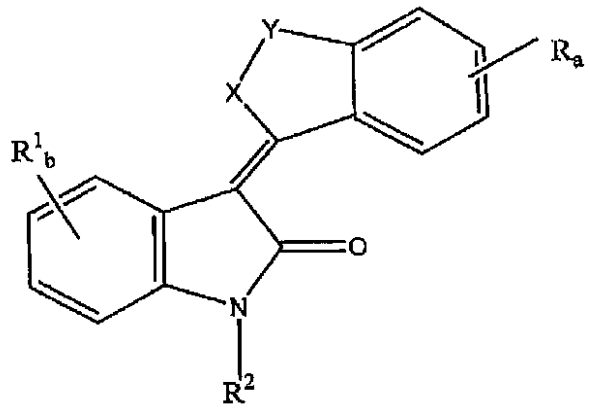
【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】平成18年2月2日(2006.2.2)

【公表番号】特表2005-532284(P2005-532284A)
【公表日】平成17年10月27日(2005.10.27)
【年通号数】公開・登録公報2005-042
【出願番号】特願2003-582148(P2003-582148)
【国際特許分類】
Ｃ０７Ｄ 405/04 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/404 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/454 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/496 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/5377 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/541 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 1/16 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 3/10 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 7/02 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 9/10 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 13/12 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 17/02 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 17/06 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 19/02 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 25/28 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 27/02 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 29/00 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 35/00 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 37/06 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 43/00 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 405/14 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 413/14 (2006.01)
【ＦＩ】
Ｃ０７Ｄ 405/04 ＣＳＰ
Ａ６１Ｋ 31/404
Ａ６１Ｋ 31/454
Ａ６１Ｋ 31/496
Ａ６１Ｋ 31/5377
Ａ６１Ｋ 31/541
Ａ６１Ｐ 1/16
Ａ６１Ｐ 3/10
Ａ６１Ｐ 7/02
Ａ６１Ｐ 9/10
Ａ６１Ｐ 13/12
Ａ６１Ｐ 17/02
Ａ６１Ｐ 17/06
Ａ６１Ｐ 19/02
Ａ６１Ｐ 25/28
Ａ６１Ｐ 27/02
Ａ６１Ｐ 29/00
Ａ６１Ｐ 35/00

Ａ６１Ｐ　37/06
Ａ６１Ｐ　43/00　　１１１
Ｃ０７Ｄ 405/14
Ｃ０７Ｄ 413/14

【手続補正書】
【提出日】平成17年12月6日(2005.12.6)
【手続補正１】
【補正対象書類名】特許請求の範囲
【補正対象項目名】全文
【補正方法】変更
【補正の内容】
【特許請求の範囲】
【請求項１】
一般式Ｉ：
【化１】



［式中、
ＸはＯであり；
Ｙは［Ｃ（R^2）$_2$］$_c$であり；
R^1は、ハロゲン、C_1～C_8アルキル、CF_3、OCF_3、OCF_2H、ＣＮ、SR^2、（CH_2）$_d$Ｃ（Ｏ）ＯR^2、Ｃ（Ｏ）Ｎ（R^2）$_2$、（CH_2）$_d$ＯR^2、ＨＮＣ（Ｏ）R^2、ＨＮＣ（Ｏ）ＯR^2、（CH_2）$_d$Ｎ（R^2）$_2$、SO_2Ｎ（R^2）$_2$、ＯＰ（Ｏ）（ＯR^2）$_2$、ＯＣ（Ｏ）ＯR^2、OCH_2O、Ｎ（R^2）（CH_2）$_d$Ｎ（R^2）$_2$およびＯ（CH_2）$_d$Ｎ（R^2）$_2$からなる群から選択され；
R^2は、水素およびC_1～C_8アルキルおよびフェニルからなる群から選択され；
Ｒは、ハロゲン、C_1～C_8アルキル、CF_3、OCF_3、OCF_2H、ＣＮ、SR^2、（CH_2）$_d$Ｃ（Ｏ）ＯR^2、Ｃ（Ｏ）Ｎ（R^2）$_2$、（CH_2）$_d$ＯR^2、ＨＮＣ（Ｏ）R^2、ＨＮＣ（Ｏ）ＯR^2、（CH_2）$_d$Ｎ（R^2）$_2$、SO_2Ｎ（R^2）$_2$、ＯＰ（Ｏ）（ＯR^2）$_2$、ＯＣ（Ｏ）ＯR^2、OCH_2Oからなる群から選択され；
ｂは、０または１から２までの整数であり；
ａは、０または１から３までの整数であり；
ｃは、１から２までの整数であり；
ｄは、０または１から５までの整数であり、
但し、該アルキルまたはフェニル基は、１つまたは２つの、ハロ、ヒドロキシ、低級アルキルオキシまたは低級アルキルアミノ基で置換されていてもよい］
で示される化合物またはその製薬的に許容される塩。
【請求項２】
ｃが１である、請求項１記載の化合物。
【請求項３】

R^2がＨである、請求項２記載の化合物。
【請求項４】
ｂが０である、請求項３記載の化合物。
【請求項５】
R^1がCH_3、ＦおよびＣｌからなる群から選択される、請求項３記載の化合物。
【請求項６】
ａが０である、請求項３記載の化合物。
【請求項７】
ＲがＮＨＣＯR^7および$N(R^7)_2$（ここに、R^7は、水素、C_1～C_4アルキルおよびフェニルからなる群から選択され、該アルキルまたはフェニルは、ヒドロキシ、メチロールまたはアミノ置換基で置換されていてもよい）からなる群から選択される、請求項３記載の化合物。
【請求項８】
R^7が水素、メチル、エチル、ヒドロキシプロピルおよびアミノメチロールフェニルからなる群から選択される、請求項６記載の化合物。
【請求項９】
上記化合物が以下からなる群から選択される、請求項１記載の化合物：
３－（３Ｈ－イソベンゾフラン－１－イリデン）－１，３－ジヒドロ－インドール－２－オン、
５－クロロ－３－（３Ｈ－イソベンゾフラン－１－イリデン）－１，３－ジヒドロ－インドール－２－オン、
３－（３Ｈ－イソベンゾフラン－１－イリデン）－４－メチル－１，３－ジヒドロ－インドール－２－オン、
５－フルオロ－３－（３Ｈ－イソベンゾフラン－１－イリデン）－１，３－ジヒドロ－インドール－２－オン、
３－（６－アミノ－３Ｈ－イソベンゾフラン－１－イリデン）－１，３－ジヒドロ－インドール－２－オン、
Ｎ－［３－（２－オキソ－１，２－ジヒドロ－インドール－３－イリデン）－１，３－ジヒドロ－イソベンゾフラン－５－イル］アセトアミド、
Ｎ－［３－（２－オキソ－１，２－ジヒドロ－インドール－３－イリデン）－１，３－ジヒドロ－イソベンゾフラン－５－イル］ブチルアミド、
シクロプロパンカルボン酸［３－（２－オキソ－１，２－ジヒドロ－インドール－３－イリデン）－１，３－ジヒドロ－イソベンゾフラン－５－イル］アミド、
４－クロロ－Ｎ－［３－（２－オキソ－１，２－ジヒドロ－インドール－３－イリデン）－１，３－ジヒドロ－イソベンゾフラン－５－イル］ブチルアミド、
２－（４－メトキシ－フェニル）－Ｎ－［３－（２－オキソ－１，２－ジヒドロ－インドール－３－イリデン）－１，３－ジヒドロ－イソベンゾフラン－５－イル］アセトアミド、
３－（６－エチルアミノ－３Ｈ－イソベンゾフラン－１－イリデン）－１，３－ジヒドロ－インドール－２－オン、
３－（５－アミノ－３Ｈ－イソベンゾフラン－１－イリデン）－１，３－ジヒドロ－インドール－２－オン、
５－アミノ－２－ヒドロキシメチル－Ｎ－［３－（２－オキソ－１，２－ジヒドロ－インドール－３－イリデン）－１，３－ジヒドロ－イソベンゾフラン－５－イル］ベンズアミド、
３－［６－（３－ヒドロキシ－プロピルアミノ）－３Ｈ－イソベンゾフラン－１－イリデン］－１，３－ジヒドロ－インドール－２－オン、
３－（５－エチルアミノ－３Ｈ－イソベンゾフラン－１－イリデン）－１，３－ジヒドロ－インドール－２－オン、
３－（６－アミノ－３Ｈ－イソベンゾフラン－１－イリデン）－５－クロロ－１，３－

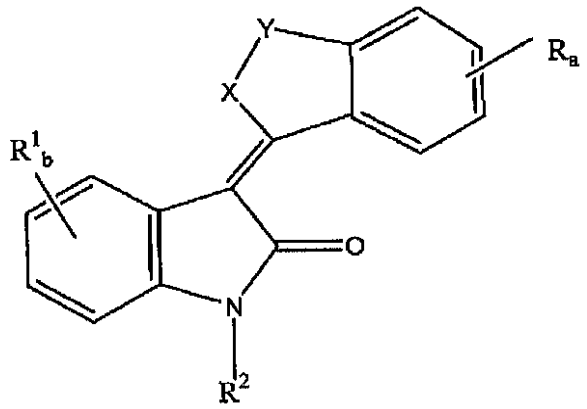
ジヒドロ－インドール－２－オン、
３－（５－アミノ－３Ｈ－イソベンゾフラン－１－イリデン）－５－クロロ－１，３－ジヒドロ－インドール－２－オン、
Ｎ－［１－（２－オキソ－１，２－ジヒドロ－インドール－３－イリデン）－１，３－ジヒドロ－イソベンゾフラン－５－イル］アセトアミド、
Ｎ－［１－（５－クロロ－２－オキソ－１，２－ジヒドロ－インドール－３－イリデン）－１，３－ジヒドロ－イソベンゾフラン－５－イル］アセトアミド、
Ｎ－［３－（５－クロロ－２－オキソ－１，２－ジヒドロ－インドール－３－イリデン）－１，３－ジヒドロ－イソベンゾフラン－５－イル］アセトアミド、
３－（６－ジメチルアミノ－３Ｈ－イソベンゾフラン－１－イリデン）－１，３－ジヒドロ－インドール－２－オン、
３－（６－メチルアミノ－３Ｈ－イソベンゾフラン－１－イリデン）－１，３－ジヒドロ－インドール－２－オン、
３－（５－ジメチルアミノ－３Ｈ－イソベンゾフラン－１－イリデン）－１，３－ジヒドロ－インドール－２－オン、
３－（５－メチルアミノ－３Ｈ－イソベンゾフラン－１－イリデン）－１，３－ジヒドロ－インドール－２－オン、
４－クロロ－Ｎ－［３－（２－オキソ－１，２－ジヒドロ－インドール－３－イリデン）－１，３－ジヒドロ－イソベンゾフラン－５－イル］プロピオンアミド、および
３－（６－エチルアミノ－３Ｈ－イソベンゾフラン－１－イリデン）－１，３－ジヒドロ－インドール－２－オン。

【請求項１０】

上記化合物が以下からなる群から選択される、請求項９記載の化合物：
３－（３Ｈ－イソベンゾフラン－１－イリデン）－１，３－ジヒドロ－インドール－２－オン、
５－クロロ－３－（３Ｈ－イソベンゾフラン－１－イリデン）－１，３－ジヒドロ－インドール－２－オン、
３－（３Ｈ－イソベンゾフラン－１－イリデン）－４－メチル－１，３－ジヒドロ－インドール－２－オン、
５－フルオロ－３－（３Ｈ－イソベンゾフラン－１－イリデン）－１，３－ジヒドロ－インドール－２－オン、
３－（６－アミノ－３Ｈ－イソベンゾフラン－１－イリデン）－１，３－ジヒドロ－インドール－２－オン、
Ｎ－［３－（２－オキソ－１，２－ジヒドロ－インドール－３－イリデン）－１，３－ジヒドロ－イソベンゾフラン－５－イル］アセトアミド、
３－（６－エチルアミノ－３Ｈ－イソベンゾフラン－１－イリデン）－１，３－ジヒドロ－インドール－２－オン、
３－（５－アミノ－３Ｈ－イソベンゾフラン－１－イリデン）－１，３－ジヒドロ－インドール－２－オン、
５－アミノ－２－ヒドロキシメチル－Ｎ－［３－（２－オキソ－１，２－ジヒドロ－インドール－３－イリデン）－１，３－ジヒドロ－イソベンゾフラン－５－イル］ベンズアミド、
３－［６－（３－ヒドロキシ－プロピルアミノ）－３Ｈ－イソベンゾフラン－１－イリデン］－１，３－ジヒドロ－インドール－２－オン、
３－（６－アミノ－３Ｈ－イソベンゾフラン－１－イリデン）－５－クロロ－１，３－ジヒドロ－インドール－２－オン、
３－（５－アミノ－３Ｈ－イソベンゾフラン－１－イリデン）－５－クロロ－１，３－ジヒドロ－インドール－２－オン、
Ｎ－［１－（２－オキソ－１，２－ジヒドロ－インドール－３－イリデン）－１，３－ジヒドロ－イソベンゾフラン－５－イル］アセトアミド、

Ｎ－［１－（５－クロロ－２－オキソ－１，２－ジヒドロ－インドール－３－イリデン）－１，３－ジヒドロ－イソベンゾフラン－５－イル］アセトアミド、および
Ｎ－［３－（５－クロロ－２－オキソ－１，２－ジヒドロ－インドール－３－イリデン）－１，３－ジヒドロ－イソベンゾフラン－５－イル］アセトアミド。

【請求項１１】
一般式Ｉ：
【化２】



［式中、
ＸはＯであり；
Ｙは［Ｃ（R^2）$_2$］$_c$であり；
R^1は、ハロゲン、C_1～C_8アルキル、CF_3、OCF_3、OCF_2H、ＣＮ、SR^2、（CH_2）$_b$Ｃ（Ｏ）ＯR^2、Ｃ（Ｏ）Ｎ（R^2）$_2$、（CH_2）$_b$ＯR^2、ＨＮＣ（Ｏ）R^2、ＨＮＣ（Ｏ）ＯR^2、（CH_2）$_b$Ｎ（R^2）$_2$、SO_2Ｎ（R^2）$_2$、ＯＰ（Ｏ）（ＯR^2）$_2$、ＯＣ（Ｏ）ＯR^2、OCH_2O、Ｎ（R^2）（CH_2）$_d$Ｎ（R^2）$_2$およびＯ（CH_2）$_d$Ｎ（R^2）$_2$からなる群から選択され；
R^2は、水素およびC_1～C_8アルキルおよびフェニルからなる群から選択され；
Ｒは、ハロゲン、C_1～C_8アルキル、CF_3、OCF_3、OCF_2H、ＣＮ、SR^2、（CH_2）$_d$Ｃ（Ｏ）ＯR^2、Ｃ（Ｏ）Ｎ（R^2）$_2$、（CH_2）$_d$ＯR^2、ＨＮＣ（Ｏ）R^2、ＨＮＣ（Ｏ）ＯR^2、（CH_2）$_d$Ｎ（R^2）$_2$、SO_2Ｎ（R^2）$_2$、ＯＰ（Ｏ）（ＯR^2）$_2$、ＯＣ（Ｏ）ＯR^2、OCH_2Oからなる群から選択され；
ｂは、０または１から２までの整数であり；
ａは、０または１から３までの整数であり；
ｃは、１から２までの整数であり；
ｄは、０または１から５までの整数であり、
但し、該アルキルまたはフェニル基は、１つまたは２つの、ハロ、ヒドロキシ、低級アルキルオキシまたは低級アルキルアミノ基で置換されていてもよい］
で示される化合物またはその製薬的に許容される塩を含有する、非調整チロシンキナーゼシグナル伝達に関連する疾患の処置のための医薬組成物。

【請求項１２】
上記疾患が、癌、血管増殖性障害、線維性障害、メサンギウム細胞増殖性障害および代謝疾患からなる群から選択される、請求項１１記載の医薬組成物。

【請求項１３】
血管増殖性障害が、糖尿病性網膜症、加齢性黄斑変性症、未熟児網膜症、関節炎および再狭窄からなる群から選択される、請求項１１記載の医薬組成物。

【請求項１４】
線維性障害が、肝硬変、アテローム性動脈硬化および外科的癒着からなる群から選択される、請求項１１記載の医薬組成物。

【請求項１５】

メサンギウム細胞増殖性障害が、糸球体腎炎、糖尿病性腎症、悪性腎硬化症、血栓性微小血管症症候群、移植拒絶および糸球体症からなる群から選択される、請求項１１記載の医薬組成物。

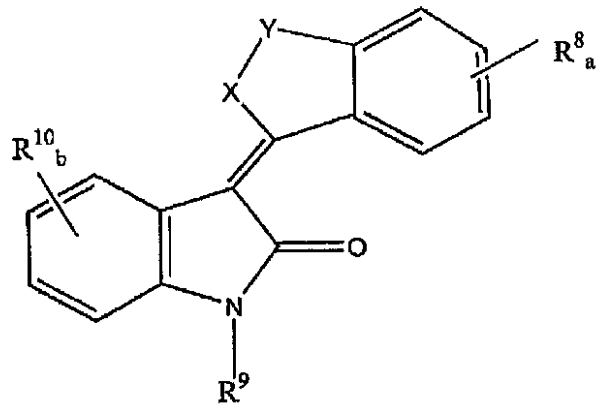
【請求項１６】

代謝障害が、乾癬、糖尿病、創傷治癒、炎症および神経変性疾患からなる群から選択される、請求項１１記載の医薬組成物。

【請求項１７】

一般式ＩＩ：

【化３】



［式中、

ＸはＯであり；

Ｙは［Ｃ（Ｒ^9）$_2$］$_c$であり；

Ｒ^{10}は、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、ヒドロカルビル、置換されているヒドロカルビル、アミド、チオアミド、アミン、チオエーテルおよびスルホニルからなる群から選択され；

Ｒ^{8}は、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、ヒドロカルビル、置換されているヒドロカルビル、アミド、チオアミド、アミン、チオエーテルおよびスルホニルおよびホスホン酸からなる群から選択され；

Ｒ^{9}は、水素、ヒドロカルビルおよび置換されているヒドロカルビルからなる群から選択され；

ｃは、１から２までの整数であり；

ｂは、０または１から３までの整数であり；

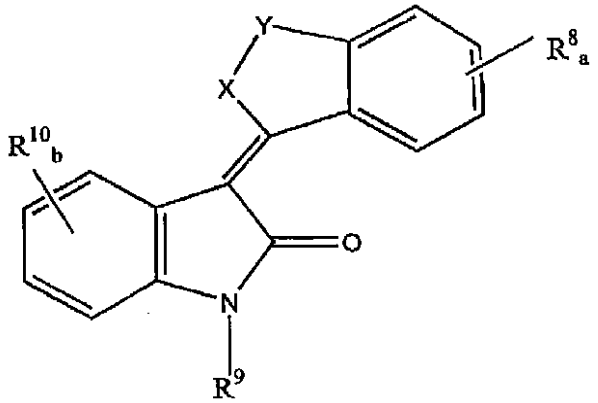
ａは、０または１から３までの整数である］

で示される化合物またはその製薬的に許容される塩。

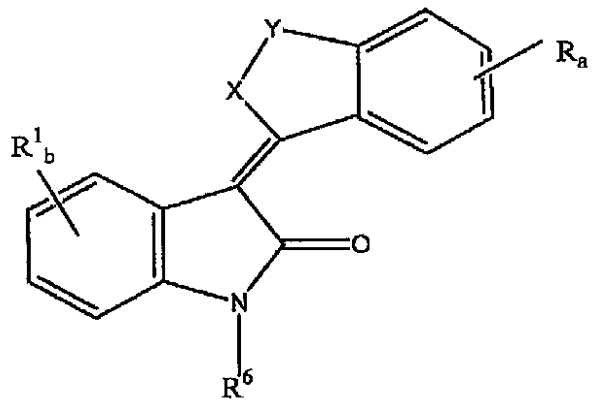
【請求項１８】

一般式ＩＩ：

【化４】



［式中、
Ｘは Ｏであり；
Ｙは［Ｃ（Ｒ^{9}）$_{2}$］$_{c}$であり；
Ｒ^{10}は、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、ヒドロカルビル、置換されているヒドロカルビル、アミド、チオアミド、アミン、チオエーテルおよびスルホニルからなる群から選択され；
Ｒ^{8}は、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、ヒドロカルビル、置換されているヒドロカルビル、アミド、チオアミド、アミン、チオエーテルおよびスルホニルおよびホスホン酸からなる群から選択され；
Ｒ^{9}は、水素、ヒドロカルビルおよび置換されているヒドロカルビルからなる群から選択され；
ｃは、１から２までの整数であり；
ｂは、０または１から３までの整数であり；
ａは、０または１から３までの整数である］
で示される化合物またはその製薬的に許容される塩を含有する、非調整チロシンキナーゼシグナル伝達に関連する疾患の処置のための医薬組成物。
【請求項１９】
一般式：
【化５】



［式中、
Ｘは Ｏであり；
Ｙは［Ｃ（Ｒ^{2}）$_{2}$］$_{c}$であり；
Ｒ^{1}は、ハロゲン、アリール、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{8}$アルキル、ＣＦ$_{3}$、ＯＣＦ$_{3}$、ＯＣＦ$_{2}$Ｈ、Ｓ（Ｏ）$_{f}$Ｒ^{2}、（ＣＲ^{3}Ｒ^{4}）$_{d}$Ｃ（Ｏ）ＯＲ^{2}、Ｏ（ＣＲ^{3}Ｒ^{4}）$_{e}$Ｃ（Ｏ）ＯＲ^{2}、ＮＲ^{2}（ＣＲ^{3}Ｒ^{4}）$_{d}$Ｃ（Ｏ）Ｒ^{2}、ＮＲ^{2}（ＣＲ^{3}Ｒ^{4}）$_{d}$Ｃ（Ｏ）ＯＲ^{2}、ＯＰ（Ｏ）（ＯＲ^{2}）$_{2}$、ＯＣ（Ｏ）ＯＲ^{2}、ＯＣＨ$_{2}$Ｏ、ＮＲ^{2}（ＣＨ$_{2}$）$_{e}$Ｎ（Ｒ^{2}）$_{2}$、Ｏ（ＣＨ$_{2}$）$_{e}$Ｎ（Ｒ^{2}）$_{2}$、（ＣＲ^{3}Ｒ^{4}）$_{d}$ＣＮ、Ｏ（ＣＲ^{3}Ｒ^{4}）$_{e}$ＣＮ、（ＣＲ^{3}Ｒ^{4}）$_{d}$Ａｒ、ＮＲ^{2}（ＣＲ^{3}Ｒ^{4}）$_{d}$Ａｒ、Ｏ（ＣＲ^{3}Ｒ^{4}）$_{d}$Ａｒ、Ｓ（Ｏ）$_{f}$（ＣＲ^{3}Ｒ^{4}）$_{d}$Ａｒ、（ＣＲ^{3}Ｒ^{4}）$_{d}$ＳＯ$_{2}$Ｒ^{2}、（ＣＲ^{3}Ｒ^{4}）$_{d}$Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ^{2}）$_{2}$、
ＮＲ^{2}（ＣＲ^{3}Ｒ^{4}）$_{d}$Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ^{2}）$_{2}$、Ｏ（ＣＲ^{3}Ｒ^{4}）$_{d}$Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ^{2}）$_{2}$、Ｓ（Ｏ）$_{f}$（ＣＲ^{3}Ｒ^{4}）$_{e}$Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ^{2}）$_{2}$、（ＣＲ^{3}Ｒ^{4}）$_{d}$ＯＲ^{2}、ＮＲ^{2}（ＣＲ^{3}Ｒ^{4}）$_{e}$ＯＲ^{2}、Ｏ（ＣＲ^{3}Ｒ^{4}）$_{e}$ＯＲ^{2}、Ｓ（Ｏ）$_{f}$（ＣＲ^{3}Ｒ^{4}）$_{d}$ＯＲ^{2}、Ｃ（Ｏ）（ＣＲ^{3}Ｒ^{4}）$_{d}$Ｒ^{3}、ＮＲ^{2}Ｃ（Ｏ）（ＣＲ^{3}Ｒ^{4}）$_{d}$Ｒ^{3}、ＯＣ（Ｏ）（ＣＲ^{3}Ｒ^{4}）$_{d}$Ｎ（Ｒ^{2}）$_{2}$、Ｃ（Ｏ）（ＣＲ^{3}Ｒ^{4}）$_{d}$Ｎ（Ｒ^{2}）$_{2}$、
ＮＲ^{2}Ｃ（Ｏ）（ＣＲ^{3}Ｒ^{4}）$_{d}$Ｎ（Ｒ^{2}）$_{2}$、ＯＣ（Ｏ）（ＣＲ^{3}Ｒ^{4}）$_{d}$Ｎ（Ｒ^{2}）$_{2}$、（ＣＲ^{3}Ｒ^{4}）$_{d}$Ｒ^{3}、ＮＲ^{2}（ＣＲ^{3}Ｒ^{4}）$_{d}$Ｒ^{3}、Ｏ（ＣＲ^{3}Ｒ^{4}）$_{d}$Ｒ^{3}、Ｓ（Ｏ）$_{f}$（ＣＲ^{3}Ｒ^{4}）$_{d}$Ｒ^{3}、（ＣＲ^{3}Ｒ^{4}）$_{d}$Ｎ（Ｒ^{2}）$_{2}$、ＮＲ^{2}（ＣＲ^{3}Ｒ^{4}）$_{e}$Ｎ（Ｒ^{2}）$_{2}$、Ｏ（ＣＲ^{3}Ｒ^{4}）$_{e}$Ｎ（Ｒ^{2}）$_{2}$、
Ｓ（Ｏ）$_{f}$（ＣＲ^{3}Ｒ^{4}）$_{d}$Ｎ（Ｒ^{2}）$_{2}$、Ｎ（Ｒ^{5}）$_{2}$、ＯＲ^{5}、Ｃ（Ｏ）Ｒ^{5}、Ｓ（Ｏ）$_{f}$Ｒ^{5}か

らなる群から選択され；

R^2は、水素、C_1～C_8アルキル、C_1～C_8アルケニル、C_1～C_4アルキロール、低級アルキルフェニル、フェニル、$(CR^3R^4)_dAr$、$(CR^3R^4)_dC(O)OR^2$、$(CR^3R^4)_dSO_2R^2$、$(CR^3R^4)_dOR^2$、$(CR^3R^4)_dOSO_2R^2$、$(CR^3R^4)_dP(O)(OR^2)_2$、$(CR^3R^4)_dR^2$、$(CR^3R^4)_eN(R^2)_2$、$(CR^3R^4)_eNR^2C(O)N(R^2)_2$からなる群から選択され；

$N(R^2)_2$は、３～７員ヘテロ環、例えばピロリジン、３－フルオロピロリジン、ピペリジン、４－フルオロピペリジン、Ｎ－メチルピペラジン、モルホリン、２，６－ジメチルモルホリン、チオモルホリンを形成してもよい。該ヘテロ環は、１つまたはそれ以上のR^3で置換されていてもよく；

$[C(R^2)_2]_c$は、３～７員炭素環またはヘテロ環を形成してもよく；

Ｒは、ハロゲン、C_1～C_8アルキル、CF_3、OCF_3、OCF_2H、$(CR^3R^4)_dCN$、$NR^2(CR^3R^4)_eCN$、$O(CR^3R^4)_eCN$、$S(O)_fR^2$、$(CR^3R^4)_dC(O)OR^2$、$NR^2(CR^3R^4)_dC(O)OR^2$、$O(CR^3R^4)_dC(O)OR^2$、$S(O)_f(CR^3R^4)_dC(O)OR^2$、$(CR^3R^4)_dAr$、$NR^2(CR^3R^4)_dAr$、$O(CR^3R^4)_dAr$、$S(O)_f(CR^3R^4)_dAr$、$(CR^3R^4)_dSO_2R^2$、$NR^2(CR^3R^4)_dS(O)_fR^2$、$O(CR^3R^4)_dS(O)_fR^2$、$S(O)_f(CR^3R^4)_eS(O)_fR^2$、$(CR^3R^4)_dC(O)N(R^2)_2$、$NR^2(CR^3R^4)_dC(O)N(R^2)_2$、$O(CR^3R^4)_dC(O)N(R^2)_2$、$S(O)_f(CR^3R^4)_eC(O)N(R^2)_2$、$(CR^3R^4)_dOR^2$、$NR^2(CR^3R^4)_eOR^2$、$O(CR^3R^4)_eOR^2$、$S(O)_f(CR^3R^4)_dOR^2$、$(CR^3R^4)_dOSO_2R^2$、$NR^2(CR^3R^4)_eOSO_2R^2$、$O(CR^3R^4)_eOSO_2R^2$、$S(O)_f(CR^3R^4)_eOSO_2R^2$、$(CR^3R^4)_dP(O)(OR^2)_2$、$NR^2(CR^3R^4)_dP(O)(OR^2)_2$、$O(CR^3R^4)_dP(O)(OR^2)_2$、$S(O)_f(CR^3R^4)_eP(O)(OR^2)_2$、$C(O)(CR^3R^4)_dR^3$、$NR^2C(O)(CR^3R^4)_dR^3$、$OC(O)(CR^3R^4)_dN(R^2)_2$、$C(O)(CR^3R^4)_dN(R^2)_2$、$NR^2C(O)(CR^3R^4)_dN(R^2)_2$、$OC(O)(CR^3R^4)_dN(R^2)_2$、$(CR^3R^4)_dR^3$、$NR^2(CR^3R^4)_dR^3$、$O(CR^3R^4)_dR^3$、$S(O)_f(CR^3R^4)_dR^3$、$HNC(O)R^2$、$HN-C(O)OR^2$、$(CR^3R^4)_dN(R^2)_2$、$NR^2(CR^3R^4)_eN(R^2)_2$、$O(CR^3R^4)_eN(R^2)_2$、$S(O)_f(CR^3R^4)_dN(R^2)_2$、$OP(O)(OR^2)_2$、$OC(O)OR^2$、$OCH_2O$、$HN-CH=CH$、$-N(COR^2)CH_2CH_2$、$HC=N-NH$、$N=CH-S$、$(CR^3R^4)_dC=C(CR^3R^4)_dR^2$、$(CR^3R^4)_dC=C(CR^3R^4)_dOR^2$、$(CR^3R^4)_dC=C(CR^3R^4)_dN(R^2)_2$、$(CR^3R^4)_dCC(CR^3R^4)_dR^2$、$(CR^3R^4)_dCC(CR^3R^4)_eOR^2$、$(CR^3R^4)_dCC(CR^3R^4)_eN(R^2)_2$、$(CR^3R^4)_dC(O)(CR^3R^4)_dR^2$、$(CR^3R^4)_dC(O)(CR^3R^4)_dOR^2$、$(CR^3R^4)_dC(O)(CR^3R^4)_dN(R^2)_2$からなる群から選択され、

R^3およびR^4は、Ｈ、Ｆ、ヒドロキシおよびC_1～C_4アルキルからなる群から選択されてもよく、またはCR^3R^4は、３～６つの炭素の炭素環またはヘテロ環を示してもよく、あるいは、$(CR^3R^4)_d$および$(CR^3R^4)_e$は、３～７員炭素環またはヘテロ環を形成してもよく、好ましくは、R^3およびR^4は、Ｈ、Ｆ、CH_3またはヒドロキシであり；

R^5は、$Ar-R^1_b$であり；

R^6は、水素、C_1～C_8アルキル、ヒドロキシメチルおよびフェニルから選択され；

ｂは、０または１から２までの整数であり；

ａは、０または１から３までの整数であり；

ｃは、１から２までの整数であり；

ｄは、０または１から５までの整数であり；

ｅは、１から４までの整数であり；

ｆは、０または１から２までの整数であり、

但し、該アルキルまたはアリール基は、１つまたは２つの、ハロ、ヒドロキシ、低級アルキルオキシ、低級アルキルアミノまたはシクロアルキルアミノ基（ここに、該シクロアルキル環は、鎖でつながれた酸素、硫黄またはさらなる窒素原子を含むことができ、１つまたは２つの、ハロまたは低級アルキル基で置換されていてもよい）で置換されていてもよい］
で示される化合物またはその製薬的に許容される塩。
【請求項２０】
R^1がＨ、Ｃｌ、Ｆ、CH_3から選択され、Ｒが、ハロゲン、$(CR^3R^4)_dN(R^2)_2$、$NR^2(CR^3R^4)_eN(R^2)_2$、$O(CR^3R^4)_eN(R^2)_2$、$S(O)_f(CR^3R^4)_dN(R^2)_2$、$(CR^3R^4)_dCC(CR^3R^4)_eN(R^2)_2$、$NR^2C(O)(CR^3R^4)_dN(R^2)_2$、$(CR^3R^4)_dOR^2$、$NR^2(CR^3R^4)_eOR^2$、$O(CR^3R^4)_eOR^2$から選択される、請求項１９記載の化合物。
【請求項２１】
R^1がＨ、Ｃｌ、Ｆ、CH_3から選択され、Ｒが$NR^2(CR^3R^4)_eN(R^2)_2$から選択される、請求項２０記載の化合物。
【請求項２２】
上記化合物が以下からなる群から選択される、請求項２１記載の化合物：
３－［５－（２－ピペリジン－１－イル－エチルアミノ）－３Ｈ－イソベンゾフラン－１－イリデン］－１，３－ジヒドロ－インドール－２－オン、
３－［５－（２－モルホリン－４－イル－エチルアミノ）－３Ｈ－イソベンゾフラン－１－イリデン］－１，３－ジヒドロ－インドール－２－オン、
６－フルオロ－３－［５－（２－モルホリン－４－イル－エチルアミノ）－３Ｈ－イソベンゾフラン－１－イリデン］－１，３－ジヒドロ－インドール－２－オン、
６－フルオロ－３－［５－（２－ピペリジン－１－イル－エチルアミノ）－３Ｈ－イソベンゾフラン－１－イリデン］－１，３－ジヒドロ－インドール－２－オン、
３－｛５－［２－（４－メチル－ピペラジン－１－イル）エチルアミノ］－３Ｈ－イソベンゾフラン－１－イリデン｝－１，３－ジヒドロ－インドール－２－オン、
３－［５－（２－ピロリジン－１－イル－エチルアミノ）－３Ｈ－イソベンゾフラン－１－イリデン］－１，３－ジヒドロ－インドール－２－オン、
６－フルオロ－３－｛５－［２－（４－メチル－ピペラジン－１－イル）エチルアミノ］－３Ｈ－イソベンゾフラン－１－イリデン｝－１，３－ジヒドロ－インドール－２－オン、
５－フルオロ－３－［５－（２－モルホリン－４－イル－エチルアミノ）－３Ｈ－イソベンゾフラン－１－イリデン］－１，３－ジヒドロ－インドール－２－オン、
５－フルオロ－３－［５－（２－ピペリジン－１－イル－エチルアミノ）－３Ｈ－イソベンゾフラン－１－イリデン］－１，３－ジヒドロ－インドール－２－オン、
５－フルオロ－３－｛５－［２－（４－メチル－ピペラジン－１－イル）エチルアミノ］－３Ｈ－イソベンゾフラン－１－イリデン｝－１，３－ジヒドロ－インドール－２－オン、
３－｛５－［２－（（２Ｒ，６Ｓ）－２，６－ジメチル－モルホリン－４－イル）エチルアミノ］－３Ｈ－イソベンゾフラン－１－イリデン｝－１，３－ジヒドロ－インドール－２－オン、
３－｛５－［２－（（２Ｒ，６Ｓ）－２，６－ジメチル－モルホリン－４－イル）エチルアミノ］－３Ｈ－イソベンゾフラン－１－イリデン｝－５－フルオロ－１，３－ジヒドロ－インドール－２－オン、
３－｛５－［２－（（２Ｒ，６Ｓ）－２，６－ジメチル－モルホリン－４－イル）エチルアミノ］－３Ｈ－イソベンゾフラン－１－イリデン｝－６－フルオロ－１，３－ジヒドロ－インドール－２－オン、
３－｛５－［２－（３－フルオロ－ピロリジン－１－イル）エチルアミノ］－３Ｈ－イソベンゾフラン－１－イリデン｝－１，３－ジヒドロ－インドール－２－オン、

３－｛５－［２－（４－フルオロ－ピペリジン－１－イル）エチルアミノ］－３Ｈ－イソベンゾフラン－１－イリデン｝－１，３－ジヒドロ－インドール－２－オン、
３－［５－（２－ジエチルアミノ－エチルアミノ）－３Ｈ－イソベンゾフラン－１－イリデン］－５－フルオロ－１，３－ジヒドロ－インドール－２－オン、
３－｛５－［メチル－（２－モルホリン－４－イル－エチル）アミノ］－３Ｈ－イソベンゾフラン－１－イリデン｝－１，３－ジヒドロ－インドール－２－オン、
５－フルオロ－３－｛５－［メチル－（２－モルホリン－４－イル－エチル）アミノ］－３Ｈ－イソベンゾフラン－１－イリデン｝－１，３－ジヒドロ－インドール－２－オン。

【請求項２３】
R^1がＨ、Ｃｌ、Ｆ、CH_3から選択され、Ｒが$NR^2C(O)(CR^3R^4)_dN(R^2)_2$から選択される、請求項２０記載の化合物。

【請求項２４】
上記化合物が以下からなる群から選択される、請求項２３記載の化合物：
Ｎ－［１－（５－クロロ－２－オキソ－１，２－ジヒドロ－インドール－３－イリデン）－１，３－ジヒドロ－イソベンゾフラン－５－イル］－２－モルホリン－４－イル－アセトアミド、
２－モルホリン－４－イル－Ｎ－［１－（２－オキソ－１，２－ジヒドロ－インドール－３－イリデン）－１，３－ジヒドロ－イソベンゾフラン－５－イル］アセトアミド、
Ｎ－［１－（５－クロロ－２－オキソ－１，２－ジヒドロ－インドール－３－イリデン）－１，３－ジヒドロ－イソベンゾフラン－５－イル］－Ｃ－ジエチルアミノ－アセトアミド、
Ｎ－［１－（５－クロロ－２－オキソ－１，２－ジヒドロ－インドール－３－イリデン）－１，３－ジヒドロ－イソベンゾフラン－５－イル］－２－（４－メチル－ピペラジン－１－イル）アセトアミド、
Ｎ－［１－（５－クロロ－２－オキソ－１，２－ジヒドロ－インドール－３－イリデン）－１，３－ジヒドロ－イソベンゾフラン－５－イル］－２－ピペリジン－１－イル－アセトアミド。

【請求項２５】
R^1がＨ、Ｃｌ、Ｆ、CH_3から選択され、Ｒが$(CR^3R^4)_dCC(CR^3R^4)_eN(R^2)_2$から選択される、請求項２０記載の化合物。

【請求項２６】
上記化合物が以下からなる群から選択される、請求項２５記載の化合物：
３－［５－（３－ジメチルアミノ－プロパ－１－イニル）－３Ｈ－イソベンゾフラン－１－イリデン］－１，３－ジヒドロ－インドール－２－オン。

【請求項２７】
R^1がＨ、Ｃｌ、Ｆ、CH_3から選択され、Ｒが$(CR^3R^4)_dN(R^2)_2$から選択される、請求項２０記載の化合物。

【請求項２８】
上記化合物が以下からなる群から選択される、請求項２７記載の化合物：
３－（５－アミノ－３Ｈ－イソベンゾフラン－１－イリデン）－６－フルオロ－１，３－ジヒドロ－インドール－２－オン、
３－（５－アミノ－３Ｈ－イソベンゾフラン－１－イリデン）－５－フルオロ－１，３－ジヒドロ－インドール－２－オン、
６－フルオロ－３－（５－メチルアミノ－３Ｈ－イソベンゾフラン－１－イリデン）－１，３－ジヒドロ－インドール－２－オン、
５－フルオロ－３－（５－メチルアミノ－３Ｈ－イソベンゾフラン－１－イリデン）－１，３－ジヒドロ－インドール－２－オン、
５－クロロ－３－（５－メチルアミノ－３Ｈ－イソベンゾフラン－１－イリデン）－１，３－ジヒドロ－インドール－２－オン、

６－クロロ－３－（５－メチルアミノ－３Ｈ－イソベンゾフラン－１－イリデン）－１，３－ジヒドロ－インドール－２－オン、
７－フルオロ－３－（５－メチルアミノ－３Ｈ－イソベンゾフラン－１－イリデン）－１，３－ジヒドロ－インドール－２－オン、
５－クロロ－３－（５－ジメチルアミノ－３Ｈ－イソベンゾフラン－１－イリデン）－１，３－ジヒドロ－インドール－２－オン、
３－［５－（３－モルホリン－４－イル－プロピル）－３Ｈ－イソベンゾフラン－１－イリデン］－１，３－ジヒドロ－インドール－２－オン、
３－［５－（３－チオモルホリン－４－イル－プロピル）－３Ｈ－イソベンゾフラン－１－イリデン］－１，３－ジヒドロ－インドール－２－オン、
３－［５－（３－ジメチルアミノ－プロピル）－３Ｈ－イソベンゾフラン－１－イリデン］－１，３－ジヒドロ－インドール－２－オン、
５－フルオロ－３－［５－（３－ピペリジン－１－イル－プロピルアミノ）－３Ｈ－イソベンゾフラン－１－イリデン］－１，３－ジヒドロ－インドール－２－オン。

【請求項２９】

R^1がＨ、Ｃｌ、Ｆ、CH_3から選択され、ＲがＯ（CR^3R^4）$_e$Ｎ（R^2）$_2$から選択される、請求項２０記載の化合物。

【請求項３０】

上記化合物が以下からなる群から選択される、請求項２９記載の化合物：
５－フルオロ－３－［５－（２－ピペリジン－１－イル－エトキシ）－３Ｈ－イソベンゾフラン－１－イリデン］－１，３－ジヒドロ－インドール－２－オン、
３－［５－（２－ジエチルアミノ－エトキシ）－３Ｈ－イソベンゾフラン－１－イリデン］－５－フルオロ－１，３－ジヒドロ－インドール－２－オン、
５－フルオロ－３－［５－（３－モルホリン－４－イル－プロポキシ）－３Ｈ－イソベンゾフラン－１－イリデン］－１，３－ジヒドロ－インドール－２－オン、
３－［５－（３－ジエチルアミノ－プロポキシ）－３Ｈ－イソベンゾフラン－１－イリデン］－５－フルオロ－１，３－ジヒドロ－インドール－２－オン、
３－［５－（４－ジエチルアミノ－ブトキシ）－３Ｈ－イソベンゾフラン－１－イリデン］－５－フルオロ－１，３－ジヒドロ－インドール－２－オン、
３－［５－（４－ジエチルアミノ－ブトキシ）－３Ｈ－イソベンゾフラン－１－イリデン］－５－フルオロ－１，３－ジヒドロ－インドール－２－オン、
５－フルオロ－３－［５－（３－モルホリン－４－イル－プロピルアミノ）－３Ｈ－イソベンゾフラン－１－イリデン］－１，３－ジヒドロ－インドール－２－オン、
５－フルオロ－３－［５－（３－ピペリジン－１－イル－プロピルアミノ）－３Ｈ－イソベンゾフラン－１－イリデン］－１，３－ジヒドロ－インドール－２－オン。

【請求項３１】

R^1がＨ、Ｃｌ、Ｆ、CH_3から選択され、ＲがNR^2（CR^3R^4）$_d$$OR^2$から選択される、請求項１９記載の化合物。

【請求項３２】

上記化合物が以下からなる群から選択される、請求項３１記載の化合物：
３－［５－（２－ヒドロキシ－エチルアミノ）－３Ｈ－イソベンゾフラン－１－イリデン］－１，３－ジヒドロ－インドール－２－オン、
６－フルオロ－３－［５－（２－ヒドロキシ－エチルアミノ）－３Ｈ－イソベンゾフラン－１－イリデン］－１，３－ジヒドロ－インドール－２－オン。

【請求項３３】

R^1がＨ、Ｃｌ、Ｆ、CH_3から選択され、R^2が（CR^3R^4）$_d$Ｃ（Ｏ）OR^2から選択される、請求項１９記載の化合物。

【請求項３４】

上記化合物が以下からなる群から選択される、請求項３３記載の化合物：
［３－（２－オキソ－１，２－ジヒドロ－インドール－３－イリデン）－１，３－ジヒ

ドロ－イソベンゾフラン－１－イル］酢酸、
［３－（５－クロロ－２－オキソ－１，２－ジヒドロ－インドール－３－イリデン）－１，３－ジヒドロ－イソベンゾフラン－１－イル］酢酸、
［３－（６－フルオロ－２－オキソ－１，２－ジヒドロ－インドール－３－イリデン）－１，３－ジヒドロ－イソベンゾフラン－１－イル］酢酸、
３－［３－（２－ヒドロキシ－エチル）－３Ｈ－イソベンゾフラン－１－イリデン］－１，３－ジヒドロ－インドール－２－オン、
［（３Ｅ）－６－メトキシ－３－（２－オキソ－１，２－ジヒドロ－３Ｈ－インドール－３－イリデン）－１，３－ジヒドロ－２－ベンゾフラン－１－イル］酢酸、
［（３Ｅ）－５－メトキシ－３－（２－オキソ－１，２－ジヒドロ－３Ｈ－インドール－３－イリデン）－１，３－ジヒドロ－２－ベンゾフラン－１－イル］酢酸、
ナトリウム［（３Ｅ）－３－（２－オキソ－１，２－ジヒドロ－３Ｈ－インドール－３－イリデン）－１，３－ジヒドロ－２－ベンゾフラン－１－イル］アセテート、
ナトリウム［（３Ｅ）－３－（６－フルオロ－２－オキソ－１，２－ジヒドロ－３Ｈ－インドール－３－イリデン）－１，３－ジヒドロ－２－ベンゾフラン－１－イル］アセテート。