 尿素、
 N - [5 - (ベンジルオキシ) - 1H - インダゾール - 3 - イル] - N' - [2 - (メチルチオ)フェニル] 尿素、
 N - {5 - [(4 - プロモ - 2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1H - インダゾール - 3 - イル} - N' - [2 - (メチルチオ)フェニル] 尿素、
 N - [5 - (アリルオキシ) - 1H - インダゾール - 3 - イル] - N' - [2 - (メチルチオ)フェニル] 尿素、
 N - [2 - (メチルチオ)フェニル] - N' - (5 - { [3 - (トリフルオロメトキシ)ベンジル] オキシ } - 1H - インダゾール - 3 - イル) 尿素、
 N - [2 - (メチルチオ)フェニル] - N' - {5 - [(2,4,5 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1H - インダゾール - 3 - イル} 尿素、

- 1 - (5 - { [2 - (ジフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 3 - [2 - (メチルスルファニル) フェニル] 尿素、
- 1 - [2 - (メチルスルファニル) フェニル] - 3 - [5 - (ペンタ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] 尿素、
- N - [5 - (ブタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - [2 - (メチルチオ) フェニル] 尿素、
- N - [2 - (メチルチオ) フェニル] - N' - { 5 - [(4 - ニトロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、
- N - { 5 - [(2 - シアノベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - [2 - (メチルチオ) フェニル] 尿素、
- N - { 5 - [(3, 5 - ジメチルイソオキサゾール - 4 - イル) メトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - [2 - (メチルチオ) フェニル] 尿素、
- N - { 5 - [(2, 6 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - [2 - (メチルチオ) フェニル] 尿素、
- N - { 5 - [(2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - [2 - (メチルチオ) フェニル] 尿素、
- N - [2 - (メチルチオ) フェニル] - N' - (5 - { [2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素、
- N - [5 - (2 - フルオロエトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - [2 - (メチルチオ) フェニル] 尿素、
- N - (5 - { [2, 4 - ビス (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - N' - [2 - (メチルチオ) フェニル] 尿素、
- N - { 5 - [(2 - クロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - [2 - (メチルチオ) フェニル] 尿素、
- N - [2 - (メチルチオ) フェニル] - N' - { 5 - [(2, 3, 6 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、
- N - (5 - { [4 - フルオロ - 2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - N' - [2 - (メチルチオ) フェニル] 尿素、
- N - [5 - (3 - フルオロプロポキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - [2 - (メチルチオ) フェニル] 尿素、
- N - [5 - (ブタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - [3 - (トリフルオロメチル) フェニル] 尿素、
- N - { 5 - [(4 - ニトロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - [3 - (トリフルオロメチル) フェニル] 尿素、
- N - { 5 - [(2 - シアノベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - [3 - (トリフルオロメチル) フェニル] 尿素、
- N - { 5 - [(3, 5 - ジメチルイソオキサゾール - 4 - イル) メトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - [3 - (トリフルオロメチル) フェニル] 尿素、
- N - { 5 - [(2, 6 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - [3 - (トリフルオロメチル) フェニル] 尿素、
- N - (5 - { [2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - N' - [3 - (トリフルオロメチル) フェニル] 尿素、
- N - [5 - (2 - フルオロエトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - [3 - (トリフルオロメチル) フェニル] 尿素、
- N - (5 - { [2, 4 - ビス (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - N' - [3 - (トリフルオロメチル) フェニル] 尿素、
- N - { 5 - [(2 - クロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - [3 - (トリフルオロメチル) フェニル] 尿素、
- N - { 5 - [(2, 3, 6 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - [3 - (トリフルオロメチル) フェニル] 尿素、

N - (5 - { [4 - フルオロ - 2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - N' - [3 - (トリフルオロメチル) フェニル] 尿素、
 N - [5 - (3 - フルオロプロポキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - [3 - (トリフルオロメチル) フェニル] 尿素、
 N - [5 - (アリルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - (2 - フルオロフェニル) 尿素、
 N - (2 - フルオロフェニル) - N' - (5 - { [3 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素、
 1 - (5 - { [2 - (ジフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 3 - (2 - フルオロフェニル) 尿素、
 1 - (2 - フルオロフェニル) - 3 - [5 - (ペンタ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] 尿素、
 N - [5 - (ブタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - (2 - フルオロフェニル) 尿素、
 N - { 5 - [(2 - シアノベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - (2 - フルオロフェニル) 尿素、
 N - { 5 - [(3 , 5 - ジメチルイソオキサゾール - 4 - イル) メトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - (2 - フルオロフェニル) 尿素、
 N - { 5 - [(2 , 6 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - (2 - フルオロフェニル) 尿素、
 N - { 5 - [(2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - (2 - フルオロフェニル) 尿素、
 N - (2 - フルオロフェニル) - N' - (5 - { [2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素、
 N - (5 - { [2 , 4 - ビス (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - N' - (2 - フルオロフェニル) 尿素、
 N - { 5 - [(2 - クロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - (2 - フルオロフェニル) 尿素、
 N - (2 - フルオロフェニル) - N' - { 5 - [(2 , 3 , 6 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、
 N - (2 - フルオロフェニル) - N' - (5 - { [4 - フルオロ - 2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素、
 N - (2 - フルオロフェニル) - N' - [5 - (3 - フルオロプロポキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] 尿素、
 N - [5 - (ベンジルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - (2 - フェニルエチル) 尿素、
 N - { 5 - [(4 - プロモ - 2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - (2 - フェニルエチル) 尿素、
 N - [5 - (アリルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - (2 - フェニルエチル) 尿素、
 N - (2 - フェニルエチル) - N' - (5 - { [3 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素、
 1 - (2 - フェニルエチル) - 3 - { 5 - [(2 , 4 , 5 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、
 1 - (5 - { [2 - (ジフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 3 - (2 - フェニルエチル) 尿素、
 1 - [5 - (ペンタ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 3 - (2 - フェニルエチル) 尿素、
 N - [5 - (ブタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - (2 - フェニルエチル) 尿素、

10

20

30

40

50

- N - { 5 - [(2 - シアノベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - (2 - フェニルエチル) 尿素、
- N - { 5 - [(3 , 5 - ジメチルイソオキサゾール - 4 - イル) メトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - (2 - フェニルエチル) 尿素、
- N - { 5 - [(2 , 6 - ジフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - (2 - フェニルエチル) 尿素、
- N - { 5 - [(2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - (2 - フェニルエチル) 尿素、
- N - (2 - フェニルエチル) - N' - (5 - { [2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素、
- N - [5 - (2 - フルオロエトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - (2 - フェニルエチル) 尿素、
- N - (5 - { [2 , 4 - ビス (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - N' - (2 - フェニルエチル) 尿素、
- N - { 5 - [(2 - クロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - (2 - フェニルエチル) 尿素、
- N - (2 - フェニルエチル) - N' - { 5 - [(2 , 3 , 6 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、
- N - (5 - { [4 - フルオロ - 2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - N' - (2 - フェニルエチル) 尿素、
- N - [5 - (3 - フルオロプロポキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - (2 - フェニルエチル) 尿素、
- N - { 5 - [(4 - プロモ - 2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - (4 - メトキシフェニル) 尿素、
- N - [5 - (アリルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - (4 - メトキシフェニル) 尿素、
- N - (4 - メトキシフェニル) - N' - (5 - { [3 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素、
- 1 - (4 - メトキシフェニル) - 3 - [5 - (ペンタ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] 尿素、
- N - [5 - (ブタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - (4 - メトキシフェニル) 尿素、
- N - { 5 - [(3 , 5 - ジメチルイソオキサゾール - 4 - イル) メトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - (4 - メトキシフェニル) 尿素、
- N - { 5 - [(2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - (4 - メトキシフェニル) 尿素、
- N - (4 - メトキシフェニル) - N' - (5 - { [2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素、
- N - (5 - { [2 , 4 - ビス (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - N' - (4 - メトキシフェニル) 尿素、
- N - { 5 - [(2 - クロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - (4 - メトキシフェニル) 尿素、
- N - (4 - メトキシフェニル) - N' - { 5 - [(2 , 3 , 6 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、
- N - (5 - { [4 - フルオロ - 2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - N' - (4 - メトキシフェニル) 尿素、
- N - [5 - (3 - フルオロプロポキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - (4 - メトキシフェニル) 尿素、
- N - (1 , 3 - ベンゾジオキサゾール - 5 - イル) - N' - { 5 - [(4 - プロモ - 2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、

10

20

30

40

50

N - [5 - (アリルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - (1, 3 - ベンゾジオキソール - 5 - イル) 尿素、

N - (1, 3 - ベンゾジオキソール - 5 - イル) - N' - (5 - { [3 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素、

1 - (1, 3 - ベンゾジオキソール - 5 - イル) - 3 - (5 - { [2 - (ジフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素、

N - (1, 3 - ベンゾジオキソール - 5 - イル) - N' - [5 - (ブタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] 尿素、

N - (1, 3 - ベンゾジオキソール - 5 - イル) - N' - { 5 - [(3, 5 - ジメチルイソオキサゾール - 4 - イル) メトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、

10

N - (1, 3 - ベンゾジオキソール - 5 - イル) - N' - { 5 - [(2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、

N - (1, 3 - ベンゾジオキソール - 5 - イル) - N' - (5 - { [2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素、

N - (1, 3 - ベンゾジオキソール - 5 - イル) - N' - (5 - { [2, 4 - ビス (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素、

N - (1, 3 - ベンゾジオキソール - 5 - イル) - N' - { 5 - [(2 - クロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、

N - (1, 3 - ベンゾジオキソール - 5 - イル) - N' - { 5 - [(2, 3, 6 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、

20

N - (1, 3 - ベンゾジオキソール - 5 - イル) - N' - (5 - { [4 - フルオロ - 2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素、

N - (1, 3 - ベンゾジオキソール - 5 - イル) - N' - [5 - (3 - フルオロプロポキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] 尿素、

メチル 3 - [({ [5 - (ベンジルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] アミノ } カルボニル) アミノ] ベンゾエート、

メチル 3 - { [({ 5 - [(4 - プロモ - 2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } アミノ) カルボニル] アミノ } ベンゾエート、

メチル 3 - [({ [5 - (アリルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] アミノ } カルボニル) アミノ] ベンゾエート、

30

メチル 3 - ({ [(5 - { [3 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) アミノ] カルボニル } アミノ) ベンゾエート、

メチル 3 - { [(5 - { [2 - (ジフルオロメトキシ) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) カルバモイル] アミノ } ベンゾエート、

メチル 3 - ({ [5 - (ペンタ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] カルバモイル } アミノ) ベンゾエート、

メチル 3 - [({ [5 - (ブタ - 2 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] アミノ } カルボニル) アミノ] ベンゾエート、

メチル 3 - { [({ 5 - [(2 - フルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } アミノ) カルボニル] アミノ } ベンゾエート、

40

メチル 3 - ({ [(5 - { [2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) アミノ] カルボニル } アミノ) ベンゾエート、

メチル 3 - ({ [(5 - { [2, 4 - ビス (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) アミノ] カルボニル } アミノ) ベンゾエート、

メチル 3 - { [({ 5 - [(2 - クロロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } アミノ) カルボニル] アミノ } ベンゾエート、

メチル 3 - { [({ 5 - [(2, 3, 6 - トリフルオロベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } アミノ) カルボニル] アミノ } ベンゾエート、

メチル 3 - ({ [(5 - { [4 - フルオロ - 2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) アミノ] カルボニル } アミノ) ベンゾエート、

50

メチル 3 - [({ [5 - (3 - フルオロプロボキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] アミノ } カルボニル) アミノ] ベンゾエート、
 N - (5 - { [5 - (ベンジルオキシ) ベンチル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 3 - フェニルプロパンアミド、
 N - (5 - メトキシ - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 3 - フェニルプロパンアミド、
 N - (5 - { [5 - (ベンジルオキシ) ベンチル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) シクロプロパンカルボキサミド、
 N - { 5 - [2 - (ピロリジン - 1 - イル) エトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } シクロプロパンカルボキサミド、
 N - [5 - (ヘキシルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] シクロプロパンカルボキサミド、
 N - { 5 - [2 - (4 - メチル - 1, 3 - チアゾール - 5 - イル) エトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } シクロプロパンカルボキサミド、
 N - [5 - (ブタ - 3 - イン - 1 - イルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] シクロプロパンカルボキサミド、
 N - { 5 - [2 - (ピペリジン - 1 - イル) エトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } シクロプロパンカルボキサミド、
 N - (5 - { [5 - (ベンジルオキシ) ベンチル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 2 - (4 - tert - ブチルフェノキシ) アセトアミド、
 2 - (4 - tert - ブチルフェノキシ) - N - [5 - (ヘキシルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] アセトアミド、
 2 - (4 - tert - ブチルフェノキシ) - N - { 5 - [2 - (4 - メチル - 1, 3 - チアゾール - 5 - イル) エトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } アセトアミド、
 2 - (4 - tert - ブチルフェノキシ) - N - [5 - (ブタ - 3 - イン - 1 - イルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] アセトアミド、
 2 - (4 - tert - ブチルフェノキシ) - N - [5 - (テトラヒドロフラン - 2 - イルメトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] アセトアミド、
 N - (5 - { 2 - [4 - (アセチルアミノ) フェノキシ] エトキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 2 - (4 - tert - ブチルフェノキシ) アセトアミド、
 N - (5 - { [5 - (ベンジルオキシ) ベンチル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 2 - (4 - メトキシフェニル) アセトアミド、
 2 - (4 - tert - ブチルフェノキシ) - N - { 6 - [2 - (4 - メチル - 1, 3 - チアゾール - 5 - イル) エトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } アセトアミド、
 2 - (4 - tert - ブチルフェノキシ) - N - [6 - (ブタ - 3 - イン - 1 - イルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] アセトアミド、
 N - (6 - メトキシ - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 2 - (4 - メトキシフェニル) アセトアミド、
 N - [6 - (シクロペンチルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] ベンズアミド、
 N - [5 - (シクロペンチルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] ベンズアミド、
 N - { 5 - [(3 - メトキシベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、
 N - (5 - メトキシ - 1 H - インダゾール - 3 - イル) ベンズアミド、
 N - [5 - (4 - フルオロプロトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] ベンズアミド、
 N - { 6 - [3 - (ジメチルアミノ) プロボキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、
 N - [6 - (2 - シクロプロピルエトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] ベンズ

10

20

30

40

50

アミド、

N - [6 - (シクロペンチルメトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] ベンズアミド、

N - { 6 - [(1 , 5 - ジメチルヘキシル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、

N - { 6 - [2 - (1 - メチルピロリジン - 2 - イル) エトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、

N - [6 - (シクロペンチルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 1 , 3 - ベンゾジオキソール - 5 - カルボキサミド、

N - [5 - (シクロペンチルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 1 , 3 - ベンゾジオキソール - 5 - カルボキサミド、

N - { 5 - [(3 - メトキシベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 1 , 3 - ベンゾジオキソール - 5 - カルボキサミド、

N - (5 - メトキシ - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 1 , 3 - ベンゾジオキソール - 5 - カルボキサミド、

N - [5 - (4 - フルオロプロトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 1 , 3 - ベンゾジオキソール - 5 - カルボキサミド、

N - { 6 - [3 - (ジメチルアミノ) プロポキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 1 , 3 - ベンゾジオキソール - 5 - カルボキサミド、

N - [6 - (2 - シクロプロピルエトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 1 , 3 - ベンゾジオキソール - 5 - カルボキサミド、

N - [6 - (シクロペンチルメトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 1 , 3 - ベンゾジオキソール - 5 - カルボキサミド、

N - [6 - (2 - チエン - 3 - イルエトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 1 , 3 - ベンゾジオキソール - 5 - カルボキサミド、

N - { 6 - [(1 , 5 - ジメチルヘキシル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 1 , 3 - ベンゾジオキソール - 5 - カルボキサミド、

N - { 6 - [2 - (1 - メチルピロリジン - 2 - イル) エトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 1 , 3 - ベンゾジオキソール - 5 - カルボキサミド、

N - (6 - イソプロトキシ - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 1 , 3 - ベンゾジオキソール - 5 - カルボキサミド、

N - [6 - (シクロペンチルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 1 - ナフトアミド、

N - [5 - (シクロペンチルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 1 - ナフトアミド、

N - { 5 - [(3 - メトキシベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 1 - ナフトアミド、

N - (5 - メトキシ - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 1 - ナフトアミド、

N - [5 - (4 - フルオロプロトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 1 - ナフトアミド、

N - { 6 - [3 - (ジメチルアミノ) プロポキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 1 - ナフトアミド、

N - [6 - (シクロペンチルメトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 1 - ナフトアミド、

N - [6 - (シクロヘキサ - 3 - エン - 1 - イルメトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 1 - ナフトアミド、

N - { 6 - [2 - (1 - メチルピロリジン - 2 - イル) エトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 1 - ナフトアミド、

N - [6 - (シクロペンチルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 2 - フルアミド、

10

20

30

40

50

- N - { 5 - [(3 - メトキシベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 2 - フルアミド、
- N - (5 - メトキシ - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 2 - フルアミド、
- N - [5 - (4 - フルオロプトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 2 - フルアミド、
- N - { 6 - [3 - (ジメチルアミノ) プロポキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 2 - フルアミド、
- N - [6 - (2 - シクロプロピルエトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 2 - フルアミド、
- N - [6 - (シクロペンチルメトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 2 - フルアミド、
- N - [6 - (2 - チエン - 3 - イルエトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 2 - フルアミド、
- N - { 6 - [(1, 5 - ジメチルヘキシル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 2 - フルアミド、
- N - { 6 - [2 - (1 - メチルピロリジン - 2 - イル) エトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 2 - フルアミド、
- N - (6 - イソプトキシ - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 2 - フルアミド、
- N - [6 - (シクロペンチルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 4 - (ジメチルアミノ) ベンズアミド、
- 4 - (ジメチルアミノ) - N - { 5 - [(3 - メトキシベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、
- 4 - (ジメチルアミノ) - N - (5 - メトキシ - 1 H - インダゾール - 3 - イル) ベンズアミド、
- 4 - (ジメチルアミノ) - N - [5 - (4 - フルオロプトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] ベンズアミド、
- 4 - (ジメチルアミノ) - N - { 6 - [3 - (ジメチルアミノ) プロポキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、
- N - [6 - (2 - シクロプロピルエトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 4 - (ジメチルアミノ) ベンズアミド、
- N - [6 - (シクロペンチルメトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 4 - (ジメチルアミノ) ベンズアミド、
- 4 - (ジメチルアミノ) - N - [6 - (2 - チエン - 3 - イルエトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] ベンズアミド、
- 4 - (ジメチルアミノ) - N - { 6 - [(1, 5 - ジメチルヘキシル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、
- 4 - (ジメチルアミノ) - N - { 6 - [2 - (1 - メチルピロリジン - 2 - イル) エトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、
- N - [5 - (シクロペンチルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 4 - (トリフルオロメチル) ベンズアミド、
- N - [6 - (シクロペンチルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 4 - (トリフルオロメチル) ベンズアミド、
- N - { 5 - [(3 - メトキシベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 4 - (トリフルオロメチル) ベンズアミド、
- N - (5 - メトキシ - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 4 - (トリフルオロメチル) ベンズアミド、
- N - [5 - (4 - フルオロプトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 4 - (トリフルオロメチル) ベンズアミド、
- N - { 6 - [3 - (ジメチルアミノ) プロポキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 4 - (トリフルオロメチル) ベンズアミド、

- N - [6 - (2 - シクロプロピルエトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 4 - (トリフルオロメチル) ベンズアミド、
- N - [6 - (シクロペンチルメトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 4 - (トリフルオロメチル) ベンズアミド、
- N - [6 - (シクロヘキサ - 3 - エン - 1 - イルメトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 4 - (トリフルオロメチル) ベンズアミド、
- N - [6 - (2 - チエン - 3 - イルエトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 4 - (トリフルオロメチル) ベンズアミド、
- N - { 6 - [2 - (1 - メチルピロリジン - 2 - イル) エトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 4 - (トリフルオロメチル) ベンズアミド、
- 3, 5 - ジクロロ - N - [6 - (シクロペンチルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] ベンズアミド、
- 3, 5 - ジクロロ - N - { 5 - [(3 - メトキシベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、
- 3, 5 - ジクロロ - N - (5 - メトキシ - 1 H - インダゾール - 3 - イル) ベンズアミド、
- 3, 5 - ジクロロ - N - [5 - (4 - フルオロプロトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] ベンズアミド、
- 3, 5 - ジクロロ - N - { 6 - [3 - (ジメチルアミノ) プロポキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、
- 3, 5 - ジクロロ - N - [6 - (2 - シクロプロピルエトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] ベンズアミド、
- 3, 5 - ジクロロ - N - [6 - (シクロペンチルメトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] ベンズアミド、
- 3, 5 - ジクロロ - N - [6 - (2 - チエン - 3 - イルエトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] ベンズアミド、
- 3, 5 - ジクロロ - N - { 6 - [(1, 5 - ジメチルヘキシル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、
- 3, 5 - ジクロロ - N - { 6 - [2 - (1 - メチルピロリジン - 2 - イル) エトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、
- 2 - (ベンジルオキシ) - N - { 5 - [(3 - メチルベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } アセトアミド、
- 2 - (ベンジルオキシ) - N - [6 - (シクロペンチルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] アセトアミド、
- 2 - (ベンジルオキシ) - N - { 5 - [(3 - メトキシベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } アセトアミド、
- 2 - (ベンジルオキシ) - N - (5 - メトキシ - 1 H - インダゾール - 3 - イル) アセトアミド、
- 2 - (ベンジルオキシ) - N - [5 - (4 - フルオロプロトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] アセトアミド、
- 2 - (ベンジルオキシ) - N - { 6 - [3 - (ジメチルアミノ) プロポキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } アセトアミド、
- 2 - (ベンジルオキシ) - N - [6 - (2 - シクロプロピルエトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] アセトアミド、
- 2 - (ベンジルオキシ) - N - [6 - (シクロペンチルメトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] アセトアミド、
- 2 - (ベンジルオキシ) - N - [6 - (2 - チエン - 3 - イルエトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] アセトアミド、
- 2 - (ベンジルオキシ) - N - { 6 - [(1, 5 - ジメチルヘキシル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } アセトアミド、

10

20

30

40

50

2 - (ベンジルオキシ) - N - { 6 - [2 - (1 - メチルピロリジン - 2 - イル) エトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } アセトアミド、

4 - tert - ブチル - N - [6 - (シクロペンチルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] ベンズアミド、

4 - tert - ブチル - N - { 5 - [(3 - メトキシベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、

4 - tert - ブチル - N - (5 - メトキシ - 1 H - インダゾール - 3 - イル) ベンズアミド、

4 - tert - ブチル - N - [5 - (4 - フルオロプロトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] ベンズアミド、

4 - tert - ブチル - N - { 6 - [3 - (ジメチルアミノ) プロポキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、

4 - tert - ブチル - N - [6 - (2 - チエン - 3 - イルエトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] ベンズアミド、

4 - tert - ブチル - N - { 6 - [(1 , 5 - ジメチルヘキシル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、

4 - tert - ブチル - N - { 6 - [2 - (1 - メチルピロリジン - 2 - イル) エトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、

N - [6 - (シクロペンチルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 3 , 4 - ジメトキシベンズアミド、

3 , 4 - ジメトキシ - N - { 5 - [(3 - メトキシベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、

3 , 4 - ジメトキシ - N - (5 - メトキシ - 1 H - インダゾール - 3 - イル) ベンズアミド、

N - [5 - (4 - フルオロプロトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 3 , 4 - ジメトキシベンズアミド、

N - { 6 - [3 - (ジメチルアミノ) プロポキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 3 , 4 - ジメトキシベンズアミド、

N - [6 - (2 - シクロプロピルエトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 3 , 4 - ジメトキシベンズアミド、

3 , 4 - ジメトキシ - N - [6 - (2 - チエン - 3 - イルエトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] ベンズアミド、

N - { 6 - [(1 , 5 - ジメチルヘキシル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 3 , 4 - ジメトキシベンズアミド、

3 , 4 - ジメトキシ - N - { 6 - [2 - (1 - メチルピロリジン - 2 - イル) エトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、

N - [6 - (シクロペンチルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 2 - フルオロベンズアミド、

2 - フルオロ - N - { 5 - [(3 - メトキシベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、

2 - フルオロ - N - (5 - メトキシ - 1 H - インダゾール - 3 - イル) ベンズアミド、

2 - フルオロ - N - [5 - (4 - フルオロプロトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] ベンズアミド、

N - { 6 - [3 - (ジメチルアミノ) プロポキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 2 - フルオロベンズアミド、

N - [6 - (2 - シクロプロピルエトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 2 - フルオロベンズアミド、

N - [6 - (シクロペンチルメトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 2 - フルオロベンズアミド、

2 - フルオロ - N - [6 - (2 - チエン - 3 - イルエトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 2 - フルオロベンズアミド、

10

20

30

40

50

- 3 - イル] ベンズアミド、
 N - { 6 - [(1 , 5 - ジメチルヘキシル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 2 - フルオロベンズアミド、
 2 - フルオロ - N - { 6 - [2 - (1 - メチルピロリジン - 2 - イル) エトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、
 N - [6 - (シクロペンチルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 4 - (トリフルオロメトキシ) ベンズアミド、
 N - { 5 - [(3 - メトキシベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 4 - (トリフルオロメトキシ) ベンズアミド、
 N - (5 - メトキシ - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 4 - (トリフルオロメトキシ) ベンズアミド、
 N - [5 - (4 - フルオロプロトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 4 - (トリフルオロメトキシ) ベンズアミド、
 N - { 6 - [3 - (ジメチルアミノ) プロポキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 4 - (トリフルオロメトキシ) ベンズアミド、
 N - [6 - (2 - シクロプロピルエトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 4 - (トリフルオロメトキシ) ベンズアミド、
 N - [6 - (シクロペンチルメトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 4 - (トリフルオロメトキシ) ベンズアミド、
 N - [6 - (シクロヘキサ - 3 - エン - 1 - イルメトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 4 - (トリフルオロメトキシ) ベンズアミド、
 N - [6 - (2 - チエン - 3 - イルエトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 4 - (トリフルオロメトキシ) ベンズアミド、
 N - { 6 - [(1 , 5 - ジメチルヘキシル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 4 - (トリフルオロメトキシ) ベンズアミド、
 N - { 6 - [2 - (1 - メチルピロリジン - 2 - イル) エトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 4 - (トリフルオロメトキシ) ベンズアミド、
 1 - アセチル - N - [6 - (シクロペンチルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] ピペリジン - 4 - カルボキサミド、
 1 - アセチル - N - { 6 - [3 - (ジメチルアミノ) プロポキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ピペリジン - 4 - カルボキサミド、
 1 - アセチル - N - [6 - (2 - シクロプロピルエトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] ピペリジン - 4 - カルボキサミド、
 1 - アセチル - N - [6 - (2 - チエン - 3 - イルエトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] ピペリジン - 4 - カルボキサミド、
 N - [6 - (シクロペンチルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 2 - フェノキシプロパンアミド、
 N - { 5 - [(3 - メトキシベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 2 - フェノキシプロパンアミド、
 N - (5 - メトキシ - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 2 - フェノキシプロパンアミド、
 N - [5 - (4 - フルオロプロトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 2 - フェノキシプロパンアミド、
 N - { 6 - [3 - (ジメチルアミノ) プロポキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 2 - フェノキシプロパンアミド、
 N - [6 - (2 - シクロプロピルエトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 2 - フェノキシプロパンアミド、
 N - [6 - (シクロペンチルメトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 2 - フェノキシプロパンアミド、
 2 - フェノキシ - N - [6 - (2 - チエン - 3 - イルエトキシ) - 1 H - インダゾール

10

20

30

40

50

- 3 - イル] プロパンアミド、
- N - { 6 - [(1, 5 - ジメチルヘキシル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 2 - フェノキシプロパンアミド、
- N - (6 - イソプトキシ - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 2 - フェノキシプロパンアミド、
- 2 - メトキシ - N - { 5 - [(3 - メトキシベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } アセトアミド、
- 2 - メトキシ - N - (5 - メトキシ - 1 H - インダゾール - 3 - イル) アセトアミド、
- N - [5 - (4 - フルオロプトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 2 - メトキシアセトアミド、
- N - [2 - ({ 5 - [(3 - メトキシベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } アミノ) - 2 - オキソエチル] ベンズアミド、
- N - { 2 - [(5 - メトキシ - 1 H - インダゾール - 3 - イル) アミノ] - 2 - オキソエチル } ベンズアミド、
- N - (2 - { [5 - (4 - フルオロプトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] アミノ } - 2 - オキソエチル) ベンズアミド、
- 4 - プロモ - N - { 5 - [(3 - メトキシベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、
- 4 - プロモ - N - (5 - メトキシ - 1 H - インダゾール - 3 - イル) ベンズアミド、
- 4 - プロモ - N - [5 - (4 - フルオロプトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] ベンズアミド、
- 4 - フルオロ - N - { 5 - [(3 - メトキシベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、
- 4 - フルオロ - N - (5 - メトキシ - 1 H - インダゾール - 3 - イル) ベンズアミド、
- 4 - フルオロ - N - [5 - (4 - フルオロプトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] ベンズアミド、
- 4 - ブトキシ - N - { 5 - [(3 - メトキシベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、
- 4 - ブトキシ - N - (5 - メトキシ - 1 H - インダゾール - 3 - イル) ベンズアミド、
- 4 - ブトキシ - N - [5 - (4 - フルオロプトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] ベンズアミド、
- 3 - クロロ - 4 - フルオロ - N - { 5 - [(3 - メトキシベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンズアミド、
- 3 - クロロ - 4 - フルオロ - N - (5 - メトキシ - 1 H - インダゾール - 3 - イル) ベンズアミド、
- 3 - クロロ - 4 - フルオロ - N - [5 - (4 - フルオロプトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] ベンズアミド、
- 2 - エトキシ - N - { 5 - [(3 - メトキシベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - 1 - ナフトアミド、
- 2 - エトキシ - N - (5 - メトキシ - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 1 - ナフトアミド、
- 2 - エトキシ - N - [5 - (4 - フルオロプトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 1 - ナフトアミド、
- 3 - クロロ - N - { 5 - [(3 - メトキシベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } チオフェン - 2 - カルボキサミド、
- 3 - クロロ - N - (5 - メトキシ - 1 H - インダゾール - 3 - イル) チオフェン - 2 - カルボキサミド、
- 3 - クロロ - N - [5 - (4 - フルオロプトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] チオフェン - 2 - カルボキサミド、
- N - { 5 - [(3 - メトキシベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } -

10

20

30

40

50

- 3, 5 - ジメチルイソオキサゾール - 4 - カルボキサミド、
 N - (5 - メトキシ - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 3, 5 - ジメチルイソオキサ
 ザール - 4 - カルボキサミド、
 N - [5 - (4 - フルオロプトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 3, 5 - ジ
 メチルイソオキサゾール - 4 - カルボキサミド、
 4 - エチル - N - { 5 - [(3 - メトキシベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール -
 3 - イル } ベンズアミド、
 4 - エチル - N - (5 - メトキシ - 1 H - インダゾール - 3 - イル) ベンズアミド、
 4 - エチル - N - [5 - (4 - フルオロプトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル]
 ベンズアミド、
 N - { 5 - [(3 - メトキシベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } -
 2 - プロピルペンタンアミド、
 N - (5 - メトキシ - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 2 - プロピルペンタンアミド
 、
 N - [5 - (4 - フルオロプトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 2 - プロピ
 ルペンタンアミド、
 N - [6 - (シクロベンチルメトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 2 - プロ
 ピルペンタンアミド、
 N - { 6 - [(1, 5 - ジメチルヘキシル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル
 } - 2 - プロピルペンタンアミド、
 3, 5 - ジメトキシ - N - { 5 - [(3 - メトキシベンジル) オキシ] - 1 H - インダ
 ザール - 3 - イル } ベンズアミド、
 3, 5 - ジメトキシ - N - (5 - メトキシ - 1 H - インダゾール - 3 - イル) ベンズア
 ミド、
 N - [5 - (4 - フルオロプトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 3, 5 - ジ
 メトキシベンズアミド、
 N - { 5 - [(3 - メトキシベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } -
 N - [(4 - メチルフェニル) スルホニル] - L - フェニルアラニンアミド、
 N - (5 - メトキシ - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - N - [(4 - メチルフェ
 ニル) スルホニル] - L - フェニルアラニンアミド、
 N - [5 - (4 - フルオロプトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N - [(4
 - メチルフェニル) スルホニル] - L - フェニルアラニンアミド、
 1 - ベンジル - 3 - (5 - { [5 - (ベンジルオキシ) ベンチル] オキシ } - 1 H - イン
 ダゾール - 3 - イル) 尿素、
 1 - ベンジル - 3 - [5 - (ヘキシルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] 尿素
 、
 1 - ベンジル - 3 - { 5 - [2 - (4 - メチル - 1, 3 - チアゾール - 5 - イル) エト
 キシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、
 1 - プロパン - 2 - イル - 3 - { 5 - [2 - (ピロリジン - 1 - イル) エトキシ] - 1
 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、
 1 - [5 - (ヘキシルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 3 - プロパン - 2
 - イル 尿素、
 1 - [5 - (ブタ - 3 - イン - 1 - イルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] -
 3 - プロパン - 2 - イル 尿素、
 N - [6 - (シクロベンチルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - (3
 - メトキシフェニル) 尿素、
 N - [5 - (シクロベンチルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - (3
 - メトキシフェニル) 尿素、
 N - { 5 - [(3 - メトキシベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } -
 N' - (3 - メトキシフェニル) 尿素、

10

20

30

40

50

N - (5 - メトキシ - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - N' - (3 - メトキシフェニル) 尿素、

N - [5 - (4 - フルオロプトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - (3 - メトキシフェニル) 尿素、

N - (3 - メトキシフェニル) - N' - [6 - (1 - メチル - 3 - フェニルプロポキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] 尿素、

N - [5 - (シクロペンチルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - (4 - メチルフェニル) 尿素、

N - [6 - (シクロペンチルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - (4 - メチルフェニル) 尿素、

N - { 5 - [(3 - メトキシベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - (4 - メチルフェニル) 尿素、

N - (5 - メトキシ - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - N' - (4 - メチルフェニル) 尿素、

N - [5 - (4 - フルオロプトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - (4 - メチルフェニル) 尿素、

N - (3 - クロロフェニル) - N' - { 5 - [(3 - メトキシベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、

N - (3 - クロロフェニル) - N' - (5 - メトキシ - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素、

N - (3 - クロロフェニル) - N' - [5 - (4 - フルオロプトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] 尿素、

N - (1, 1' - ビフェニル - 4 - イル) - N' - [6 - (シクロペンチルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] 尿素、

N - (1, 1' - ビフェニル - 4 - イル) - N' - { 5 - [(3 - メトキシベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、

N - (1, 1' - ビフェニル - 4 - イル) - N' - (5 - メトキシ - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素、

N - (1, 1' - ビフェニル - 4 - イル) - N' - [5 - (4 - フルオロプトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] 尿素、

N - (1, 1' - ビフェニル - 4 - イル) - N' - (6 - イソプトキシ - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素、

N - (4 - アセチルフェニル) - N' - [6 - (シクロペンチルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] 尿素、

N - (4 - アセチルフェニル) - N' - { 5 - [(3 - メトキシベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、

N - (4 - アセチルフェニル) - N' - (5 - メトキシ - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素、

N - (4 - アセチルフェニル) - N' - [5 - (4 - フルオロプトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] 尿素、

N - (4 - アセチルフェニル) - N' - [6 - (2 - チエン - 3 - イルエトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] 尿素、

N - ベンゾイル - N' - [6 - (シクロペンチルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] 尿素、

N - ベンゾイル - N' - { 5 - [(3 - メトキシベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、

N - ベンゾイル - N' - (5 - メトキシ - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素、

N - ベンゾイル - N' - [5 - (4 - フルオロプトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] 尿素、

N - ベンゾイル - N' - { 6 - [(1, 5 - ジメチルヘキシル) オキシ] - 1 H - インダ

10

20

30

40

50

ゾール - 3 - イル} 尿素、

N - [6 - (シクロペンチルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - イソプロピル尿素、

N - イソプロピル - N' - { 5 - [(3 - メトキシベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、

N - イソプロピル - N' - (5 - メトキシ - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素、

N - [5 - (4 - フルオロプロトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - イソプロピル尿素、

1 - [6 - (シクロペンチルメトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 3 - プロパン - 2 - イル尿素、

N - (6 - イソプロトキシ - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - N' - イソプロピル尿素

N - [6 - (シクロペンチルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - (2 , 4 - ジメチルフェニル) 尿素、

N - (2 , 4 - ジメチルフェニル) - N' - { 5 - [(3 - メトキシベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、

N - (2 , 4 - ジメチルフェニル) - N' - (5 - メトキシ - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素、

N - (2 , 4 - ジメチルフェニル) - N' - [5 - (4 - フルオロプロトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] 尿素、

N - (2 , 4 - ジメチルフェニル) - N' - { 6 - [2 - (1 - メチルピロリジン - 2 - イル) エトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、

N - [6 - (シクロペンチルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - [2 - (ジフルオロメトキシ)フェニル] 尿素、

N - [6 - (シクロペンチルメトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - [2 - (ジフルオロメトキシ)フェニル] 尿素、

N - [2 - (ジフルオロメトキシ)フェニル] - N' - [6 - (2 - チエン - 3 - イル エトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] 尿素、

N - [2 - (ジフルオロメトキシ)フェニル] - N' - { 6 - [(1 , 5 - ジメチルヘキシル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、

N - [2 - (ジフルオロメトキシ)フェニル] - N' - (6 - イソプロトキシ - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素、

N - [6 - (シクロペンチルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - (4 - フルオロベンジル) 尿素、

N - (4 - フルオロベンジル) - N' - { 5 - [(3 - メトキシベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、

N - (4 - フルオロベンジル) - N' - (5 - メトキシ - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素、

N - (4 - フルオロベンジル) - N' - [5 - (4 - フルオロプロトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] 尿素、

N - (4 - フルオロベンジル) - N' - [6 - (1 - メチル - 3 - フェニルプロポキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] 尿素、

N - { 6 - [3 - (ジメチルアミノ)プロポキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - (4 - フルオロベンジル) 尿素、

N - [6 - (シクロペンチルメトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - (4 - フルオロベンジル) 尿素、

N - { 6 - [(1 , 5 - ジメチルヘキシル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } - N' - (4 - フルオロベンジル) 尿素、

N - (4 - フルオロベンジル) - N' - { 6 - [2 - (1 - メチルピロリジン - 2 - イル) エトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素、

10

20

30

40

50

- N - (4 - フルオロベンジル) - N' - (6 - イソプトキシ - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素、
- N - ブチル - N' - [6 - (シクロペンチルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] 尿素、
- N - ブチル - N' - {5 - [(3 - メトキシベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル} 尿素、
- N - ブチル - N' - (5 - メトキシ - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素、
- N - ブチル - N' - [5 - (4 - フルオロプトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] 尿素、
- N - ブチル - N' - [6 - (1 - メチル - 3 - フェニルプロポキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] 尿素、 10
- N - ブチル - N' - {6 - [3 - (ジメチルアミノ) プロポキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル} 尿素、
- N - ブチル - N' - [6 - (シクロペンチルメトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] 尿素、
- N - ブチル - N' - {6 - [(1,5 - ジメチルヘキシル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル} 尿素、
- N - ブチル - N' - {6 - [2 - (1 - メチルピロリジン - 2 - イル) エトキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル} 尿素、
- N - [6 - (シクロペンチルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - (2, 3, 4 - トリフルオロフェニル) 尿素、 20
- N - [6 - (1 - メチル - 3 - フェニルプロポキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - (2, 3, 4 - トリフルオロフェニル) 尿素、
- N - [6 - (シクロペンチルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - (3, 5 - ジメトキシフェニル) 尿素、
- N - [5 - (シクロペンチルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - (3, 5 - ジメトキシフェニル) 尿素、
- N - (3, 5 - ジメトキシフェニル) - N' - {5 - [(3 - メトキシベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル} 尿素、
- N - (3, 5 - ジメトキシフェニル) - N' - (5 - メトキシ - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素、 30
- N - (3, 5 - ジメトキシフェニル) - N' - [5 - (4 - フルオロプトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] 尿素、
- N - (3, 5 - ジメトキシフェニル) - N' - {6 - [(1,5 - ジメチルヘキシル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル} 尿素、
- N - {5 - [(3 - メトキシベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル} - N' - [2 - (メチルチオ) フェニル] 尿素、
- N - (5 - メトキシ - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - N' - [2 - (メチルチオ) フェニル] 尿素、
- N - [5 - (4 - フルオロプトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - [2 - (メチルチオ) フェニル] 尿素、 40
- N - {5 - [(3 - メトキシベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル} - N' - [3 - (トリフルオロメチル) フェニル] 尿素、
- N - (5 - メトキシ - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - N' - [3 - (トリフルオロメチル) フェニル] 尿素、
- N - [5 - (4 - フルオロプトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - [3 - (トリフルオロメチル) フェニル] 尿素、
- N - (2 - フルオロフェニル) - N' - (5 - メトキシ - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素、
- N - [5 - (4 - フルオロプトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - (2 50

- フルオロフェニル) 尿素、
 N - { 5 - [(3 - メトキシベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } -
 N' - (2 - フェニルエチル) 尿素、
 N - [5 - (4 - フルオロプトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - (2
 - フェニルエチル) 尿素、
 N - { 5 - [(3 - メトキシベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } -
 N' - (4 - メトキシフェニル) 尿素、
 N - (5 - メトキシ - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - N' - (4 - メトキシフェニ
 ル) 尿素、
 N - [5 - (4 - フルオロプトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - (4 10
 - メトキシフェニル) 尿素、
 N - (1, 3 - ベンゾジオキソール - 5 - イル) - N' - (5 - メトキシ - 1 H - インダ
 ゴール - 3 - イル) 尿素、
 N - (1, 3 - ベンゾジオキソール - 5 - イル) - N' - [5 - (4 - フルオロプトキシ
) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] 尿素、
 メチル 3 - ({ [(5 - メトキシ - 1 H - インダゾール - 3 - イル) アミノ] カルボニ
 ル } アミノ) ベンゾエート、および
 メチル 3 - [({ [5 - (4 - フルオロプトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル]
 アミノ } カルボニル) アミノ] ベンゾエート
 からなる群から選択される、場合により医薬適合性の塩の形態の化合物。 20

【請求項 2 1】

薬剤として使用するための、請求項 1 で定義した式 (I) の化合物又は医薬適合性のそ
 の塩。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、キナーゼ阻害因子として活性なアミノインダゾール誘導体に関し、特に、3
 - アミノ - インダゾール誘導体、それらの製造ための方法、それらを含む医薬組成物
 及び治療薬としてのそれらの使用、特にプロテインキナーゼ調節障害に結びつく疾患の治
 療における治療薬としてのそれらの使用に関する。 30

【背景技術】

【0002】

プロテインキナーゼ (P K) の機能不全は多数の疾患の特徴である。ヒト癌に関わる癌
 遺伝子及び原癌遺伝子の多くが P K をコードする。P K の高い活性は、良性前立腺過形成
 、家族性腺腫症、ポリープ症、神経線維腫症、乾癬、アテローム性動脈硬化症に関連する
 血管平滑筋細胞増殖、肺線維症、関節炎、糸球体腎炎及び術後狭窄及び再狭窄などの多く
 の非悪性疾患にも関係する。

【0003】

P K はまた、炎症状態及びウイルスや寄生生物の増殖にも関係付けられる。P K は、神
 経変性疾患の病因及び発症においても重要な役割を果たすと考えられる。 40

【0004】

P K の機能不全又は調節障害に関する全般的な説明については、例えば、Curren
 t Opinion in Chemical Biology 1999, 3, 459
 - 465 参照。

【0005】

プロテインキナーゼ活性の調節不全によって引き起こされる及び / 又は関連する疾患の
 宿主に対する薬剤として治療において有用な化合物を提供することが本発明の 1 つの目的
 である。

【0006】

多数のプロテインキナーゼに対する阻害活性を備えた化合物を提供することが本発明の 50

もう一つの目的である。

【0007】

本願の発明者は、今や、以下略してインダゾール誘導体又はインダゾールと称する、一部の3-アミノインダゾール誘導体が多数のプロテインキナーゼ阻害活性を有しており、それ故プロテインキナーゼ調節不全に関連する疾患の治療において有用であることを発見した。

【0008】

より特定すると、本発明のインダゾールは、膀胱癌、乳癌、結腸癌、腎臓癌、肝臓癌、小細胞肺癌を含む肺癌、食道癌、胆嚢癌、卵巣癌、膵癌、胃癌、子宮頸癌、甲状腺癌、前立腺癌、及び扁平上皮癌を含む皮膚癌などの癌腫；白血病、急性リンパ性白血病、急性リンパ芽球性白血病、B細胞リンパ腫、T細胞リンパ腫、ホジキンリンパ腫、非ホジキンリンパ腫、毛状細胞リンパ腫及びパーキットリンパ腫を含む、リンパ系の造血器腫瘍；急性及び慢性骨髄性白血病、骨髄形成異常症候群及び前骨髄球性白血病を含む、骨髄系の造血器腫瘍；線維肉腫及び横紋筋肉腫を含む、間葉由来の腫瘍；神経膠星状細胞腫、神経芽細胞腫、神経膠腫及び神経鞘腫を含む、中枢及び末梢神経系の腫瘍；黒色腫、精上皮腫、奇形癌、骨肉腫、色素性乾皮症、角化性黄色腫、甲状腺小胞癌及びカボジ肉腫を含む他の腫瘍を含むがこれらに限定されない様々な癌の治療において有用である。

【0009】

細胞増殖の調節におけるPKの重要な役割の故に、これらのインダゾールはまた、例えば良性前立腺過形成、家族性腺腫症、ポリープ症、神経線維腫症、乾癬、アテローム性動脈硬化症に関連する血管平滑筋細胞増殖、肺線維症、関節炎、糸球体腎炎及び術後狭窄及び再狭窄などの様々な細胞増殖性疾患の治療においても有用である。

【0010】

本発明の化合物は、cdk5がタンパク質のリン酸化に関与する(J. Biochem., 117, 741-749, 1995)という事実が示唆するように、アルツハイマー病に治療において有用でありうる。

【0011】

本発明の化合物はまた、アポトーシスのモジュレーターとして、癌、ウイルス感染の治療、HIV感染個体におけるAIDS発症の予防、自己免疫疾患及び神経変性疾患の治療においても有用であると考えられる。

【0012】

本発明の化合物は、腫瘍の血管新生及び転移を阻止する上で有用でありうる。

【0013】

本発明の化合物は、サイクリン依存性キナーゼ(cdk)阻害因子として及び、例えば様々なアイソフォームのプロテインキナーゼC、Met、PAK-4、PAK-5、ZC-1、STLK-2、DDR-2、Aurora 1、Aurora 2、Bub-1、PLK、Chk1、Chk2、HER2、raf1、MEK1、MAPK、EGF-R、PDGF-R、FGF-R、IGF-R、VEGF-R、PI3K、weelキナーゼ、Src、Ab1、Akt、ILK、MK-2、IKK-2、Cdc7、Nek、などの他のプロテインキナーゼの阻害因子としても有用であり、それ故他のプロテインキナーゼに関連する疾患の治療において有効である。

【0014】

いくつかのインダゾール及びアミノインダゾールは、合成又は化学的中間体として、ポリマー安定剤として、治療薬として、そしてさらにはプロテインキナーゼ阻害因子として、当技術分野において知られている。

【0015】

一例として、いくつかのアルキルアミノ-インダゾールが、Smithklineによる米国特許第28939号(米国特許第3,133,081号の再発行)において筋弛緩作用及び鎮痛作用を有すると開示されている；それらの中でも特に、3-メチルアミノ-5-トリフルオロメチル-インダゾール及び3-ジエチルアミノ-5-トリフルオロメチ

10

20

30

40

50

ル - インダゾールが挙げられる。

【0016】

3 - アミノインダゾール基を担う環状N, N' - 尿素誘導体は、H I Vプロテアーゼ阻害因子としてB i o o r g . M e d . C h e m . L e t t . (1 9 9 8)、8 (7)、7 1 5 - 7 2 0に開示されている。

【0017】

癌以外の疾患の治療において有用なジアリール - 尿素誘導体は、p 3 8キナーゼ阻害因子としてB a y e r C o . によるW O 9 9 / 3 2 1 1 1号に開示されている；その中で特に例示されている化合物として、N - [4 - [(ピリジル - 4 - イル) オキシ] フェニル] - N ' - [6 - クロロ - (インダゾール - 3 - イル)] - 尿素が挙げられる。

10

【0018】

アリール部分によって、例えばインダゾリル - アミノカルボニル - フェニルによってさらに置換されたイミダゾピリジン誘導体は、P f i z e r L t d . によるW O 9 1 / 1 7 1 6 2号において血小板活性化因子 (P A F) 拮抗物質として開示されている。

【0019】

3位でアミノ又はその誘導体以外の基によってさらに置換されたインダゾール化合物は、A g o u r o n P h a r m a c e u t i c a l s I n c . によるW O 0 1 / 0 2 3 6 9号においてプロテインキナーゼ阻害活性を有すると開示されている。

【0020】

メルカプト - シアノアクリロイルアミノ - 又はアルキルチオ - シアノアクリロイルアミノ - ヘテロ環は、H o e c h s t による米国特許第5, 7 1 4, 5 1 4号の中で、細胞増殖上昇に結びつく疾患の治療において有用であると開示されている。

20

【0021】

そのアリール部分がインダゾール基も含む、1 - アシルアミノ - 3 - (N - アリールスルホニル - N - アルコキシアミノ) - 2 - ヒドロキシプロパン誘導体は、V e r t e x P h a r m a c e u t i c a l s I n c . によるW O 9 9 / 6 5 8 7 0号においてH I Vアスパルチルプロテアーゼ阻害因子として開示されている。

【0022】

他のいくつかの特定インダゾール誘導体は治療薬として知られている：特に、3 - [3 - (モルホリン - 4 - イル) プロピオニルアミノ] - インダゾール、3 - (N , N ' - ジエチルアミノ) - プロピルアミノ - 5 - メトキシ - インダゾール、3 - [(3 - メチル) モルホリン - 4 - イル] - プロピルアミノ - 5 - メトキシ - インダゾール、3 - (N , N ' - ジエチルアミノ) - プロピルアミノ - 5 - メチル - インダゾール及び3 - [(3 - メチル) モルホリン - 4 - イル] - プロピルアミノ - 5 - メチル - インダゾールは、鎮痛及び抗炎症作用を有すると開示されている [A s a h i C h e m i c a l I n d u s t r y による米国特許第4, 7 5 1, 3 0 2号及びJ P - A - 6 0 0 6 1 5 6 9号参照]；3 - [(2 - ヒドロキシフェニル) カルボニルアミノ] - インダゾールは抗菌薬として開示されている [P h a r m a z i e (1 9 9 0)、4 5 (6)、4 4 1 - 2参照]。

30

【0023】

主として化学的中間体として又は治療以外の目的、例えばポリマー安定剤、漂白剤、染料等の目的で開示されている他のいくつかのインダゾールが、当技術分野において既知である。

40

【0024】

それらの中でも特に：3 - (エトキシカルボニルアミノ) - インダゾール [C h e m i c a l A b s t r a c t s 9 2 (1 9 8 0) : 2 1 5 4 0 0参照]；3 - アセチルアミノ - インダゾール及び3 - ベンゾイルアミノ - インダゾール [J . O r g . C h e m . (1 9 9 6 , 6 1 (2 4) , 8 3 9 7 8 4 0 1参照]；3 - プチルアミノ - インダゾール、3 - [(4 - クロロフェニル) カルボニルアミノ] - インダゾール、3 - [(4 - メチルフェニル) カルボニルアミノ] インダゾール及び3 - [(3 , 3 - ジフェニル) プロピオニルアミノ] インダゾール [A c t a C h i m . H u n g . (1 9 9 0) , 1 2 7

50

(6)、795-802参照]; 3-[(3,5-ジメチル-イソキサゾール-4-イル)カルボニルアミノ]-インダゾール[J. Heterocycl. Chem. (1974), 11(4), 623-6参照]; 3-[(4-ニトロフェニル)カルボニルアミノ]-インダゾール及び3-(フェニルアセチルアミノ)-インダゾール[J. Chem. Soc., Perkin Trans. 1(1982), (3), 759-66参照]; 3-[(2-アミノフェニル)カルボニルアミノ]-インダゾール及び3-[(2-ニトロフェニル)カルボニルアミノ]-インダゾール[Heterocycles(1996), 43(11), 2385-2396参照]; 3-[(4-クロロ-2-ニトロフェニル)カルボニルアミノ]-インダゾール、3-[(2-アミノ-4-クロロフェニル)カルボニルアミノ]-インダゾール、3-[(2-アミノ-5-クロロフェニル)カルボニルアミノ]-インダゾール及び3-[(3-クロロ-6-ニトロフェニル)カルボニルアミノ]-インダゾール[Arch. Pharm. (1999), 332(9), 317-320参照]; 3-(アセチルアミノ)-5-アミノ-インダゾール[Farbwerke Hoechst A.G.による米国特許第3,316,207号参照]; 3-ジメチルアミノ-5-トリフルオロメチル-インダゾール[Bayer A.G.によるDE-A-2458965号参照]; 3-フェニルアミノ-6-メチル-インダゾール、3-フェニルアミノ-、3-(4-クロロ)フェニルアミノ-、3-(4-メチル)フェニルアミノ-、3-(3-メチル)フェニルアミノ-及び3-(4-アミノスルホニル)フェニルアミノ-5-メチル-インダゾール[Chemical Abstracts 78(1973):136158参照]; 3-[(1-ヒドロキシ-2-メチル)-2-プロピル]アミノ-6,7-ジメトキシ-インダゾール[Ortho Pharmaceutical Co.による米国特許第4,864,032号参照]が挙げられる。

10

20

【0025】

さらに、3-フタルイミド-インダゾール及び4-クロロ-3-フタルイミド-インダゾールは、Asahi Chemical Industry Co.による米国特許第4,751,302号の中で、鎮痛及び抗炎症作用を有する薬剤の製造における合成中間体として開示されている。

【0026】

スルホニルアミノインダゾール、特に長鎖アルキルオキシフェニルスルホニルアミノ-インダゾールは、HeiseiによるJP-A-08022109号においてシアン染料形成化合物として開示されている。

30

【0027】

プロテインキナーゼ阻害因子として有用な広いクラスのピラゾール化合物も、WO02/62789号、WO02/59112号、WO02/59111号、WO02/57259号、WO02/50066号、WO02/50065号、WO02/22608号、WO02/22607号、WO02/22606号、WO02/22605号、WO02/22604号、WO02/22603号及びWO02/22601号などの種々の特許願において、Vertex Pharmaceuticals Inc.によって開示されている。

【発明の開示】

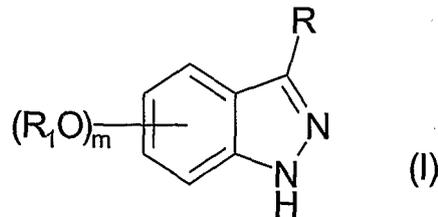
40

【0028】

従って、本発明は、式(I):

【0029】

【化1】

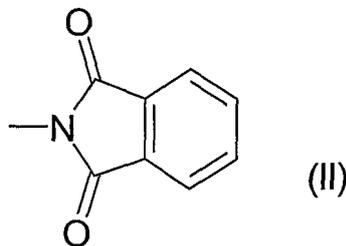


[式中、

R は、 $-NHR'$ 、 $-NR'R''$ 、 $-NHCOR'$ 、 $-NHCONHR'$ 、 $-NHCONR'R''$ 、 $-NHCOOR'$ 又は $-NHCOOR'$ [式中、 R' 及び R'' は、各々独立して、直鎖又は分枝鎖 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_2 - C_6$ アルケニル又はアルキニル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル又はシクロアルキル $C_1 - C_6$ アルキル、アリール、アリール $C_1 - C_6$ アルキル、窒素、酸素又は硫黄から選択される 1 個から 3 個のヘテロ原子を有する 5 又は 6 員ヘテロシクリル又はヘテロシクリル $C_1 - C_6$ アルキルから選択される、場合によりさらに置換された基である] から成る群より選択されるか；若しくは R は、下記の式 (II)：

【0030】

【化2】



のフタルイミド基であり、

R_1 は、存在する場合は、インダゾール環の 5 又は 6 位に位置し、場合によりさらに置換された、 R' 又は R'' について上述した基を表わし；

m は 0 又は 1 である]

によって表わされるアミノインダゾール又は医薬適合性のその塩の有効量を、その必要のある哺乳動物に投与することにより、プロテインキナーゼ活性の変化によって引き起こされる及び/又はプロテインキナーゼ活性の変化に関連する疾患を治療するための方法を提供する。

【0031】

上述した方法の好ましい実施形態では、プロテインキナーゼ活性の変化によって引き起こされる及び/又はプロテインキナーゼ活性の変化に関連する前記疾患は、癌、細胞増殖性疾患、アルツハイマー病、ウイルス感染、自己免疫疾患及び神経変性疾患から成る群より選択される。

【0032】

治療する特定の種類の癌は、癌腫、扁平上皮癌、骨髄系又はリンパ系の造血器腫瘍、間葉由来の腫瘍、中枢及び末梢神経系の腫瘍、黒色腫、精上皮腫、奇形癌、骨肉腫、色素性乾皮症、角化性黄色腫、甲状腺小胞癌及びカボジ肉腫を含む。

【0033】

上述した方法のもう 1 つの好ましい実施形態では、前記細胞増殖性疾患は、良性前立腺過形成、家族性腺腫症、ポリープ症、神経線維腫症、乾癬、アテローム性動脈硬化症に関連する血管平滑筋細胞増殖、肺線維症、関節炎、糸球体腎炎及び術後狭窄及び再狭窄から成る群より選択される。

【0034】

さらに、本発明の対象である方法はまた、腫瘍の血管新生及び転移の阻害を提供する。

10

20

30

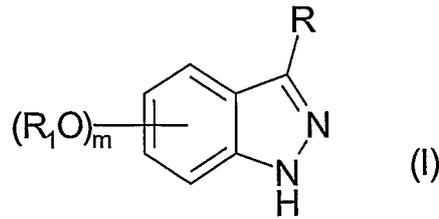
40

50

本発明はさらに、式 (I) :

【 0 0 3 5 】

【 化 3 】



10

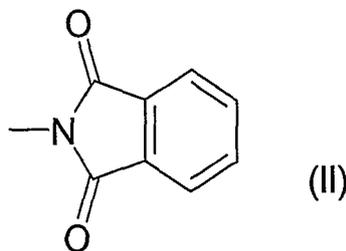
[式中、

R は、 $-NHR'$ 、 $-NR'R''$ 、 $-NHCOR'$ 、 $-NHCONHR'$ 、 $-NHCONR'R''$ 、 $-NHOSO_2R'$ 又は $-NHCOOR'$ [式中、 R' 及び R'' は、各々独立して、直鎖又は分枝鎖 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_2 - C_6$ アルケニル又はアルキニル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル又はシクロアルキル $C_1 - C_6$ アルキル、アリール、アリール $C_1 - C_6$ アルキル、窒素、酸素又は硫黄から選択される 1 個から 3 個のヘテロ原子を有する 5 又は 6 員ヘテロシクリル又はヘテロシクリル $C_1 - C_6$ アルキルから選択される、場合によりさらに置換された基である] から成る群より選択されるか；若しくは R は、下記の式 (II) :

【 0 0 3 6 】

【 化 4 】

20



のフタルイミド基であり、

R_1 は、存在する場合は、インダゾール環の 5 又は 6 位に位置し、場合によりさらに置換された、 R' 又は R'' について上述した基を表わし；

m は 0 又は 1 である]

によって表わされ、但し、

a) R が $-NHCOR'$ であり、 m が 0 であるとき、 R' は、メチル、 n -プロピル、ベンジル、2,2-ジフェニルエチル、3,5-ジメチルイソキサゾール-4-イル、2-(モルホリン-4-イル)エチル、又は場合によりクロロ、ヒドロキシ、メチル、ニトロ又はアミノで置換されたフェニル以外であり；

b) インダゾールが 5 又は 6 位でメトキシ基によって置換されているとき、R は、3-(N,N-ジエチルアミノ)プロピルアミノ、3-[(3-メチル)モルホリン-4-イル]プロピルアミノ又は 1-ヒドロキシ-2-メチル-2-プロピルアミノ以外であり；

c) 化合物 3-フタルイミド-インダゾールは除外される

ことを条件とする、アミノインダゾール誘導体又は医薬適合性のその塩を提供する。

【 0 0 3 7 】

本発明の対象である式 (I) の化合物は、不斉炭素原子を有していてもよく、それ故ラセミ混合物として又は個々の光学異性体として存在しうる。

【 0 0 3 8 】

従って、式 (I) の化合物のすべての可能な異性体及びそれらの混合物及び代謝産物及び医薬適合性の生体前駆物質 (プロドラッグとも称される)、ならびにそれらを含む治療方法も、本発明の範囲内である。

50

【0039】

本発明の説明においては、異なる記載がない限り、直鎖又は分枝鎖 $C_1 - C_6$ アルキルの語により、我々は、例えば、メチル、エチル、 n -プロピル、イソプロピル、 n -ブチル、イソブチル、*sec*-ブチル、*tert*-ブチル、 n -ペンチル、 n -ヘキシル等のような基を意味する。

【0040】

直鎖又は分枝鎖 $C_2 - C_6$ アルケニル又はアルキニルの語により、例えばビニル、エチニル、1-プロペニル、アリル、1-又は2-プロピニル、1-、2-又は3-ブテニル、1-、2-又は3-ブチニル、ペンテニル、ペンチニル、ヘキセニル、ヘキシニル等のような、二重又は三重結合を有する不飽和炭化水素鎖を意味する。

10

【0041】

$C_3 - C_6$ シクロアルキルの語により、例えばシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル又はシクロヘキシルなどの基を意味する。

【0042】

アリールの語により、単結合により互いに縮合又は結合している、1個から4個の環部分を有し、炭素環又はヘテロ環の少なくとも1つが芳香環である、一、二又は多炭素環式ならびにヘテロ環式炭化水素を意味する。

【0043】

アリール基の非制限的な例は、例えばフェニル、インダニル、ピフェニル、 $-$ 又は $-$ ナフチル、フルオレニル、9,10-ジヒドロアントラセニル、ピリジル、ピラジニル、ピリミジニル、ピリダジニル、インドリル、イミダゾリル、イミダゾピリジル、1,2-メチレンジオキシフェニル、チアゾリル、イソチアゾリル、ピロリル、ピロリル-フェニル、フリル、フェニル-フリル、ベンゾテトラヒドロフランニル、オキサゾリル、イソキサゾリル、ピラゾリル、クロメニル、チエニル、ベンゾチエニル、イソインドリニル、ベンゾイミダゾリル、テトラゾリル、テトラゾリルフェニル、ピロリジニル-テトラゾリル、イソインドリニル-フェニル、キノリニル、イソキノリニル、2,6-ジフェニル-ピリジル、キノキサリニル、ピラジニル、フェニル-キノリニル、ベンゾフラザニル、1,2,3-トリアゾリル、1-フェニル-1,2,3-トリアゾリル等である。

20

【0044】

5又は6員ヘテロシクリルの語により、それ故アリール基とも称される芳香族ヘテロ環式基を含めて、我々はさらに、1個又はそれ以上の炭素原子が窒素、酸素及び硫黄などの1個から3個のヘテロ原子によって置換されている、飽和又は部分不飽和5又は6員炭素環を意味する。

30

【0045】

場合によりベンゾ縮合された又はさらに置換された、5又は6員ヘテロシクリル基の例は、1,3-ジオキサラン、ピラン、ピロリジン、ピロリン、イミダゾリジン、ピラゾリジン、ピラゾリン、ピペリジン、ピペラジン、モルホリン、テトラヒドロフラン等である。

【0046】

R_1 、 R' 及び R'' に与えられた前記の意味に従って、前記の基のいずれもが、ハロゲン、ニトロ、オキシ基(=O)、カルボキシ、シアノ、アルキル、過フッ素化アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、アリール、ヘテロシクリル、例えばアルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アリールアミノ、ジアリールアミノ、ウレイド、アルキルウレイド又はアリールウレイドなどのアミノ基及びその誘導体；例えばホルミルアミノ、アルキルカルボニルアミノ、アルケニルカルボニルアミノ、アリールカルボニルアミノ、アルコキシカルボニルアミノなどのカルボニルアミノ基及びその誘導体；例えばアルコキシ、アリールオキシ、アルキルカルボニルオキシ、アリールカルボニルオキシ、シクロアルケニルオキシ又はアルキリデンアミノオキシなどのヒドロキシ基及びその誘導体；例えばアルキルカルボニル、アリールカルボニル、アルコキシカルボニル、アリールオキシカルボニル、シクロアルキルオキシカルボニル、アミノカルボニル、アルキルアミノカルボニ

40

50

ル、ジアルキルアミノカルボニルなどのカルボニル基及びその誘導体；例えばアルキルチオ、アリールチオ、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、アルキルスルフィニル、アリールスルフィニル、アリールスルホニルオキシ、アミノスルホニル、アルキルアミノスルホニル又はジアルキルアミノスルホニルなどの硫化誘導体から選択される、1個又はそれ以上の基、例えば1個から6個の基によって、自由位置のいずれかで場合によりさらに置換されているもよい。

【0047】

順次、適宜に、前記の基の各々は、上述した基の1つ又はそれ以上によってさらに置換されているもよい。

【0048】

これら後者の基の中で及び本発明の説明の中で異なる規定がない限り、ハロゲン原子の語により、我々はフッ素、塩素、臭素又はヨウ素原子を意味する。

【0049】

過フッ素化アルキルの語により、2個以上の水素原子がフッ素原子で置換されている、前記で定義した直鎖又は分枝鎖 $C_1 - C_6$ アルキルを意味する。過フッ素化アルキル基の例は、例えばトリフルオロメチル、2, 2, 2 - トリフルオロエチル、1, 2 - ジフルオロエチル、1, 1, 1, 3, 3, 3 - ヘキサフルオロプロピル - 2 - イル等である。

【0050】

前記のすべてから、その名称が、例えばシクロアルキルアルキル、アリールアルキル、ヘテロシクリルアルキル、アルコキシ、アルキルチオ、アリールオキシ、アリールアルコキシ、ヘテロシクリルオキシ、ヘテロシクリルアルコキシ、アルキルカルボニルオキシ等のような複合語として特定される基は、それらが由来する部分から慣例的に解釈されるように意図されていることは当業者には明白である。

【0051】

一例として、ヘテロシクリル - アルキルの語は、前記で定義したヘテロシクリル基によってさらに置換されているアルキル基を表わす。

【0052】

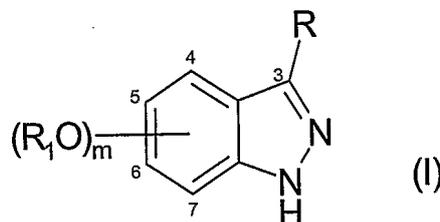
式(I)の化合物の医薬適合性の塩は、無機又は有機酸、例えば硝酸、塩酸、臭化水素酸、硫酸、過塩素酸、リン酸、酢酸、トリフルオロ酢酸、プロピオン酸、グリコール酸、乳酸、シュウ酸、マロン酸、リンゴ酸、マレイン酸、酒石酸、クエン酸、安息香酸、桂皮酸、マンデル酸、メタンスルホン酸、イセチオン酸及びサリチル酸との酸付加塩、ならびに無機又は有機塩基、例えばアルカリ又はアルカリ土類金属、特にナトリウム、カリウム、カルシウム又はマグネシウム水酸化物、炭酸塩又は重炭酸塩、非環式又は環式アミン、好ましくはメチルアミン、エチルアミン、ジエチルアミン、トリエチルアミン又はピペリジンとの塩である。

【0053】

前記のすべてから、式(I)の化合物において、 m が0であるとき、 $-OR_1$ 基は存在せず、従って酸素原子を通してインダゾール骨格に結合している R_1 基は存在しないことは、当業者には明白である。そのような場合は、それ故、下記に示す番号付けシステムに従った5位又は6位は置換されていない(又は水素置換されている)。

【0054】

【化5】



【0055】

10

20

30

40

50

他方で、 m が1であるとき、インダゾール環の5位又は6位のいずれか1つに1個の $-OR_1$ 基が存在する。

【発明を実施するための最良の形態】

【0056】

本発明の好ましい化合物の最初のクラスは、式中、 R が $-NHR'$ 又は $-NR'R''$ 基であり、 R' 、 R'' 、 R_1 及び m が前記で定義したとおりである、式(I)の化合物によって表わされる。

【0057】

このクラスの中で、式中、 m が1であり、 R_1 がインダゾール環の5位又は6位のいずれか1つに存在する化合物は、より好ましい。

10

【0058】

式中、 R_1 、 R' 及び R'' が、各々独立して、 $C_2 - C_6$ アルケニル、 $C_3 - C_6$ アルキニル、アリール、アリール $C_1 - C_6$ アルキル、窒素、酸素又は硫黄から選択される1個から3個のヘテロ原子を有する5又は7員ヘテロシクリル又はヘテロシクリル $C_1 - C_6$ アルキルから選択される化合物は、さらに一層好ましい。

【0059】

本発明の好ましい化合物のもう1つのクラスは、式中、 R が $-NHCO R'$ 基であり、 R' 、 R_1 及び m が前記で定義したとおりである、式(I)の化合物によって表わされる。

【0060】

このクラスの中で、式中、 m が1であり、 R_1 がインダゾール環の5位又は6位のいずれか1つに存在する化合物は、より好ましい。

20

【0061】

式中、 R_1 及び R' が、各々独立して、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル又はシクロアルキル $C_1 - C_6$ アルキル、アリール、アリール $C_1 - C_6$ アルキル、窒素、酸素又は硫黄から選択される1個から3個のヘテロ原子を有する5又は7員ヘテロシクリル又はヘテロシクリル $C_1 - C_6$ アルキルから選択される化合物は、さらに一層好ましい。

【0062】

本発明の好ましい化合物のもう1つのクラスは、式中、 R が $-NHCONHR'$ 又は $-NHCONR'R''$ 基であり、 R' 、 R'' 、 R_1 及び m が前記で定義したとおりである、式(I)の化合物によって表わされる。

30

【0063】

このクラスの中で、式中、 m が1であり、 R_1 がインダゾール環の5位又は6位のいずれか1つに存在する化合物は、より好ましい。

【0064】

式中、 R_1 、 R' 及び R'' が、各々独立して、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル又はシクロアルキル $C_1 - C_6$ アルキル、アリール、アリール $C_1 - C_6$ アルキル、窒素、酸素又は硫黄から選択される1個から3個のヘテロ原子を有する5又は7員ヘテロシクリル又はヘテロシクリル $C_1 - C_6$ アルキルから選択される化合物は、さらに一層好ましい。

40

【0065】

本発明の好ましい化合物のもう1つのクラスは、式中、 R が $-NH SO_2 R'$ 基であり、 R' 、 R_1 及び m が前記で定義したとおりである、式(I)の化合物によって表わされる。

【0066】

このクラスの中で、式中、 m が1であり、 R_1 がインダゾール環の5位又は6位のいずれか1つに存在する化合物は、より好ましい。

【0067】

式中、 R_1 及び R' が、各々独立して、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキ

50

ル又はシクロアルキル $C_1 - C_6$ アルキル、アリール、アリール $C_1 - C_6$ アルキル、窒素、酸素又は硫黄から選択される1個から3個のヘテロ原子を有する5又は7員ヘテロシクリル又はヘテロシクリル $C_1 - C_6$ アルキルから選択される化合物は、さらに一層好ましい。

【0068】

本発明の好ましい化合物のもう1つのクラスは、Rが-NHCOOR'基であり、R'、 R_1 及びmが前記で定義したとおりである、式(I)の化合物によって表わされる。

【0069】

このクラスの中で、式中、mが1であり、 R_1 がインダゾール環の5位又は6位のいずれか1つに存在する化合物は、より好ましい。

10

【0070】

式中、 R_1 及びR'が、各々独立して、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル又はシクロアルキル $C_1 - C_6$ アルキル、アリール、アリール $C_1 - C_6$ アルキル、窒素、酸素又は硫黄から選択される1個から3個のヘテロ原子を有する5又は7員ヘテロシクリル又はヘテロシクリル $C_1 - C_6$ アルキルから選択される化合物は、さらに一層好ましい。

【0071】

本発明の好ましい化合物のもう1つのクラスは、Rが式(II)のフタルイミド基であり、 R_1 及びmが前記で定義したとおりである、式(I)の化合物によって表わされる。

【0072】

このクラスの中で、式中、mが1であり、 R_1 がインダゾール環の5位又は6位のいずれか1つに存在する化合物は、より好ましい。

20

【0073】

式中、 R_1 が、 $C_2 - C_6$ アルケニル、 $C_3 - C_6$ アルキニル、アリール、アリール $C_1 - C_6$ アルキル、窒素、酸素又は硫黄から選択される1個から3個のヘテロ原子を有する5又は7員ヘテロシクリル又はヘテロシクリル $C_1 - C_6$ アルキルから選択される化合物は、さらに一層好ましい。

【0074】

場合により医薬適合性の塩の形態の、式(I)の化合物の特定例は、実験の章において報告する。

30

【0075】

上述したように、式(I)のアミノインダゾール誘導体を製造するための方法が、本発明のさらなる目的である。

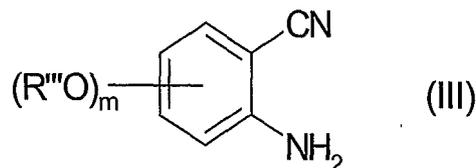
【0076】

それ故、式中、Rが、式(II)のフタルイミド基以外の、前記で定義したとおりである式(I)の化合物及び医薬適合性のその塩は、

a) 式(III) :

【0077】

【化6】



40

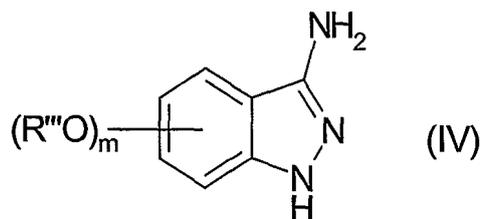
[式中、mは前記で定義したとおりであり、存在する場合R'''はメチル又はベンジル基である]

の2-アミノベンゾニトリル誘導体を、酸性条件下で、塩化第一スズの存在下に亜硝酸ナトリウムと反応させて、式(IV) :

【0078】

50

【化7】



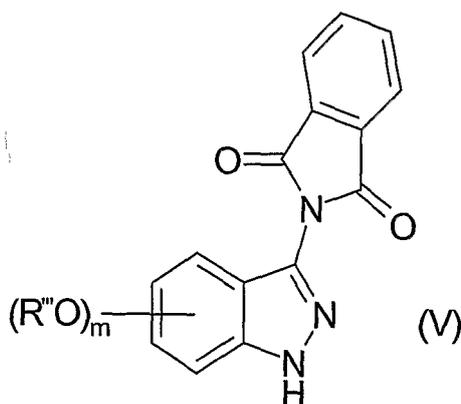
の化合物を得ること、

b) 式 (IV) の化合物を無水フタル酸と反応させて、式 (V) :

10

【0079】

【化8】



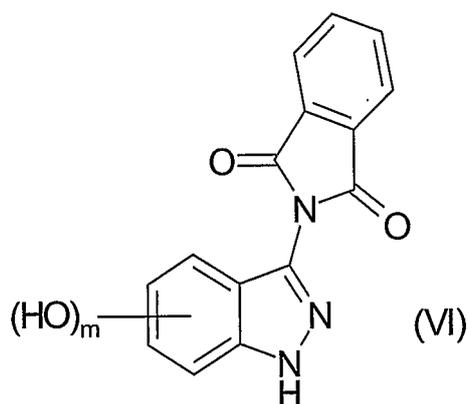
20

の化合物を得ること、

c) 式 (V) の化合物を適切なエーテル開裂剤と反応させて、式 (VI) :

【0080】

【化9】



30

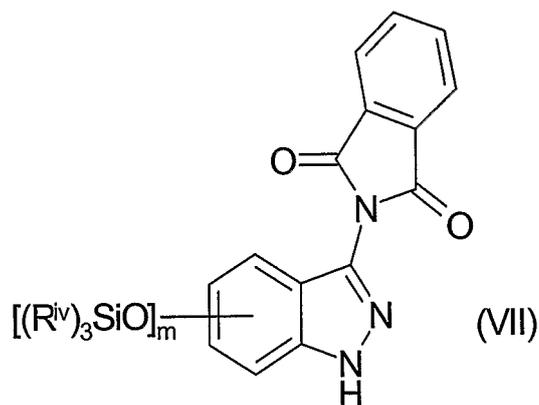
の対応するヒドロキシ誘導体を得ること、

d) 式 (VI) の化合物を適切なシリル化剤 $(R^{iv})_3SiZ$ [式中、各々の R^{iv} は、同じか又は異なる、直鎖又は分枝鎖 $C_1 - C_4$ アルキル基であり、Z はハロゲン原子である] と反応させて、式 (VII) :

40

【0081】

【化10】



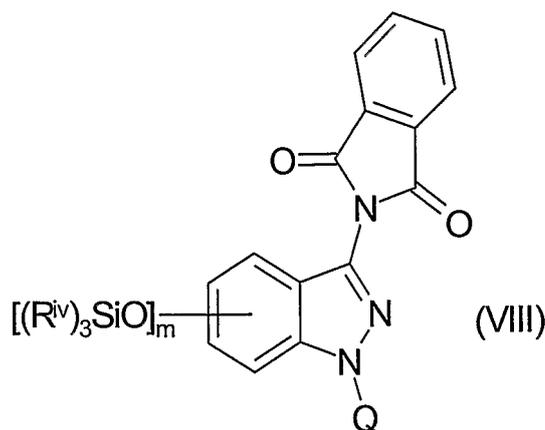
10

の化合物を得ること、

e) 式(VII)の化合物を適切なインダゾール窒素保護剤と反応させるか、あるいは、適切なポリマー樹脂上に支持して、式(VIII)：

【0082】

【化11】



20

[式中、Qは前記保護基であるか又は支持樹脂を表わす]

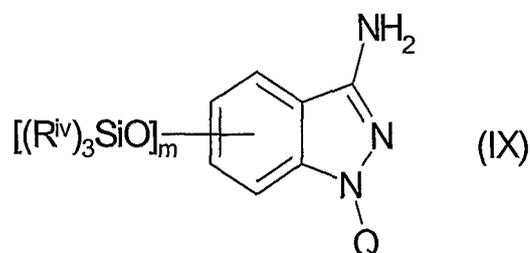
30

の化合物を得ること、

f) 式(VIII)の化合物をヒドラジン-水和物と反応させて、式(IX)：

【0083】

【化12】



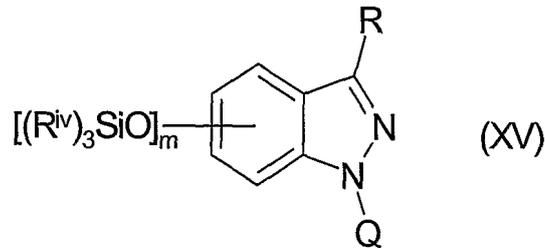
40

の化合物を得ること、及び下記の段階g. 1)又はg. 2)のいずれかに従って式(IX)の化合物を反応させること、

g. 1) 式R' - Z(X)、R' - COZ(XI)、R' - NCO(XII)、R' - SO₂Z(XIII)又はR' - OCOZ(XIV) [式中、R'は前記で定義したとおりであり、Zはハロゲン原子又は適切な脱離基を表わす]の適切な試薬と反応させて、式(XV)：

【0084】

【化13】



[式中、Rは、-NHR'、-NHCO R'、-NHCONHR'、-NH SO₂ R'又は -NHCOOR'基である] 10
 の化合物を得ること及び、所望する場合は、-NHR'又は-NHCONHR'基としてRを有する化合物を式：

【0085】

【化14】

R"Z (XVI)

[式中、R"及びZは前記で定義したとおりである]
 の化合物と反応させて、式(XV)[式中、Rは-NR'R"又は-NHCONR'R"基である]の化合物を得ること、 20

g. 2) 4-ニトロフェニルクロロホルメートの存在下に、式(XVII)：

【0086】

【化15】

R'R"NH (XVII)

[式中、R'及びR"は前記で定義したとおりである]
 の化合物と反応させて、式(XV)[式中、Rは-NHCONR'R"基である]の対応する化合物を得ること、

h) 式(XV)の前記化合物のいずれかをフッ化テトラブチルアンモニウムと反応させて、式(XVIII)：

30

【0087】

【化16】



40

の化合物を得ること、

i) 式(XVIII)の化合物を、式：

【0088】

【化17】

R₁-Z (XIX)

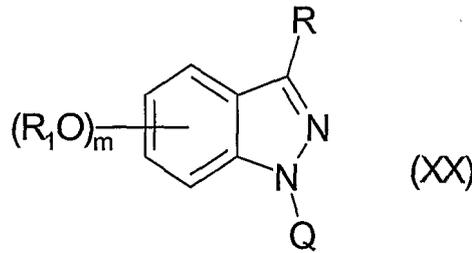
[式中、R₁は前記で定義したとおりであり、Zはハロゲン原子、適切な脱離基又はヒドロキシである]

の誘導体と反応させて、式(XX)：

【0089】

50

【化 18】



の化合物を得ること、

10

j) 式 (XX) の化合物を脱保護するか、あるいは、ポリマー樹脂を開裂して、式 (I) の所望化合物を得ること、及び所望する場合はいつでも、それを式 (I) のもう 1 つ別の化合物及び / 又は医薬適合性のその塩に変換することを含む製造方法によって入手しうる。

【0090】

前記のすべてから、前記の製造方法に従って製造した式 (I) の化合物が、異性体の混合物として得られる場合は、従来の手法に従って実施される、式 (I) の単一異性体へのそれらの分離がやはり本発明の範囲内であることは、当業者には明白である。

【0091】

同様に、当技術分野において周知の手順に従った、対応するその塩の式 (I) の化合物への変換は、やはり本発明の範囲内である。

20

【0092】

前記製造方法の段階 a) によれば、式 (III) の化合物、好ましくは 2 - アミノ - 4 - メトキシ - ベンゾニトリル又は 2 - アミノ - 5 - ベンジルオキシ - ベンゾニトリルを亜硝酸ナトリウムと反応させる。そのジアゾニウム塩を、酸性条件下で、例えば塩酸又は硫酸の存在下で、塩化第一スズの存在下に還元する。

【0093】

その反応は、約 0 から約 10 の範囲の温度で、水と、例えばメタノール、エタノール等のような適切な溶媒の混合物中で実施しうる。

【0094】

前記の反応は、約 1 時間から 3 時間にわたって攪拌を続けながら、濃塩酸中の式 (III) の化合物の溶液に亜硝酸ナトリウムを加えることによって実施しうる。

30

【0095】

次に、適切な時間、例えば約 4 時間から約 6 時間にわたって攪拌を続けながら、その懸濁液を濃塩酸中の塩化第一スズの溶液に滴下して移し、約 0 に冷却することができる。

【0096】

前記製造方法の段階 b) によれば、式 (IV) の化合物を、フタルイミド誘導体を製造するための従来の方法に従って無水フタル酸と反応させる。その反応は、クロロホルム、アセトニトリル、ジオキサソ、テトラヒドロフラン、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド等を含む様々な溶媒中で実施しうる。アセトニトリルが好ましい。これに関して、無水フタル酸を式 (V) の溶液に加える。次に温度を適切な値、例えば約 70 から約 100、好ましくは 80 にする。約 1 時間から約 4 時間の範囲の適切な時間にわたって、攪拌を実施する。

40

【0097】

前記製造方法の段階 c) によれば、式 (V) の化合物を、例えば塩酸ピリジニウム塩、ヨードトリメチルシラン又は三臭化ホウ素などの適切なエーテル開裂剤との反応を通して対応するヒドロキシ誘導体に変換する。その反応は、そのままの塩化ピリジニウム中で、又は他の試薬と共にジクロロメタン又はクロロホルム中で実施しうる。好ましくは、そのままの塩化ピリジニウムを使用する。

【0098】

50

これに関して、塩化ピリジニウムと式(V)の化合物の混合物を、約1時間から約3時間の範囲のある時間にわたって攪拌を実施しながら、約180 から約200 の適切な温度にする。

【0099】

前記製造方法の段階d)によれば、式(VI)の化合物を、シリル誘導体、好ましくはtert-ブチル-ジメチル-シリルクロリド(TBDMSCl)と反応させて、対応するシリルエーテル誘導体を得る。その反応は、例えば1,5-ジアザビシクロ[4.3.0]ノン-5-エン(DBN)又は、より好ましくは1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]ウンデク-7-エン(DBU)などの適切な塩基の存在下で実施しうる。

【0100】

これに関して、tert-ブチル-ジメチル-シリルクロリド(TBDMSCl)を式(VI)の化合物の溶液に加える。その反応は、ジクロロメタン、アセトニトリル、ジメチルホルムアミド等のような様々な溶媒中で、好ましくはジクロロメタン中で実施しうる。その温度は、約1時間から4時間の範囲のある時間にわたって攪拌を維持しながら、約20 から約40 の範囲でありうる。

【0101】

前記製造方法の段階e)によれば、このようにして得た式(VII)のインダゾール誘導体を、インダゾール窒素原子で保護するか、あるいは、適切なポリマー樹脂上に支持する。

【0102】

保護反応は、当技術分野において周知の従来の方法に従って、例えば、例えばtert-ブトキシ-カルボニル(BOC)基などの適切な窒素保護基を使用することによって実施しうる。

【0103】

この同じ位置で、代替的に、式(VII)のインダゾールを、例えば、すべてこの分野において慣例的に知られる、2-クロロ-トリチルクロリド樹脂、トリチルクロリド樹脂、p-ニトロフェニルカーボネートワン樹脂又はプロモ-4-(メトキシフェニル)メチルポリスチレンなどの不活性ポリマー支持体上に好都合に固定しうる。

【0104】

明らかに、この同選択肢は、例えば下記で述べるように、組合せ化学手法に従って化合物のライブラリーを作製するときに典型的に採用される、固相合成(SPS)条件下で式(I)の化合物を製造するために特に好都合である。

【0105】

前記樹脂との反応は、適切な溶媒中、例えばジクロロメタン、クロロホルム、テトラヒドロフラン、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド等において、わずかに過剰の適切な塩基、例えばアミン、例えばジイソプロピルエチルアミン(DIPEA)、トリエチルアミン(TEA)、1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]ウンデク-7-エン(DBU)又は2-tert-ブチルイミノ-2-ジエチルアミノ-1,3-ジメチルペルヒドロ-1,3,2-ジアザホスホリンの存在下で実施する。好ましくは、その反応は、ジクロロメタン中約20 の温度で実施する。

【0106】

その反応は、前記樹脂の懸濁液に前記塩基及び式(VII)の化合物を加えて、約20 の温度で適切な時間、例えば最高24時間まで攪拌することによって実施しうる。

【0107】

前記製造方法の段階f)によれば、式(VIII)の誘導体をヒドラジン-水和物で処理して、フタルイミド基を開裂する。

【0108】

その反応は、好ましくは、例えばハロゲン化炭化水素、低級アルコール及びそれらの混合物などの適切な溶媒の存在下に、大きく過剰の、例えば10当量までのヒドラジン水和物又は一水和物を使用することによって実施する。

10

20

30

40

50

【0109】

好ましい溶媒は、ジクロロメタン、エタノール及びそれらの混合物である。

【0110】

前記の反応は、式(VIII)の化合物の溶液にヒドラジンを加え、約20 から約45 の範囲の温度で適切な時間攪拌することによって実施しうる。好ましくは、その反応混合物を、約40 で約16時間、攪拌下に保持する。

【0111】

前記製造方法の段階g.1)又はg.2)のいずれかに応じて、式(IX)のアミノ誘導体を、周知の方法に従って、式(X)から(XIV)までの適切な試薬と、又は式(XVII)の化合物と反応させる。

10

【0112】

典型的には、式(IX)の化合物を：式(X)の化合物と反応させて、式中、R'が前記で定義したとおりである、対応する-NHR'誘導体を得るか；式(XI)の化合物と反応させて、対応する-NHCOR'アシル誘導体を得るか；式(XII)の化合物と反応させて、対応する-NHCNHR'ウレイド誘導体を得るか；式(XIII)の化合物と反応させて、対応する-NHSO₂R'誘導体を得るか；式(XIV)の化合物と反応させて、対応する-NHCOOR'誘導体を得ることができる。選択的に、式(IX)の化合物を、4-ニトロフェニルクロロホルメートの存在下に式R'R''NH(XVII)の化合物と反応させて、対応するウレイド-NHCNRR''誘導体を得ることができる。

20

【0113】

前記反応のいずれもが、対応するアミンから出発することにより、官能基化アミノ誘導体の製造において通常使用される慣例的な方法に従って実施される。

【0114】

好ましくは、式(X)の化合物において、Zは適切な脱離基、例えばヨウ素、臭素又はホウ素酸を表わす；式(XI)、(XIII)又は(XIV)の化合物において、Zはハロゲン原子、さらに一層好ましくは塩素原子を表わす。

【0115】

前記に加えて、所望する場合はいつでも、このようにして製造した、式中、Rが-NHR'又は-NHCNHR'基を表わす式(XV)の前記化合物のいずれもが、それぞれ-NR'R''又は-NHCNRR''基としてRを有する対応する誘導体にさらに変換しうることは、当業者には明白である。

30

【0116】

これらの反応はまた、式(XV)の適切な中間体化合物を式(XVI)の適切な誘導体と反応させることにより、慣例的な方法に従って実施される。

【0117】

これに関して、式(IX)の化合物を、ジクロロメタン、ジメチルホルムアミド、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のような適切な溶媒に溶解し、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、炭酸ナトリウム等のような適切な塩基を加える。次に一般式(XI)、(XIII)又は(XIV)の化合物を加え、その混合物を約20 から約80 の範囲の温度で約2時間から約15時間にわたるある時間攪拌する。一般式(XII)のイソシアネートを使用するとき、その反応条件は、塩基を必要としないことを除いて前記と同じである。これらの反応のすべてにおいて、場合によってはジメチルアミノピリジンなどの適切な触媒を使用してもよい。

40

【0118】

式(XII)の化合物を、周知の方法に従って式(X)の化合物と反応させて、式(XIV)の対応する官能基化アミノ誘導体を得るとき、実質的に類似する手順が適用できる。

【0119】

一例として、慣例的な方法に従って操作することにより、式(IX)の化合物を、式中

50

、Zがハロゲン、例えばヨウ素又は臭素であり、R'が、例えばベンジル基などのアリアルキル基である式(X)の誘導体と反応させる。

【0120】

他方で、式(X)の化合物を、例えばトリス(ジベンジリデンアセトン)ジパラジウム、酢酸パラジウム又は1,1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセンジクロロパラジウムなどのパラジウム触媒の存在下に、適切な塩基、例えばカリウムtert-ブトキシド、炭酸セシウム等、及び2,2'-ビス(ジフェニルホスフィノ)-1,1'-ビナフチル、トリ-o-トリルホスフィン、トリ-n-ブチルホスフィン、トリ-t-ブチルホスフィン等のようなパラジウムリガンドを加えることにより、式中、Zが臭素原子であり、R'がアリアル基である式(X)の誘導体と反応させて、式(XV)の対応する誘導体を得ることができる。

10

【0121】

これに関して、式(X)の化合物を、トルエン、N-メチル-2-ピロリドン、ジメトキシエタン、ジオキサン等のような適切な無水溶媒中に懸濁し、式(X)の化合物、前記触媒、前記塩基及びリガンドをその中に加える。次のその懸濁液を、約8時間から5時間にわたるある時間攪拌を保持しながら、約50 から約100 までの適切な温度にする。その反応は不活性ガス体下で実施する。

【0122】

前記製造方法の段階h)によれば、式(XV)の化合物をフッ化テトラブチルアンモニウムと反応させて、式(XVII)の対応するヒドロキシ誘導体を得る。前記化合物(XV)を、ジオキサン、テトラヒドロフラン等のような無水溶媒に懸濁し、適切な溶媒中のフッ化テトラブチルアンモニウムの溶液を加える。その溶液を約20 から約50 の範囲の温度で約2時間から約16時間攪拌する。

20

【0123】

このようにして得た式(XVII)の化合物を、前記製造方法の段階i)に従って、式(XIX)の適切な誘導体とさらに反応させてもよい。

【0124】

より特定すると、式中、Zが臭素又は塩素などのハロゲン原子又は適切な脱離基である式(XIX)の化合物との反応を、例えば水酸化ナトリウム、水素化ナトリウム、2-tert-ブチルイミノ-2-ジエチルアミノ-1,3-ジメチルペルヒドロ-1,3,2-ジアザ-ホスホリン又はより好ましくは炭酸セシウムなどの塩基の存在下で実施して、式(XX)の対応するエーテル誘導体を得る。

30

【0125】

これに関して、式(XVII)の化合物を、ジメチルアセトアミド、テトラヒドロフラン、ジオキサン又はより好ましくはジメチルホルムアミドなどの適切な溶媒に懸濁して、前記塩基を加える。

【0126】

その混合物を約20 から約80 の範囲の温度で約5時間から約36時間攪拌する。選択的に、これらの式(XX)の同じ化合物は、式(XVII)の誘導体を、Mitsunobu操作条件下で、例えばトリフェニルホスフィン及びジイソプロピルアゾジカルボキシレート存在下に、式中、Zがヒドロキシである式(XIX)の化合物と反応させることによって入手しうる。

40

【0127】

これに関して、トリフェニルホスフィン、ジイソプロピルアゾジカルボキシレート及び一般式(XIX)の化合物を、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のような適切な溶媒に溶解し、その溶液を、トリエチルアミン又はジイソプロピルエチルアミンなどの適切な塩基の存在下に、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のような適切な溶媒に溶解している式(XVII)の化合物の混合物中に移す。その混合物を0 から20 の範囲の温度で約2時間から約15時間までの時間攪拌する。

【0128】

50

最後に、前記製造方法の段階 j) によれば、式 (X X) の化合物を、酸性条件下で慣例的な方法に従って操作することにより、インダゾール窒素原子で脱保護する。式 (X X) の化合物を、メチルアルコール、エチルアルコール等のような適切な溶媒に懸濁し、塩酸の濃縮溶液を加える。その混合物を約 20 から約 40 の範囲の温度、好ましくは約 20 で約 5 時間から約 15 時間までの適切な時間攪拌する。また、式 (X X) のこの同じ中間体化合物は、それを支持する樹脂から開裂される。

【 0 1 2 9 】

樹脂の開裂を、例えばトリフルオロ酢酸の存在下で実施して、式 (I) の所望化合物を生成しうる。前記樹脂を、ジクロロメタン中の 5 % から 95 % トリフルオロ酢酸の溶液に懸濁し、その混合物を約 20 で約 5 分間から約 3 時間までの時間攪拌する。

10

【 0 1 3 0 】

前記のすべてから、式中、 R_1 及び m が前記で定義したとおりであり、R が式 (I I) のフタルイミド基である式 (I) の化合物、及び医薬適合性のそれらの塩が、前記製造方法の段階 h)、i) 及び j) に従って式 (V I I I) の化合物を反応させて、R 基の代りにフタルイミド基 (I I) を担う式 (I) の所望誘導体を得ることにより、類似の製造方法に従って製造しうることは当業者には明白である。

【 0 1 3 1 】

好ましくは、式中、R がスルホンアミド (- N H S O ₂ R ') 基である式 (I) の化合物を製造するとき、脱保護段階の順序を変えることにより、前記合成経路を好都合に修正することができる。

20

【 0 1 3 2 】

より特定すると、式中、R が - N H S O ₂ R ' 基である式 (I) の化合物は、好ましくは、前記製造方法の段階 (e) に従って得られる式 (V I I I) の中間体誘導体を、前記製造方法の段階 (h) に従ってフッ化テトラブチルアンモニウムと反応させて、式中、R がフタルイミド基である式 (X V I I I) の化合物を得ることによって製造しうる。

【 0 1 3 3 】

このようにして得た式 (X V I I I) の化合物を、次に、前記製造方法の段階 (i) に従って式 (X I X) の誘導体と反応させて、式中、R がフタルイミド基である式 (X X) の化合物を得る。

【 0 1 3 4 】

次に式 (X X) の前記化合物を、前記製造方法の段階 (f) に従ってヒドラジン-水合物と反応させて、式中、R が - N H ₂ である式 (X X) の化合物を得る。

30

【 0 1 3 5 】

最後に、式 (X X) の前記化合物を、前記製造方法の段階 (g . 1) に従って式 (X I I I) の適切な誘導体と反応させ、式中、R が所与の - N H S O ₂ R ' 基を表わす、式 (X X) の対応するスルホンアミド誘導体を得て、それをさらに前記製造方法の段階 (j) に従って脱保護するか又は樹脂から開裂する。

【 0 1 3 6 】

すべて本発明の範囲内として解釈されるべきである、該製造方法の何らかの変法に従って式 (I) の化合物を製造するとき、望ましくない副作用を生じうる出発物質、試薬又はそれらの中間体内の任意の官能基は、慣例的手法に従って適切に保護される必要がある。

40

【 0 1 3 7 】

同様に、これら後者の遊離脱保護化合物への変換は、既知の手順に従って実施しうる。

【 0 1 3 8 】

式 (I) の化合物の医薬適合性の塩又は、代替的に、それらの塩からの遊離化合物は、すべて慣例的な方法に従って入手しうる。

【 0 1 3 9 】

式 (I I I) の化合物は、既知であるか又は既知の方法に従って容易に製造される。一例として、2 - アミノ - 4 - メトキシ - ベンゾニトリルは、Shionogi & Co. の名義の E P - A - 2 5 7 5 8 3 号に述べられているように操作することによって製造

50

しうる；2-アミノ-5-ベンジルオキシ-ベンゾニトリルは、J. H e t e r o c y c l . C h e m . (1 9 7 2) , 9 (4) , 7 5 9 - 7 3 に述べられているように製造しうる。

【0140】

それ自体が市販されていない場合でも、式(X)、(XI)、(XII)、(XIII)、(XIV)、(XVI)、(XVII)及び(XIX)の化合物はすべて、既知であるか又は周知の方法に従って容易に製造される。

【0141】

同様に、シリル誘導体 $(R^{iv})_3SiZ$ ならびにポリマー樹脂を含む本発明の製造方法の試薬は、市販されているか又は市販のソースから容易に製造しうる。

10

【0142】

先に述べたように、本発明の式(I)の化合物は、一連の方法の中でいくつかの中間体の間で上述した反応を実施すること及びSPS条件下で操作することにより、当技術分野において広く知られる組合せ化学手法に従って好都合に製造された。

【0143】

適宜に医薬適合性の塩の形態の、本発明の好ましい化合物はすべて、ここで好都合に、製造方法による産物、すなわち、例えば所与の製造方法を通して入手しうる式(I)の産物と指示され、定義される。

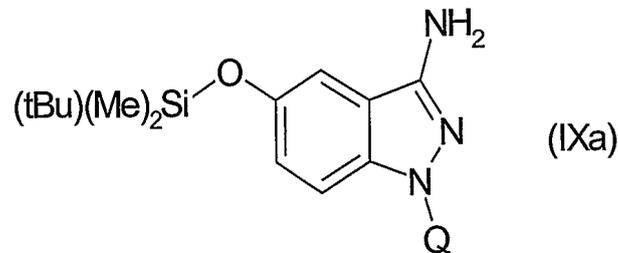
【0144】

それ故、例えば前記製造方法に従った組合せ化学手法を通して入手しうる本発明の新規化合物及び医薬適合性のそれらの塩は、最初に式(IXa)：

20

【0145】

【化19】

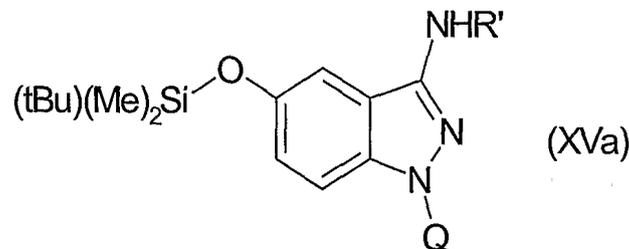


30

の化合物を、表Iに示す式(X)の化合物の各々1つと反応させて、式(XVa)：

【0146】

【化20】



40

の複数の化合物を入手し、次に式(XVa)の誘導体の各々を、前記製造方法の段階h)に従ってフッ化テトラブチルアンモニウムと反応させ、次に表II又はIIIに示す式(XIX)の誘導体の各々1つと反応させること、及びその後前記製造方法の段階j)に従って操作することによって提供される。

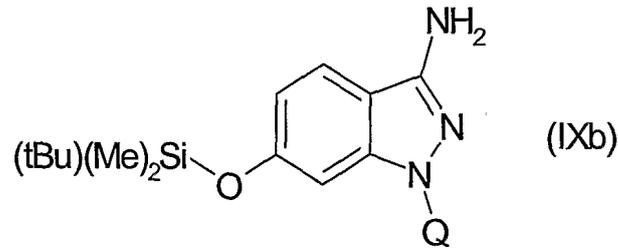
【0147】

例えば前記製造方法に従った組合せ化学手法を通して入手しうる本発明の新規化合物及び医薬適合性のそれらの塩はまた、最初に式(IXb)：

【0148】

50

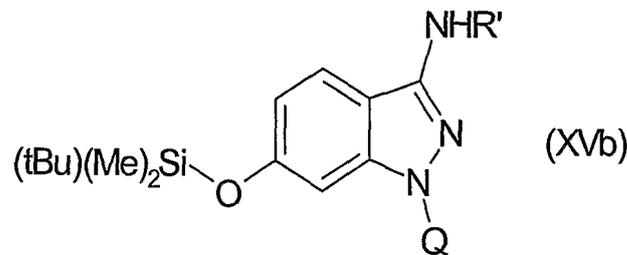
【化 2 1】



の化合物を、表 I に示す式 (X) の化合物の各々 1 つと反応させて、式 (X V b) :

【 0 1 4 9】

【化 2 2】



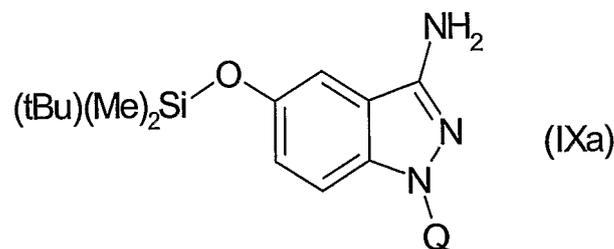
の複数の化合物を入手し、次に式 (X V b) の誘導体の各々を、前記製造方法の段階 h) に従ってフッ化テトラブチルアンモニウムと反応させ、次に表 I I 又は I I I に示す式 (X I X) の誘導体の各々 1 つと反応させること、及びその後前記製造方法の段階 j) に従って操作することによって提供される。

【 0 1 5 0】

例えば前記製造方法に従った組合せ化学手法を通して入手しうる本発明の新規化合物及び医薬適合性のそれらの塩はまた、最初に式 (I X a) :

【 0 1 5 1】

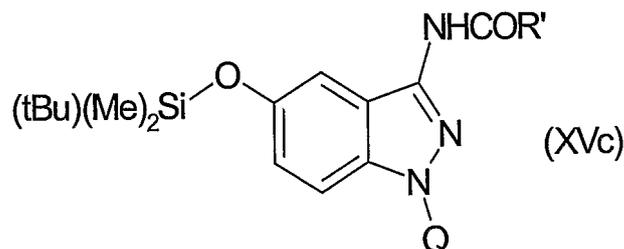
【化 2 3】



の化合物を、表 I V に示す式 (X I) の化合物の各々 1 つと反応させて、式 (X V c) :

【 0 1 5 2】

【化 2 4】



の複数の化合物を入手し、次に式 (X V c) の誘導体の各々を、前記製造方法の段階 h) に従ってフッ化テトラブチルアンモニウムと反応させ、次に表 I I 又は I I I に示す式 (X I X) の誘導体の各々 1 つと反応させること、及びその後前記製造方法の段階 j) に従って操作することによって提供される。

10

20

30

40

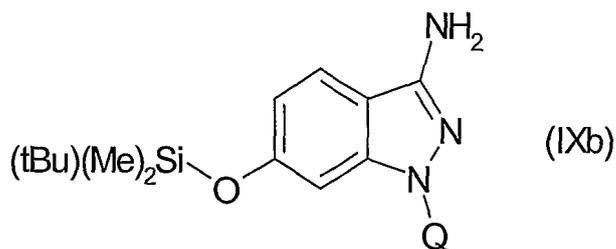
50

【 0 1 5 3 】

例えば前記製造方法に従った組合せ化学手法を通して入手しうる本発明の新規化合物及び医薬適合性のそれらの塩はまた、最初に式 (I X b) :

【 0 1 5 4 】

【 化 2 5 】

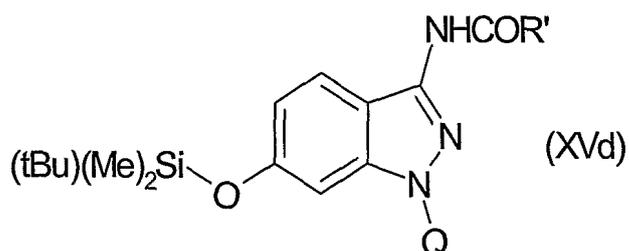


10

の化合物を、表 I V に示す式 (X I) の化合物の各々 1 つと反応させて、式 (X V d) :

【 0 1 5 5 】

【 化 2 6 】



20

の複数の化合物を入手し、次に式 (X V d) の誘導体の各々を、前記製造方法の段階 h) に従ってフッ化テトラブチルアンモニウムと反応させ、次に表 I I 又は I I I に示す式 (X I X) の誘導体の各々 1 つと反応させること、及びその後前記製造方法の段階 j) に従って操作することによって提供される。

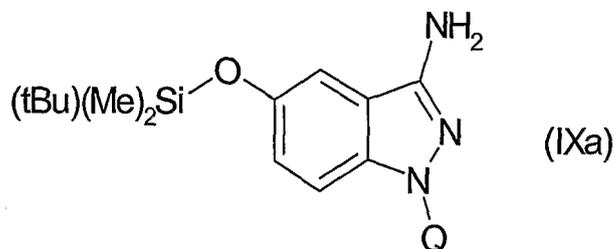
【 0 1 5 6 】

例えば前記製造方法に従った組合せ化学手法を通して入手しうる本発明の新規化合物及び医薬適合性のそれらの塩はまた、最初に式 (I X a) :

30

【 0 1 5 7 】

【 化 2 7 】

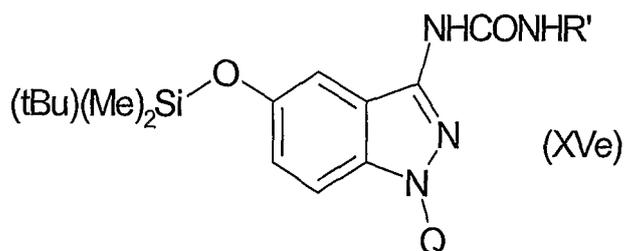


40

の化合物を、表 V に示す式 (X I I) の化合物の各々 1 つと反応させて、式 (X V e) :

【 0 1 5 8 】

【化28】



の複数の化合物を入手し、次に式(XVe)の誘導体の各々を、前記製造方法の段階h)に従ってフッ化テトラブチルアンモニウムと反応させ、次に表II又はIIIに示す式(XIX)の誘導体の各々1つと反応させること、及びその後前記製造方法の段階j)に従って操作することによって提供される。

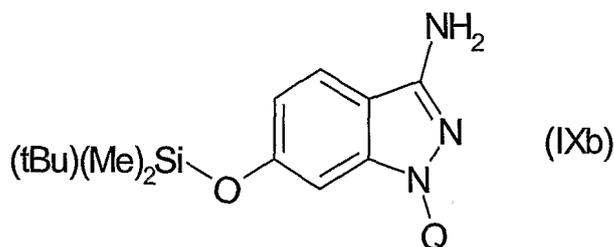
10

【0159】

例えば前記製造方法に従った組合せ化学手法を通して入手しうる本発明の新規化合物及び医薬適合性のそれらの塩はまた、最初に式(IXb)：

【0160】

【化29】

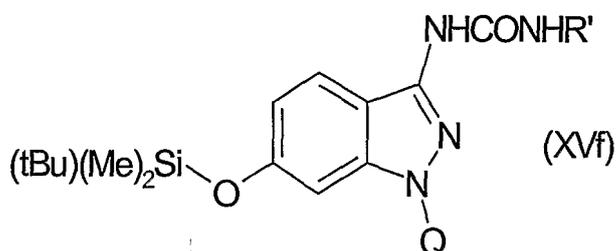


20

の化合物を、表Vに示す式(XII)の化合物の各々1つと反応させて、式(XVf)：

【0161】

【化30】



30

の複数の化合物を入手し、次に式(XVf)の誘導体の各々を、前記製造方法の段階h)に従ってフッ化テトラブチルアンモニウムと反応させ、次に表II又はIIIに示す式(XIX)の誘導体の各々1つと反応させること、及びその後前記製造方法の段階j)に従って操作することによって提供される。

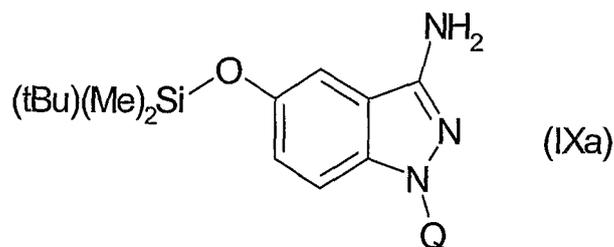
40

【0162】

例えば前記製造方法に従った組合せ化学手法を通して入手しうる本発明の新規化合物及び医薬適合性のそれらの塩はまた、最初に式(IXa)：

【0163】

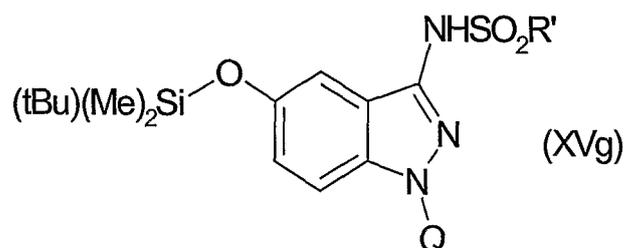
【化 3 1】



の化合物を、表 V I に示す式 (X I I I) の化合物の各々 1 つと反応させて、式 (X V g) 10

【 0 1 6 4】

【化 3 2】



20

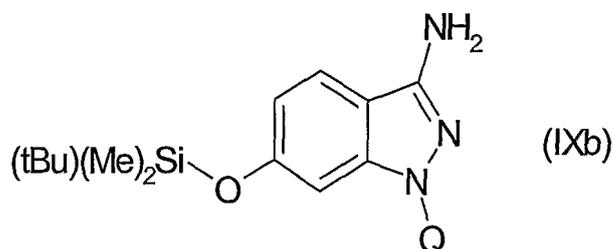
の複数の化合物を入手し、次に式 (X V g) の誘導体の各々を、前記製造方法の段階 h)
に従ってフッ化テトラブチルアンモニウムと反応させ、次に表 I I 又は I I I に示す式 (X I X) の誘導体の各々 1 つと反応させること、及びその後前記製造方法の段階 j) に従って操作することによって提供される。

【 0 1 6 5】

例えば前記製造方法に従った組合せ化学手法を通して入手しうる本発明の新規化合物及び医薬適合性のそれらの塩はまた、最初に式 (I X b) :

【 0 1 6 6】

【化 3 3】

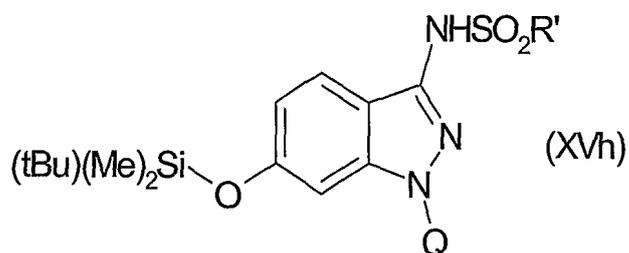


30

の化合物を、表 V I に示す式 (X I I I) の化合物の各々 1 つと反応させて、式 (X V h) 40

【 0 1 6 7】

【化 3 4】



40

の複数の化合物を入手し、次に式 (X V h) の誘導体の各々を、前記製造方法の段階 h) 50

に従ってフッ化テトラブチルアンモニウムと反応させ、次に表 I I 又は I I I に示す式 (X I X) の誘導体の各々 1 つと反応させること、及びその後前記製造方法の段階 j) に従って操作することによって提供される。

【 0 1 6 8 】

【 表 1 】

表 I
式 R' -Z(X) の化合物

1.	(1-フ ^o ロ ^o エチル)ベンゼン
2.	α -フ ^o ロ ^o -m-キシレン
3.	シナミル ^o ロミド
4.	3,4-(エチレンジ ^o キシ)フェニル ^o ロミド
5.	2-フ ^o ロ ^o -1-(4-クロ ^o フェニル)-2-フェニルエタン-1-オン
6.	2-ベンゾ ^o イル-2-フ ^o ロ ^o アセトアミド
7.	α -フ ^o ロ ^o -4-(1-ヒ ^o ロ ^o リジ ^o)アセトフェノ
8.	エチル 2-フ ^o ロ ^o チレート

10

【 0 1 6 9 】

【表 2】

表 II

Z が臭素である、式 R₁-Z(XIX)の化合物

1.	2-フ ^o ロモ-2-フェニルアセトフェノ
2.	臭化ベンジル
3.	2-メチルベンジル ^o ロミト ^o
4.	α-フ ^o ロモ-m-キシレン
5.	2-フ ^o ロモ-2',5'-ジメトキシアセトフェノ
6.	4-メトキシフェニル ^o ロミト ^o
7.	2-フ ^o ロモ-4'-フェニルアセトフェノ
8.	1-フ ^o ロモ ^o ナロン
9.	臭化 ^o ロハ ^o ルキル
10.	1-フ ^o ロモ-3-メチル-2-フ ^o テン
11.	臭化アリル
12.	シナミル ^o ロミト ^o
13.	2-フルオロベンジル ^o ロミト ^o
14.	2-フルオロベンジル ^o ロミト ^o
15.	2,6-ジフルオロベンジル ^o ロミト ^o
16.	2-クロロベンジル ^o ロミト ^o
17.	4-クロロフェニル ^o ロミト ^o
18.	2-シアノベンジル ^o ロミト ^o
19.	4-ニトロベンジル ^o ロミト ^o
20.	メチル 2-フ ^o ロモ ^o チレート
21.	3,5-ジフルオロベンジル ^o ロミト ^o
22.	2,4-ビス(トリフルオロメチル)ベンジル ^o ロミト ^o
23.	2-フ ^o ロモ-n-フェニル ^o ロビ ^o オンアミト ^o
24.	メチル α-フ ^o ロモフェニルアセテート
25.	2-(トリフルオロメチル)ベンジル ^o ロミト ^o
26.	3-フ ^o ロモシクロヘキセン
27.	1-フ ^o ロモ-2-フルオロエタン
28.	1-フ ^o ロモ-3-フルオロ ^o ロハ ^o ン
29.	3,4-ジクロロベンジル ^o ロミト ^o
30.	3,4-ジクロロベンジル ^o ロミト ^o
31.	2-(フ ^o ロモメチル)アントラキノン
32.	4-フ ^o ロモ-2-フルオロベンジル ^o ロミト ^o
33.	4-フルオロ-2-(トリフルオロメチル)ベンジル ^o ロミト ^o
34.	2,3,6-トリフルオロベンジル ^o ロミト ^o
35.	2,4,5-トリフルオロベンジル ^o ロミト ^o
36.	3-(トリフルオロメチル)ベンジル ^o ロミト ^o
37.	4-(トリフルオロメチル)フェニル ^o ロミト ^o
38.	3-(フ ^o ロモメチル)-5-クロロベンゾ ^o [b]チオフェン
39.	2-(ジフルオロメチル)ベンジル ^o ロミト ^o
40.	1-フ ^o ロモ-2-フ ^o チン
41.	1-フ ^o ロモ-2- ^o ンチン

10

20

30

40

42.	(+/-)-3-フ [°] ロ [°] 1-フェニル-2-ヒ [°] ロ [°] リジン
43.	α -フ [°] ロ [°] 4-(1-ヒ [°] ロ [°] リジン)アセトフェノ [°]
44.	ヘン [°] ジ [°] ル 2-フ [°] ロ [°] エチルエ [°] テル
45.	3,5-ジ [°] メ [°] キシヘン [°] ジ [°] ル [°] ロ [°] ミ [°]
46.	4-(フ [°] ロ [°] メチル)-3,5-ジ [°] メチルイソキサゾ [°] ール

【 0 1 7 0 】

【 表 3 】

表 III

Z がヒ[°]ロ[°]キシである、式 R₁-Z(XIX)の化合物

10

1.	3-メチルヘン [°] ジ [°] ルアルコール
2.	シクロヘ [°] ンタノール
3.	3-メトキシヘン [°] ジ [°] ルアルコール
4.	メタノール
5.	4-フルオロ-1-フ [°] タノール
6.	4-フェニル-2-フ [°] タノール
7.	3-ジ [°] メチルアミノ-1-フ [°] ロ [°] ハ [°] ノール
8.	(2-ヒ [°] ロ [°] キシエチル)シクロフ [°] ロ [°] ン
9.	シクロヘ [°] ンタンメタノール
10.	1,2,3,6-テトラヒ [°] ロ [°] ヘン [°] ジ [°] ルアルコール
11.	2-(3-チエニル)エタノール
12.	6-メチル-2-ヘ [°] フ [°] タノール
13.	1-メチル-2-ヒ [°] ロ [°] リジンエタノール
14.	2-メチル-1-フ [°] ロ [°] ハ [°] ノール
15.	1-(2-ヒ [°] ロ [°] キシエチル)ヒ [°] ロ [°] リジン
16.	5-ヘン [°] ジ [°] ルオキシ-1-ヘ [°] ンタノール
17.	1-ヘキサノール
18.	4-メチル-5-チアゾ [°] ールエタノール
19.	3-フ [°] チソ-1-オール
20.	n-(2-ヒ [°] ロ [°] キシエチル)ヒ [°] ロ [°] リジン
21.	テトラヒ [°] ロ [°] フルフリルアルコール
22.	4 [°] -(2-ヒ [°] ロ [°] キシエトキシ)アセトアニリ [°]

20

30

【 0 1 7 1 】

【表4】

表IV
式R' COZ(XI)の化合物

1.	塩化ベンゾイル	
2.	1,3-ベンゾジオキソール-5-カルボニルクロリド	
3.	1-ナフトイルクロリド	
4.	2-フロイルクロリド	
5.	4-ジメチルアミノベンゾイルクロリド	
6.	4-(トリフルオロメチル)ベンゾイルクロリド	10
7.	3,5-ジクロロベンゾイルクロリド	
8.	ベンジロキシアセチルクロリド	
9.	4-tert-ブチルベンゾイルクロリド	
10.	3,4-ジメトキシベンゾイルクロリド	
11.	2-フルオロベンゾイルクロリド	
12.	4-(トリフルオロメトキシ)ベンゾイルクロリド	
13.	1-アセチルイソヘキシルクロリド	
14.	2-フェニルプロピオンイルクロリド	
15.	4-tert-ブチルフェニルアセチルクロリド	
16.	メトキシアセチルクロリド	20
17.	塩化馬尿酸	
18.	4-フロモベンゾイルクロリド	
19.	4-フルオロベンゾイルクロリド	
20.	4-n-ブトキシベンゾイルクロリド	
21.	3-クロロ-4-フルオロベンゾイルクロリド	
22.	2-エトキシ-1-ナフトイルクロリド	
23.	3-クロロチオフェン-2-カルボニルクロリド	
24.	3,5-ジメチルイソキサゾール-4-カルボニルクロリド	
25.	4-エチルベンゾイルクロリド	
26.	2-n-プロピル-n-ヘキシルイルクロリド	
27.	3,5-ジメトキシベンゾイルクロリド	30
28.	(s)-N-トシルフェニルアラニルクロリド	
29.	m-アニソイルクロリド	
30.	塩化ベンゾイル	
31.	塩化シクロプロパノンカルボニル	
32.	塩化フェニルアセチル	
33.	3-クロロベンゾイルクロリド	
34.	4-メトキシフェニルアセチルクロリド	
35.	ヒドロキシナモイルクロリド	
36.	4-tert-ブチルフェニルアセチルクロリド	
37.	4-tert-ブチルフェニルアセチルクロリド	40
38.	4-メトキシフェニルアセチルクロリド	

【0172】

【表5】

表V
式R'-NCO(XII)の化合物

1.	3-メトキシフェニルイソシアネート
2.	p-トリルイソシアネート
3.	3-クロロフェニルイソシアネート
4.	4-ヒドフェニルイソシアネート
5.	4-アセチルフェニルイソシアネート
6.	イソシアン酸ベンゾイル
7.	イソシアン酸イソプロピル
8.	2,4-ジメチルフェニルイソシアネート
9.	2-(ジフルオロメトキシ)フェニルイソシアネート
10.	4-フルオロベンジルイソシアネート
11.	n-ブチルイソシアネート
12.	2,3,4-トリフルオロフェニルイソシアネート
13.	3,5-ジメトキシフェニルイソシアネート
14.	2-(メチルチオ)フェニルイソシアネート
15.	3-(トリフルオロメチル)フェニルイソシアネート
16.	2-フルオロフェニルイソシアネート
17.	2-フェニルエチルイソシアネート
18.	4-メトキシフェニルイソシアネート
19.	3,4-(メチレンジオキシ)フェニルイソシアネート
20.	3-カルボメトキシフェニルイソシアネート
21.	イソシアン酸フェニル
22.	イソシアン酸ベンジル
23.	イソシアン酸イソプロピル

10

20

【0173】

【表 6】

表 VI
式 R' -SO₂Z(XIII)の化合物

1.	4-イソプロピルベンゼンスルホニルクロリド
2.	2-チオフェンスルホニルクロリド
3.	3-(トリフルオロメチル)ベンゼンスルホニルクロリド
4.	4-n-ブチルベンゼンスルホニルクロリド
5.	4-(トリフルオロメトキシ)ベンゼンスルホニルクロリド
6.	2,4-ジフルオロベンゼンスルホニルクロリド
7.	1-ブタンチンチンスルホニルクロリド
8.	3-クロロ-2-メチルベンゼンスルホニルクロリド
9.	3-メトキシベンゼンスルホニルクロリド
10.	3,4-ジクロロベンゼンスルホニルクロリド
11.	3-メチルベンゼンスルホニルクロリド
12.	3,5-ジメチルイソキサゾール-4-スルホニルクロリド
13.	4-クロロ-2,5-ジメチルベンゼンスルホニルクロリド
14.	5-(tert-ブチル)-2-メチルフラン-3-カルボニルクロリド
15.	3,4-ジメトキシベンゼンスルホニルクロリド
16.	2-ナフタレンスルホニルクロリド
17.	8-キノリンスルホニルクロリド
18.	3,4-ジフルオロベンゼンスルホニルクロリド
19.	4-tert-ブチルベンゼンスルホニルクロリド
20.	4-クロロベンゼンスルホニルクロリド
21.	3-メチルベンゼンスルホニルクロリド
22.	N-アセチルスルファニリルクロリド

10

20

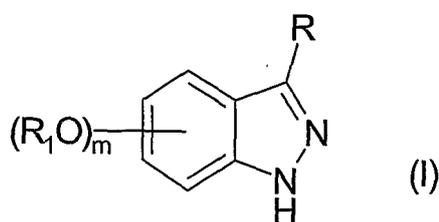
【 0 1 7 4 】

従って、式 (I) :

【 0 1 7 5 】

【 化 3 5 】

30



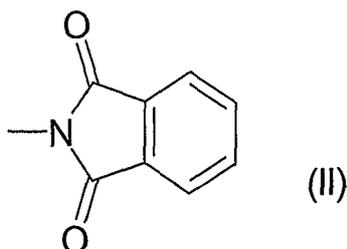
[式中、

R は、-NHR'、-NR'R''、-NHCOR'、-NHCONHR'、-NHCONR'R''、-NHCOOR' 又は -NHCOOR' [式中、R' 及び R'' は、各々独立して、直鎖又は分枝鎖 C₁-C₆ アルキル、C₂-C₆ アルケニル又はアルキニル、C₃-C₆ シクロアルキル又はシクロアルキル C₁-C₆ アルキル、アリール、アリール C₁-C₆ アルキル、窒素、酸素又は硫黄から選択される 1 個から 3 個のヘテロ原子を有する 5 又は 6 員ヘテロシクリル又はヘテロシクリル C₁-C₆ アルキルから選択される、場合によりさらに置換された基である] から成る群より選択されるか；若しくは R は、下記の式 (II) :

40

【 0 1 7 6 】

【化36】



のフタルイミド基であり、

R_1 は、存在する場合は、インダゾール環の5又は6位に位置し、場合によりさらに置換された、 R' 又は R'' について上述した基を表わし；

m は0又は1である]

によって表わされる2又はそれ以上のアミノインダゾール誘導体又は医薬適合性のその塩のライブラリーは、本発明のさらなる目的である。

【0177】

前記のすべてから、例えば数千個の式(I)の化合物から成るインダゾール誘導体のライブラリーがこのようにしてひとたび作製されれば、前記ライブラリーは、先に報告したように、所与のキナーゼをスクリーニングするために非常に好都合に使用できることは当業者には明白である。

【0178】

生物活性をスクリーニングするためのツールとしての化合物のライブラリー及びその使用に関する全般的説明については、*J. Med. Chem.* 1999, 42, 2373-2382；及び *Bioorg. Med. Chem. Lett.* 10(2000), 223-226 参照。

【0179】

(薬理学)

式(I)の化合物はプロテインキナーゼ阻害因子として活性であり、それ故、例えば腫瘍細胞の調節されない増殖を制限するために有用である。治療においては、それらは、例えば癌腫、例えば乳癌、肺癌、膀胱癌、結腸癌、卵巣及び子宮内膜腫瘍、肉腫、例えば軟組織及び骨肉腫、及び例えば白血病のような血液悪性疾患などの様々な腫瘍の治療において有用であると考えられる。

【0180】

さらに、式(I)の化合物はまた、乾癬、アテローム性動脈硬化症に関連する血管平滑筋細胞増殖、術後狭窄及び再狭窄などの他の細胞増殖性疾患の治療において及びアルツハイマー病の治療においても有用である。

【0181】

推定上のcdk/サイクリン阻害因子の阻害活性及び選択した化合物の効力を、SPAテクノロジー(Amersham Pharmacia Biotech)の使用に基づくアッセイ方法を通して測定した。

【0182】

このアッセイは、キナーゼによる、放射能標識したリン酸部分のビオチニル化基質への転移から成る。生じた ^{33}P -標識ビオチニル化産物をストレプトアビジン被覆SPAビーズ(ビオチン容量130 pmol/mg)に結合させ、放出される光をシンチレーション計数器で測定した。

【0183】

cdk2/サイクリンA活性の阻害アッセイ

キナーゼ反応：インハウスビオチニル化ヒストンH1(Sigma #H-5505)基質4 μ M、ATP 10 μ M(P^{33} -ATP 0.1 μ Ci)、サイクリンA/CDK2複合体4.2 ng、最終容量30 μ lの緩衝液(TRIS HCl 10 mM p

10

20

30

40

50

H7.5、MgCl₂ 10mM、DTT 7.5mM + BSA 0.2mg/ml)中の阻害因子を96U底穴平板の各々の穴に加えた。室温で30分間のインキュベーション後、SPAビーズ1mgを含む、PBS 100μl + EDTA 32mM + 0.1% Triton X-100 + ATP 500μMによって反応を停止させた。その後110μlの容量をOptiplateに移した。

【0184】

基質捕獲のために20分間インキュベートした後、5M CsCl 100μlを加えてビーズをプレートの上部まで層化させ、4時間放置した後、Top-Count装置で放射能を測定した。

【0185】

IC50の測定：阻害因子を0.0015μMから10μMの範囲にわたる種々の濃度で試験した。実験データを、4パラメータロジスティック方程式：

$$y = \text{底} + (\text{上部} - \text{底}) / (1 + 10^{-(\log \text{IC}50 - x) \cdot \text{勾配}})$$

[式中、xは阻害因子濃度の対数、yは応答であり；yは底から出発して、S字型の上部に達する]

を使用してコンピュータプログラムGraphPad Prismによって解析した。

【0186】

Kiの算定：

実験方法：酵素3.7nM、ヒストン及びATP（低温/標識ATPの定数比率 1/3000）を含む緩衝液（Tris 10mM pH7.5、MgCl₂ 10mM、BSA 0.2mg/ml、DTT 7.5mM）中で反応を実施した。EDTAで反応を停止させ、ホスホメンブレン（MilliporeからのMultiscreen96穴平板）上に基質を捕獲した。十分に洗った後、マルチスクリーン平板をトップカウンターで読み取った。各々のATP及びヒストン濃度についての対照（ゼロの時点）を測定した。

【0187】

実験計画：異なる4つのATP、基質（ヒストン）及び阻害因子濃度で反応速度を測定する。80ポイント濃度マトリックスをそれぞれATP及び基質Km値、及び阻害因子IC50値付近に設定した（Km又はIC50値の0.3、1、3、9倍）。阻害因子なしで、種々のATP及び基質濃度での予備時間経過実験により、Ki測定実験についての反応の線形範囲内で単一エンドポイント時間（10分）を選択した。

【0188】

速度論的パラメータの評価：完全なデータセット（80ポイント）を用いた[方程式1]（ATPに対する競合的阻害因子、ランダム機構）を使用して同時非線形最小二乗回帰法によって速度論的パラメータを評価した：

【0189】

【数1】

$$v = \frac{V_m \cdot A \cdot B}{\alpha \cdot K_a \cdot K_b + \alpha \cdot K_a \cdot B + \alpha \cdot K_b \cdot A + A \cdot B + \alpha \cdot \frac{K_a}{K_i} \cdot I \cdot (K_b + \frac{B}{\beta})} \quad \text{[方程式1]}$$

[式中、A = [ATP]、B = [基質]、I = [阻害因子]、V_m = 最大速度、K_a、K_b、K_i = それぞれATP、基質及び阻害因子の解離定数、及びβ = それぞれ基質とATPの結合及び基質と阻害因子の結合の間の協同性係数]。

【0190】

さらに、細胞周期に厳密に関係付けたser/threoキナーゼ（cdk2/サイクリンE、cdk1/サイクリンB1、cdk5/p25、cdk4/サイクリンD1）のパネル上で、及びMAPK、PKA、EGFR、IGF1-R及びAurora-2に対する特異性に関して、選択した化合物を特徴付けた。

cdk2/サイクリンE活性の阻害アッセイ

10

20

30

40

50

キナーゼ反応：インハウスビオチニル化ヒストンH1 (Sigma #H-5505) 基質10 μ M、ATP 30 μ M (P^{33} -ATP 0.3 μ Ci)、GST-サイクリンE/CDK2複合体4ng、最終容量30 μ lの緩衝液 (TRIS HCl 10mM pH7.5、MgCl₂ 10mM、DTT 7.5mM+BSA 0.2mg/ml) 中の阻害因子を96U底穴平板の各々の穴に加えた。室温で60分間のインキュベーション後、SPAビーズ1mgを含む、PBS 100 μ l+EDTA 32mM+0.1% Triton X-100+ATP 500 μ Mによって反応を停止させた。その後110 μ lの容量をOptiplateに移した。

【0191】

基質捕獲のために20分間インキュベートした後、5M CsCl 100 μ lを加えてビーズをプレートの上部まで層化させ、4時間放置した後、Top-Count装置で放射能を測定した。

10

【0192】

IC50の測定：前記参照。

【0193】

cdk1/サイクリンB1活性の阻害アッセイ

キナーゼ反応：インハウスビオチニル化ヒストンH1 (Sigma #H-5505) 基質4 μ M、ATP 20 μ M (P^{33} -ATP 0.2 μ Ci)、サイクリンB/CDK1複合体3ng、最終容量30 μ lの緩衝液 (TRIS HCl 10mM pH7.5、MgCl₂ 10mM、DTT 7.5mM+BSA 0.2mg/ml) 中の阻害因子を96U底穴平板の各々の穴に加えた。室温で20分間のインキュベーション後、SPAビーズ1mgを含む、PBS 100 μ l+EDTA 32mM+0.1% Triton X-100+ATP 500 μ Mによって反応を停止させた。その後110 μ lの容量をOptiplateに移した。

20

【0194】

基質捕獲のために20分間インキュベートした後、5M CsCl 100 μ lを加えてビーズをプレートの上部まで層化させ、4時間放置した後、Top-Count装置で放射能を測定した。

【0195】

IC50の測定：前記参照。

30

【0196】

cdk5/p25活性の阻害アッセイ

cdk5/p25活性の阻害アッセイを下記のプロトコールに従って実施した。

【0197】

キナーゼ反応：ビオチニル化ヒストンH1 (Sigma #H-5505) 基質10 μ M、ATP 30 μ M (P^{33} -ATP 0.3 μ Ci)、CDK5/p25複合体15ng、最終容量30 μ lの緩衝液 (TRIS HCl 10mM pH7.5、MgCl₂ 10mM、DTT 7.5mM+BSA 0.2mg/ml) 中の阻害因子を96U底穴平板の各々の穴に加えた。室温で30分間のインキュベーション後、SPAビーズ1mgを含む、PBS 100 μ l+EDTA 32mM+0.1% Triton X-100+ATP 500 μ Mによって反応を停止させた。その後110 μ lの容量をOptiplateに移した。

40

【0198】

基質捕獲のために20分間インキュベートした後、5M CsCl 100 μ lを加えてビーズをプレートの上部まで層化させ、4時間放置した後、Top-Count装置で放射能を測定した。

【0199】

IC50の測定：前記参照。

【0200】

cdk4/サイクリンD1活性の阻害アッセイ

50

キナーゼ反応：マウスGST-Rb(769-921)(Santa Cruzからの#sc-4112)基質0.4 μ M、ATP 10 μ M(P^{33} -ATP 0.5 μ Ci)、バキュロウイルス発現GST-cdk4/GST-サイクリンD1 100ng、最終容量50 μ lの緩衝液(TRIS HCl 10mM pH7.5、MgCl₂ 10mM、DTT 7.5mM+BSA 0.2mg/ml)中の適切な濃度の阻害因子を96U底穴平板の各々の穴に加えた。37 $^{\circ}$ Cで40分間のインキュベーション後、EDTA 120mM 20 μ lによって反応を停止させた。

【0201】

捕獲：60 μ lを各々の穴からMultiScreen平板に移し、基質をホスホセルロースフィルターに結合させた。次に平板を150 μ l/穴のCa⁺⁺/Mg⁺⁺不含PBSで3回洗い、MultiScreen濾過システムによって濾過した。

10

【0202】

検出：フィルターを37 $^{\circ}$ Cで乾燥し、次に100 μ l/穴のシンチラントを加えて、Top-Count装置での放射能測定により 33 P標識Rbフラグメントを検出した。

【0203】

IC50の測定：前記参照。

【0204】

MAPK活性の阻害アッセイ

キナーゼ反応：インハウスビオチニル化MBP(Sigma #M-1891)基質10 μ M、ATP 15 μ M(P^{33} -ATP 0.15 μ Ci)、GST-MAPK(Upstate Biotechnology #14-173)30ng、最終容量30 μ lの緩衝液(TRIS HCl 10mM pH7.5、MgCl₂ 10mM、DTT 7.5mM+BSA 0.2mg/ml)中の阻害因子を96U底穴平板の各々の穴に加えた。室温で30分間のインキュベーション後、SPAビーズ1mgを含む、PBS 100 μ l+EDTA 32mM+0.1%Triton X-100+ATP 500 μ Mによって反応を停止させた。その後110 μ lの容量をOptiplateに移した。

20

【0205】

基質捕獲のために20分間インキュベートした後、5M CsCl 100 μ lを加えてビーズをOptiplateの上部まで層化させ、4時間放置した後、Top-Count装置で放射能を測定した。

30

【0206】

IC50の測定：前記参照。

【0207】

PKA活性の阻害アッセイ

キナーゼ反応：インハウスビオチニル化ヒストンH1(Sigma #H-5505)基質10 μ M、ATP 10 μ M(P^{33} -ATP 0.2 μ Ci)、PKA(Sigma #2645)0.45U、最終容量30 μ lの緩衝液(TRIS HCl 10mM pH7.5、MgCl₂ 10mM、DTT 7.5mM+BSA 0.2mg/ml)中の阻害因子を96U底穴平板の各々の穴に加えた。室温で90分間のインキュベーション後、SPAビーズ1mgを含む、PBS 100 μ l+EDTA 32mM+0.1%Triton X-100+ATP 500 μ Mによって反応を停止させた。その後110 μ lの容量をOptiplateに移した。

40

【0208】

基質捕獲のために20分間インキュベートした後、5M CsCl 100 μ lを加えてビーズをOptiplateの上部まで層化させ、4時間放置した後、Top-Count装置で放射能を測定した。

【0209】

IC50の測定：前記参照。

【0210】

50

E G F R 活性の阻害アッセイ

キナーゼ反応：インハウスビオチニル化MBP (Sigma #M-1891) 基質 10 μ M、ATP 2 μ M (P^{33} -ATP 0.04 μ Ci)、昆虫細胞発現GST-E G F R 36 ng、最終容量30 μ lの緩衝液 (Hepes 50 mM pH 7.5、MgCl₂ 3 mM、MnCl₂ 3 mM、DTT 1 mM、NaVO₃ 3 μ M + BSA 0.2 mg/ml) 中の阻害因子を96 U底穴平板の各々の穴に加えた。室温で20分間のインキュベーション後、SPAビーズ1 mgを含む、PBS 100 μ l + EDTA 32 mM + 0.1% Triton X-100 + ATP 500 μ Mによって反応を停止させた。その後110 μ lの容量をOptiplateに移した。

【0211】

基質捕獲のために20分間インキュベートした後、5M CsCl 100 μ lを加えてビーズをOptiplateの上部まで層化させ、4時間放置した後、Top-Count装置で放射能を測定した。

【0212】

IC50の測定：前記参照。

【0213】

I G F 1 - R 活性の阻害アッセイ

I G F 1 - R 活性の阻害アッセイを下記のプロトコールに従って実施した。

【0214】

キナーゼ反応：ビオチニル化MBP (Sigmaカタログ#M-1891) 基質10 μ M、阻害因子0 μ Mから20 μ M、ATP 6 μ M、 P^{33} -ATP 1 μ Ci、及び最終容量30 μ lの緩衝液 (HEPES 50 mM pH 7.9、MnCl₂ 3 mM、DTT 1 mM、NaVO₃ 3 μ M) 中のGST-I G F 1 - R (低温ATP 60 μ Mと共に室温で30分間、前インキュベートした) 22.5 ngを96 U底穴平板の各々の穴に加えた。室温で35分間のインキュベーション後、EDTA 32 mM、低温ATP 500 μ M、0.1% Triton X-100及び10 mg/mlストレプトアビジン被覆SPAビーズを加えて反応を停止させた。20分間のインキュベーション後、懸濁液110 μ lを回収し、5M CsCl 100 μ lを含む96穴OPTIPLATEに移した。4時間後、Packard TOP-Count放射能測定器で2分間平板を読み取った。

【0215】

Aurora-2 活性の阻害アッセイ

キナーゼ反応：ビオチニル化ペプチド (LRRWSLGの4反復) 8 μ M、ATP 10 μ M (P^{33} -ATP 0.5 μ Ci)、Aurora2 15 ng、最終容量30 μ lの緩衝液 (HEPES 50 mM pH 7.0、MgCl₂ 10 mM、DTT 1 mM、BSA 0.2 mg/ml、オルトバナジン酸塩3 μ M) 中の阻害因子を96 U底穴平板の各々の穴に加えた。室温で30分間のインキュベーション後、ビーズ懸濁液100 μ lを加えて反応を停止させ、ビオチニル化ペプチドを捕獲した。

【0216】

層化：5M CsCl₂ 100 μ lを各々の穴に加えて、4時間放置した後、Top-Count装置で放射能を測定した。

【0217】

IC50の測定：前記参照。

【0218】

Cdc7/dbf4 活性の阻害アッセイ

Cdc7/dbf4 活性の阻害アッセイを下記のプロトコールに従って実施した。

【0219】

ビオチン-MCM2 基質を、 P^{33} -ATPでトレースしたATPの存在下にCdc7/Dbf4複合体によってトランス-リン酸化する。次に、リン酸化したビオチン-MCM2 基質をストレプトアビジン被覆SPAビーズによって捕獲し、リン酸化の程度を計

10

20

30

40

50

数によって評価する。

【0220】

Cdc7/dbf4活性の阻害アッセイを下記のプロトコールに従って96穴平板で実施した。

【0221】

平板の各々の穴に次のものを加えた：

- 基質10 μ l (ピオチニル化MCM2、最終濃度6 μ M)
- 酵素10 μ l (Cdc/Dbf4、最終濃度12.5nM)
- 被験化合物10 μ l (用量-反応曲線を作成するための、nMから μ Mの範囲内の12の漸増濃度)

- 次に、低温ATP (最終濃度10 μ M)と放射性ATP (低温ATPとのモル比1/2500)の混合物10 μ lを使用して、37 $^{\circ}$ Cで反応を開始させた。

【0222】

基質、酵素及びATPを、MgCl₂ 15mM、DTT 2mM、NaVO₃ 3 μ M、グリセロリン酸塩2mM及びBSA 0.2mg/mlを含むHEPES 50mM pH7.9に希釈した。被験化合物のための溶媒は、10%DMSOも含有した。

【0223】

20分間のインキュベーション後、EDTA 50mM、低温ATP 1mM、0.1%Triton X100及びストレプトアビジン被覆SPAビーズ10mg/mlを含むPBS 100 μ l、pH7.4を各々の穴に加えて反応を停止させた。

【0224】

室温で15分間インキュベートしてピオチニル化MCM2-ストレプトアビジン被覆SPAビーズの相互作用を生じさせた後、Packard Cell Harvester (Filtermate)を用いてビーズを96穴フィルター平板(Unifilter (登録商標)GF/B (商標))に捕獲し、蒸留水で洗って、Top Count (Packard)を用いて計数した。

【0225】

計数からブランクを差し引き、実験データ(各々のポイントを3回)を、非線形回帰分析(Sigma Plot)を用いてIC50測定について解析した。

【0226】

哺乳動物、例えばヒトへの投与に適する本発明の式(I)の化合物は、通常の経路によって投与することができ、その用量レベルは、患者の年齢、体重、状態及び投与経路に依存する。

【0227】

例えば、式(I)の化合物の経口投与のために採用される適切な用量は、1日1-5回、約10mgから約500mgプロ用量の範囲をとりうる。

【0228】

本発明の化合物は、様々な投与剤型で、例えば経口的に、錠剤、カプセル、糖衣錠又は薄膜被覆錠、液体溶液又は懸濁液の形態で；坐薬の形態で経直腸的に；非経口的に、例えば筋肉内経路で、又は静脈内及び/又はクモ膜下腔内及び/又は髄腔内注射又は注入によって、投与することができる。

【0229】

さらに、本発明の化合物は、単一薬剤として、あるいは、細胞増殖抑制剤又は細胞障害性薬剤、抗生物質型薬剤、アルキル化剤、代謝拮抗剤、ホルモン剤、免疫学的薬剤、インターフェロン型薬剤、シクロオキシゲナーゼ阻害因子(例えばCOX-2阻害因子)、メタロマトリックスポテアーゼ阻害因子、テロメラーゼ阻害因子、チロシンキナーゼ阻害因子、抗増殖因子受容体物質、抗HER物質、抗EGFR物質、抗血管新生剤、ファルネシルトランスフェラーゼ阻害因子、ras-rafシグナル伝達経路阻害因子、細胞周期阻止因子、他のcdk阻害因子、チューブリン結合物質、トポイソメラーゼI阻害因子、トポイソメラーゼII阻害因子等と組み合わせた放射線療法又は化学療法プログラムなど

10

20

30

40

50

の既知の抗癌治療との組合せとして投与することができる。

【0230】

一例として、本発明の化合物は、例えば、場合によりそのリポソーム製剤中の、エクセメスタン、フォルメスタン、アナストロゾール、レトロゾール、ファドロゾール、タキサン、タキサン誘導体、被包タキサン、CPT-11、カンプトテシン誘導体、アントラサイクリン配糖体、例えばドキソルピシン、イダルピシン、エピルピシン、エトポシド、ナベルピン、ピンブラスチン、カルボプラチン、シスプラチン、エストラムスチン、セレコキシブ、タモキシフェン、ラロキシフェン、Sugen SU-5416、Sugen SU-6668、Herceptin等のような1又はそれ以上の化学療法剤と組み合わせて投与することができる。

10

【0231】

固定用量として製剤する場合、そのような組合せ製品は、上述した用量範囲内の本発明の化合物と、認可されている用量範囲内の他の製薬活性物質を用いる。

【0232】

組合せ製剤が不適切であるとき、式(I)の化合物は、既知の抗癌剤と連続的に使用しうる。

【0233】

本発明はまた、医薬適合性の賦形剤(担体又は希釈剤でありうる)と共に式(I)の化合物又は医薬適合性のその塩を含有する医薬組成物を包含する。

【0234】

本発明の化合物を含有する医薬組成物は、通常、従来の方法に従って製造され、製薬上適切な形態で投与される。

20

【0235】

例えば、固体経口製剤は、活性化合物と共に、希釈剤、例えばラクトース、デキストロース、サッカロース、スクロース、セルロース、トウモロコシデンプン又はジャガイモデンプン；潤滑剤、例えばシリカ、滑石、ステアリン酸、ステアリン酸マグネシウム又はカルシウム、及び/又はポリエチレングリコール；結合剤、例えばデンプン、アラビアゴム、ゼラチン、メチルセルロース、カルボキシメチルセルロース又はポリビニルピロリドン；離解剤、例えばデンプン、アルギン酸、アルギン酸塩又はデンプングリコール酸ナトリウム；起泡性混合物；染料；甘味料；レシチン、ポリソルベート、ラウリル硫酸塩などの湿潤剤；及び、一般に、医薬製剤において使用される非毒性で薬理的に不活性な物質を含みうる。前記医薬組成物は、既知の方法で、例えば混合、顆粒化、錠剤化、糖被覆、又は薄膜被覆製造方法によって製造しうる。

30

【0236】

経口投与用の液体分散剤は、例えばシロップ、乳剤及び懸濁液でありうる。

【0237】

シロップは、担体として、例えばサッカロース又はグリセリン及び/又はマンニトール含有サッカロース及び/又はソルビトールを含みうる。

【0238】

懸濁液及び乳剤は、担体として、天然ゴム、寒天、アルギン酸ナトリウム、ペクチン、メチルセルロース、カルボキシメチルセルロース又はポリビニルアルコールを含みうる。

40

【0239】

筋肉内注射用の懸濁液又は溶液は、活性化合物と共に、医薬適合性の担体、例えば無菌水、オリーブ油、オレイン酸エチル、グリコール、例えばプロピレングリコール、及び、所望に応じて、適切な量の塩酸リドカインを含みうる。静脈内注射又は注入用の溶液は、担体として、例えば無菌水を含みうるか、又は好ましくは、それらは無菌水性等張塩類溶液の形態であるか又は担体としてプロピレングリコールを含みうる。

【0240】

坐薬は、活性化合物と共に、医薬適合性の担体、例えばココアバター、ポリエチレングリコール、ポリオキシエチレンソルビタン脂肪エステル界面活性剤又はレシチンを含みう

50

る。

【0241】

下記の実施例は、本発明にいかなる限定も課すことなく、本発明をよりよく説明することを意図するものである。

【0242】

(一般的方法)

フラッシュクロマトグラフィーはシリカゲル(Merckグレード9395、60A)上で実施した。高圧液体クロマトグラフィーの保持時間(HPLC: R_t 値)は下記の方法によって決定した:

方法1:

装置: 996 Waters PDA検出器を備えたWaters 2790 HPLCシステム及びエレクトロスプレー(ESI)イオン源を備えたMicromass ZQ型単一四重極質量分析計。

【0243】

クロマトグラフィー条件: RP18 Waters X Terra (4.6 x 50 mm、3.5 μ m) カラム; 移動相Aは、5 mM酢酸アンモニウム緩衝液(pH 5.5、酢酸/アセトニトリル95:5)であり、移動相Bは、H₂O/アセトニトリル(5:95)であった。8分間で10%から90%Bの勾配、90%Bを2分間保持。220 nm及び254 nmでの紫外吸収検出。流速1 ml/分。注入量10 μ l。フルスキャン、100 amuから800 amuの質量範囲。毛管電圧は2.5 KVであった; ソース温度は120 であった; コーンは10 Vであった。保持時間(HPLC r.t.)は、220 nm又は254 nmでの分単位で示す。質量はm/z比で示す。

【0244】

方法2:

装置: 恒温に保たれた自動試料採取器を備えるWaters 2790 Alliance; 二波長紫外吸収検出器2487; Satin Interface; DivertバルブLab Pro、ESIインターフェースを備えたWaters ZQ単一四重極質量分析計; Antek化学発光窒素検出器(CLND)8060。

【0245】

クロマトグラフィー条件: Zorbax SB C8 (4.6 x 50 mm; 5 μ m) カラム; 移動相Aは、アセトニトリル中の0.01%ギ酸であり、移動相Bは、メタノール中の0.01%ギ酸であった。10分間で0%から95%Bの勾配、95%を2分間保持。220 nmでの紫外吸収検出。流速1 ml/分。注入量10 μ l。フルスキャン、120 amuから1000 amuの質量範囲。毛管電圧2.8 KV; ソース温度115 ; コーンは32 Vであった。

【0246】

保持時間(HPLC r.t.)は、220 nm又は254 nmでの分単位で示す。質量はm/z比で示す。

【0247】

方法3:

装置: HP1100 HPLC二元ポンプ; Gilson 215自動試料採取器、HP1100単一波紫外吸収検出器、Sedex 75c蒸発光散乱(ELS)検出器(Sedere, France); 及びPE/Sciex API-2000質量分析計。

【0248】

クロマトグラフィー条件: YMC ODS-AQ 4.6 x 50 mm、5 μ mのS5カラム; HPLCグレードの水中の0.5%ギ酸(A)及びHPLCグレードのアセトニトリル中の0.5%ギ酸(B)から成るHPLC移動相。表に示すHPLC勾配を、各々の試料について5 μ lを注入して実施した。紫外吸収は220 nmで検出した。

【0249】

10

20

30

40

【表 7】

LC/MS/UV/ELS 勾配			
時間 (分)	流速 (mL/分)	% A	% B
0.00	2.0	98	2
2.58	2.0	2	98
3.08	2.0	2	98
3.13	2.0	0	100
3.28	2.0	0	100
3.33	2.0	98	2
4.00	2.0	98	2

10

【0250】

Turbo Ion Sprayソースを、イオンスプレー電圧5 kV、温度475℃、オリフィス及びリング電圧、それぞれ10 V及び250 Vで使用した。正イオンをQ1において160から800 amuまで走査した。

20

【0251】

必要に応じて、996 Waters PDA検出器及びMicromass ZMD型単一四重極質量分析計を備えたWaters分取HPLC 600、エレクトロスプレーイオン化法、正のモードを使用して、Waters Symmetry C18 (19 × 50 mm、5 μm)カラムでの分取HPLCによって化合物を精製した。移動相Aは水中0.01% TFAであり、移動相Bはアセトニトリルであった。8分間で10%から90% Bの勾配、90% Bを2分間保持。流速20 ml / 分。

【0252】

5 mmの二重共鳴プローブ [1H (15N - 31P) ID_PFG Varian] を備え、400.45 MHzで操作するMercury VX 400で、1H NMR分光測定法を実施した。

30

【0253】

先に述べたように、本発明の式(I)のいくつかの化合物を、組み合わせ化学手法に従って平行して合成した。

【0254】

これに関して、そのようにして製造した一部の化合物は、HPLC保持時間(方法1-3)及び質量と共に、表IXからXVIのコードシステムに従って、好都合且つ明確に特定された。

【0255】

式(I)の1つの特定化合物を特定する各々のコードは、3つの単位A - M - Bからなる。

40

【0256】

Aは、置換基R₁ - [式(I)参照]を表わし、酸素原子を通してインダゾール部分の残りの部分に結合して、5位(A - M1 - B)又は6位(A - M2 - B)で置換されたインダゾール誘導体を形成する；各々のA基(置換基)を下記の表VIIに示す。

【0257】

結合しているインダゾール部分の3位の - NH - 基と共に、B - NH - は式(I)のR基を表わす；各々のB基(置換基)を下記の表VIIIに示す。

【0258】

50

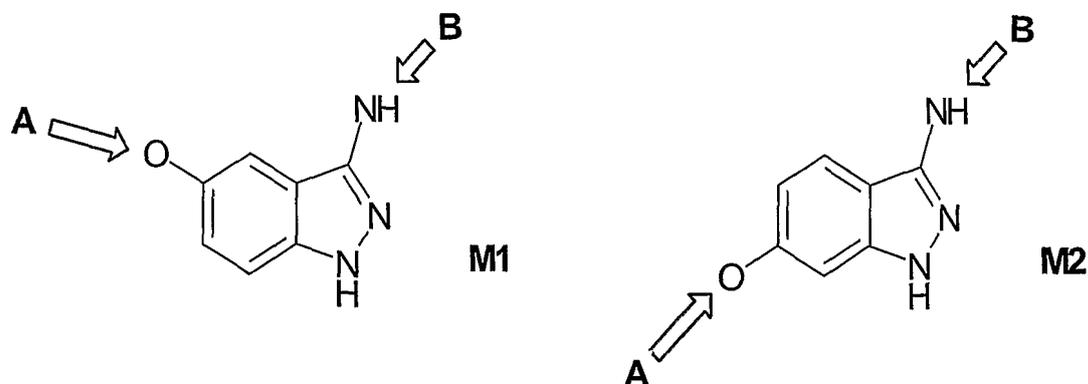
Mは、5位又は6位に-O-基を有する2価3-アミノ-インダゾール部分の中心核を表わし、A及びB基によって置換されている。

【0259】

特に、Mは、各々が5位(M1)又は6位(M2)でA-O-基によって置換されている化合物を特定する、下記の式に従ってM1又はM2から変化しうる。

【0260】

【化37】



10

参照を容易にするため、表VII及びVIIの各々のA又はB群を、分子Mの残りの部分との結合点も示す適切な化学式で特定した。

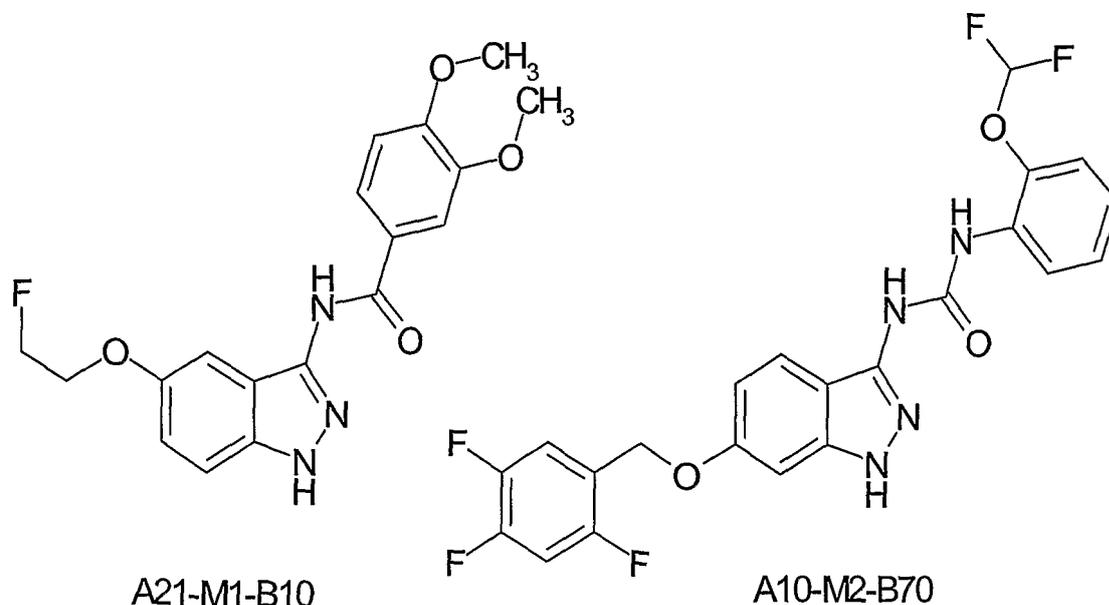
20

【0261】

単なる一例として、表XIの化合物A21-M1-B10(実施例11、登録番号429参照)は、A21基により5位で(酸素原子を通して)、及びB10基により3位で(-NH-基を通して)置換されているインダゾールM1を表わす;同様に、表XIIの化合物A10-M2-B70(実施例12、登録番号281参照)は、A10基により6位で(酸素原子を通して)、及びB70基により3位で(-NH-基を通して)置換されているインダゾールM2を表わす:

【0262】

【化38】



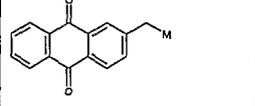
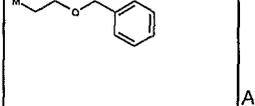
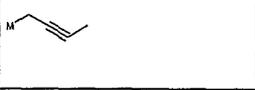
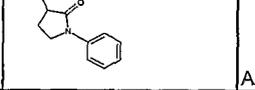
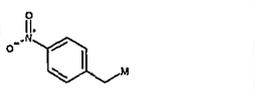
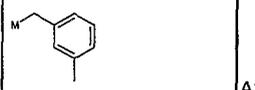
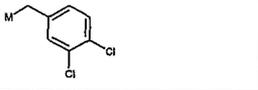
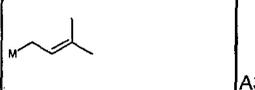
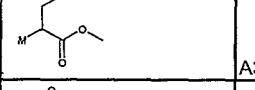
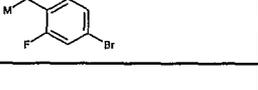
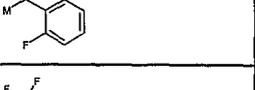
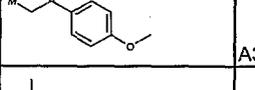
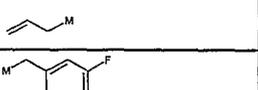
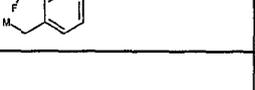
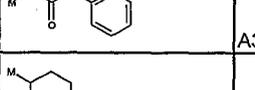
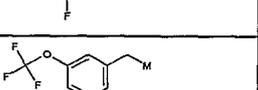
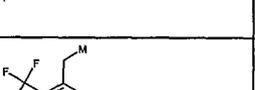
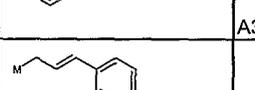
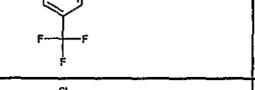
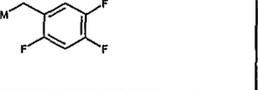
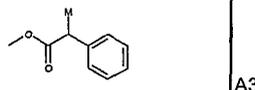
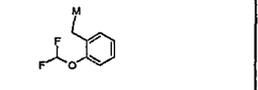
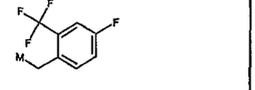
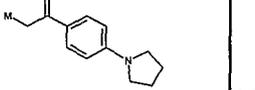
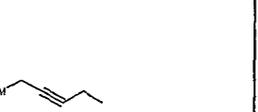
30

40

【0263】

【表 8】

表 V I I - A 群

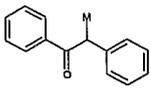
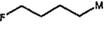
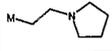
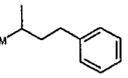
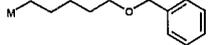
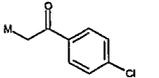
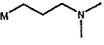
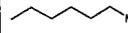
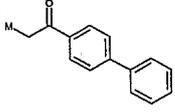
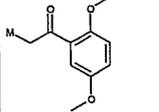
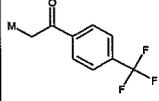
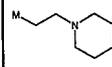
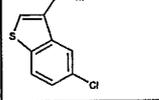
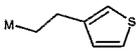
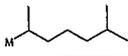
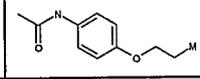
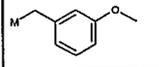
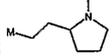
フラグメント	コード	フラグメント	コード	フラグメント	コード
	A00		A13		A27
	A01		A14		A29
	A02		A15		A30
	A03		A16		A31
	A04		A17		A32
	A05		A18		A33
	A06		A20		A35
	A07		A21		A36
	A08		A22		A37
	A09		A23		A38
	A10		A24		A39
	A11		A25		A40
	A12		A26		

10

20

30

40

	A41		A53		A64
	A43		A54		A65
	A44		A55		A66
	A45		A56		A67
	A46		A57		A68
	A47		A58		A69
	A48		A59		A70
	A50		A60		A71
	A51		A61		
	A52		A62		

【 0 2 6 4 】

10

20

30

【表 9】

表VIII-B群

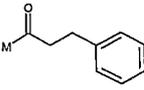
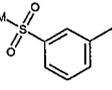
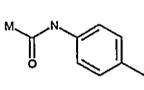
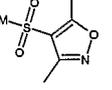
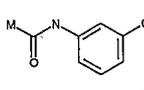
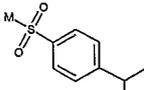
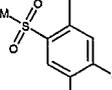
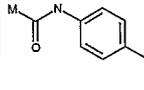
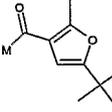
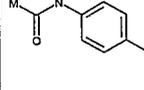
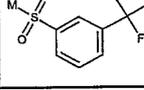
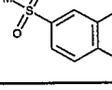
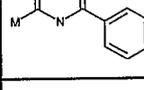
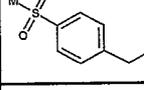
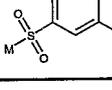
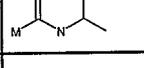
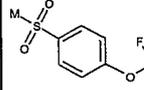
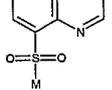
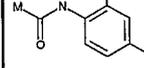
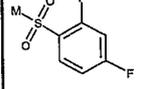
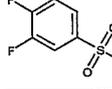
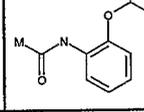
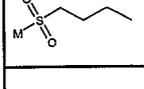
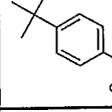
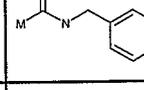
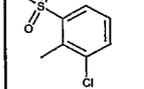
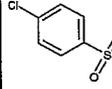
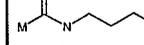
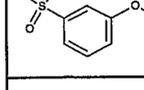
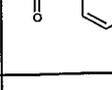
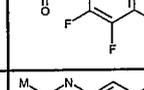
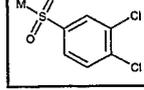
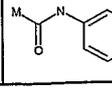
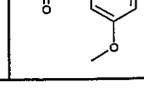
フラグメント	コード	フラグメント	コード	フラグメント	コード
	B01		B12		B23
	B02		B13		B24
	B03		B14		B25
	B04		B15		B26
	B05		B16		B27
	B06		B17		B28
	B07		B18		B29
	B08		B19		B31
	B09		B20		B32
	B10		B21		B33
	B11		B22		B35

10

20

30

40

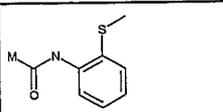
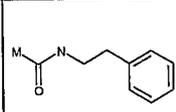
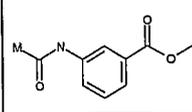
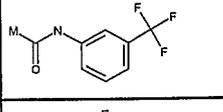
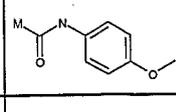
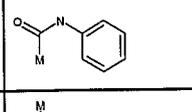
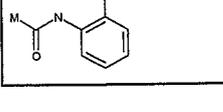
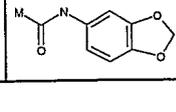
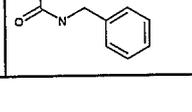
	B36		B50		B63
			B51		B64
	B40		B52		B65
	B41		B53		B66
	B42		B54		B67
	B43		B55		B68
	B44		B56		B69
	B45		B57		B70
	B46		B58		B71
	B47		B59		B72
	B48		B61		B73
	B49		B62		B74

10

20

30

40

	B75		B78		B81
	B76		B79		B82
	B77		B80		B83

10

【実施例 1】

【0265】

6 - メトキシ - 1 H - インダゾール - 3 - アミン

濃塩酸 530 ml 中の 2 - アミノ - 4 - メトキシベンゾニトリル 66.35 g (0.48 mol) の氷冷懸濁液に、水 55 ml 中の硝酸ナトリウム 37.07 g (0.537 mol) の溶液を滴下した。1 時間半後、その低温懸濁液を、濃塩酸 (HCl) 530 ml 中の塩化第一スズ 679.25 g (3.58 mol) のあらかじめ生成しておいた溶液に 5 で滴下した。3 時間後、前記低温懸濁液をろ過し、その湿潤固体を沸騰水 1.7 l で 30 分間処理した。高温混濁溶液を布フィルターで濾過して清澄化した。その液体を氷冷し、17% NaOH 0.8 l を滴下して処理した。固体をろ取り、真空下に 50 で乾燥した；生成物 67.2 g を明褐色固体として得た。収率 = 91.9%。融点 = 195 ~ 197 dec。HPLC r.t. 1.9 [M+H]⁺ = 164。

20

【0266】

¹H NMR (DMSO-d₆)、診断シグナル (ppm) : 3.74 (s, 3H)、5.17 (ブロード s, 2H)、6.5 (dd, 1H)、6.6 (d, 1H)、7.5 (d, 2H)、11.07 (s, 1H)。

【実施例 2】

【0267】

2 - ({ 6 - メトキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 1 H - イソインドール - 1, 3 (2 H) - ジオン

30

6 - メトキシ - 1 H - インダゾール - 3 - アミン 20 g (0.122 mol)、無水フタル酸 20 g (0.135 mol) 及び 4 - ジメチルアミノピリジン 140 mg (1.22 mol) をアセトニトリル 0.4 l 中で 2 時間半還流した。その混合物を 5 に冷却し、ろ過して、最初の収穫の生成物 (24.2 g) を得た。母液を真空下で濃縮し、tert - ブチルメチルエーテル (MTBE) 70 ml で処理した；ろ過によって 2 番目の収穫の生成物 (5.8 g) を得た。次に、合計 30.0 g の生成物を黄色固体として得た。収率 = 83.6%。融点 = 193 ~ 195 。

【0268】

HPLC r.t. 4.7 [M+H]⁺ = 294 [2M+H]⁺ = 587 [3M+H]⁺ = 880。

40

【0269】

¹H NMR (DMSO-d₆)、診断シグナル (ppm) : 3.84 (s, 3H)、6.78 (dd, 1H)、6.96 (d, 1H)、7.55 (dd, 1H)、7.91 - 8.1 (m, 4H)、13.14 (s, 1H)。

【実施例 3】

【0270】

2 - ({ 6 - ヒドロキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 1 H - イソインドール - 1, 3 (2 H) - ジオン

2 - ({ 6 - メトキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 1 H - イソインドール - 1, 3 (2 H) - ジオン 24.2 g (82.5 mmol) と塩酸ピリジン 73.4 g (0

50

．635 mol)の混合物を200 で4時間加熱した。生じた褐色溶液を140 に冷却し、0.2N HCl 250 mlと酢酸エチル350 mlの十分に攪拌した混合物に緩やかに注ぎ入れた。その有機層を分離し、水相に塩(NaCl 45 g)を加えて、酢酸エチル350 mlで2回抽出した。有機抽出物を硫酸ナトリウムで乾燥し、真空下で小容量に濃縮した。その沈殿物をろ取し、乾燥した：生成物15.89 gを黄色固体として得た。収率=68.9%。融点=265~270 dec。

【0271】

HPLC r.t. 3.7 [M+H]⁺ = 280 [2M+H]⁺ = 559 [3M+H]⁺ = 838。

【0272】

¹H NMR (DMSO-d₆)、診断シグナル(ppm)：6.65 (dd, 1H)、6.8 (s, 1H)、7.44 (d, 1H)、7.79 (m, 4H)、9.73 (ブロード s, 1H) 12.86 (s, 1H)。

【実施例4】

【0273】

2-(6-{tert-ブチル(ジメチル)シリル}オキシ)-1H-インダゾール-3-イル)-1H-イソインドール-1,3(2H)-ジオン

ジクロロメタン150 ml中の2-(6-ヒドロキシ)-1H-インダゾール-3-イル)-1H-イソインドール-1,3(2H)-ジオン15.03 g (53.82 mmol)の懸濁液に、ジクロロメタン75 ml中の塩化TBDMs 20.19 g (0.134 mol)の溶液を加えた。生じた混合物を、室温で1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]ウンデク-7-エン(DBU)12.06 ml (80.73 mmol)を滴下して処理し、透明な溶液を得た。3時間後、その反応混合物を0.5N HCl 250 mlに注ぎ入れた。水層を分離し、ジクロロメタン120 mlで抽出した。有機抽出物を硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を真空下で蒸発させた。湿潤な粗生成物を酢酸エチル50 ml中50 で攪拌した。次に、溶媒の約2分の1を真空下で蒸発させ、その混合物をシクロヘキサン100 mlの滴下によって処理した。その生成物を吸引によって明黄色固体として単離した(15.04 g)。収率=71.0%。融点=207~209 。

【0274】

HPLC r.t. 7.6 [M+H]⁺ = 394 [2M+H]⁺ = 787。

【0275】

¹H NMR (DMSO-d₆)、診断シグナル(ppm)：0.21 (s, 6H)、0.98 (s, 9H)、6.71 (dd, 1H)、6.91 (d, 1H)、7.54 (d, 1H)、7.93 (m, 2H)、8.1 (m, 2H)。

【実施例5】

【0276】

5-ベンジルオキシ-1H-インダゾール-3-アミン

濃塩酸500 ml中の2-アミノ-5-(ベンジルオキシ)ベンゾニトリル63.27 g (0.282 mol)の氷冷懸濁液に、水75 ml中の硝酸ナトリウム23.32 g (0.338 mol)の溶液を滴下した。2時間後、その低温懸濁液を、濃塩酸(HCl) 380 ml中の塩化第一スズ509.25 g (2.26 mol)のあらかじめ生成しておいた溶液に2 で滴下した。3時間後、前記低温懸濁液をろ過し、その湿潤固体を沸騰水1.8 l及び95°エタノールで30分間処理した。高温混濁溶液を布フィルターで濾過して清澄化した。その液体を濃縮してエタノールを除去し、4 で35% NaOH 0.35 lを滴下して処理した。固体をろ取し、真空下に50 で乾燥した；生成物73.82 gを明褐色固体として得た。融点=193~195 。HPLC r.t. 4.7 [M]⁺ = 240 [2M+H]⁺ = 479。

【0277】

¹H NMR (DMSO-d₆)、診断シグナル(ppm)：5.03 (s, 2H)、5.16 (ブロード s, 1M)、6.96 (d, 1H)、7.13 (d, 1H)、7.

2.6 (d, 1H), 7.27 - 7.49 (m, 5H)。

【実施例6】

【0278】

2 - [5 - (ベンジルオキシ) - 1H - インダゾール - 3 - イル] - 1H - イソインドール - 1, 3 (2H) - ジオン

5 - ベンジルオキシ - 1H - インダゾール - 3 - アミン 73.82 g を、攪拌下にアセトニトリル 3 l で処理した。その液体を傾瀉し、残留物を、攪拌下にメタノール 0.5 l と酢酸エチル 0.5 l の混合物で処理した。残った固体をろ取し (スズ塩 11.05 g)、液体を真空下で蒸発乾固させた。残留物を前記液体に溶解し、溶媒を真空下で除去して、最終容量約 1 l とした。この溶液に、無水フタル酸 45.97 g (0.31 mol) 及び 4 - ジメチルアミノピリジン 345 mg (2.82 mmol) を加えた。この混合物を 2 時間還流し、その後、真空下で濃縮して最初の収穫の生成物を得た (70.11 g)。母液を濃縮乾燥し、残留物を酢酸エチル 30 ml 及び tert - ブチルメチルエーテル (MTBE) 100 ml で処理した：ろ過によって 2 番目の収穫の生成物 (9.75 g) を得た。合計 79.86 g の生成物を黄色固体として得た。収率 = 76.6% (2つの段階にわたって)。融点 = 190 ~ 192。HPLC r.t. 6.5 分。[M+H]⁺ = 370 [2M+H]⁺ = 739。

10

【0279】

¹H NMR (DMSO - d₆)、診断シグナル (ppm) : 5 (s, 2H)、7.14 (d, 1H)、7.3 - 7.47 (m, 5H)、7.52 (d, 2H)、8、(m, 4H)、13.27 (s, 1H)。

20

【実施例7】

【0280】

2 - (5 - ヒドロキシ - 1H - インダゾール - 3 - イル) - 1H - イソインドール - 1, 3 (2H) - ジオン

2 - [5 - (ベンジルオキシ) - 1H - インダゾール - 3 - イル] - 1H - イソインドール - 1, 3 (2H) - ジオン 46.14 g (0.125 mol) と塩酸ピリジン 143.35 g (1.24 mol) の混合物を 180 で 1 時間半加熱した。生じた褐色溶液を 120 に冷却し、0.5 N HCl 800 ml の十分に攪拌した混合物に緩やかに注ぎ入れた。その沈殿物をろ取し、乾燥した：生成物 32.26 g を黄色固体として得た。収率 = 92.4%。融点 > 270。HPLC r.t. 3.2 [M+H]⁺ = 280 [2M+H]⁺ = 559。

30

【0281】

¹H NMR (DMSO - d₆)、診断シグナル (ppm) : 6.8 (s, 1H)、6.98 (d, 1H)、7.42 (d, 1H)、8 (m, 4H)、9.2 (s, 1H) 13.12 (s, 1H)。

【実施例8】

【0282】

2 - [5 - (tert - ブチル - ジメチル - シラニルオキシ) - 1H - インダゾール - 3 - イル] - イソインドール - 1, 3 - ジオン

40

ジクロロメタン 320 ml 中の 2 - (5 - ヒドロキシ - 1H - インダゾール - 3 - イル) - 1H - イソインドール - 1, 3 (2H) - ジオン 32.26 g (0.115 mol) の懸濁液に、ジクロロメタン 150 ml 中の塩化 T B D M S 43.54 g (0.288 mol) の溶液を加えた。生じた混合物を、室温で 1, 8 - ジアザビシクロ [5.4.0] ウンデク - 7 - エン (DBU) 35.5 ml (0.23 mol) を滴下して処理し、透明な溶液を得た。3 時間後、その反応混合物を 0.1 N 塩酸溶液 300 ml に注ぎ入れた。水層を分離し、ジクロロメタン 200 ml で抽出した。有機抽出物を硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を真空下で蒸発させた。粗生成物を、ジクロロメタン - シクロヘキサン - 酢酸エチル (4 : 4 : 2) で溶出するシリカゲルでのフラッシュクロマトグラフィーによって精製した。生成物 36.03 g を白色固体として得た。収率 = 79.2%。融点 = 22

50

5 ~ 228。HPLC r.t. 8.3 [M+H]⁺ = 394 [2M+H]⁺ = 787。

【0283】

¹H NMR (DMSO-d₆)、診断シグナル (ppm) : 0.15 (s, 6H), 0.93 (s, 9H), 6.98 (dd, 1H), 7.07 (s, 1H), 7.49 (d, 1H), 7.96 (m, 4H), 13.25 (s, 1H)。

【実施例9】

【0284】

N-(6-ヒドロキシ-1H-インダゾール-3-イル)ベンズアミド

Novabiochemトリチル樹脂(公表置換1.27mmol/g、0.64mmol)500mgをジクロロメタンに懸濁し、2-[6-(tert-ブチル-ジメチル-シラニルオキシ)-1H-インダゾール-3-イル]-イソインドール-1,3-ジオン374mg(0.9mmol)及び2-tert-ブチルイミノ-2-ジエチルアミノ-1,3-ジメチルペルヒドロ-1,3,2-ジアザホスホリン367μl(1.3mmol)を加えた。その懸濁液を16時間攪拌し、次に樹脂をろ過して、ジクロロメタン、メタノール、ジメチルホルムアミド、再びメタノール及びジクロロメタンで洗った。その後樹脂を真空下で乾燥した。

10

【0285】

樹脂の同一性及び充填段階の収率を充填生成物の開裂によって確認した；樹脂40mgをジクロロメタン1mlに懸濁し、トリフルオロ酢酸150μlを加えた。2時間後、樹脂を排出し、ジクロロメタン1mlで2回洗った；収集した溶液を乾燥し、表題化合物13.8mgを回収した。算定充填量0.85mmol/g、HPLC r.t.方法1:7.64 [M+H]⁺ = 394。

20

【0286】

第一段階で得た樹脂(500mg、~0.425mmol)をジクロロメタンとメタノール1:1の混合物5mlに懸濁し、ヒドラジン-水合物500μlを加えた。その懸濁液を45℃に加熱した。加熱と攪拌を一晩続け、その後混合物を室温に冷却した。樹脂をろ過し、メタノールと水1:1の混合物、メタノール、ジメチルホルムアミド、及び再びメタノールで洗った後、真空下で乾燥した。

【0287】

樹脂の同一性を開裂によって確認した。その反応は上述したように実施した。

30

【0288】

開裂生成物:6-{[tert-ブチル(ジメチル)シリル]オキシ}-1H-インダゾール-3-アミン:HPLC r.t.方法1:5.99 [M+H]⁺ = 264; [M-H]⁻ = 262。

【0289】

第二段階で得た樹脂の試料(100mg、0.08mmol)をジクロロメタン2.5mlに懸濁した；N,N'-ジイソプロピルエチルアミン(131μl、~10当量)及び塩化ベンゾイル(30μl、~3当量)を加えた。室温での攪拌を20時間維持し、樹脂をろ過して、ジクロロメタン、メタノール、ジメチルホルムアミド、再びメタノール及びジクロロメタンで洗った後、真空下で乾燥した。

40

【0290】

樹脂の同一性を充填生成物の開裂によって確認した。その反応は上述したように実施した。

【0291】

開裂生成物:N-(6-{[tert-ブチル(ジメチル)シリル]オキシ}-1H-インダゾール-3-イル)ベンズアミド HPLC r.t.方法1:7.47 [M+H]⁺ = 368; [M-H]⁻ = 366。

【0292】

前の段階で得た樹脂(100mg、0.08mmol)を無水テトラヒドロフラン3m

50

1 に懸濁し、テトラヒドロフラン中のフッ化テトラブチルアンモニウムの 1 M 溶液 120 μ l (~ 1 . 5 当量) を加えた。その懸濁液を一晩攪拌し、樹脂をろ過して、ジクロロメタン、メタノール、ジメチルホルムアミド、メタノール及びジクロロメタンで洗った。

【 0 2 9 3 】

樹脂 100 mg をジクロロメタン 3 ml に懸濁し、トリフルオロ酢酸 450 μ l を加えた。2 時間後、樹脂を排出し、ジクロロメタン 1 ml で 2 回洗った；収集した溶液を乾燥し、表題化合物を回収した。

【 0 2 9 4 】

N - (6 - ヒドロキシ - 1 H - インダゾール - 3 - イル) ベンズアミド H P L C 方法 1 r . t . 3 . 5 [M + H] + = 2 5 3 . 9 9 [M - H] - = 2 5 2 .

10

【 0 2 9 5 】

実施例 9 と同様に操作することにより、2 - (6 - { [t e r t - ブチル (ジメチル) シリル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 1 H - イソインドール - 1 , 3 (2 H) - ジオン及び 2 - [5 - (t e r t - ブチル - ジメチル - シラニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - イソインドール - 1 , 3 - ジオンを樹脂上に保持し、その後、上述した合成スキームに従うことにより、下記の生成物を合成した。

【 0 2 9 6 】

N - (5 - ヒドロキシ - インダゾール - 3 - イル) - ベンズアミド : H P L C 方法 1 r . t . 3 . 0 8 [M + H] + = 2 5 3 . 9 9 .

【 0 2 9 7 】

2 - (4 - t e r t - ブチルフェノキシ) - N - (5 - ヒドロキシ - 2 H - インダゾール - 3 - イル) アセトアミド H P L C 方法 1 r . t . 5 . 3 8 [M + H] + = 3 4 0 . 2 .

20

【 0 2 9 8 】

N - (5 - ヒドロキシ - 2 H - インダゾール - 3 - イル) - 2 - (4 - メトキシフェニル) アセトアミド H P L C 方法 1 r . t . 3 . 3 5 [M + H] + = 2 9 8 . 1 .

【 0 2 9 9 】

N - (6 - ヒドロキシ - 2 H - インダゾール - 3 - イル) - 3 - フェニルプロパンアミド : H P L C 方法 1 r . t . 3 . 9 4 [M + H] + = 2 8 2 . 1 .

【 0 3 0 0 】

N - (6 - ヒドロキシ - 2 H - インダゾール - 3 - イル) シクロプロパンカルボキサミド : H P L C 方法 1 r . t . 2 . 3 6 [M + H] + = 2 1 8 . 1 .

30

【 0 3 0 1 】

同様に (実施例 9) 操作することにより、7 つの生成物を平行して合成し、先に示したように、表 I X においてコード化した；関連する H P L C 保持時間及び実験的に認められた [M + H] + を報告する。

【 0 3 0 2 】

【 表 1 0 】

表 I X

登録番号	化合物	HPLCの方法	r. t. (保持時間) (分)	[M+H]+
1	A00-M1-B36	1	3.68	282.1
2	A00-M1-B31	1	2	218.1
3	A00-M1-B33	1	4.05	288
4	A00-M2-B68	1	3.08	235.1
5	A00-M2-B15	1	5.52	340.2
6	A00-M2-B35	1	3.62	298.1
7	A00-M2-B33	1	4.38	288

40

【 実施例 1 0 】

50

【0303】

N - ブチル - N' - (6 - ヒドロキシ - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素

Novabiochemトリチル樹脂 (公表置換 1.27 mmol / g、0.64 mmol) 500 mg をジクロロメタンに懸濁し、2 - [6 - (tert - ブチル - ジメチル - シラニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - イソインドール - 1, 3 - ジオン 374 mg (0.9 mmol) 及び 2 - tert - ブチルイミノ - 2 - ジエチルアミノ - 1, 3 - ジメチルペルヒドロ - 1, 3, 2 - ジアザホスホリン 367 μ l (1.3 mmol) を加えた。その懸濁液を 16 時間攪拌し、次に樹脂をろ過して、ジクロロメタン、メタノール、ジメチルホルムアミド、再びメタノール及びジクロロメタンで洗った。その後樹脂を真空下で乾燥した。

10

【0304】

樹脂の同一性及び充填段階の収率を充填生成物の開裂によって確認した；樹脂 40 mg をジクロロメタン 1 ml に懸濁し、トリフルオロ酢酸 150 μ l を加えた。2 時間後、樹脂を排出し、ジクロロメタン 1 ml で 2 回洗った；収集した溶液を乾燥し、表題化合物 13.8 mg を回収した。算定充填量 0.85 mmol / g、HPLC r.t. 方法 1 : 7.64 [M + H] + = 394。

【0305】

第一段階で得た樹脂 (500 mg、~ 0.425 mmol) をジクロロメタンとメタノール 1 : 1 の混合物 5 ml に懸濁し、ヒドラジーン水和物 500 μ l を加えた。その懸濁液を 45 に加熱した。加熱と攪拌を一晩続け、その後混合物を室温に冷却した。樹脂をろ過し、メタノールと水 1 : 1 の混合物、メタノール、ジメチルホルムアミド、及び再びメタノールで洗った。

20

【0306】

樹脂の同一性を開裂によって確認した。その反応は上述したように実施した。

【0307】

開裂生成物：6 - { [tert - ブチル (ジメチル) シリル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - アミン：HPLC r.t. 方法 1 : 5.99 [M + H] + = 264 ; [M - H] - = 262。

【0308】

第二段階で得た樹脂の試料 (100 mg、0.08 mmol) をジメチルホルムアミド 2 ml に懸濁した；N - ブチルイソシアネート (28 μ l、~ 5 当量) を加えた。その懸濁液を 50 に加熱した。攪拌と加熱を 60 時間維持し、その後懸濁液を室温に冷却した。樹脂をろ過し、ジクロロメタン、メタノール、ジメチルホルムアミド、メタノール及びジクロロメタンで洗った後、真空下で乾燥した。

30

【0309】

樹脂 100 mg をジクロロメタン 3 ml に懸濁し、トリフルオロ酢酸 450 μ l を加えた。2 時間後、樹脂を排出し、ジクロロメタン 1 ml で 2 回洗った；収集した溶液を乾燥して、表題化合物を回収した。

【0310】

1 - ブチル - 3 - (6 - ヒドロキシ - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素 HPLC 方法 1 r.t. 3.87 [M + H] + = 249 [M - H] - = 247。

40

【0311】

実施例 10 と同様に操作することにより、2 - (6 - { [tert - ブチル (ジメチル) シリル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 1 H - イソインドール - 1, 3 (2 H) - ジオン及び 2 - [5 - (tert - ブチル - ジメチル - シラニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - イソインドール - 1, 3 - ジオンを樹脂上に保持し、その後、上述した合成スキームに従うことにより、下記の生成物を合成した。

【0312】

1 - ブチル - 3 - (5 - ヒドロキシ - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素 HPLC 方法 1 r.t. 3.65 [M + H] + = 249 [M - H] - = 247。

50

【0313】

N - ベンジル - N' - (5 - ヒドロキシ - 2 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素 H P L C 方法 1 r . t . : 4 [M + H] + = 2 8 3 . 1。

【0314】

N - (5 - ヒドロキシ - 2 H - インダゾール - 3 - イル) - N' - イソプロピル尿素 H P L C 方法 1 r . t . : 2 . 9 2 [M + H] + = 2 3 5 . 1。

【0315】

N - (6 - ヒドロキシ - 2 H - インダゾール - 3 - イル) - N' - フェニル尿素 H P L C 方法 1 r . t . : 4 . 4 [M + H] + = 2 6 9 . 1。

【0316】

同様に (実施例 1 0) 操作することにより、平行して 1 3 の生成物を合成し、先に示したように、表 X においてコード化した ; 関連する H P L C 保持時間及び実験的に認められた [M + H] + を報告する。

【0317】

【表 1 1】

表 X

登録番号	化合物	HPLC の方法	r. t. (保持 時間) (分)	[M+H] ⁺
1	A00-M1-B68	3	1.39	235.1
2	A00-M1-B63	3	1.89	283.1
3	A00-M1-B78	3	1.85	297.1
4	A00-M1-B79	3	1.71	299.1
5	A00-M1-B62	3	1.77	299.1
6	A00-M1-B64	3	2.01	303.1
7	A00-M1-B66	3	1.65	311.1
8	A00-M1-B17	3	1.33	311.1
9	A00-M1-B74	3	1.83	329.1
10	A00-M1-B76	3	2.12	337.1
11	A00-M1-B65	3	2.27	345.1
12	A00-M2-B83	1	4.15	283.1
13	A00-M1-B82	1	4.15	269.1

【実施例 1 1】

【0318】

N - (6 - ベンジルオキシ - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - ベンズアミド
Novabiochem トリチル樹脂 (公表置換 1 . 2 7 m m o l / g 、 0 . 6 4 m m o l) 5 0 0 m g をジクロロメタンに懸濁し、2 - [6 - (tert - ブチル - ジメチル - シラニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - イソインドール - 1 , 3 - ジオン 3 7 4 m g (0 . 9 m m o l) 及び 2 - tert - ブチルイミノ - 2 - ジエチルアミノ - 1 , 3 - ジメチルペルヒドロ - 1 , 3 , 2 - ジアザホスホリン 3 6 7 μ l (1 . 3 m m o l) を加えた。その懸濁液を 1 6 時間攪拌し、次に樹脂をろ過して、ジクロロメタン、メタノール、ジメチルホルムアミド、再びメタノール及びジクロロメタンで洗った。その後樹脂を真空下で乾燥した。

【0319】

樹脂の同一性及び充填段階の収率を充填生成物の開裂によって確認した ; 樹脂 4 0 m g をジクロロメタン 1 m l に懸濁し、トリフルオロ酢酸 1 5 0 μ l を加えた。2 時間後、樹脂を排出し、ジクロロメタン 1 m l で 2 回洗った ; 収集した溶液を乾燥し、表題化合物 1 3 . 8 m g を回収した。算定充填量 0 . 8 5 m m o l / g 、 H P L C r . t . 方法 1 : 7 . 6 4 [M + H] + = 3 9 4。

【0320】

第一段階で得た樹脂 (500 mg、~0.425 mmol) をジクロロメタンとメタノール 1 : 1 の混合物 5 ml に懸濁し、ヒドラジーン水和物 500 μ l を加えた。その懸濁液を 45 に加熱した。加熱と攪拌を一晚続け、その後混合物を室温に冷却した。樹脂をろ過し、メタノールと水 1 : 1 の混合物、メタノール、ジメチルホルムアミド、及び再びメタノールで洗った後、真空下で乾燥した。

【0321】

樹脂の同一性を開裂によって確認した。その反応は上述したように実施した。

【0322】

6 - { [tert - ブチル (ジメチル) シリル] オキシ } - 1H - インダゾール - 3 - アミン HPLC r . t . 方法 1 : 5 . 99 [M + H]⁺ = 264 ; [M - H]⁻ = 262。 10

【0323】

第二段階で得た樹脂の試料 (100 mg、0.08 mmol) をジクロロメタン 2.5 ml に懸濁した ; N , N' - ジイソプロピルエチルアミン (131 μ l、~10 当量) 及び塩化ベンゾイル (30 μ l、~3 当量) を加えた。室温での攪拌を 20 時間維持し、その後樹脂をろ過して、ジクロロメタン、メタノール、ジメチルホルムアミド、再びメタノール及びジクロロメタンで洗った後、真空下で乾燥した。

【0324】

樹脂の同一性を充填生成物の開裂によって確認した。その反応は上述したように実施した。 20

【0325】

N - (6 - { [tert - ブチル (ジメチル) シリル] オキシ } - 1H - インダゾール - 3 - イル) ベンズアミド HPLC 方法 1 r . t . : 7 . 47 [M + H]⁺ = 368 ; [M - H]⁻ = 366。

【0326】

第三段階で得た樹脂 (100 mg、0.08 mmol) を無水テトラヒドロフラン 3 ml に懸濁し、テトラヒドロフラン中のフッ化テトラブチルアンモニウムの 1 M 溶液 120 μ l (~1.5 当量) を加えた。その懸濁液を一晚攪拌し、樹脂をろ過して、ジクロロメタン、メタノール、ジメチルホルムアミド、メタノール及びジクロロメタンで洗った。

【0327】

樹脂の同一性を充填生成物の開裂によって確認した。その反応は上述したように実施した。 30

【0328】

N - (6 - ヒドロキシ - 1H - インダゾール - 3 - イル) ベンズアミド HPLC 方法 1 r . t . 3 . 5 [M + H]⁺ = 253 . 99 ; [M - H]⁻ = 252。

【0329】

第四段階で得た樹脂 (100 mg、0.08 mmol) を 1 - メチル - 2 - ピロリジノン 3 ml に懸濁し、次に 2 - tert - ブチルイミノ - 2 - ジエチルアミノ - 1 , 3 - ジメチルペルヒドロ - 1 , 3 , 2 - ジアザホスホリン 43 μ l (~1.5 当量) 及び臭化ベンジル 57 μ l (~6 当量) を加えた。その懸濁液を 16 時間攪拌した。樹脂をろ過して、ジクロロメタン、メタノール、ジメチルホルムアミド、メタノール及びジクロロメタンで洗った。 40

【0330】

乾燥樹脂 100 mg をジクロロメタン 3 ml に懸濁し、トリフルオロ酢酸 450 μ l を加えた。2 時間後、樹脂を排出し、ジクロロメタン 3 ml で 2 回洗った ; 収集した溶液を乾燥し、所望表題化合物を回収した。

【0331】

N - (6 - ベンジルオキシ - 1H - インダゾール - 3 - イル) - ベンズアミド HPLC r . t . 方法 1 : 6 . 17 [M + H]⁺ = 344。

【0332】

実施例 11 と同様に操作することにより、2 - (6 - { [tert - ブチル (ジメチル) シリル] オキシ } - 1H - インダゾール - 3 - イル) - 1H - イソインドール - 1, 3 (2H) - ジオン及び 2 - [5 - (tert - ブチル - ジメチル - シラニルオキシ) - 1H - インダゾール - 3 - イル] - イソインドール - 1, 3 - ジオンを樹脂上に保持し、その後、上述した合成スキームに従うことにより、下記の生成物を合成した。

【0333】

N - (5 - ベンジルオキシ - 1H - インダゾール - 3 - イル) - ベンズアミド HPLC r . t . 6 . 05 [M + H] + = 344 ;

メチル 2 - ({ 3 - [(3 - フェニルプロパノイル) アミノ] - 1H - インダゾール - 5 - イル } オキシ) ブタノエート HPLC 方法 2 r . t . 8 . 2 [M + H] + = 382 . 1 ;

N - { 5 - [(2 - オキソ - 1 - フェニルピロリジン - 3 - イル) オキシ] - 1H - インダゾール - 3 - イル } シクロプロパンカルボキサミド HPLC 方法 2 r . t . 7 . 19 [M + H] + = 377 . 2 ;

メチル 2 - ({ 3 - [(シクロプロピルカルボニル) アミノ] - 1H - インダゾール - 5 - イル } オキシ) ブタノエート HPLC 方法 2 r . t . 7 . 05 [M + H] + = 318 . 1 ;

メチル 2 - [(3 - { [(4 - メトキシフェニル) アセチル] アミノ } - 1H - インダゾール - 5 - イル) オキシ] ブタノエート HPLC 方法 2 r . t . 7 . 78 [M + H] + = 398 . 2 ;

N - { 6 - [(2 - メチルベンジル) オキシ] - 1H - インダゾール - 3 - イル } シクロプロパンカルボキサミド HPLC 方法 2 r . t . 8 . 38 [M + H] + = 322 . 1 ;

N - { 6 - [(2 - オキソ - 1 - フェニルピロリジン - 3 - イル) オキシ] - 1H - インダゾール - 3 - イル } シクロプロパンカルボキサミド HPLC 方法 2 r . t . 7 . 41 [M + H] + = 377 . 2 ;

メチル 2 - ({ 3 - [(シクロプロピルカルボニル) アミノ] - 1H - インダゾール - 6 - イル) オキシ] ブタノエート HPLC 方法 1 r . t . 4 . 31 [M + H] + = 318 . 1 ;

メチル 2 - ({ 3 - [(3 - クロロベンゾイル) アミノ] - 1H - インダゾール - 6 - イル } オキシ) ブタノエート HPLC 方法 1 r . t . 6 . 02 [M + H] + = 388 . 1 .

【0334】

同様に (実施例 11) 操作することにより、806 の生成物を平行して合成し、先に示したように、表 XI においてコード化した ; 関連する HPLC 保持時間及び実験的に認められた [M + H] + を報告する。

【0335】

10

20

30

【表 1 2】

表 X I

登録 番号	化合物	HPLC の方法	r. t. (保持 時間) (分)	[M+H] ⁺	登録 番号	化合物	HPLC の方法	r. t. (保持 時間) (分)	[M+H] ⁺
1	A29-M1-B36	2	8.18	441.2	404	A02-M1-B10	3	2.06	404.2
2	A31-M1-B36	2	8.02	350.2	405	A03-M1-B10	3	2.37	472.1
3	A35-M1-B36	2	8.18	429.2	406	A03-M2-B10	3	2.48	472.1
4	A40-M1-B36	2	8.91	469.2	407	A04-M1-B10	3	2.07	422.1
5	A38-M1-B31	2	8.27	322.1	408	A04-M2-B10	3	2.2	422.1
6	A03-M1-B31	2	8.91	376.1	409	A05-M1-B10	3	2.3	500.1
7	A31-M1-B31	2	6.95	286.1	410	A05-M2-B10	3	2.41	500.1
8	A35-M1-B31	2	7.08	365.2	411	A06-M1-B10	3	1.85	354.1
9	A29-M1-B15	2	9.28	499.2	412	A07-M1-B10	3	2.17	440.1
10	A31-M1-B15	2	9.11	408.2	413	A07-M2-B10	3	2.28	440.1
11	A35-M1-B15	2	9.3	487.2	414	A08-M1-B10	3	2.3	488.1
12	A32-M1-B15	2	9.39	440.2	415	A08-M2-B10	3	2.41	488.1
13	A38-M1-B35	2	8.73	402.2	416	A09-M1-B10	3	2.14	464.2

14	A29-M1-B35	2	7.87	457.2	417	A10-M1-B10	3	2.24	458.1
15	A31-M1-B35	2	7.61	366.2	418	A10-M2-B10	3	2.27	458.1
16	A35-M1-B35	2	7.82	445.2	419	A11-M1-B10	3	2.2	470.1
17	A39-M1-B35	2	8.09	446.2	420	A11-M2-B10	3	2.27	470.1
18	A40-M1-B35	2	8.67	485.2	421	A12-M1-B10	3	2.05	380.2
19	A29-M1-B33	2	8.37	447.1	422	A12-M2-B10	3	2.09	380.2
20	A38-M2-B36	2	9.16	386.2	423	A14-M1-B10	3	2.07	366.1
21	A45-M2-B36	2	9.27	476.2	424	A15-M1-B10	3	2.33	449.1
22	A03-M2-B36	2	9.59	440.1	425	A16-M1-B10	3	2.19	429.1
23	A29-M2-B36	2	8.35	441.2	426	A18-M2-B10	3	2.4	440.1
24	A31-M2-B36	2	8.45	350.2	427	A18-M1-B10	3	2.3	440.1
25	A44-M2-B36	2	8.72	434.1	428	A20-M1-B10	3	2.5	472.1
26	A46-M2-B36	2	8.61	460.2	429	A21-M1-B10	3	1.85	360.1
27	A35-M2-B36	2	8.26	429.2	430	A22-M1-B10	3	2.74	540.1
28	A32-M2-B36	2	8.3	382.2	431	A23-M1-B10	3	2.47	438.1
29	A41-M2-B36	2	8.98	476.2	432	A24-M1-B10	3	2.35	458.1
30	A39-M2-B36	2	8.52	430.2	433	A25-M1-B10	3	2.55	490.1
31	A40-M2-B36	2	9.05	469.2	434	A26-M1-B10	3	2.01	374.1
32	A45-M2-B31	2	8.65	412.2	435	A27-M2-B10	3	2.41	448.2
33	A03-M2-B31	2	9.01	376.1	436	A02-M1-B11	3	2.25	362.1
34	A31-M2-B31	2	7.5	286.1	437	A02-M2-B11	3	2.3	362.1
35	A44-M2-B31	2	7.87	370.1	438	A03-M1-B11	3	2.55	430.0
36	A46-M2-B31	2	7.77	396.1	439	A03-M2-B11	3	2.59	430.0
37	A35-M2-B31	2	7.27	365.2	440	A04-M1-B11	3	2.25	380.1
38	A41-M2-B31	2	8.26	412.2	441	A04-M2-B11	3	2.31	380.1
39	A39-M2-B31	2	7.64	366.1	442	A05-M1-B11	3	2.47	458.0
40	A40-M2-B31	2	8.34	405.2	443	A05-M2-B11	3	2.52	458.0
41	A29-M2-B15	2	9.39	499.2	444	A06-M1-B11	3	2.03	312.1
42	A31-M2-B15	2	8.99	408.2	445	A07-M2-B11	3	2.39	398.1
43	A35-M2-B15	2	9.35	487.2	446	A08-M1-B11	3	2.53	446.1
44	A32-M2-B15	2	9.42	440.2	447	A08-M2-B11	3	2.52	446.1
45	A29-M2-B35	2	8.01	457.2	448	A10-M1-B11	3	2.41	416.1
46	A31-M2-B35	2	8.03	366.2	449	A10-M2-B11	3	2.39	416.1
47	A44-M2-B35	2	8.41	450.1	450	A11-M2-B11	3	2.38	428.1
48	A35-M2-B35	2	7.95	445.2	451	A12-M2-B11	3	2.21	338.1
49	A32-M2-B35	1	5.21	398.2	452	A13-M2-B11	3	2.54	492.1
50	A41-M2-B35	2	8.7	492.2	453	A14-M1-B11	3	2.17	324.1
51	A38-M2-B33	2	9.32	392.1	454	A15-M1-B11	3	2.43	407.1
52	A03-M2-B33	2	9.75	446.0	455	A16-M1-B11	3	2.29	387.1
53	A29-M2-B33	2	8.56	447.1	456	A17-M1-B11	3	2.07	381.1
54	A44-M2-B33	2	8.9	440.0	457	A18-M2-B11	3	2.51	398.1
55	A46-M2-B33	2	8.81	466.1	458	A18-M1-B11	3	2.41	398.1
56	A35-M2-B33	2	8.46	435.1	459	A20-M1-B11	3	2.61	430.1
57	A41-M2-B33	2	9.14	482.1	460	A21-M1-B11	3	1.94	318.1
58	A39-M2-B33	2	8.74	436.1	461	A22-M1-B11	3	2.85	498.1
59	A40-M2-B33	2	9.22	475.1	462	A23-M1-B11	3	2.57	396.1
60	A30-M1-B29	1	6.39	388.2	463	A24-M1-B11	3	2.46	416.1
61	A31-M1-B29	1	4.72	352.2	464	A25-M1-B11	3	2.67	448.1
62	A29-M1-B29	1	5.33	443.2	465	A26-M1-B11	3	2.13	332.1
63	A03-M1-B29	1	7.09	442.1	466	A27-M2-B11	3	2.51	406.1
64	A37-M1-B29	2	7.81	400.2	467	A01-M1-B12	3	2.11	376.1

10

20

30

40

65	A30-M2-B29	1	6.56	388.2	468	A02-M1-B12	3	2.42	428.1
66	A31-M2-B29	2	8.33	352.2	469	A02-M2-B12	3	2.54	428.1
67	A29-M2-B29	1	5.5	443.2	470	A03-M1-B12	3	2.69	496.0
68	A03-M2-B29	1	7.22	442.1	471	A03-M2-B12	3	2.73	496.0
69	A41-M2-B01	1	6.56	448.2	472	A04-M1-B12	3	2.42	446.1
70	A32-M2-B32	1	5.34	368.2	473	A05-M1-B12	3	2.63	524.0
71	A47-M2-B32	2	8.63	454.1	474	A05-M2-B12	3	2.69	524.0
72	A48-M2-B32	1	7.31	448.1	475	A06-M1-B12	3	2.25	378.1
73	A43-M2-B32	1	5.33	366.2	476	A07-M1-B12	3	2.49	464.1
74	A33-M1-B32	1	5.32	416.2	477	A07-M2-B12	3	2.55	464.1
75	A35-M1-B32	1	5.33	415.2	478	A08-M1-B12	3	2.6	512.1
76	A31-M1-B01	1	4.7	322.1	479	A09-M1-B12	3	2.54	488.1
77	A36-M1-B01	2	7.45	334.1	480	A09-M2-B12	3	2.56	488.1
78	A29-M1-B01	1	5.29	413.2	481	A10-M1-B12	3	2.64	482.1
79	A01-M1-B01	3	1.81	292.1	482	A10-M2-B12	3	2.63	482.1
80	A01-M2-B01	3	1.95	292.1	483	A11-M1-B12	3	2.57	494.1
81	A03-M1-B01	3	2.47	412.1	484	A11-M2-B12	3	2.6	494.1
82	A03-M2-B01	3	2.55	412.1	485	A12-M1-B12	3	2.49	404.1
83	A04-M1-B01	3	2.15	362.1	486	A13-M1-B12	3	2.75	558.1
84	A04-M2-B01	3	2.27	362.1	487	A14-M1-B12	3	2.47	390.1
85	A05-M1-B01	3	2.39	440.0	488	A15-M1-B12	3	2.67	473.1
86	A05-M2-B01	3	2.47	440.0	489	A16-M1-B12	3	2.57	453.1
87	A06-M1-B01	3	1.93	294.1	490	A17-M1-B12	3	2.39	447.1
88	A07-M1-B01	3	2.24	380.1	491	A18-M2-B12	3	2.77	464.1
89	A07-M2-B01	3	2.35	380.1	492	A18-M1-B12	3	2.67	464.1
90	A08-M1-B01	3	2.39	428.1	493	A20-M1-B12	3	2.85	496.1
91	A09-M1-B01	3	2.29	404.2	494	A21-M1-B12	3	2.31	384.1
92	A09-M2-B01	3	2.25	404.2	495	A22-M1-B12	3	3.05	564.1
93	A10-M1-B01	3	2.31	398.1	496	A23-M1-B12	3	2.83	462.1
94	A10-M2-B01	3	2.36	398.1	497	A24-M1-B12	3	2.71	482.1
95	A11-M1-B01	3	2.26	410.1	498	A25-M1-B12	3	2.89	514.1
96	A11-M2-B01	3	2.31	410.1	499	A26-M1-B12	3	2.43	398.1
97	A12-M1-B01	3	2.12	320.1	500	A27-M2-B12	3	2.77	472.1
98	A13-M2-B01	3	2.5	474.1	501	A01-M1-B13	3	1.39	341.2
99	A13-M1-B01	3	2.53	474.1	502	A02-M1-B13	3	1.7	393.2
100	A14-M1-B01	3	2.13	306.1	503	A03-M1-B13	3	2	461.1
101	A15-M1-B01	3	2.39	389.1	504	A12-M1-B13	3	1.67	369.2
102	A16-M1-B01	3	2.26	369.1	505	A13-M1-B13	3	2.08	523.2
103	A17-M1-B01	3	2.04	363.1	506	A14-M1-B13	3	1.7	355.2
104	A18-M2-B01	3	2.45	380.1	507	A18-M2-B13	3	2.07	429.2
105	A18-M1-B01	3	2.37	380.1	508	A20-M1-B13	3	2.29	461.2
106	A20-M1-B01	3	2.58	412.1	509	A22-M1-B13	3	2.5	529.2
107	A21-M1-B01	3	1.9	300.1	510	A27-M2-B13	3	2.06	437.2
108	A22-M1-B01	3	2.81	480.1	511	A01-M1-B14	3	1.95	336.1
109	A23-M1-B01	3	2.53	378.1	512	A01-M2-B14	3	2.04	336.1
110	A24-M1-B01	3	2.42	398.1	513	A02-M1-B14	3	2.27	388.2
111	A25-M1-B01	3	2.63	430.1	514	A03-M1-B14	3	2.57	456.1
112	A26-M1-B01	3	2.07	314.1	515	A03-M2-B14	3	2.61	456.1
113	A27-M2-B01	3	2.47	388.2	516	A04-M1-B14	3	2.28	406.1
114	A01-M1-B02	3	1.82	336.1	517	A04-M2-B14	3	2.38	406.1
115	A01-M2-B02	3	1.97	336.1	518	A05-M1-B14	3	2.51	484.1

10

20

30

40

116	A02-M1-B02	3	2.14	388.1	519	A05-M2-B14	3	2.57	484.1
117	A02-M2-B02	3	2.26	388.1	520	A06-M1-B14	3	2.07	338.1
118	A03-M1-B02	3	2.44	456.0	521	A07-M1-B14	3	2.43	424.1
119	A04-M1-B02	3	2.14	406.1	522	A07-M2-B14	3	2.45	424.1
120	A04-M2-B02	3	2.27	406.1	523	A08-M1-B14	3	2.49	472.1
121	A05-M1-B02	3	2.36	484.0	524	A08-M2-B14	3	2.55	472.1
122	A05-M2-B02	3	2.46	484.0	525	A09-M1-B14	3	2.41	448.2
123	A06-M1-B02	3	1.92	338.1	526	A09-M2-B14	3	2.41	448.2
124	A07-M1-B02	3	2.29	424.1	527	A10-M1-B14	3	2.51	442.1
125	A07-M2-B02	3	2.35	424.1	528	A10-M2-B14	3	2.51	442.1
126	A08-M1-B02	3	2.35	472.1	529	A11-M1-B14	3	2.46	454.2
127	A08-M2-B02	3	2.46	472.1	530	A11-M2-B14	3	2.47	454.2
128	A09-M1-B02	3	2.2	448.1	531	A12-M2-B14	3	2.35	364.2
129	A09-M2-B02	3	2.25	448.1	532	A13-M1-B14	3	2.64	518.2
130	A10-M1-B02	3	2.3	442.1	533	A14-M1-B14	3	2.27	350.1
131	A11-M1-B02	3	2.25	454.1	534	A15-M1-B14	3	2.51	433.1
132	A11-M2-B02	3	2.3	454.1	535	A16-M1-B14	3	2.39	413.2
133	A12-M1-B02	3	2.1	364.1	536	A17-M1-B14	3	2.19	407.2
134	A13-M2-B02	3	2.48	518.1	537	A18-M2-B14	3	2.59	424.1
135	A13-M1-B02	3	2.49	518.1	538	A18-M1-B14	3	2.5	424.1
136	A14-M1-B02	3	2.11	350.1	539	A20-M1-B14	3	2.7	456.1
137	A15-M1-B02	3	2.39	433.1	540	A21-M1-B14	3	2.09	344.1
138	A16-M1-B02	3	2.26	413.1	541	A22-M1-B14	3	2.93	524.1
139	A17-M1-B02	3	2.06	407.1	542	A23-M1-B14	3	2.66	422.1
140	A18-M2-B02	3	2.47	424.1	543	A24-M1-B14	3	2.54	442.1
141	A18-M1-B02	3	2.37	424.1	544	A25-M1-B14	3	2.75	474.1
142	A20-M1-B02	3	2.56	456.1	545	A26-M1-B14	3	2.24	358.1
143	A21-M1-B02	3	1.93	344.1	546	A27-M2-B14	3	2.57	432.2
144	A22-M1-B02	3	2.79	524.1	547	A01-M1-B15	3	2.32	378.2
145	A23-M1-B02	3	2.53	422.1	548	A01-M2-B15	3	2.43	378.2
146	A24-M1-B02	3	2.41	442.1	549	A02-M1-B15	3	2.61	430.2
147	A25-M1-B02	3	2.61	474.1	550	A02-M2-B15	3	2.65	430.2
148	A26-M1-B02	3	2.1	358.1	551	A03-M1-B15	3	2.85	498.1
149	A27-M2-B02	3	2.48	432.1	552	A04-M1-B15	3	2.61	448.2
150	A01-M1-B03	3	2.01	342.1	553	A04-M2-B15	3	2.65	448.2
151	A01-M2-B03	3	2.13	342.1	554	A05-M1-B15	3	2.79	526.1
152	A02-M1-B03	3	2.32	394.1	555	A05-M2-B15	3	2.84	526.1
153	A02-M2-B03	3	2.42	394.1	556	A06-M1-B15	3	2.45	380.2
154	A03-M1-B03	3	2.61	462.1	557	A07-M1-B15	3	2.67	466.2
155	A04-M1-B03	3	2.32	412.1	558	A08-M1-B15	3	2.76	514.2
156	A04-M2-B03	3	2.43	412.1	559	A08-M2-B15	3	2.81	514.2
157	A05-M1-B03	3	2.54	490.0	560	A09-M1-B15	3	2.73	490.2
158	A06-M1-B03	3	2.13	344.1	561	A09-M2-B15	3	2.72	490.2
159	A06-M2-B03	3	2.24	344.1	562	A10-M1-B15	3	2.81	484.2
160	A07-M1-B03	3	2.4	430.1	563	A11-M1-B15	3	2.75	496.2
161	A07-M2-B03	3	2.5	430.1	564	A11-M2-B15	3	2.75	496.2
162	A08-M1-B03	3	2.52	478.1	565	A12-M1-B15	3	2.67	406.2
163	A08-M2-B03	3	2.61	478.1	566	A12-M2-B15	3	2.67	406.2
164	A09-M1-B03	3	2.36	454.2	567	A13-M2-B15	3	2.92	560.2
165	A09-M2-B03	3	2.41	454.2	568	A13-M1-B15	3	2.93	560.2
166	A10-M1-B03	3	2.46	448.1	569	A20-M1-B15	3	3.05	498.2

10

20

30

40

167	A11-M1-B03	3	2.4	460.1	570	A02-M1-B16	3	2.1	312.1
168	A11-M2-B03	3	2.46	460.1	571	A05-M1-B16	3	2.37	408.0
169	A12-M1-B03	3	2.29	370.1	572	A06-M1-B16	3	1.74	262.1
170	A12-M2-B03	3	2.37	370.1	573	A08-M1-B16	3	2.41	396.1
171	A14-M1-B03	3	2.34	356.1	574	A11-M1-B16	3	2.21	378.1
172	A15-M1-B03	3	2.57	439.1	575	A14-M1-B16	3	1.72	274.1
173	A16-M1-B03	3	2.46	419.1	576	A15-M1-B16	3	2.11	357.1
174	A17-M1-B03	3	2.26	413.2	577	A16-M1-B16	3	1.95	337.1
175	A18-M2-B03	3	2.65	430.1	578	A17-M1-B16	3	1.67	331.1
176	A18-M1-B03	3	2.55	430.1	579	A18-M1-B16	3	2.06	348.1
177	A20-M1-B03	3	2.75	462.1	580	A04-M1-B16	3	2.11	330.1
178	A21-M1-B03	3	2.17	350.1	581	A20-M1-B16	3	2.3	380.1
179	A22-M1-B03	3	2.97	530.1	582	A21-M1-B16	3	1.47	268.1
180	A23-M1-B03	3	2.71	428.1	583	A22-M1-B16	3	2.58	448.1
181	A24-M1-B03	3	2.59	448.1	584	A23-M1-B16	3	2.22	346.1
182	A25-M1-B03	3	2.8	480.1	585	A24-M1-B16	3	2.11	366.1
183	A26-M1-B03	3	2.29	364.1	586	A25-M1-B16	3	2.37	398.1
184	A27-M2-B03	3	2.66	438.2	587	A26-M1-B16	3	1.71	282.1
185	A01-M1-B04	3	1.62	282.1	588	A15-M1-B17	3	2.23	446.1
186	A01-M2-B04	3	1.76	282.1	589	A16-M1-B17	3	2.09	426.1
187	A02-M1-B04	3	1.99	334.1	590	A17-M1-B17	3	1.86	420.2
188	A02-M2-B04	3	2.11	334.1	591	A18-M1-B17	3	2.17	437.1
189	A03-M1-B04	3	2.32	402.0	592	A20-M1-B17	3	2.39	469.1
190	A03-M2-B04	3	2.41	402.0	593	A21-M1-B17	3	1.73	357.1
191	A04-M1-B04	3	2.01	352.1	594	A22-M1-B17	3	2.63	537.1
192	A04-M2-B04	3	2.13	352.1	595	A23-M1-B17	3	2.33	435.1
193	A05-M1-B04	3	2.24	430.0	596	A24-M1-B17	3	2.24	455.1
194	A05-M2-B04	3	2.34	430.0	597	A25-M1-B17	3	2.43	487.1
195	A06-M1-B04	3	1.75	284.1	598	A26-M1-B17	3	1.88	371.1
196	A06-M2-B04	3	1.89	284.1	599	A02-M1-B18	3	2.62	422.0
197	A07-M1-B04	3	2.1	370.1	600	A05-M1-B18	3	2.87	517.9
198	A07-M2-B04	3	2.21	370.1	601	A06-M1-B18	3	2.39	372.0
199	A08-M1-B04	3	2.25	418.1	602	A08-M1-B18	3	2.86	506.0
200	A08-M2-B04	3	2.35	418.1	603	A10-M1-B18	3	2.72	476.0
201	A09-M1-B04	3	2.08	394.1	604	A11-M1-B18	3	2.65	488.0
202	A09-M2-B04	3	2.1	394.1	605	A12-M1-B18	3	2.51	398.0
203	A10-M1-B04	3	2.19	388.1	606	A14-M1-B18	3	2.37	384.0
204	A11-M1-B04	3	2.14	400.1	607	A15-M1-B18	3	2.61	467.0
205	A11-M2-B04	3	2.17	400.1	608	A16-M1-B18	3	2.49	447.0
206	A12-M1-B04	3	1.98	310.1	609	A17-M1-B18	3	2.29	441.0
207	A13-M2-B04	3	2.35	464.1	610	A18-M1-B18	3	2.61	458.0
208	A13-M1-B04	3	2.39	464.1	611	A04-M1-B18	3	2.63	440.0
209	A14-M1-B04	3	1.94	296.1	612	A20-M1-B18	3	2.79	490.0
210	A15-M1-B04	3	2.25	379.1	613	A21-M1-B18	3	2.18	378.0
211	A16-M1-B04	3	2.11	359.1	614	A22-M1-B18	3	3.01	558.0
212	A17-M1-B04	3	1.87	353.1	615	A23-M1-B18	3	2.77	456.0
213	A18-M2-B04	3	2.31	370.1	616	A24-M1-B18	3	2.63	476.0
214	A18-M1-B04	3	2.22	370.1	617	A25-M1-B18	3	2.83	508.0
215	A20-M1-B04	3	2.43	402.1	618	A26-M1-B18	3	2.34	392.0
216	A21-M1-B04	3	1.69	290.1	619	A02-M1-B19	3	2.45	362.1
217	A22-M1-B04	3	2.69	470.1	620	A05-M1-B19	3	2.7	458.0

10

20

30

40

218	A23-M1-B04	3	2.39	368.1	621	A06-M1-B19	3	2.2	312.1
219	A24-M1-B04	3	2.27	388.1	622	A08-M1-B19	3	2.7	446.1
220	A25-M1-B04	3	2.49	420.1	623	A10-M1-B19	3	2.56	416.1
221	A26-M1-B04	3	1.9	304.1	624	A11-M1-B19	3	2.5	428.1
222	A27-M2-B04	3	2.31	378.1	625	A12-M1-B19	3	2.33	338.1
223	A01-M1-B05	3	1.84	335.1	626	A14-M1-B19	3	2.17	324.1
224	A01-M2-B05	3	2.01	335.1	627	A15-M1-B19	3	2.45	407.1
225	A02-M1-B05	3	2.2	387.2	628	A16-M1-B19	3	2.31	387.1
226	A02-M2-B05	3	2.32	387.2	629	A17-M1-B19	3	2.1	381.1
227	A03-M1-B05	3	2.51	455.1	630	A18-M1-B19	3	2.43	398.1
228	A04-M1-B05	3	2.2	405.2	631	A04-M1-B19	3	2.46	380.1
229	A04-M2-B05	3	2.33	405.2	632	A20-M1-B19	3	2.62	430.1
230	A05-M1-B05	3	2.43	483.1	633	A21-M1-B19	3	1.98	318.1
231	A05-M2-B05	3	2.53	483.1	634	A22-M1-B19	3	2.85	498.1
232	A06-M1-B05	3	1.97	337.2	635	A23-M1-B19	3	2.58	396.1
233	A06-M2-B05	3	2.12	337.2	636	A24-M1-B19	3	2.47	416.1
234	A07-M1-B05	3	2.29	423.2	637	A25-M1-B19	3	2.68	448.1
235	A07-M2-B05	3	2.4	423.2	638	A26-M1-B19	3	2.15	332.1
236	A08-M1-B05	3	2.43	471.2	639	A02-M1-B20	3	2.82	416.2
237	A08-M2-B05	3	2.53	471.2	640	A05-M1-B20	3	3.06	512.1
238	A09-M1-B05	3	2.26	447.2	641	A06-M1-B20	3	2.65	366.2
239	A09-M2-B05	3	2.3	447.2	642	A08-M1-B20	3	3.03	500.2
240	A10-M2-B05	3	2.4	441.1	643	A10-M1-B20	3	2.91	470.2
241	A11-M1-B05	3	2.31	453.2	644	A11-M1-B20	3	2.84	482.2
242	A11-M2-B05	3	2.36	453.2	645	A12-M1-B20	3	2.73	392.2
243	A12-M1-B05	3	2.18	363.2	646	A14-M1-B20	3	2.59	378.2
244	A13-M2-B05	3	2.54	517.2	647	A15-M1-B20	3	2.79	461.2
245	A13-M1-B05	3	2.57	517.2	648	A16-M1-B20	3	2.69	441.2
246	A14-M1-B05	3	2.19	349.2	649	A17-M1-B20	3	2.53	435.2
247	A15-M1-B05	3	2.46	432.2	650	A18-M1-B20	3	2.8	452.2
248	A16-M1-B05	3	2.32	412.2	651	A04-M1-B20	3	2.83	434.2
249	A17-M1-B05	3	2.11	406.2	652	A20-M1-B20	3	2.98	484.2
250	A18-M2-B05	3	2.53	423.2	653	A21-M1-B20	3	2.44	372.2
251	A21-M1-B05	3	1.98	343.1	654	A22-M1-B20	3	3.18	552.2
252	A26-M1-B05	3	2.15	357.2	655	A23-M1-B20	3	2.96	450.2
253	A27-M2-B05	3	2.53	431.2	656	A24-M1-B20	3	2.83	470.2
254	A01-M1-B06	3	2.07	360.1	657	A25-M1-B20	3	3.02	502.2
255	A01-M2-B06	3	2.22	360.1	658	A26-M1-B20	3	2.57	386.2
256	A02-M1-B06	3	2.44	412.1	659	A02-M1-B21	3	2.64	396.1
257	A02-M2-B06	3	2.48	412.1	660	A05-M1-B21	3	2.89	492.0
258	A03-M1-B06	3	2.65	480.0	661	A06-M1-B21	3	2.41	346.1
259	A03-M2-B06	3	2.75	480.0	662	A08-M1-B21	3	2.87	480.1
260	A04-M1-B06	3	2.39	430.1	663	A10-M1-B21	3	2.74	450.1
261	A04-M2-B06	3	2.49	430.1	664	A11-M1-B21	3	2.67	462.1
262	A05-M1-B06	3	2.59	508.0	665	A12-M1-B21	3	2.56	372.1
263	A05-M2-B06	3	2.66	508.0	666	A14-M1-B21	3	2.39	358.1
264	A06-M1-B06	3	2.21	362.1	667	A15-M1-B21	3	2.62	441.1
265	A06-M2-B06	3	2.32	362.1	668	A16-M1-B21	3	2.5	421.1
266	A07-M1-B06	3	2.51	448.1	669	A17-M1-B21	3	2.31	415.1
267	A07-M2-B06	3	2.56	448.1	670	A18-M1-B21	3	2.62	432.1
268	A08-M1-B06	3	2.57	496.1	671	A04-M1-B21	3	2.65	414.1

10

20

30

40

269	A08-M2-B06	3	2.66	496.1	672	A20-M1-B21	3	2.81	464.1
270	A09-M1-B06	3	2.42	472.1	673	A21-M1-B21	3	2.21	352.1
271	A09-M2-B06	3	2.48	472.1	674	A22-M1-B21	3	3.02	532.1
272	A10-M1-B06	3	2.51	466.1	675	A23-M1-B21	3	2.79	430.0
273	A10-M2-B06	3	2.6	466.1	676	A24-M1-B21	3	2.65	450.1
274	A11-M1-B06	3	2.45	478.1	677	A25-M1-B21	3	2.84	482.1
275	A12-M1-B06	3	2.36	388.1	678	A26-M1-B21	3	2.36	366.1
276	A12-M2-B06	3	2.42	388.1	679	A02-M1-B22	3	2.63	438.2
277	A13-M2-B06	3	2.71	542.1	680	A05-M1-B22	3	2.87	534.1
278	A14-M1-B06	3	2.43	374.1	681	A06-M1-B22	3	2.42	388.2
279	A16-M1-B06	3	2.52	437.1	682	A08-M1-B22	3	2.86	522.2
280	A17-M1-B06	3	2.36	431.1	683	A10-M1-B22	3	2.73	492.1
281	A18-M2-B06	3	2.74	448.1	684	A11-M1-B22	3	2.67	504.2
282	A18-M1-B06	3	2.64	448.1	685	A12-M1-B22	3	2.53	414.2
283	A20-M1-B06	3	2.81	480.1	686	A14-M1-B22	3	2.4	400.2
284	A21-M1-B06	3	2.27	368.1	687	A15-M1-B22	3	2.62	483.2
285	A22-M1-B06	3	3.02	548.1	688	A16-M1-B22	3	2.51	463.2
286	A23-M1-B06	3	2.79	446.1	689	A17-M1-B22	3	2.32	457.2
287	A24-M1-B06	3	2.67	466.1	690	A18-M1-B22	3	2.6	474.2
288	A25-M1-B06	3	2.85	498.1	691	A04-M1-B22	3	2.64	456.2
289	A26-M1-B06	3	2.39	382.1	692	A20-M1-B22	3	2.8	506.2
290	A27-M2-B06	3	2.74	456.1	693	A21-M1-B22	3	2.23	394.1
291	A01-M1-B07	3	2.21	360.0	694	A22-M1-B22	3	3.02	574.1
292	A01-M2-B07	3	2.37	360.0	695	A23-M1-B22	3	2.77	472.1
293	A02-M1-B07	3	2.55	412.1	696	A24-M1-B22	3	2.63	492.1
294	A02-M2-B07	3	2.66	412.1	697	A25-M1-B22	3	2.84	524.2
295	A03-M1-B07	3	2.83	480.0	698	A26-M1-B22	3	2.36	408.2
296	A04-M1-B07	3	2.55	430.0	699	A02-M1-B23	3	2.55	384.0
297	A04-M2-B07	3	2.65	430.0	700	A06-M1-B23	3	2.3	334.0
298	A05-M1-B07	3	2.77	508.0	701	A08-M1-B23	3	2.81	468.0
299	A06-M1-B07	3	2.37	362.0	702	A10-M1-B23	3	2.66	438.0
300	A06-M2-B07	3	2.49	362.0	703	A11-M1-B23	3	2.59	450.0
301	A07-M1-B07	3	2.61	448.0	704	A12-M1-B23	3	2.43	360.0
302	A07-M2-B07	3	2.73	448.0	705	A14-M1-B23	3	2.27	346.0
303	A08-M1-B07	3	2.73	496.0	706	A15-M1-B23	3	2.55	429.0
304	A08-M2-B07	3	2.81	496.0	707	A16-M1-B23	3	2.4	409.0
305	A09-M1-B07	3	2.67	472.1	708	A17-M1-B23	3	2.19	403.1
306	A09-M2-B07	3	2.65	472.1	709	A18-M1-B23	3	2.53	420.0
307	A10-M1-B07	3	2.65	466.0	710	A04-M1-B23	3	2.57	402.0
308	A11-M1-B07	3	2.58	478.0	711	A20-M1-B23	3	2.73	452.0
309	A11-M2-B07	3	2.68	478.0	712	A21-M1-B23	3	2.07	340.0
310	A12-M1-B07	3	2.51	388.1	713	A22-M1-B23	3	2.96	520.0
311	A13-M2-B07	3	2.88	542.1	714	A23-M1-B23	3	2.7	418.0
312	A14-M1-B07	3	2.57	374.0	715	A24-M1-B23	3	2.57	438.0
313	A15-M1-B07	3	2.78	457.0	716	A25-M1-B23	3	2.77	470.0
314	A16-M1-B07	3	2.67	437.0	717	A26-M1-B23	3	2.25	354.0
315	A17-M1-B07	3	2.49	431.1	718	A02-M1-B24	3	2.27	363.1
316	A18-M2-B07	3	2.91	448.0	719	A05-M1-B24	3	2.54	459.0
317	A18-M1-B07	3	2.8	448.0	720	A06-M1-B24	3	1.99	313.1
318	A20-M1-B07	3	2.98	480.0	721	A08-M1-B24	3	2.55	447.1
319	A21-M1-B07	3	2.39	368.0	722	A10-M1-B24	3	2.39	417.1

10

20

30

40

320	A22-M1-B07	3	3.19	548.0	723	A11-M1-B24	3	2.34	429.1
321	A23-M1-B07	3	2.97	446.0	724	A12-M1-B24	3	2.14	339.1
322	A24-M1-B07	3	2.83	466.0	725	A14-M1-B24	3	1.98	325.1
323	A25-M1-B07	3	3.03	498.0	726	A15-M1-B24	3	2.27	408.1
324	A26-M1-B07	3	2.55	382.0	727	A16-M1-B24	3	2.13	388.1
325	A27-M2-B07	3	2.91	456.1	728	A17-M1-B24	3	1.89	382.1
326	A01-M1-B08	3	1.93	336.1	729	A18-M1-B24	3	2.25	399.1
327	A01-M2-B08	3	2.06	336.1	730	A04-M1-B24	3	2.29	381.1
328	A02-M1-B08	3	2.26	388.2	731	A20-M1-B24	3	2.46	431.1
329	A03-M1-B08	3	2.55	456.1	732	A21-M1-B24	3	1.74	319.1
330	A04-M1-B08	3	2.26	406.1	733	A22-M1-B24	3	2.71	499.1
331	A05-M1-B08	3	2.49	484.1	734	A23-M1-B24	3	2.41	397.1
332	A05-M2-B08	3	2.55	484.1	735	A24-M1-B24	3	2.29	417.1
333	A06-M1-B08	3	2.05	338.1	736	A25-M1-B24	3	2.51	449.1
334	A06-M2-B08	3	2.16	338.1	737	A26-M1-B24	3	1.95	333.1
335	A07-M1-B08	3	2.35	424.1	738	A02-M1-B25	3	2.63	372.2
336	A07-M2-B08	3	2.43	424.1	739	A05-M1-B25	3	2.89	468.1
337	A08-M1-B08	3	2.48	472.1	740	A06-M1-B25	3	2.41	322.1
338	A08-M2-B08	3	2.55	472.1	741	A08-M1-B25	3	2.87	456.1
339	A09-M1-B08	3	2.31	448.2	742	A10-M1-B25	3	2.73	426.1
340	A09-M2-B08	3	2.34	448.2	743	A11-M1-B25	3	2.66	438.2
341	A10-M1-B08	3	2.41	442.1	744	A14-M1-B25	3	2.38	334.1
342	A10-M2-B08	3	2.44	442.1	745	A15-M1-B25	3	2.62	417.1
343	A11-M1-B08	3	2.36	454.2	746	A16-M1-B25	3	2.5	397.2
344	A11-M2-B08	3	2.4	454.2	747	A17-M1-B25	3	2.31	391.2
345	A12-M1-B08	3	2.24	364.2	748	A18-M1-B25	3	2.61	408.1
346	A12-M2-B08	3	2.27	364.2	749	A04-M1-B25	3	2.65	390.2
347	A13-M1-B08	3	2.63	518.2	750	A20-M1-B25	3	2.8	440.2
348	A14-M1-B08	3	2.27	350.1	751	A21-M1-B25	3	2.21	328.1
349	A15-M1-B08	3	2.51	433.1	752	A22-M1-B25	3	3.02	508.1
350	A16-M1-B08	3	2.39	413.2	753	A23-M1-B25	3	2.77	406.1
351	A17-M1-B08	3	2.19	407.2	754	A24-M1-B25	3	2.65	426.1
352	A18-M2-B08	3	2.57	424.1	755	A25-M1-B25	3	2.83	458.1
353	A18-M1-B08	3	2.49	424.1	756	A26-M1-B25	3	2.35	342.2
354	A20-M1-B08	3	2.69	456.1	757	A14-M1-B26	3	3.49	328.2
355	A21-M1-B08	3	2.09	344.1	758	A15-M1-B26	3	3.53	411.2
356	A22-M1-B08	3	2.92	524.1	759	A16-M1-B26	3	3.49	391.2
357	A23-M1-B08	3	2.65	422.1	760	A17-M1-B26	3	3.39	385.2
358	A24-M1-B08	3	2.53	442.1	761	A20-M1-B26	3	3.77	434.2
359	A25-M1-B08	3	2.73	474.1	762	A21-M1-B26	3	3.31	322.2
360	A26-M1-B08	3	2.23	358.1	763	A23-M1-B26	3	3.8	400.2
361	A27-M2-B08	3	2.58	432.2	764	A24-M1-B26	3	3.61	420.2
362	A01-M1-B09	3	2.23	348.2	765	A25-M1-B26	3	3.79	452.2
363	A01-M2-B09	3	2.37	348.2	766	A26-M1-B26	3	3.45	336.2
364	A02-M1-B09	3	2.55	400.2	767	A02-M1-B27	3	2.5	404.2
365	A02-M2-B09	3	2.63	400.2	768	A05-M1-B27	3	2.75	500.1
366	A03-M1-B09	3	2.82	468.1	769	A06-M1-B27	3	2.27	354.1
367	A03-M2-B09	3	2.89	468.1	770	A08-M1-B27	3	2.74	488.1
368	A04-M1-B09	3	2.55	418.2	771	A10-M1-B27	3	2.61	458.1
369	A04-M2-B09	3	2.63	418.2	772	A11-M1-B27	3	2.54	470.1
370	A05-M1-B09	3	2.75	496.1	773	A12-M1-B27	3	2.38	380.2

10

20

30

40

371	A05-M2-B09	3	2.81	496.1	774	A14-M1-B27	3	2.25	366.1
372	A06-M1-B09	3	2.38	350.2	775	A15-M1-B27	3	2.49	449.1
373	A06-M2-B09	3	2.48	350.2	776	A16-M1-B27	3	2.37	429.1
374	A07-M1-B09	3	2.61	436.2	777	A17-M1-B27	3	2.17	423.2
375	A07-M2-B09	3	2.7	436.2	778	A18-M1-B27	3	2.47	440.1
376	A08-M1-B09	3	2.72	484.2	779	A04-M1-B27	3	2.51	422.1
377	A08-M2-B09	3	2.79	484.2	780	A20-M1-B27	3	2.66	472.1
378	A09-M1-B09	3	2.57	460.2	781	A21-M1-B27	3	2.06	360.1
379	A09-M2-B09	3	2.63	460.2	782	A22-M1-B27	3	2.89	540.1
380	A10-M1-B09	3	2.66	454.2	783	A23-M1-B27	3	2.63	438.1
381	A10-M2-B09	3	2.71	454.2	784	A24-M1-B27	3	2.51	458.1
382	A11-M1-B09	3	2.59	466.2	785	A25-M1-B27	3	2.7	490.4
383	A11-M2-B09	3	2.7	466.2	786	A26-M1-B27	3	2.22	374.4
384	A12-M1-B09	3	2.51	376.2	787	A02-M1-B28	3	2.65	541.2
385	A12-M2-B09	3	2.57	376.2	788	A05-M1-B28	3	2.86	637.1
386	A13-M2-B09	3	2.85	530.2	789	A06-M1-B28	3	2.47	491.2
387	A13-M1-B09	3	2.89	530.2	790	A08-M1-B28	3	2.85	625.2
388	A14-M1-B09	3	2.6	362.2	791	A10-M1-B28	3	2.73	595.2
389	A15-M1-B09	3	2.8	445.2	792	A11-M1-B28	3	2.68	607.2
390	A16-M1-B09	3	2.69	425.2	793	A12-M1-B28	3	2.56	517.2
391	A17-M1-B09	3	2.53	419.2	794	A14-M1-B28	3	2.44	503.2
392	A18-M2-B09	3	2.9	436.2	795	A15-M1-B28	3	2.63	586.2
393	A18-M1-B09	3	2.81	436.2	796	A16-M1-B28	3	2.54	566.2
394	A20-M1-B09	3	2.99	468.2	797	A17-M1-B28	3	2.37	560.2
395	A21-M1-B09	3	2.44	356.2	798	A18-M1-B28	3	2.63	577.2
396	A22-M1-B09	3	3.19	536.2	799	A04-M1-B28	3	2.65	559.2
397	A23-M1-B09	3	2.97	434.2	800	A20-M1-B28	3	2.79	609.2
398	A24-M1-B09	3	2.83	454.2	801	A21-M1-B28	3	2.31	497.2
399	A25-M1-B09	3	3.03	486.2	802	A22-M1-B28	3	3	677.2
400	A26-M1-B09	3	2.59	370.2	803	A23-M1-B28	3	2.76	575.1
401	A27-M2-B09	3	2.9	444.2	804	A24-M1-B28	3	2.65	595.2
402	A01-M1-B10	3	1.73	352.1	805	A25-M1-B28	3	2.83	627.2
403	A01-M2-B10	3	1.88	352.1	806	A26-M1-B28	3	2.42	511.6

10

20

30

【実施例12】

【0336】

1 - (6 - ベンジルオキシ - 1H - インダゾール - 3 - イル) - 3 - ブチル - 尿素
 Novabiochemトリチル樹脂(公表置換1.27mmol/g、0.64mmol)500mgをジクロロメタンに懸濁し、2 - [6 - (tert - ブチル - ジメチル - シラニルオキシ) - 1H - インダゾール - 3 - イル] - イソインドール - 1, 3 - ジオン374mg(0.9mmol)及び2 - tert - ブチルイミノ - 2 - ジエチルアミノ - 1, 3 - ジメチルペルヒドロ - 1, 3, 2 - ジアザホスホリン367μl(1.3mmol)を加えた。その懸濁液を16時間攪拌し、次に樹脂をろ過して、ジクロロメタン、メタノール、ジメチルホルムアミド、再びメタノール及びジクロロメタンで洗った。その後樹脂を真空下で乾燥した。

40

【0337】

樹脂の同一性及び充填段階の収率を充填生成物の開裂によって確認した；樹脂40mgをジクロロメタン1mlに懸濁し、トリフルオロ酢酸150μlを加えた。2時間後、樹脂を排出し、ジクロロメタン1mlで2回洗った；収集した溶液を乾燥し、表題化合物13.8mgを回収した。算定充填量0.85mmol/g、HPLC r.t.方法1:7.64[M+H]⁺=394。

【0338】

第一段階で得た樹脂(300mg、~0.25mmol)をジクロロメタンとメタノール

50

ル 1 : 1 の混合物 5 m l に懸濁し、ヒドラジン-水和物 4 0 0 μ l を加えた。その懸濁液を 4 5 に加熱した。加熱と攪拌を一晩続け、その後混合物を室温に冷却した。樹脂をろ過し、メタノールと水 1 : 1 の混合物、メタノール、ジメチルホルムアミド、及び再びメタノールで洗った後、真空下で乾燥した。

【 0 3 3 9 】

樹脂の同一性を開裂によって確認した。その反応は上述したように実施した。

【 0 3 4 0 】

開裂化合物 : 6 - { [t e r t - ブチル (ジメチル) シリル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - アミン : H P L C r . t . 方法 1 : 5 . 9 9 [M + H] + = 2 6 4 ; [M - H] - = 2 6 2 。

10

【 0 3 4 1 】

第二段階で得た樹脂の試料 (1 0 0 m g 、 0 . 0 8 m m o l) をジメチルホルムアミド 2 m l に懸濁した ; N - ブチルイソシアネート (2 8 μ l 、 ~ 5 当量) を加えた。懸濁液を 5 0 に加熱した。攪拌及び加熱を 6 0 時間維持し、その後懸濁液を室温に冷却した。樹脂をろ過し、ジクロロメタン、メタノール、ジメチルホルムアミド、メタノール及びジクロロメタンで洗った後、真空下で乾燥した。

【 0 3 4 2 】

第三段階で得た樹脂 (1 0 0 m g 、 0 . 0 8 m m o l) を無水テトラヒドロフラン 3 m l に懸濁し、テトラヒドロフラン中のフッ化テトラブチルアンモニウムの 1 M 溶液 1 2 0 μ l (~ 1 . 5 当量) を加えた。その懸濁液を一晩攪拌し、樹脂をろ過して、ジクロロメタン、メタノール、ジメチルホルムアミド、メタノール及びジクロロメタンで洗った。

20

【 0 3 4 3 】

開裂化合物 : 1 - ブチル - 3 - (6 - ヒドロキシ - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素 H P L C 方法 1 r . t . 3 . 8 7 [M + H] + = 2 4 9 ; [M - H] - = 2 4 7 。

【 0 3 4 4 】

第四段階で得た樹脂 (1 0 0 m g 、 0 . 0 8 m m o l) を 1 - メチル - 2 - ピロリジノン 3 m l に懸濁し、次に 2 - t e r t - ブチルイミノ - 2 - ジエチルアミノ - 1 , 3 - ジメチルペルヒドロ - 1 , 3 , 2 - ジアザホスホリン 4 3 μ l (~ 1 . 5 当量) 及び臭化ベンジル 5 7 μ l (~ 6 当量) を加えた。その懸濁液を 1 6 時間攪拌した。樹脂をろ過して、ジクロロメタン、メタノール、ジメチルホルムアミド、メタノール及びジクロロメタンで洗った。

30

【 0 3 4 5 】

乾燥樹脂 1 0 0 m g をジクロロメタン 3 m l に懸濁し、トリフルオロ酢酸 4 5 0 μ l を加えた。2 時間後、樹脂を排出し、ジクロロメタン 3 m l で 2 回洗った ; 収集した溶液を乾燥し、所望表題化合物を回収した。

【 0 3 4 6 】

1 - (6 - ベンジルオキシ - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - ブチル - 尿素 H P L C 方法 3 r . t . : 2 . 3 [M + H] + = 3 3 9 . 3 。

【 0 3 4 7 】

実施例 1 2 と同様に操作することにより、2 - (6 - { [t e r t - ブチル (ジメチル) シリル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 1 H - イソインドール - 1 , 3 (2 H) - ジオン及び 2 - [5 - (t e r t - ブチル - ジメチル - シラニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - イソインドール - 1 , 3 - ジオンを樹脂上に保持し、その後、上述した合成スキームに従うことにより、下記の生成物を合成した。

40

【 0 3 4 8 】

1 - (5 - ベンジルオキシ - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 3 - ブチル - 尿素 H P L C 方法 3 r . t . 2 . 2 5 [M + H] + = 3 3 9 . 3

メチル 2 - ({ 3 - [(アニリノカルボニル) アミノ] - 1 H - インダゾール - 5 - イル } オキシ) ブタノエート H P L C r . t . 方法 1 : 5 . 8 8 [M + H] + = 3 6 9

50

. 1。

【0349】

メチル 2 - [(3 - { [(ベンジルアミノ) カルボニル] アミノ } - 1 H - インダゾール - 5 - イル) オキシ] ブタノエート H P L C r . t . 方法 2 : 8 . 1 9 [M + H] + = 3 8 3 . 2 。

【0350】

N - イソプロピル - N ' - { 5 - [(2 - オキソ - 1 - フェニルピロリジン - 3 - イル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素 H P L C r . t . 方法 2 : 7 . 8 4 [M + H] + = 3 9 4 . 2 。

【0351】

2 - [(3 - { [(イソプロピルアミノ) カルボニル] アミノ } - 1 H - インダゾール - 5 - イル) オキシ] - N - フェニルプロパンアミド H P L C r . t . 方法 2 : 7 . 7 6 [M + H] + = 3 8 2 . 2 。

【0352】

メチル 2 - [(3 - { [(イソプロピルアミノ) カルボニル] アミノ } - 1 H - インダゾール - 5 - イル) オキシ] ブタノエート H P L C r . t . 方法 2 : 7 . 6 5 [M + H] + = 3 3 5 . 2 。

【0353】

N - イソプロピル - N ' - { 6 - [(2 - オキソ - 1 - フェニルピロリジン - 3 - イル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } 尿素 H P L C r . t . 方法 2 : 7 . 8 9 [M + H] + = 3 9 4 . 2 。

【0354】

同様に (実施例 1 2) 操作することにより、506の生成物を平行して合成し、先に示したように、表X I Iにおいてコード化した；関連するH P L C保持時間及び実験的に認められた [M + H] + を報告する。

【0355】

【表13】

表 X I I

登録番号	化合物	HPLCの方法	r. t. (保持時間) (分)	[M+H]+	登録番号	化合物	HPLCの方法	r. t. (保持時間) (分)	[M+H]+
1	A38-M1-B82	2	9.11	373.2	254	A14-M1-B69	3	2.52	349.2
2	A29-M1-B82	2	8.3	428.2	255	A15-M1-B69	3	2.74	432.2
3	A35-M1-B82	2	8.18	416.2	256	A16-M1-B69	3	2.64	412.2
4	A38-M1-B83	2	9.09	387.2	257	A17-M1-B69	3	2.46	406.2
5	A29-M1-B83	2	8.3	442.2	258	A18-M2-B69	3	2.77	423.2
6	A35-M1-B83	2	8.26	430.2	259	A18-M1-B69	3	2.75	423.2
7	A39-M1-B83	2	8.47	431.2	260	A20-M1-B69	3	2.93	455.2
8	A40-M1-B83	2	9.05	470.2	261	A21-M1-B69	3	2.37	343.1
9	A38-M1-B68	2	8.75	339.2	262	A22-M1-B69	3	3.13	523.1
10	A03-M1-B68	2	9.32	393.1	263	A23-M1-B69	3	2.91	421.1
11	A40-M1-B68	2	8.74	422.2	264	A24-M1-B69	3	2.79	441.1
12	A35-M2-B82	2	8.31	416.2	265	A25-M1-B69	3	2.97	473.2
13	A32-M2-B82	1	6.01	369.1	266	A26-M1-B69	3	2.51	357.2
14	A39-M2-B82	2	8.54	417.1	267	A27-M2-B69	3	2.77	431.2
15	A40-M2-B82	2	9.09	456.2	268	A01-M1-B70	3	2.2	373.1
16	A38-M2-B83	2	9.15	387.2	269	A01-M2-B70	3	2.22	373.1
17	A45-M2-B83	2	9.31	477.2	270	A02-M1-B70	3	2.44	425.1
18	A03-M2-B83	2	9.61	441.1	271	A03-M1-B70	3	2.7	493.1
19	A29-M2-B83	2	8.35	442.2	272	A04-M1-B70	3	2.45	443.1
20	A31-M2-B83	2	8.64	351.2	273	A05-M1-B70	3	2.63	521

10

20

30

40

50

21	A44-M2-B83	2	8.77	435.1	274	A05-M2-B70	3	2.61	521
22	A46-M2-B83	2	8.69	461.2	275	A06-M1-B70	3	2.27	375.1
23	A35-M2-B83	2	8.33	430.2	276	A06-M2-B70	3	2.33	375.1
24	A32-M2-B83	1	5.7	383.2	277	A07-M2-B70	3	2.55	461.1
25	A41-M2-B83	2	9.02	477.2	278	A08-M1-B70	3	2.61	509.1
26	A39-M2-B83	2	8.57	431.2	279	A09-M2-B70	3	2.48	485.2
27	A40-M2-B83	2	9.12	470.2	280	A10-M1-B70	3	2.57	479.1
28	A38-M2-B68	2	8.82	339.2	281	A10-M2-B70	3	2.56	479.1
29	A03-M2-B68	2	9.35	393.1	282	A11-M1-B70	3	2.51	491.1
30	A31-M2-B68	2	8.12	303.2	283	A11-M2-B70	3	2.52	491.1
31	A44-M2-B68	2	8.37	387.1	284	A12-M1-B70	3	2.41	401.1
32	A46-M2-B68	2	8.28	413.2	285	A12-M2-B70	3	2.43	401.1
33	A35-M2-B68	2	7.86	382.2	286	A13-M1-B70	3	2.76	555.1
34	A32-M2-B68	1	4.88	335.2	287	A14-M1-B70	3	2.5	387.1
35	A41-M2-B68	2	8.68	429.2	288	A18-M2-B70	3	2.71	461.1
36	A39-M2-B68	2	8.15	383.2	289	A01-M1-B71	3	1.96	339.1
37	A30-M1-B82	1	7.23	373.2	290	A02-M1-B71	3	2.27	391.1
38	A29-M1-B82	1	5.39	337.2	291	A02-M2-B71	3	2.33	391.1
39	A03-M1-B82	1	7.84	427.1	292	A03-M1-B71	3	2.55	459.1
40	A30-M2-B82	1	7.19	373.2	293	A03-M2-B71	3	2.58	459.1
41	A31-M2-B82	2	8.58	337.2	294	A04-M1-B71	3	2.28	409.1
42	A29-M2-B82	2	8.32	428.2	295	A04-M2-B71	3	2.34	409.1
43	A03-M2-B82	2	9.58	427.1	296	A05-M1-B71	3	2.49	487.1
44	A01-M1-B62	3	1.99	337.1	297	A05-M2-B71	3	2.52	487.1
45	A02-M1-B62	3	2.31	389.2	298	A06-M1-B71	3	2.09	341.1
46	A03-M1-B62	3	2.64	457.1	299	A08-M2-B71	3	2.52	475.1
47	A03-M2-B62	3	2.64	457.1	300	A09-M1-B71	3	2.31	451.2
48	A04-M1-B62	3	2.32	407.1	301	A10-M1-B71	3	2.42	445.1
49	A05-M1-B62	3	2.57	485.1	302	A11-M1-B71	3	2.36	457.1
50	A05-M2-B62	3	2.58	485.1	303	A11-M2-B71	3	2.37	457.1
51	A06-M1-B62	3	2.12	339.1	304	A12-M1-B71	3	2.24	367.1
52	A06-M2-B62	3	2.2	339.1	305	A12-M2-B71	3	2.25	367.1
53	A07-M1-B62	3	2.44	425.1	306	A13-M2-B71	3	2.54	521.2
54	A07-M2-B62	3	2.46	425.1	307	A14-M1-B71	3	2.29	353.1
55	A08-M1-B62	3	2.62	473.1	308	A15-M1-B71	3	2.51	436.1
56	A08-M2-B62	3	2.57	473.1	309	A16-M1-B71	3	2.41	416.1
57	A09-M1-B62	3	2.35	449.2	310	A17-M1-B71	3	2.21	410.2
58	A09-M2-B62	3	2.38	449.2	311	A18-M2-B71	3	2.53	427.1
59	A10-M1-B62	3	2.15	443.1	312	A18-M1-B71	3	2.49	427.1
60	A11-M1-B62	3	2.4	455.1	313	A20-M1-B71	3	2.69	459.1
61	A11-M2-B62	3	2.43	455.1	314	A21-M1-B71	3	2.13	347.1
62	A12-M1-B62	3	2.28	365.2	315	A22-M1-B71	3	2.91	527.1
63	A13-M2-B62	3	2.61	519.2	316	A23-M1-B71	3	2.65	425.1
64	A14-M1-B62	3	2.33	351.1	317	A24-M1-B71	3	2.54	445.1
65	A14-M2-B62	3	2.41	351.1	318	A25-M1-B71	3	2.72	477.1
66	A15-M1-B62	3	2.55	434.1	319	A26-M1-B71	3	2.26	361.1
67	A16-M1-B62	3	2.45	414.1	320	A27-M2-B71	3	2.54	435.2
68	A17-M1-B62	3	2.24	408.2	321	A01-M1-B72	3	1.88	287.1
69	A18-M2-B62	3	2.62	425.1	322	A03-M1-B72	3	2.55	407.1
70	A18-M1-B62	3	2.53	425.1	323	A04-M1-B72	3	2.26	357.2
71	A20-M1-B62	3	2.75	457.1	324	A04-M2-B72	3	2.31	357.2

10

20

30

40

72	A21-M1-B62	3	2.15	345.1	325	A05-M1-B72	3	2.48	435.1
73	A22-M1-B62	3	2.96	525.1	326	A05-M2-B72	3	2.53	435.1
74	A23-M1-B62	3	2.7	423.1	327	A06-M1-B72	3	2.03	289.2
75	A24-M1-B62	3	2.58	443.1	328	A07-M1-B72	3	2.33	375.2
76	A25-M1-B62	3	2.78	475.1	329	A08-M2-B72	3	2.5	423.2
77	A26-M1-B62	3	2.31	359.1	330	A09-M1-B72	3	2.27	399.2
78	A01-M1-B63	3	2.09	321.1	331	A10-M1-B72	3	2.39	393.1
79	A02-M1-B63	3	2.47	373.2	332	A11-M1-B72	3	2.34	405.2
80	A03-M1-B63	3	2.75	441.1	333	A11-M2-B72	3	2.34	405.2
81	A03-M2-B63	3	2.72	441.1	334	A12-M1-B72	3	2.19	315.2
82	A04-M1-B63	3	2.42	391.1	335	A12-M2-B72	3	2.21	315.2
83	A04-M2-B63	3	2.44	391.1	336	A13-M1-B72	3	2.62	469.2
84	A05-M1-B63	3	2.68	469.1	337	A14-M1-B72	3	2.21	301.2
85	A06-M1-B63	3	2.23	323.1	338	A15-M1-B72	3	2.47	384.2
86	A07-M2-B63	3	2.49	409.1	339	A16-M1-B72	3	2.35	364.2
87	A08-M1-B63	3	2.67	457.1	340	A17-M1-B72	3	2.13	358.2
88	A08-M2-B63	3	2.64	457.1	341	A18-M2-B72	3	2.49	375.2
89	A09-M1-B63	3	2.44	433.2	342	A18-M1-B72	3	2.45	375.2
90	A10-M1-B63	3	2.56	427.1	343	A20-M1-B72	3	2.66	407.2
91	A11-M1-B63	3	2.49	439.2	344	A21-M1-B72	3	2.03	295.1
92	A12-M1-B63	3	2.37	349.2	345	A22-M1-B72	3	2.9	475.1
93	A13-M2-B63	3	2.69	503.2	346	A23-M1-B72	3	2.61	373.1
94	A14-M1-B63	3	2.41	335.1	347	A24-M1-B72	3	2.5	393.1
95	A15-M1-B63	3	2.65	418.1	348	A25-M1-B72	3	2.7	425.2
96	A16-M1-B63	3	2.53	398.2	349	A26-M1-B72	3	2.17	309.2
97	A17-M1-B63	3	2.35	392.2	350	A01-M1-B73	3	2.19	361.1
98	A18-M2-B63	3	2.67	409.1	351	A02-M1-B73	3	2.51	413.1
99	A18-M1-B63	3	2.64	409.1	352	A06-M1-B73	3	2.33	363.1
100	A20-M1-B63	3	2.83	441.1	353	A07-M1-B73	3	2.6	449.1
101	A21-M1-B63	3	2.26	329.1	354	A07-M2-B73	3	2.57	449.1
102	A22-M1-B63	3	3.05	509.1	355	A08-M2-B73	3	2.7	497.1
103	A23-M1-B63	3	2.81	407.1	356	A10-M1-B73	3	2.63	467.1
104	A24-M1-B63	3	2.67	427.1	357	A11-M1-B73	3	2.57	479.1
105	A25-M1-B63	3	2.87	459.1	358	A11-M2-B73	3	2.58	479.1
106	A26-M1-B63	3	2.4	343.1	359	A12-M1-B73	3	2.47	389.1
107	A01-M1-B64	3	2.17	341.1	360	A12-M2-B73	3	2.49	389.1
108	A02-M1-B64	3	2.49	393.1	361	A13-M2-B73	3	2.77	543.1
109	A04-M1-B64	3	2.49	411.1	362	A14-M1-B73	3	2.55	375.1
110	A05-M1-B64	3	2.72	489	363	A18-M2-B73	3	2.77	449.1
111	A06-M1-B64	3	2.31	343.1	364	A27-M2-B73	3	2.78	457.1
112	A07-M1-B64	3	2.56	429.1	365	A01-M1-B74	3	2.08	367.1
113	A08-M1-B64	3	2.67	477.1	366	A01-M2-B74	3	2.11	367.1
114	A08-M2-B64	3	2.67	477.1	367	A02-M1-B74	3	2.39	419.2
115	A09-M1-B64	3	2.51	453.1	368	A02-M2-B74	3	2.41	419.2
116	A09-M2-B64	3	2.56	453.1	369	A03-M1-B74	3	2.67	487.1
117	A10-M1-B64	3	2.62	447.1	370	A04-M1-B74	3	2.4	437.2
118	A11-M1-B64	3	2.55	459.1	371	A04-M2-B74	3	2.41	437.2
119	A11-M2-B64	3	2.59	459.1	372	A05-M1-B74	3	2.59	515.1
120	A12-M1-B64	3	2.46	369.1	373	A05-M2-B74	3	2.6	515.1
121	A13-M2-B64	3	2.78	523.1	374	A06-M1-B74	3	2.21	369.1
122	A14-M1-B64	3	2.51	355.1	375	A06-M2-B74	3	2.23	369.1

10

20

30

40

123	A15-M1-B64	3	2.72	438.1	376	A07-M1-B74	3	2.49	455.1
124	A16-M1-B64	3	2.63	418.1	377	A07-M2-B74	3	1.18	455.1
125	A17-M1-B64	3	2.43	412.1	378	A08-M1-B74	3	2.58	503.1
126	A18-M2-B64	3	2.77	429.1	379	A08-M2-B74	3	2.6	503.1
127	A18-M1-B64	3	2.72	429.1	380	A09-M1-B74	3	2.37	479.2
128	A20-M1-B64	3	2.91	461.1	381	A09-M2-B74	3	2.4	479.2
129	A21-M1-B64	3	2.36	349.1	382	A11-M1-B74	3	2.41	485.2
130	A22-M1-B64	3	3.12	529.1	383	A11-M2-B74	3	2.44	485.2
131	A23-M1-B64	3	2.89	427.1	384	A12-M1-B74	3	2.29	395.2
132	A24-M1-B64	3	2.75	447.1	385	A12-M2-B74	3	2.33	395.2
133	A25-M1-B64	3	2.95	479.1	386	A13-M2-B74	3	2.62	549.2
134	A26-M1-B64	3	2.5	363.1	387	A13-M1-B74	3	2.69	549.2
135	A01-M1-B65	3	2.35	383.1	388	A14-M1-B74	3	2.35	381.1
136	A02-M1-B65	3	2.64	435.2	389	A14-M2-B74	3	2.43	381.1
137	A04-M1-B65	3	2.63	453.2	390	A15-M1-B74	3	2.58	464.1
138	A05-M1-B65	3	2.83	531.1	391	A16-M1-B74	3	2.47	444.2
139	A06-M1-B65	3	2.47	385.2	392	A17-M1-B74	3	2.28	438.2
140	A07-M2-B65	3	2.68	471.2	393	A18-M2-B74	3	2.61	455.1
141	A08-M1-B65	3	2.79	519.2	394	A18-M1-B74	3	2.56	455.1
142	A09-M1-B65	3	2.65	495.2	395	A21-M1-B74	3	2.2	375.1
143	A09-M2-B65	3	2.67	495.2	396	A22-M1-B74	3	2.97	555.1
144	A10-M1-B65	3	2.75	489.1	397	A23-M1-B74	3	2.73	453.1
145	A11-M1-B65	3	2.67	501.2	398	A24-M1-B74	3	2.6	473.1
146	A11-M2-B65	3	2.7	501.2	399	A25-M1-B74	3	2.8	505.1
147	A12-M1-B65	3	2.6	411.2	400	A26-M1-B74	3	2.33	389.2
148	A14-M1-B65	3	2.71	397.2	401	A02-M1-B75	3	2.69	405.1
149	A16-M1-B65	3	2.8	460.2	402	A05-M1-B75	3	2.93	501
150	A17-M1-B65	3	2.64	454.2	403	A06-M1-B75	3	2.48	355.1
151	A18-M1-B65	3	2.89	471.2	404	A08-M1-B75	3	2.93	489.1
152	A20-M1-B65	3	3.07	503.2	405	A10-M1-B75	3	2.79	459.1
153	A21-M1-B65	3	2.57	391.1	406	A11-M1-B75	3	2.74	471.1
154	A22-M1-B65	3	3.25	571.1	407	A12-M1-B75	3	2.58	381.1
155	A23-M1-B65	3	3.05	469.1	408	A14-M1-B75	3	2.44	367.1
156	A24-M1-B65	3	2.93	489.1	409	A15-M1-B75	3	2.66	450.1
157	A25-M1-B65	3	3.1	521.2	410	A16-M1-B75	3	2.57	430.1
158	A26-M1-B65	3	2.69	405.2	411	A17-M1-B75	3	2.38	424.1
159	A01-M1-B66	3	1.89	349.1	412	A18-M1-B75	3	2.65	441.1
160	A04-M1-B66	3	2.22	419.1	413	A04-M1-B75	3	2.7	423.1
161	A06-M1-B66	3	2.02	351.1	414	A20-M1-B75	3	2.87	473.1
162	A06-M2-B66	3	2.06	351.1	415	A21-M1-B75	3	2.31	361.1
163	A08-M2-B66	3	2.45	485.1	416	A22-M1-B75	3	3.08	541.1
164	A09-M1-B66	3	2.24	461.2	417	A23-M1-B75	3	2.83	439.1
165	A09-M2-B66	3	2.82	461.2	418	A24-M1-B75	3	2.71	459.1
166	A11-M1-B66	3	2.31	467.1	419	A25-M1-B75	3	2.9	491.1
167	A11-M2-B66	3	2.34	467.1	420	A26-M1-B75	3	2.43	375.1
168	A12-M1-B66	3	2.16	377.2	421	A14-M1-B76	3	2.58	389.1
169	A12-M2-B66	3	2.21	377.2	422	A15-M1-B76	3	2.77	472.1
170	A14-M1-B66	3	2.22	363.1	423	A16-M1-B76	3	2.69	452.1
171	A15-M1-B66	3	2.46	446.1	424	A17-M1-B76	3	2.51	446.1
172	A16-M1-B66	3	2.35	426.1	425	A18-M1-B76	3	2.77	463.1
173	A17-M1-B66	3	2.13	420.2	426	A20-M1-B76	3	2.96	495.1

10

20

30

40

174	A18-M2-B66	3	2.51	437.1	427	A21-M1-B76	3	2.45	383.1
175	A18-M1-B66	3	2.44	437.1	428	A22-M1-B76	3	3.15	563.1
176	A20-M1-B66	3	2.65	469.1	429	A23-M1-B76	3	2.93	461.1
177	A21-M1-B66	3	2.06	357.1	430	A24-M1-B76	3	2.8	481.1
178	A22-M1-B66	3	2.87	537.1	431	A25-M1-B76	3	2.99	513.1
179	A24-M1-B66	3	2.49	455.1	432	A26-M1-B76	3	2.57	397.1
180	A25-M1-B66	3	2.69	487.1	433	A06-M1-B77	3	2.47	327.1
181	A26-M1-B66	3	2.19	371.1	434	A08-M1-B77	3	2.89	461.1
182	A27-M2-B66	3	2.51	445.2	435	A11-M1-B77	3	2.69	443.1
183	A01-M1-B67	3	1.91	335.1	436	A12-M1-B77	3	2.54	353.1
184	A01-M2-B67	3	2.01	335.1	437	A14-M1-B77	3	2.4	339.1
185	A02-M1-B67	3	2.26	387.1	438	A16-M1-B77	3	2.53	402.1
186	A02-M2-B67	3	2.35	387.1	439	A17-M1-B77	3	2.34	396.1
187	A03-M1-B67	3	2.56	455.1	440	A18-M1-B77	3	2.62	413.1
188	A03-M2-B67	3	2.59	455.1	441	A04-M1-B77	3	2.67	395.1
189	A04-M1-B67	3	2.27	405.1	442	A20-M1-B77	3	2.83	445.1
190	A04-M2-B67	3	2.36	405.1	443	A22-M1-B77	3	3.05	513.1
191	A05-M1-B67	3	2.48	483	444	A23-M1-B77	3	2.79	411.1
192	A06-M1-B67	3	2.05	337.1	445	A24-M1-B77	3	2.66	431.1
193	A06-M2-B67	3	2.16	337.1	446	A25-M1-B77	3	2.86	463.1
194	A08-M2-B67	3	2.55	471.1	447	A26-M1-B77	3	2.39	347.1
195	A09-M1-B67	3	2.3	447.2	448	A02-M1-B78	3	2.55	387.2
196	A09-M2-B67	3	2.34	447.2	449	A05-M1-B78	3	2.79	483.1
197	A10-M1-B67	3	2.4	441.1	450	A06-M1-B78	3	2.35	337.2
198	A11-M1-B67	3	2.35	453.1	451	A08-M1-B78	3	2.79	471.2
199	A11-M2-B67	3	2.4	453.1	452	A10-M1-B78	3	2.67	441.1
200	A12-M1-B67	3	2.21	363.1	453	A11-M1-B78	3	2.63	453.2
201	A12-M2-B67	3	2.27	363.1	454	A12-M1-B78	3	2.45	363.2
202	A13-M2-B67	3	2.59	517.1	455	A14-M1-B78	3	2.33	349.2
203	A14-M1-B67	3	2.27	349.1	456	A16-M1-B78	3	2.45	412.2
204	A15-M1-B67	3	2.51	432.1	457	A17-M1-B78	3	2.27	406.2
205	A16-M1-B67	3	2.38	412.1	458	A18-M1-B78	3	2.53	423.2
206	A17-M1-B67	3	2.18	406.1	459	A04-M1-B78	3	2.57	405.2
207	A18-M2-B67	3	2.54	423.1	460	A20-M1-B78	3	2.73	455.2
208	A18-M1-B67	3	2.49	423.1	461	A21-M1-B78	3	2.2	343.1
209	A20-M1-B67	3	2.7	455.1	462	A22-M1-B78	3	2.95	523.1
210	A21-M1-B67	3	2.07	343.1	463	A23-M1-B78	3	2.69	421.1
211	A22-M1-B67	3	2.93	523.1	464	A24-M1-B78	3	2.57	441.1
212	A23-M1-B67	3	2.66	421.1	465	A25-M1-B78	3	2.77	473.2
213	A24-M1-B67	3	2.53	441.1	466	A26-M1-B78	3	2.32	357.2
214	A25-M1-B67	3	2.74	473.1	467	A05-M1-B79	3	2.76	485.1
215	A26-M1-B67	3	2.22	357.1	468	A06-M1-B79	3	2.28	339.1
216	A27-M2-B67	3	2.54	431.2	469	A08-M1-B79	3	2.76	473.1
217	A01-M1-B68	3	1.79	273.1	470	A12-M1-B79	3	2.4	365.2
218	A02-M1-B68	3	2.1	325.2	471	A14-M1-B79	3	2.27	351.1
219	A03-M1-B68	3	2.48	393.1	472	A17-M1-B79	3	2.2	408.2
220	A04-M1-B68	3	2.11	343.1	473	A04-M1-B79	3	2.53	407.1
221	A04-M2-B68	3	2.15	343.1	474	A20-M1-B79	3	2.69	457.1
222	A05-M1-B68	3	2.4	421.1	475	A22-M1-B79	3	2.91	525.1
223	A06-M1-B68	3	1.87	275.1	476	A23-M1-B79	3	2.65	423.1
224	A11-M1-B68	3	2.22	391.2	477	A24-M1-B79	3	2.53	443.1

10

20

30

40

225	A13-M1-B68	3	2.51	455.2	478	A25-M1-B79	3	2.73	475.1
226	A14-M1-B68	3	2.04	287.1	479	A26-M1-B79	3	2.24	359.1
227	A15-M1-B68	3	2.35	370.1	480	A05-M1-B80	3	2.75	499
228	A16-M1-B68	3	2.2	350.2	481	A06-M1-B80	3	2.29	353.1
229	A17-M1-B68	3	1.97	344.2	482	A08-M1-B80	3	2.75	487.1
230	A18-M2-B68	3	2.35	361.1	483	A11-M1-B80	3	2.57	469.1
231	A18-M1-B68	3	2.31	361.1	484	A14-M1-B80	3	2.27	365.1
232	A20-M1-B68	3	2.53	393.1	485	A17-M1-B80	3	2.2	422.1
233	A21-M1-B68	3	1.83	281.1	486	A04-M1-B80	3	2.52	421.1
234	A22-M1-B68	3	2.78	461.1	487	A20-M1-B80	3	2.69	471.1
235	A23-M1-B68	3	2.48	359.1	488	A22-M1-B80	3	2.91	539.1
236	A24-M1-B68	3	2.37	379.1	489	A23-M1-B80	3	2.65	437.1
237	A26-M1-B68	3	1.99	295.1	490	A24-M1-B80	3	2.53	457.1
238	A01-M1-B69	3	2.24	335.1	491	A25-M1-B80	3	2.73	489.1
239	A01-M2-B69	3	2.26	335.1	492	A26-M1-B80	3	2.25	373.1
240	A02-M1-B69	3	2.52	387.2	493	A02-M1-B81	3	2.59	417.1
241	A03-M1-B69	3	2.81	455.1	494	A05-M1-B81	3	2.83	513
242	A04-M1-B69	3	2.52	405.2	495	A06-M1-B81	3	2.39	367.1
243	A05-M1-B69	3	2.73	483.1	496	A08-M1-B81	3	2.83	501.1
244	A05-M2-B69	3	2.15	483.1	497	A11-M1-B81	3	2.64	483.1
245	A06-M1-B69	3	2.33	337.2	498	A12-M1-B81	3	2.47	393.1
246	A06-M2-B69	3	2.38	337.2	499	A14-M1-B81	3	2.33	379.1
247	A08-M2-B69	3	2.71	471.2	500	A04-M1-B81	3	2.61	435.1
248	A09-M1-B69	3	2.53	447.2	501	A20-M1-B81	3	2.77	485.1
249	A09-M2-B69	3	2.54	447.2	502	A22-M1-B81	3	2.99	553.1
250	A11-M1-B69	3	2.58	453.2	503	A23-M1-B81	3	2.73	451.1
251	A12-M1-B69	3	2.47	363.2	504	A24-M1-B81	3	2.6	471.1
252	A12-M2-B69	3	2.48	363.2	505	A25-M1-B81	3	2.8	503.1
253	A13-M2-B69	3	2.76	517.2	506	A26-M1-B81	3	2.33	387.1

10

20

【実施例13】

【0356】

3-メチル-N-{5-[(3-メチルベンジル) オキシ] - 1H-インダゾール-3-イル}ベンゼンスルホンアミド

Novabiochemトリチル樹脂(公表置換1.27mmol/g、0.64mmol)500mgをジクロロメタンに懸濁し、2-[5-(tert-ブチル-ジメチル-シラニルオキシ)-1H-インダゾール-3-イル]-イソインドール-1,3-ジオン374mg(0.9mmol)及び2-tert-ブチルイミノ-2-ジエチルアミノ-1,3-ジメチルペルヒドロ-1,3,2-ジアザホスホリン367 μ l(1.3mmol)を加えた。その懸濁液を16時間攪拌し、次に樹脂をろ過して、ジクロロメタン、メタノール、ジメチルホルムアミド、再びメタノール及びジクロロメタンで洗った。その後樹脂を真空下で乾燥した。

30

40

【0357】

樹脂の同一性及び充填段階の収率を充填生成物の開裂によって確認した;樹脂40mgをジクロロメタン1mlに懸濁し、トリフルオロ酢酸150 μ lを加えた。2時間後、樹脂を排出し、ジクロロメタン1mlで2回洗った;収集した溶液を乾燥し、表題化合物13.8mgを回収した。算定充填量0.85mmol/g、HPLC r.t.方法1:7.64[M+H]⁺=394。

【0358】

第一段階で得た樹脂(500mg、~0.42mmol)を無水テトラヒドロフラン3mlに懸濁し、テトラヒドロフラン中のフッ化テトラブチルアンモニウムの1M溶液630 μ l(~1.5当量)を加えた。その懸濁液を一晩攪拌し、樹脂をろ過して、ジクロロ

50

メタン、メタノール、ジメチルホルムアミド、メタノール及びジクロロメタンで洗った。

【0359】

樹脂の同一性を開裂によって確認した。その反応は上述したように実施した。

【0360】

2 - [6 - ヒドロキシ - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - イソインドール - 1 , 3 - ジオン : HPLC r . t . 方法 1 : 3 . 9 [M + H] + = 280 .

【0361】

第二段階で得た樹脂の試料 (100 mg 、 ~ 0 . 08 mmol) を 1 - メチル - 2 - ピロリジノン 3 ml に懸濁し、次に 2 - tert - ブチルイミノ - 2 - ジエチルアミノ - 1 , 3 - ジメチルペルヒドロ - 1 , 3 , 2 - ジアザホスホリン 43 μ l (~ 1 . 5 当量) 及び 3 - メチルベンジルブロミド 65 μ l (~ 6 当量) を加えた。その懸濁液を 16 時間攪拌した。樹脂をろ過して、ジクロロメタン、メタノール、ジメチルホルムアミド、メタノール及びジクロロメタンで洗った。

10

【0362】

第三段階で得た樹脂 (100 mg 、 ~ 0 . 08 mmol) をジクロロメタンとメタノール 1 : 1 の混合物 5 ml に懸濁し、ヒドラジン - 水和水物 100 μ l を加えた。その懸濁液を 45 に加熱した。加熱と攪拌を一晩続け、その後混合物を室温に冷却した。樹脂をろ過し、メタノールと水 1 : 1 の混合物、メタノール、ジメチルホルムアミド、及び再びメタノールで洗った後、真空下で乾燥した。

【0363】

20

第四段階で得た樹脂 (100 mg 、 ~ 0 . 08 mmol) をジクロロメタン 2 . 5 ml に懸濁し、m - トルエンスルホンクロリド 90 mg (~ 6 当量) 、 N , N ' - ジイソプロピルエチルアミン 200 μ l (~ 15 当量) 及び触媒量の 4 - ジメチルアミノピリジンを加えた。その懸濁液を一晩攪拌した。樹脂をろ過し、メタノールと水 1 : 1 の混合物、メタノール、ジメチルホルムアミド、メタノール及びジクロロメタンで洗った後、真空下で乾燥した。

【0364】

第五段階で得た樹脂を無水テトラヒドロフラン 3 ml に懸濁し、テトラヒドロフラン中のフッ化テトラブチルアンモニウムの 1 M 溶液 120 μ l (~ 1 . 5 当量) を加えた。その懸濁液を一晩攪拌し、その後樹脂をろ過して、ジクロロメタン、メタノール、ジメチルホルムアミド、メタノール及びジクロロメタンで洗った。

30

【0365】

乾燥樹脂 100 mg をジクロロメタン 3 ml に懸濁し、トリフルオロ酢酸 450 μ l を加えた。2 時間後、樹脂を排出し、ジクロロメタン 3 ml で 2 回洗った ; 収集した溶液を乾燥し、表題化合物を回収した。

【0366】

3 - メチル - N - { 5 - [(3 - メチルベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - ベンゼンスルホンアミド HPLC 方法 2 r . t . : 8 . 79 [M + H] + = 408 . 1 .

【0367】

40

同様に (実施例 13) 操作することにより、下記の表 X I I I の化合物を製造した。

【0368】

【表 1 4】

表 X I I I

登録番号	化合物	HPLCの方法	r. t. (保持時間) (分)	[M+H] ⁺	登録番号	化合物	HPLCの方法	r. t. (保持時間) (分)	[M+H] ⁺
1	A30-M2-B59	1	4.29	427.1	167	A21-M1-B46	3	1.97	315.1
2	A30-M2-B61	2	8.2	450.1	168	A22-M1-B46	3	2.83	495.1
3	A30-M2-B58	1	4.58	449.2	169	A23-M1-B46	3	2.57	393.1
4	A30-M2-B57	1	4.19	429.1	170	A24-M1-B46	3	2.45	413.1
5	A31-M2-B61	2	7.32	414.1	171	A25-M1-B46	3	2.65	445.1
6	A31-M2-B58	1	4.21	413.2	172	A26-M1-B46	3	2.13	329.1
7	A30-M1-B59	1	4.2	427.1	173	A27-M2-B46	3	2.44	403.2
8	A30-M1-B61	2	7.86	450.1	174	A01-M1-B47	3	2.11	375.0
9	A30-M1-B58	1	4.51	449.2	175	A02-M2-B47	3	2.47	427.1
10	A30-M1-B57	1	4.16	429.1	176	A09-M1-B47	3	2.43	487.1
11	A01-M1-B40	3	2.14	369.1	177	A09-M2-B47	3	2.46	487.1
12	A02-M1-B40	3	2.48	421.1	178	A10-M1-B47	3	2.53	481.0
13	A03-M1-B40	3	2.73	489.1	179	A11-M1-B47	3	2.47	493.1
14	A04-M1-B40	3	2.42	439.1	180	A11-M2-B47	3	2.51	493.1
15	A05-M1-B40	3	2.62	517.0	181	A12-M1-B47	3	2.38	403.1
16	A06-M1-B40	3	2.27	371.1	182	A13-M1-B47	3	2.73	557.1
17	A07-M1-B40	3	2.5	457.1	183	A14-M1-B47	3	2.44	389.1
18	A08-M1-B40	3	2.61	505.1	184	A15-M1-B47	3	2.64	472.1
19	A09-M1-B40	3	2.54	481.2	185	A16-M1-B47	3	2.53	452.1
20	A09-M2-B40	3	2.53	481.2	186	A17-M1-B47	3	2.35	446.1
21	A10-M1-B40	3	2.63	475.1	187	A18-M2-B47	3	2.71	463.1
22	A10-M2-B40	3	2.61	475.1	188	A18-M1-B47	3	2.63	463.1
23	A11-M1-B40	3	2.58	487.1	189	A20-M1-B47	3	2.82	495.1
24	A11-M2-B40	3	2.57	487.1	190	A21-M1-B47	3	2.27	383.1
25	A12-M1-B40	3	2.5	397.1	191	A23-M1-B47	3	2.79	461.0
26	A13-M1-B40	3	2.75	551.2	192	A24-M1-B47	3	2.67	481.0
27	A01-M1-B41	3	1.88	333.0	193	A25-M1-B47	3	2.88	513.1
28	A02-M1-B41	3	2.13	385.1	194	A26-M1-B47	3	2.4	397.1
29	A04-M1-B41	3	2.14	403.0	195	A02-M2-B48	3	2.29	409.1
30	A05-M1-B41	3	2.43	481.0	196	A05-M1-B48	3	2.46	505.0
31	A06-M1-B41	3	2	335.0	197	A05-M2-B48	3	2.48	505.0
32	A07-M1-B41	3	2.23	421.0	198	A06-M1-B48	3	2	359.1
33	A08-M1-B41	3	2.35	469.0	199	A08-M1-B48	3	2.48	493.1
34	A09-M1-B41	3	2.29	445.1	200	A10-M1-B48	3	2.34	463.1
35	A10-M1-B41	3	2.37	439.0	201	A11-M1-B48	3	2.3	475.1
36	A10-M2-B41	3	2.35	439.0	202	A11-M2-B48	3	2.33	475.1
37	A11-M1-B41	3	2.33	451.0	203	A12-M1-B48	3	2.18	385.1
38	A12-M2-B41	3	2.18	361.1	204	A13-M2-B48	3	2.51	539.1
39	A14-M1-B41	3	2.13	347.0	205	A13-M1-B48	3	2.55	539.1
40	A15-M1-B41	3	2.37	430.0	206	A14-M1-B48	3	2.21	371.1
41	A16-M1-B41	3	2.25	410.1	207	A15-M1-B48	3	2.45	454.1
42	A17-M1-B41	3	2.03	404.1	208	A16-M1-B48	3	2.32	434.1
43	A18-M1-B41	3	2.35	421.0	209	A17-M1-B48	3	2.12	428.1
44	A21-M1-B41	3	1.91	341.0	210	A18-M2-B48	3	2.5	445.1
45	A23-M1-B41	3	2.51	419.0	211	A18-M1-B48	3	2.41	445.1
46	A24-M1-B41	3	2.39	439.0	212	A21-M1-B48	3	2.01	365.1
47	A25-M1-B41	3	2.59	471.0	213	A22-M1-B48	3	2.83	545.1

10

20

30

40

48	A26-M1-B41	3	2.07	355.0	214	A23-M1-B48	3	2.57	443.1
49	A01-M1-B42	3	2.15	395.1	215	A24-M1-B48	3	2.46	463.1
50	A02-M1-B42	3	2.36	447.1	216	A25-M1-B48	3	2.67	495.1
51	A03-M1-B42	3	2.69	515.0	217	A26-M1-B48	3	2.17	379.1
52	A04-M1-B42	3	2.35	465.1	218	A27-M2-B48	3	2.47	453.1
53	A05-M1-B42	3	2.55	543.0	219	A09-M1-B49	3	2.58	507.0
54	A06-M1-B42	3	2.19	397.1	220	A02-M1-B50	3	2.5	393.1
55	A07-M1-B42	3	2.49	483.1	221	A05-M1-B50	3	2.73	489.0
56	A08-M1-B42	3	2.6	531.1	222	A06-M1-B50	3	2.27	343.1
57	A09-M1-B42	3	2.49	507.1	223	A08-M1-B50	3	2.74	477.1
58	A10-M1-B42	3	2.57	501.1	224	A10-M1-B50	3	2.6	447.1
59	A11-M1-B42	3	2.51	513.1	225	A11-M1-B50	3	2.55	459.1
60	A11-M2-B42	3	2.51	513.1	226	A12-M1-B50	3	2.4	369.1
61	A12-M1-B42	3	2.43	423.1	227	A14-M1-B50	3	2.25	355.1
62	A12-M2-B42	3	2.41	423.1	228	A15-M1-B50	3	2.5	438.1
63	A01-M1-B43	3	2.16	369.1	229	A16-M1-B50	3	2.38	418.1
64	A02-M1-B43	3	2.45	421.1	230	A18-M1-B50	3	2.47	429.1
65	A03-M1-B43	3	2.75	489.1	231	A04-M1-B50	3	2.49	411.1
66	A04-M1-B43	3	2.44	439.1	232	A20-M1-B50	3	2.67	461.1
67	A05-M1-B43	3	2.68	517.0	233	A21-M1-B50	3	2.11	349.1
68	A06-M1-B43	3	2.34	371.1	234	A22-M1-B50	3	2.88	529.1
69	A07-M1-B43	3	2.51	457.1	235	A23-M1-B50	3	2.62	427.1
70	A08-M1-B43	3	2.62	505.1	236	A24-M1-B50	3	2.51	447.1
71	A09-M1-B43	3	2.56	481.2	237	A25-M1-B50	3	2.71	479.1
72	A09-M2-B43	3	2.55	481.2	238	A26-M1-B50	3	2.21	363.1
73	A10-M1-B43	3	2.64	475.1	239	A02-M1-B51	3	2.42	398.1
74	A10-M2-B43	3	2.63	475.1	240	A05-M1-B51	3	2.67	494.0
75	A11-M1-B43	3	2.59	487.1	241	A06-M1-B51	3	2.18	348.1
76	A11-M2-B43	3	2.58	487.1	242	A08-M1-B51	3	2.68	482.1
77	A14-M1-B43	3	2.51	383.1	243	A10-M1-B51	3	2.53	452.1
78	A15-M1-B43	3	2.7	466.1	244	A11-M1-B51	3	2.49	464.1
79	A16-M1-B43	3	2.59	446.1	245	A12-M1-B51	3	2.32	374.1
80	A17-M1-B43	3	2.42	440.2	246	A14-M1-B51	3	2.17	360.1
81	A18-M2-B43	3	2.76	457.1	247	A15-M1-B51	3	2.42	443.1
82	A18-M1-B43	3	2.68	457.1	248	A16-M1-B51	3	2.3	423.1
83	A20-M1-B43	3	2.87	489.1	249	A17-M1-B51	3	2.11	417.1
84	A21-M1-B43	3	2.35	377.1	250	A18-M1-B51	3	2.4	434.1
85	A23-M1-B43	3	2.83	455.1	251	A04-M1-B51	3	2.43	416.1
86	A24-M1-B43	3	2.72	475.1	252	A20-M1-B51	3	2.6	466.1
87	A25-M1-B43	3	2.9	507.1	253	A21-M1-B51	3	2.01	354.1
88	A26-M1-B43	3	2.47	391.1	254	A22-M1-B51	3	2.82	534.1
89	A27-M2-B43	3	2.73	465.2	255	A23-M1-B51	3	2.55	432.1
90	A01-M1-B44	3	2.19	411.1	256	A24-M1-B51	3	2.43	452.1
91	A03-M1-B44	3	2.65	531.0	257	A25-M1-B51	3	2.64	484.1
92	A04-M1-B44	3	2.39	481.1	258	A26-M1-B51	3	2.13	368.1
93	A05-M1-B44	3	2.57	559.0	259	A02-M1-B52	3	2.77	441.1
94	A06-M1-B44	3	2.24	413.1	260	A05-M1-B52	3	3.01	537.0
95	A07-M1-B44	3	2.52	499.1	261	A06-M1-B52	3	2.59	391.1
96	A09-M1-B44	3	2.53	523.1	262	A08-M1-B52	3	2.99	525.1
97	A10-M1-B44	3	2.57	517.1	263	A10-M1-B52	3	2.86	495.1
98	A11-M1-B44	3	2.55	529.1	264	A11-M1-B52	3	2.79	507.1

10

20

30

40

99	A11-M2-B44	3	2.53	529.1	265	A12-M1-B52	3	2.69	417.1
100	A12-M1-B44	3	2.47	439.1	266	A14-M1-B52	3	2.56	403.1
101	A12-M2-B44	3	2.45	439.1	267	A16-M1-B52	3	2.65	466.1
102	A14-M1-B44	3	2.47	425.1	268	A17-M1-B52	3	2.47	460.1
103	A15-M1-B44	3	2.65	508.1	269	A04-M1-B52	3	2.77	459.1
104	A16-M1-B44	3	2.55	488.1	270	A20-M1-B52	3	2.93	509.1
105	A17-M1-B44	3	2.39	482.1	271	A21-M1-B52	3	2.4	397.1
106	A18-M2-B44	3	2.71	499.1	272	A22-M1-B52	3	3.13	577.1
107	A18-M1-B44	3	2.63	499.1	273	A23-M1-B52	3	2.89	475.1
108	A20-M1-B44	3	2.81	531.1	274	A24-M1-B52	3	2.77	495.1
109	A21-M1-B44	3	2.31	419.1	275	A25-M1-B52	3	2.97	527.1
110	A23-M1-B44	3	2.78	497.0	276	A26-M1-B52	3	2.52	411.1
111	A24-M1-B44	3	2.67	517.1	277	A02-M1-B53	3	2.9	403.2
112	A25-M1-B44	3	2.85	549.1	278	A05-M1-B53	3	3.15	499.1
113	A26-M1-B44	3	2.43	433.4	279	A06-M1-B53	3	2.69	353.2
114	A27-M2-B44	3	2.69	507.1	280	A08-M1-B53	3	3.11	487.2
115	A02-M1-B45	3	2.3	415.1	281	A10-M1-B53	3	2.99	457.2
116	A03-M1-B45	3	2.59	483.0	282	A11-M1-B53	3	2.93	469.2
117	A05-M1-B45	3	2.49	511.0	283	A12-M1-B53	3	2.81	379.2
118	A06-M1-B45	3	2.04	365.1	284	A14-M1-B53	3	2.66	365.2
119	A07-M1-B45	3	2.37	451.1	285	A16-M1-B53	3	2.75	428.2
120	A09-M1-B45	3	2.37	475.1	286	A17-M1-B53	3	2.58	422.2
121	A10-M1-B45	3	2.45	469.1	287	A18-M1-B53	3	2.87	439.2
122	A10-M2-B45	3	2.43	469.1	288	A04-M1-B53	3	2.91	421.2
123	A11-M1-B45	3	2.4	481.1	289	A20-M1-B53	3	3.07	471.2
124	A11-M2-B45	3	2.39	481.1	290	A21-M1-B53	3	2.49	359.2
125	A12-M2-B45	3	2.28	391.1	291	A22-M1-B53	3	3.27	539.2
126	A13-M2-B45	3	2.56	545.1	292	A23-M1-B53	3	3.05	437.2
127	A13-M1-B45	3	2.57	545.1	293	A24-M1-B53	3	2.9	457.2
128	A14-M1-B45	3	2.25	377.1	294	A25-M1-B53	3	3.09	489.2
129	A15-M1-B45	3	2.47	460.1	295	A26-M1-B53	3	2.62	373.2
130	A16-M1-B45	3	2.35	440.1	296	A02-M1-B54	3	2.33	439.1
131	A17-M1-B45	3	2.15	434.1	297	A06-M1-B54	3	2.09	389.1
132	A18-M2-B45	3	2.52	451.1	298	A08-M1-B54	3	2.61	523.1
133	A18-M1-B45	3	2.45	451.1	299	A10-M1-B54	3	2.45	493.1
134	A20-M1-B45	3	2.64	483.1	300	A11-M1-B54	3	2.41	505.1
135	A21-M1-B45	3	2.05	371.1	301	A12-M1-B54	3	2.24	415.1
136	A23-M1-B45	3	2.6	449.0	302	A14-M1-B54	3	2.09	401.1
137	A24-M1-B45	3	2.49	469.1	303	A17-M1-B54	3	2.05	458.1
138	A25-M1-B45	3	2.68	501.1	304	A18-M1-B54	3	2.32	475.1
139	A26-M1-B45	3	2.21	385.1	305	A04-M1-B54	3	2.33	457.1
140	A27-M2-B45	3	2.49	459.1	306	A20-M1-B54	3	2.51	507.1
141	A01-M1-B46	3	1.87	307.1	307	A22-M1-B54	3	2.74	575.1
142	A02-M1-B46	3	2.25	359.1	308	A23-M1-B54	3	2.45	473.1
143	A02-M2-B46	3	2.26	359.1	309	A24-M1-B54	3	2.36	493.1
144	A03-M1-B46	3	2.49	427.1	310	A25-M1-B54	3	2.56	525.1
145	A03-M2-B46	3	2.52	427.1	311	A26-M1-B54	3	2.04	409.1
146	A04-M1-B46	3	2.2	377.1	312	A02-M1-B55	3	2.59	429.1
147	A05-M1-B46	3	2.41	455.0	313	A06-M1-B55	3	2.39	379.1
148	A05-M2-B46	3	2.46	455.0	314	A08-M1-B55	3	2.83	513.1
149	A06-M1-B46	3	1.99	309.1	315	A10-M1-B55	3	2.69	483.1

10

20

30

40

150	A07-M1-B46	3	2.28	395.1	316	A11-M1-B55	3	2.64	495.1
151	A08-M1-B46	3	2.41	443.1	317	A12-M1-B55	3	2.51	405.1
152	A08-M2-B46	3	2.46	443.1	318	A14-M1-B55	3	2.39	391.1
153	A09-M1-B46	3	2.25	419.2	319	A04-M1-B55	3	2.59	447.1
154	A09-M2-B46	3	2.26	419.2	320	A20-M1-B55	3	2.75	497.1
155	A10-M1-B46	3	2.34	413.1	321	A21-M1-B55	3	2.23	385.1
156	A11-M1-B46	3	2.3	425.1	322	A22-M1-B55	3	2.96	565.1
157	A11-M2-B46	3	2.32	425.1	323	A23-M1-B55	3	2.71	463.1
158	A12-M1-B46	3	2.17	335.1	324	A24-M1-B55	3	2.6	483.1
159	A13-M2-B46	3	2.49	489.1	325	A25-M1-B55	3	2.79	515.1
160	A13-M1-B46	3	2.55	489.1	326	A26-M1-B55	3	2.35	399.1
161	A14-M1-B46	3	2.17	321.1	327	A20-M1-B56	3	2.61	498.1
162	A15-M1-B46	3	2.42	404.1	328	A23-M1-B56	3	2.57	464.1
163	A16-M1-B46	3	2.3	384.1	329	A24-M1-B56	3	2.46	484.1
164	A17-M1-B46	3	2.09	378.1	330	A25-M1-B56	3	2.66	516.1
165	A18-M2-B46	3	2.47	395.1	331	A26-M1-B56	3	2.15	400.1
166	A18-M1-B46	3	2.4	395.1					

10

【実施例14】

【0369】

4 - イソプロピル - N - { 6 - [(3 - メチルベンジル) オキシ] - 1 H - インダゾール - 3 - イル } ベンゼンスルホンアミド

20

Novabiochemトリチル樹脂 (公表置換 1.27 mmol/g、0.64 mmol) 500 mg をジクロロメタンに懸濁し、2 - [6 - (tert - ブチル - ジメチル - シラニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - イソインドール - 1, 3 - ジオン 374 mg (0.9 mmol) 及び 2 - tert - ブチルイミノ - 2 - ジエチルアミノ - 1, 3 - ジメチルペルヒドロ - 1, 3, 2 - ジアザホスホリン 367 μl (1.3 mmol) を加えた。その懸濁液を 16 時間攪拌し、次に樹脂をろ過して、ジクロロメタン、メタノール、ジメチルホルムアミド、再びメタノール及びジクロロメタンで洗った。その後樹脂を真空下で乾燥した。

【0370】

30

樹脂の同一性及び充填段階の収率を充填生成物の開裂によって確認した；樹脂 40 mg をジクロロメタン 1 ml に懸濁し、トリフルオロ酢酸 150 μl を加えた。2 時間後、樹脂を排出し、ジクロロメタン 1 ml で 2 回洗った；収集した溶液を乾燥し、表題化合物 13.8 mg を回収した。算定充填量 0.85 mmol/g、HPLC r.t. 方法 1 : 7.64 [M + H] + = 394。

【0371】

第一段階で得た樹脂 (500 mg、~ 0.42 mmol) を無水テトラヒドロフラン 3 ml に懸濁し、テトラヒドロフラン中のフッ化テトラブチルアンモニウムの 1 M 溶液 630 μl (~ 1.5 当量) を加えた。その懸濁液を一晩攪拌し、樹脂をろ過して、ジクロロメタン、メタノール、ジメチルホルムアミド、メタノール及びジクロロメタンで洗った後、真空下で乾燥した。

40

【0372】

樹脂の同一性を開裂によって確認した。その反応は上述したように実施した。

【0373】

2 - [6 - ヒドロキシ - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - イソインドール - 1, 3 - ジオン : HPLC r.t. 方法 1 3.9 [M + H] + = 280。

【0374】

第二段階で得た樹脂の試料 (100 mg、~ 0.08 mmol) を無水テトラヒドロフラン 1.5 ml に懸濁した。丸底フラスコ中で、トリフェニルホスフィン 209 mg (0.8 mmol、~ 10 当量) を無水テトラヒドロフラン 2 ml に溶解し、次に 0 でジイ

50

ソプロピルアゾジカルボキシレート 157 μ l (0.8 mmol、~10 当量) 及び 3-メチルベンジルアルコール (1.2 mmol、~15 当量) を静かに加えた。その溶液を 2 時間振とうし、次にそれを樹脂の懸濁液中に移した。

【0375】

その懸濁液を一晩攪拌し、その後樹脂をろ過して、ジクロロメタン、メタノール、ジメチルホルムアミド、メタノール及びジクロロメタンで洗った。この手順を 2 回反復する。

【0376】

第三段階で得た樹脂 (100 mg、~0.08 mmol) をジクロロメタンとメタノール 1:1 の混合物 5 ml に懸濁し、ヒドラジン-水和物 100 μ l を加えた。その懸濁液を 45 に加熱した。加熱と攪拌を一晩続け、その後混合物を室温に冷却した。樹脂をろ過し、メタノールと水 1:1 の混合物、メタノール、ジメチルホルムアミド、及び再びメタノールで洗った後、真空下で乾燥した。

【0377】

第四段階で得た樹脂 (100 mg、~0.08 mmol) をジクロロメタン 2.5 ml に懸濁し、4-tert-ブチルベンゼンスルホニルクロリド 111 mg (~6 当量)、N,N'-ジイソプロピルエチルアミン 200 μ l (~15 当量) 及び触媒量の 4-ジメチルアミノピリジンを加えた。その懸濁液を一晩攪拌した。樹脂をろ過し、メタノールと水 1:1 の混合物、メタノール、ジメチルホルムアミド、メタノール及びジクロロメタンで洗った後、真空下で乾燥した。

【0378】

第五段階で得た樹脂を無水テトラヒドロフラン 3 ml に懸濁し、テトラヒドロフラン中のフッ化テトラブチルアンモニウムの 1 M 溶液 120 μ l (~1.5 当量) を加えた。その懸濁液を一晩攪拌し、その後樹脂をろ過して、ジクロロメタン、メタノール、ジメチルホルムアミド、メタノール及びジクロロメタンで洗った。

【0379】

乾燥樹脂 100 mg をジクロロメタン 3 ml に懸濁し、トリフルオロ酢酸 450 μ l を加えた。2 時間後、樹脂を排出し、ジクロロメタン 3 ml で 2 回洗った；収集した溶液を乾燥し、表題化合物を回収した。

【0380】

4-イソプロピル-N-{6-[(3-メチルベンジル) オキシ] -1H-インダゾール-3-イル}ベンゼンスルホンアミド HPLC 方法 3 r.t.: 2.69、[M+H]⁺ = 436.2。

【0381】

同様に (実施例 14) 操作することにより、下記の表 X I V の化合物を製造した。

【0382】

【表 15】

表 X I V

登録番号	化合物	HPLCの方法	r. t. (保持時間) (分)	[M+H] ⁺	登録番号	化合物	HPLCの方法	r. t. (保持時間) (分)	[M+H] ⁺
1	A50-M2-B41	3	2.45	364.1	43	A56-M2-B46	3	2.5	338.1
2	A51-M1-B41	3	2.36	416.1	44	A57-M2-B46	3	2.69	352.2
3	A52-M1-B41	3	1.84	310	45	A58-M2-B46	3	2.71	364.2
4	A53-M1-B41	3	2.19	370.1	46	A59-M2-B46	3	2.48	380.1
5	A57-M2-B41	3	2.65	378.1	47	A60-M2-B46	3	2.97	382.2
6	A60-M2-B41	3	2.93	408.1	48	A61-M2-B46	3	1.36	381.2

10

20

30

40

7	A50-M2-B43	3	2.82	400.2		49	A62-M2-B46	3	2.51	326.1
8	A50-M1-B43	3	2.76	400.2		50	A30-M1-B47	3	2.64	442.1
9	A51-M1-B43	3	2.69	452.2		51	A30-M2-B47	3	2.67	442.1
10	A52-M1-B43	3	2.32	346.1		52	A50-M1-B47	3	2.71	406.1
11	A53-M1-B43	3	2.55	406.2		53	A50-M2-B47	3	2.76	406.1
12	A55-M2-B43	3	1.69	417.2		54	A51-M1-B47	3	2.64	458.1
13	A56-M2-B43	3	2.83	400.2		55	A52-M1-B47	3	2.25	352
14	A57-M2-B43	3	3	414.2		56	A53-M1-B47	3	2.49	412.1
15	A58-M2-B43	3	3.01	426.2		57	A55-M2-B47	3	1.63	423.1
16	A59-M2-B43	3	2.77	442.1		58	A56-M2-B47	3	2.77	406.1
17	A60-M2-B43	3	2.95	444.2		59	A57-M2-B47	3	2.94	420.1
18	A61-M2-B43	3	1.71	443.2		60	A58-M2-B47	3	2.95	432.1
19	A50-M1-B44	3	2.71	442.1		61	A59-M2-B47	3	2.72	448
20	A50-M2-B44	3	2.76	442.1		62	A60-M2-B47	3	3.19	450.2
21	A51-M1-B44	3	2.65	494.1		63	A61-M2-B47	3	1.65	449.1
22	A52-M1-B44	3	2.29	388.1		64	A62-M2-B47	3	2.77	394.1
23	A53-M1-B44	3	2.51	448.1		65	A50-M2-B48	3	2.53	388.1
24	A55-M2-B44	3	1.67	459.1		66	A51-M1-B48	3	2.43	440.1
25	A56-M2-B44	3	2.76	442.1		67	A52-M1-B48	3	1.96	334.1
26	A59-M2-B44	3	2.73	484.1		68	A53-M1-B48	3	2.27	394.1
27	A60-M2-B44	3	3.17	486.2		69	A55-M2-B48	3	1.41	405.2
28	A50-M2-B45	3	2.55	394.1		70	A56-M2-B48	3	2.54	388.1
29	A51-M1-B45	3	2.45	446.1		71	A60-M2-B48	3	2.99	432.2
30	A52-M1-B45	3	2	340		72	A51-M1-B50	3	2.49	424.1
31	A53-M1-B45	3	2.31	400.1		73	A53-M1-B50	3	2.31	378.1
32	A55-M2-B45	3	1.42	411.1		74	A51-M1-B51	3	2.41	429.1
33	A56-M2-B45	3	2.56	394.1		75	A52-M1-B51	3	1.97	323.1
34	A59-M2-B45	3	2.53	436.1		76	A53-M1-B51	3	2.23	383.1
35	A60-M2-B45	3	3	438.2		77	A52-M1-B52	3	2.4	366.1
36	A62-M2-B45	3	2.57	382.1		78	A53-M1-B52	3	2.61	426.1
37	A50-M1-B46	3	2.44	338.1		79	A51-M1-B53	3	2.87	434.2
38	A50-M2-B46	3	2.49	338.1		80	A52-M1-B53	3	2.48	328.2
39	A51-M1-B46	3	2.41	390.1		81	A53-M1-B53	3	2.71	388.2
40	A52-M1-B46	3	1.9	284.1		82	A53-M1-B54	3	2.15	424.1
41	A53-M1-B46	3	2.25	344.1		83	A53-M1-B55	3	2.43	414.1
42	A55-M2-B46	3	1.33	355.2						

【実施例15】

【0383】

3 - フェニル - N - [5 - (2 - ピロリジン - 1 - イルエトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] プロパンアミド

Novabiochemトリチル樹脂(公表置換1.27mmol/g、0.64mmol)500mgをジクロロメタンに懸濁し、2-[6-(tert-ブチル-ジメチル-シラニルオキシ)-1H-インダゾール-3-イル]-イソインドール-1,3-ジオン374mg(0.9mmol)及び2-tert-ブチルイミノ-2-ジエチルアミノ-1,3-ジメチルペルヒドロ-1,3,2-ジアザホスホリン367μl(1.3mmol)を加えた。その懸濁液を16時間攪拌し、次に樹脂をろ過して、ジクロロメタン、メタノール、ジメチルホルムアミド、再びメタノール及びジクロロメタンで洗った。その後樹脂を真空下で乾燥した。

【0384】

樹脂の同一性及び充填段階の収率を充填生成物の開裂によって確認した；樹脂40mgをジクロロメタン1mlに懸濁し、トリフルオロ酢酸150μlを加えた。2時間後、樹脂を排出し、ジクロロメタン1mlで2回洗った；収集した溶液を乾燥し、表題化合物1

10

20

30

40

50

3.8 mg を回収した。算定充填量 0.85 mmol / g、HPLC r.t. 方法 1 : 7.64 [M + H]⁺ = 394。

【0385】

第一段階で得た樹脂 (500 mg、~0.425 mmol) をジクロロメタンとメタノール 1 : 1 の混合物 5 ml に懸濁し、ヒドラジーン水和物 500 μl を加えた。その懸濁液を 45 に加熱した。加熱と攪拌を一晩続け、その後混合物を室温に冷却した。樹脂をろ過し、メタノールと水 1 : 1 の混合物、メタノール、ジメチルホルムアミド、及び再びメタノールで洗った後、真空下で乾燥した。

【0386】

樹脂の同一性を開裂によって確認した。その反応は上述したように実施した。

10

【0387】

6 - { [tert - ブチル (ジメチル) シリル] オキシ } - 1H - インダゾール - 3 - アミン HPLC r.t. 方法 1 : 5.99 [M + H]⁺ = 264 ; [M - H]⁻ = 262。

【0388】

第二段階で得た樹脂の試料 (100 mg、0.08 mmol) をジクロロメタン 2.5 ml に懸濁した ; N, N' - ジイソプロピルエチルアミン (131 μl、~10 当量) 及びヒドロシナモイルクロリド (35 μl、0.24 mmol、~3 当量) を加えた。室温での攪拌を 20 時間維持し、その後樹脂をろ過して、ジクロロメタン、メタノール、ジメチルホルムアミド、メタノール及びジクロロメタンで洗った後、真空下で乾燥した。

20

【0389】

第三段階で得た樹脂 (100 mg、~0.08 mmol) を無水テトラヒドロフラン 3 ml に懸濁し、テトラヒドロフラン中のフッ化テトラブチルアンモニウムの 1 M 溶液 120 μl (~1.5 当量) を加えた。その懸濁液を一晩攪拌し、樹脂をろ過して、ジクロロメタン、メタノール、ジメチルホルムアミド、メタノール及びジクロロメタンで洗った後、真空下で乾燥した。

【0390】

第四段階で得た樹脂 (100 mg、~0.08 mmol) を無水テトラヒドロフラン 1 ml に懸濁した。丸底フラスコ中で、トリフェニルホスフィン 209 mg (0.8 mmol、~10 当量) を無水テトラヒドロフラン 2 ml に溶解し、次に 0 でジイソプロピルアゾジカルボキシレート 157 μl (0.8 mmol、~10 当量) 及び 1 - (2 - ヒドロキシエチル) ピロリジン 147 μl (1.2 mmol、~15 当量) を静かに加えた。その溶液を 2 時間振とうし、次にそれを樹脂の懸濁液中に移した。

30

【0391】

その懸濁液を一晩攪拌し、その後樹脂をろ過して、ジクロロメタン、メタノール、ジメチルホルムアミド、メタノール及びジクロロメタンで洗った。

【0392】

この手順を 2 回反復する。

【0393】

乾燥樹脂 100 mg をジクロロメタン 3 ml に懸濁し、トリフルオロ酢酸 450 μl を加えた。2 時間後、樹脂を排出し、ジクロロメタン 3 ml で 2 回洗った ; 収集した溶液を乾燥し、所望表題化合物を回収した。

40

【0394】

3 - フェニル - N - [5 - (2 - ピロリジン - 1 - イルエトキシ) - 1H - インダゾール - 3 - イル] プロパンアミド HPLC r.t. 方法 1 : 2.99 [M + H]⁺ = 379.2。

【0395】

実施例 15 と同様に操作することにより、2 - (6 - { [tert - ブチル (ジメチル) シリル] オキシ } - 1H - インダゾール - 3 - イル) - 1H - イソインドール - 1, 3 (2H) - ジオン及び 2 - [5 - (tert - ブチル - ジメチル - シラニルオキシ) - 1

50

H - インドゾール - 3 - イル] - イソインドール - 1 , 3 - ジオンを樹脂上に保持し、その後、上述した合成スキームに従うことにより、下記の生成物を合成した。

【0396】

2 - (4 - tert - ブチルフェノキシ) - N - [5 - (2 - ピロリジン - 1 - イルエトキシ) - 1 H - インドゾール - 3 - イル] アセトアミド HPLC 方法2 r . t . 6 . 6 5 [M + H] + = 4 3 7 . 2 .

【0397】

2 - (4 - メトキシフェニル) - N - [5 - (2 - ピロリジン - 1 - イルエトキシ) - 1 H - インドゾール - 3 - イル] アセトアミド HPLC 方法2 r . t . 4 . 5 6 [M + H] + = 3 9 5 . 2 .

【0398】

実施例15と同様に操作することにより、表XVの195の生成物を平行して合成した。

【0399】

【表16】

表XV

登録番号	化合物	HPLCの方法	r. t. (保持時間) (分)	[M+H] ⁺	登録番号	化合物	HPLCの方法	r. t. (保持時間) (分)	[M+H] ⁺
1	A65-M1-B36	2	9.55	458.2	99	A57-M2-B08	3	2.8	380.2
2	A52-M1-B36	1	4.52	296.1	100	A59-M2-B08	3	2.62	408.1
3	A65-M1-B31	2	8.97	394.2	101	A60-M2-B08	3	3.1	410.2
4	A64-M1-B31	1	1.6	315.2	102	A61-M2-B08	3	1.57	409.2
5	A66-M1-B31	1	6.06	302.2	103	A50-M2-B09	3	2.96	378.2
6	A67-M1-B31	1	3.86	343.1	104	A51-M1-B09	3	2.81	430.2
7	A68-M1-B31	2	6.63	270.1	105	A52-M1-B09	3	2.43	324.2
8	A69-M1-B31	1	1.9	329.2	106	A53-M1-B09	3	2.66	384.2
9	A65-M1-B15	2	10.3	516.3	107	A55-M2-B09	3	1.83	395.2
10	A66-M1-B15	2	10.4	424.3	108	A59-M2-B09	3	2.95	420.2
11	A67-M1-B15	1	6.27	465.2	109	A60-M2-B09	3	3.4	422.3
12	A68-M1-B15	2	9.15	392.2	110	A61-M2-B09	3	1.87	421.3
13	A70-M1-B15	2	9.21	424.2	111	A50-M2-B10	3	2.41	382.2
14	A71-M1-B15	2	8.95	517.2	112	A51-M1-B10	3	2.31	434.2
15	A65-M1-B35	2	9.32	474.2	113	A52-M1-B10	3	1.81	328.1
16	A67-M2-B15	2	9.65	465.2	114	A53-M1-B10	3	2.13	388.2
17	A68-M2-B15	2	9.27	392.2	115	A55-M2-B10	3	1.37	399.2
18	A52-M2-B35	2	7.17	312.1	116	A56-M2-B10	3	2.45	382.2
19	A50-M2-B01	3	2.51	322.1	117	A59-M2-B10	3	2.45	424.1
20	A50-M1-B01	3	2.44	322.1	118	A60-M2-B10	3	2.95	426.2
21	A51-M1-B01	3	2.38	374.1	119	A61-M2-B10	3	1.43	425.2
22	A52-M1-B01	3	1.85	268.1	120	A50-M2-B11	3	2.54	340.1
23	A53-M1-B01	3	2.19	328.1	121	A51-M1-B11	3	2.41	392.1

20

30

40

24	A55-M2-B01	3	1.38	339.2	122	A52-M1-B11	3	1.9	286.1
25	A56-M2-B01	3	2.51	322.1	123	A53-M1-B11	3	2.23	346.1
26	A57-M2-B01	3	2.7	336.2	124	A55-M2-B11	3	1.39	357.2
27	A60-M2-B01	3	3.02	366.2	125	A56-M2-B11	3	2.56	340.1
28	A61-M2-B01	3	1.44	365.2	126	A57-M2-B11	3	2.76	354.2
29	A50-M2-B02	3	2.51	366.1	127	A59-M2-B11	3	2.56	382.1
30	A50-M1-B02	3	2.44	366.1	128	A60-M2-B11	3	3.07	384.2
31	A51-M1-B02	3	2.38	418.1	129	A61-M2-B11	3	1.46	383.2
32	A52-M1-B02	3	1.88	312.1	130	A50-M2-B12	3	2.81	406.1
33	A53-M1-B02	3	2.21	372.1	131	A51-M1-B12	3	2.68	458.1
34	A55-M2-B02	3	1.41	383.2	132	A52-M1-B12	3	2.28	352.1
35	A56-M2-B02	3	2.51	366.1	133	A53-M1-B12	3	2.53	412.1
36	A57-M2-B02	3	2.7	380.2	134	A55-M2-B12	3	1.73	423.2
37	A59-M2-B02	3	2.51	408.1	135	A56-M2-B12	3	2.83	406.1
38	A60-M2-B02	3	3.01	410.2	136	A57-M2-B12	3	3	420.1
39	A61-M2-B02	3	1.46	409.2	137	A58-M2-B12	3	3.01	432.1
40	A62-M2-B02	3	2.51	354.1	138	A59-M2-B12	3	2.81	448.1
41	A50-M2-B03	3	2.71	372.2	139	A60-M2-B12	3	3.27	450.2
42	A50-M1-B03	3	2.65	372.2	140	A61-M2-B12	3	1.77	449.2
43	A51-M1-B03	3	2.56	424.2	141	A50-M2-B13	3	2.05	371.2
44	A52-M1-B03	3	2.13	318.1	142	A55-M2-B13	3	1.09	388.2
45	A53-M1-B03	3	2.39	378.2	143	A56-M2-B13	3	2.09	371.2
46	A55-M2-B03	3	1.58	389.2	144	A59-M2-B13	3	2.1	413.2
47	A57-M2-B03	3	2.89	386.2	145	A50-M2-B14	3	2.63	366.2
48	A58-M2-B03	3	2.89	398.2	146	A51-M1-B14	3	2.51	418.2
49	A61-M2-B03	3	1.63	415.2	147	A52-M1-B14	3	2.04	312.1
50	A50-M2-B04	3	2.33	312.1	148	A53-M1-B14	3	2.37	372.2
51	A51-M1-B04	3	2.23	364.1	149	A55-M2-B14	3	1.51	383.2
52	A52-M1-B04	3	1.62	258.1	150	A56-M2-B14	3	2.63	366.2
53	A53-M1-B04	3	2.03	318.1	151	A57-M2-B14	3	2.81	380.2
54	A55-M2-B04	3	1.21	329.2	152	A59-M2-B14	3	2.6	408.1
55	A56-M2-B04	3	2.33	312.1	153	A60-M2-B14	3	3.08	410.2
56	A57-M2-B04	3	2.53	326.1	154	A62-M2-B14	3	2.65	354.2
57	A59-M2-B04	3	2.35	354.1	155	A51-M1-B16	3	2.07	342.1
58	A60-M2-B04	3	2.87	356.2	156	A52-M1-B16	3	1.38	236.1
59	A61-M2-B04	3	1.27	355.2	157	A53-M1-B16	3	1.82	296.1
60	A62-M2-B04	3	2.33	300.1	158	A51-M1-B17	3	2.18	431.2
61	A50-M2-B05	3	2.57	365.2	159	A52-M1-B17	3	1.65	325.1
62	A51-M1-B05	3	2.43	417.2	160	A53-M1-B17	3	2.05	385.2
63	A52-M1-B05	3	1.92	311.1	161	A51-M1-B18	3	2.6	452.1
64	A53-M1-B05	3	2.26	371.2	162	A52-M1-B18	3	2.15	346
65	A55-M2-B05	3	1.46	382.2	163	A53-M1-B18	3	2.43	406
66	A56-M2-B05	3	2.57	365.2	164	A51-M1-B19	3	2.42	392.1
67	A57-M2-B05	3	2.76	379.2	165	A52-M1-B19	3	1.92	286.1
68	A59-M2-B05	3	2.57	407.1	166	A53-M1-B19	3	2.25	346.1
69	A60-M2-B05	3	3.08	409.3	167	A51-M1-B20	3	2.81	446.2
70	A61-M2-B05	3	1.51	408.2	168	A52-M1-B20	3	2.43	340.2
71	A50-M1-B06	3	2.75	390.1	169	A53-M1-B20	3	2.65	400.2
72	A50-M2-B06	3	2.78	390.1	170	A51-M1-B21	3	2.63	426.1
73	A51-M1-B06	3	2.64	442.1	171	A52-M1-B21	3	2.18	320.1
74	A52-M1-B06	3	2.24	336.1	172	A53-M1-B21	3	2.45	380.1

10

20

30

40

75	A53-M1-B06	3	2.48	396.1	173	A51-M1-B22	3	2.61	468.2
76	A55-M2-B06	3	1.69	407.2	174	A52-M1-B22	3	2.2	362.1
77	A56-M2-B06	3	2.81	390.1	175	A53-M1-B22	3	2.45	422.2
78	A57-M2-B06	3	2.97	404.2	176	A51-M1-B23	3	2.53	414.1
79	A58-M2-B06	3	2.97	416.2	177	A52-M1-B23	3	2.03	308
80	A59-M2-B06	3	2.78	432.1	178	A53-M1-B23	3	2.35	368.1
81	A61-M2-B06	3	1.73	433.2	179	A51-M1-B24	3	2.25	393.1
82	A50-M2-B07	3	2.98	390.1	180	A52-M1-B24	3	1.67	287.1
83	A51-M1-B07	3	2.8	442.1	181	A53-M1-B24	3	2.05	347.1
84	A52-M1-B07	3	2.39	336	182	A51-M1-B25	3	2.61	402.2
85	A53-M1-B07	3	2.63	396.1	183	A52-M1-B25	3	2.17	296.1
86	A55-M2-B07	3	1.77	407.1	184	A53-M1-B25	3	2.44	356.2
87	A56-M2-B07	3	2.99	390.1	185	A51-M1-B26	3	3.62	396.2
88	A57-M2-B07	3	3.17	404.1	186	A52-M1-B26	3	3.43	290.2
89	A59-M2-B07	3	2.95	432	187	A53-M1-B26	3	3.51	350.2
90	A60-M2-B07	3	3.45	434.1	188	A57-M2-B26	3	2.98	358.2
91	A61-M2-B07	3	1.81	433.1	189	A60-M2-B26	3	3.25	388.3
92	A30-M1-B08	3	2.53	402.2	190	A51-M1-B27	3	2.49	434.2
93	A50-M2-B08	3	2.6	366.2	191	A52-M1-B27	3	2.03	328.1
94	A51-M1-B08	3	2.5	418.2	192	A53-M1-B27	3	2.32	388.2
95	A52-M1-B08	3	2.04	312.1	193	A51-M1-B28	3	2.63	571.2
96	A53-M1-B08	3	2.33	372.2	194	A52-M1-B28	3	2.28	465.2
97	A55-M2-B08	3	1.52	383.2	195	A53-M1-B28	3	2.49	525.2
98	A56-M2-B08	3	2.61	366.2					

10

20

【実施例16】

【0400】

N - (5 - { [5 - (ベンジルオキシ) ペンチル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - N ' - イソプロピル尿素

Novabiochemトリチル樹脂 (公表置換 1 . 2 7 m m o l / g 、 0 . 6 4 m m o l) 5 0 0 m g をジクロロメタンに懸濁し、2 - [5 - (tert - ブチル - ジメチル - シラニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - イソインドール - 1 , 3 - ジオン 3 7 4 m g (0 . 9 m m o l) 及び 2 - tert - ブチルイミノ - 2 - ジエチルアミノ - 1 , 3 - ジメチルペルヒドロ - 1 , 3 , 2 - ジアザホスホリン 3 6 7 μ l (1 . 3 m m o l) を加えた。その懸濁液を 1 6 時間攪拌し、次に樹脂をろ過して、ジクロロメタン、メタノール、ジメチルホルムアミド、再びメタノール及びジクロロメタンで洗った。その後樹脂を真空下で乾燥した。

30

【0401】

樹脂の同一性及び充填段階の収率を充填生成物の開裂によって確認した；樹脂 4 0 m g をジクロロメタン 1 m l に懸濁し、トリフルオロ酢酸 1 5 0 μ l を加えた。2 時間後、樹脂を排出し、ジクロロメタン 1 m l で 2 回洗った；収集した溶液を乾燥し、表題化合物 1 3 . 8 m g を回収した。算定充填量 0 . 8 5 m m o l / g 、 H P L C r . t . 方法 1 : 7 . 6 4 [M + H] + = 3 9 4 。

40

【0402】

第一段階で得た樹脂 (5 0 0 m g 、 ~ 0 . 4 2 5 m m o l) をジクロロメタンとメタノール 1 : 1 の混合物 5 m l に懸濁し、ヒドラジーン水和物 5 0 0 μ l を加えた。その懸濁液を 4 5 に加熱した。加熱と攪拌を一晩続け、その後混合物を室温に冷却した。樹脂をろ過し、メタノールと水 1 : 1 の混合物、メタノール、ジメチルホルムアミド、及び再びメタノールで洗った後、真空下で乾燥した。

【0403】

樹脂の同一性を開裂によって確認した。その反応は上述したように実施した。

【0404】

50

6 - { [t e r t - ブチル (ジメチル) シリル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - アミン H P L C r . t . 方法 1 : 5 . 9 9 [M + H] + = 2 6 4 ; [M - H] - = 2 6 2 。

【 0 4 0 5 】

第二段階で得た樹脂の試料 (1 0 0 m g 、 0 . 0 8 m m o l) をジメチルホルムアミド 2 m l に懸濁した ; イソプロピルイソシアネート (3 9 μ l 、 0 . 4 m m o l 、 ~ 5 当量) を加えた。その懸濁液を 5 0 ° に加熱した。攪拌と加熱を 6 0 時間維持し、その後懸濁液を室温に冷却した。樹脂をろ過し、ジクロロメタン、メタノール、ジメチルホルムアミド、メタノール及びジクロロメタンで洗った後、真空下で乾燥した。

【 0 4 0 6 】

第三段階で得た樹脂 (1 0 0 m g 、 ~ 0 . 0 8 m m o l) を無水テトラヒドロフラン 3 m l に懸濁し、テトラヒドロフラン中のフッ化テトラブチルアンモニウムの 1 M 溶液 1 2 0 μ l (~ 1 . 5 当量) を加えた。その懸濁液を一晩攪拌し、樹脂をろ過して、ジクロロメタン、メタノール、ジメチルホルムアミド、メタノール及びジクロロメタンで洗った後、真空下で乾燥した。

【 0 4 0 7 】

第四段階で得た樹脂 (1 0 0 m g 、 ~ 0 . 0 8 m m o l) を無水テトラヒドロフラン 1 m l に懸濁した。丸底フラスコ中で、トリフェニルホスフィン 2 0 9 m g (0 . 8 m m o l 、 ~ 1 0 当量) を無水テトラヒドロフラン 2 m l に溶解し、次に 0 ° でジイソプロピルアゾジカルボキシレート 1 5 7 μ l (0 . 8 m m o l 、 ~ 1 0 当量) 及び 5 - ベンジルオキシ - 1 - ペンタノール 2 3 0 μ l (1 . 2 m m o l 、 ~ 1 5 当量) を静かに加えた。その溶液を 2 時間振とうし、次にそれを樹脂の懸濁液中に移した。

【 0 4 0 8 】

その懸濁液を一晩攪拌し、その後樹脂をろ過して、ジクロロメタン、メタノール、ジメチルホルムアミド、メタノール及びジクロロメタンで洗った。

【 0 4 0 9 】

この手順を 2 回反復する。

【 0 4 1 0 】

乾燥樹脂 1 0 0 m g をジクロロメタン 3 m l に懸濁し、トリフルオロ酢酸 4 5 0 μ l を加えた。2 時間後、樹脂を排出し、ジクロロメタン 3 m l で 2 回洗った ; 収集した溶液を乾燥し、所望表題化合物を回収した。

【 0 4 1 1 】

N - (5 - { [5 - (ベンジルオキシ) ベンチル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - N ' - イソプロピル尿素 H P L C 方法 1 r . t . 6 . 7 5 [M + H] + = 4 1 1 . 2 。

【 0 4 1 2 】

実施例 1 6 と同様に操作することにより、2 - (6 - { [t e r t - ブチル (ジメチル) シリル] オキシ } - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 1 H - イソインドール - 1 , 3 (2 H) - ジオン及び 2 - [5 - (t e r t - ブチル - ジメチル - シラニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - イソインドール - 1 , 3 - ジオンを樹脂上に保持し、その後、上述した合成スキームに従うことにより、下記の生成物を合成した。

【 0 4 1 3 】

N - [5 - (プト - 3 - イニルオキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N ' - イソプロピル尿素 H P L C 方法 1 r . t . 4 . 7 7 [M + H] + = 2 8 7 . 1 。

【 0 4 1 4 】

N - ベンジル - N ' - [5 - (2 - ピロリジン - 1 - イルエトキシ) - 1 H - インダゾール - 3 - イル] 尿素 H P L C 方法 1 r . t . 3 . 2 8 [M + H] + = 3 8 0 . 2 。

【 0 4 1 5 】

N - イソプロピル - N ' - { 5 - [2 - (4 - メチル - 1 , 3 - チアゾール - 5 - イル

10

20

30

40

50

エトキシ) - 1H - インダゾール - 3 - イル] 尿素 HPLC 方法2 r.t. 8.0
2 [M+H]⁺ = 360.1。

【0416】

実施例16と同様に操作することにより、表XVIの95の生成物を平行して合成した。

【0417】

【表17】

表XVI

登録 番号	化合物	HPLC の方法	r. t. (保 持時間) (分)	[M+H] ⁺	登録 番号	化合物	HPLC の方法	r. t. (保 持時間) (分)	[M+H] ⁺
1	A65-M1-B83	1	7.3	459.2	49	A59-M2-B70	3	2.75	445.1
2	A66-M1-B83	1	7.41	367.2	50	A60-M2-B70	3	3.22	447.2
3	A67-M1-B83	2	8.53	408.1	51	A62-M2-B70	3	2.77	391.2
4	A64-M1-B68	1	2.42	332.2	52	A50-M2-B71	3	2.57	369.2
5	A66-M1-B68	1	6.78	319.2	53	A51-M1-B71	3	2.5	421.2
6	A68-M1-B68	1	4.77	287.1	54	A52-M1-B71	3	2.08	315.1
7	A50-M2-B62	3	2.67	367.2	55	A53-M1-B71	3	2.36	375.2
8	A50-M1-B62	3	2.61	367.2	56	A54-M2-B71	3	2.59	433.2
9	A51-M1-B62	3	2.55	419.2	57	A55-M2-B71	3	1.94	386.2
10	A52-M1-B62	3	2.11	313.1	58	A57-M2-B71	3	2.75	383.2
11	A53-M1-B62	3	2.4	373.2	59	A60-M2-B71	3	3.05	413.2
12	A54-M2-B62	3	2.62	431.2	60	A61-M2-B71	3	1.54	412.2
13	A50-M1-B63	3	2.72	351.2	61	A62-M2-B71	3	2.63	357.2
14	A50-M2-B63	3	2.72	351.2	62	A50-M2-B72	3	2.51	317.2
15	A51-M1-B63	3	2.64	403.2	63	A51-M1-B72	3	2.45	369.2
16	A52-M1-B63	3	2.22	297.1	64	A52-M1-B72	3	1.97	263.1
17	A53-M1-B63	3	2.5	357.2	65	A53-M1-B72	3	2.29	323.2
18	A51-M1-B64	3	2.73	423.1	66	A54-M2-B72	3	2.59	381.2
19	A52-M1-B64	3	2.34	317.1	67	A55-M2-B72	3	1.83	334.2
20	A53-M1-B64	3	2.59	377.1	68	A57-M2-B72	3	2.73	331.2
21	A50-M2-B65	3	3.05	413.2	69	A60-M2-B72	3	3.05	361.3
22	A51-M1-B65	3	2.9	465.2	70	A61-M2-B72	3	1.43	360.5
23	A52-M1-B65	3	2.57	359.1	71	A50-M2-B73	3	2.85	391.1
24	A53-M1-B65	3	2.78	419.2	72	A54-M2-B73	3	2.79	455.2
25	A62-M2-B65	3	3.05	401.2	73	A50-M2-B74	3	2.67	397.2
26	A50-M2-B66	3	2.54	379.2	74	A50-M1-B74	3	2.63	397.2
27	A51-M1-B66	3	2.45	431.2	75	A51-M1-B74	3	2.57	449.2
28	A52-M1-B66	3	1.99	325.1	76	A52-M1-B74	3	2.17	343.1
29	A53-M1-B66	3	2.32	385.2	77	A53-M1-B74	3	2.44	403.2
30	A59-M2-B66	3	2.55	421.1	78	A60-M2-B74	3	3.14	441.2
31	A50-M2-B67	3	2.58	365.2	79	A51-M1-B75	3	2.67	435.1
32	A51-M1-B67	3	2.5	417.1	80	A52-M1-B75	3	2.28	329.1
33	A52-M1-B67	3	2.03	311.1	81	A53-M1-B75	3	2.52	389.1
34	A53-M1-B67	3	2.35	371.1	82	A51-M1-B76	3	2.78	457.1
35	A60-M2-B67	3	3.09	409.2	83	A52-M1-B76	3	2.43	351.1
36	A50-M2-B68	3	2.35	303.2	84	A53-M1-B76	3	2.66	411.1
37	A51-M1-B68	3	2.32	355.2	85	A52-M1-B77	3	2.21	301.1
38	A52-M1-B68	3	1.76	249.1	86	A53-M1-B77	3	2.48	361.1

10

20

30

40

39	A53-M1-B68	3	2.16	309.2	87	A51-M1-B78	3	2.55	417.2
40	A57-M2-B68	3	2.58	317.2	88	A53-M1-B78	3	2.4	371.2
41	A62-M2-B68	3	2.37	291.2	89	A51-M1-B79	3	2.5	419.2
42	A50-M2-B69	3	2.84	365.2	90	A52-M1-B79	3	2.07	313.1
43	A51-M1-B69	3	2.75	417.2	91	A53-M1-B79	3	2.35	373.2
44	A52-M1-B69	3	2.35	311.1	92	A52-M1-B80	3	2.08	327.1
45	A53-M1-B69	3	2.61	371.2	93	A53-M1-B80	3	2.35	387.1
46	A61-M2-B69	3	1.71	408.2	94	A52-M1-B81	3	2.16	341.1
47	A50-M2-B70	3	2.77	403.2	95	A53-M1-B81	3	2.43	401.2
48	A57-M2-B70	3	2.95	417.2					

フロントページの続き

(51)Int.Cl.

C 0 7 D 409/12 (2006.01)
 C 0 7 D 409/14 (2006.01)
 C 0 7 D 413/12 (2006.01)
 C 0 7 D 413/14 (2006.01)
 C 4 0 B 40/04 (2006.01)
 C 0 7 D 417/12 (2006.01)
 A 6 1 K 31/416 (2006.01)
 A 6 1 K 31/42 (2006.01)
 A 6 1 K 31/427 (2006.01)
 A 6 1 K 31/454 (2006.01)
 A 6 1 K 31/4709 (2006.01)
 A 6 1 K 31/695 (2006.01)
 A 6 1 P 9/00 (2006.01)
 A 6 1 P 11/00 (2006.01)
 A 6 1 P 13/08 (2006.01)
 A 6 1 P 13/12 (2006.01)
 A 6 1 P 19/02 (2006.01)
 A 6 1 P 25/00 (2006.01)
 A 6 1 P 25/28 (2006.01)
 A 6 1 P 31/12 (2006.01)
 A 6 1 P 35/00 (2006.01)
 A 6 1 P 35/04 (2006.01)
 A 6 1 P 37/06 (2006.01)
 A 6 1 P 43/00 (2006.01)

F I

C 0 7 D 409/12
 C 0 7 D 409/14
 C 0 7 D 413/12
 C 0 7 D 413/14
 C 4 0 B 40/04
 C 0 7 D 417/12
 A 6 1 K 31/416
 A 6 1 K 31/42
 A 6 1 K 31/427
 A 6 1 K 31/454
 A 6 1 K 31/4709
 A 6 1 K 31/695
 A 6 1 P 9/00
 A 6 1 P 11/00
 A 6 1 P 13/08
 A 6 1 P 13/12
 A 6 1 P 19/02
 A 6 1 P 25/00
 A 6 1 P 25/28
 A 6 1 P 31/12
 A 6 1 P 35/00
 A 6 1 P 35/04
 A 6 1 P 37/06
 A 6 1 P 43/00 1 0 5
 A 6 1 P 43/00 1 1 1

- (72)発明者 アミーチ, ラファエツラ
 イタリア国、イ - 2 0 0 7 3 ・ コドーニヨ (ロデイ)、ピア・エ・モンターレ、3 4
- (72)発明者 ダネツロ, マツテオ
 イタリア国、イ - 2 0 0 2 6 ・ ノバテ・ミラネーゼ (ミラノ)、ピア・マツテオツテイ・1 8
- (72)発明者 マルティーナ, カティア
 イタリア国、イ - 1 0 0 6 6 ・ トツレ・ペリーチエ (トリノ)、ピア・ジオリツテイ・5 / 4
- (72)発明者 サロム, バルバラ
 イタリア国、イ - 2 0 0 5 7 ・ ベダノ・アル・ランプロ、ピア・ピツラ、2 0
- (72)発明者 ブルベツテイ, アンナ
 イタリア国、イ - 2 0 0 4 7 ・ ブルゲリオ (ミラノ)、ピア・ボルトウルノ・ボルテイチ、3

審査官 植原 克典

- (56)参考文献 米国特許第 0 4 0 8 6 3 5 3 (US, A)
 特開平 0 6 - 3 0 1 1 7 1 (JP, A)
 特開平 0 8 - 0 2 2 1 0 9 (JP, A)
 特開昭 5 1 - 1 4 3 0 1 0 (JP, A)
 特開昭 5 7 - 0 5 4 1 7 5 (JP, A)
 米国特許第 0 3 7 5 5 3 3 2 (US, A)
 特開昭 6 0 - 1 7 2 9 6 9 (JP, A)
 米国特許第 0 4 7 5 1 3 0 2 (US, A)

KWARTLER, C.; LUCAS, P, The preparation of Sulfanilamidoindazoles. , JOURNAL OF THE AMERICAN CHEMICAL SOCIETY , 1943年, vol. 65, no. 10, pp.1804-1806
PARTRIDGE M W et al. , CYCLIC AMIDINES. PART XVII. 4-IMINO-1,2,3-BENZOTRIAZINES. , JOURNAL OF THE CHEMICAL SOCIETY , 1964年, pp. 3663-3669
金子豊ら , Study on new cyan dye forming compounds. (II). Indazole derivatives. (1) , Nippon Shashin Gakkaishi , 1995年, 58(2) , pp.122-128
Koren, B et al. , Indazoles in organic synthesis. Formation of some fused heterocycles . , Tetrahedron , 1976年, 32(4) , pp.493-497

(58)調査した分野(Int.Cl. , D B名)

C07D 231/56-417/12

CA/REGISTRY(STN)