

【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24年8月2日(2012.8.2)

【公表番号】特表2011-526610(P2011-526610A)

【公表日】平成23年10月13日(2011.10.13)

【年通号数】公開・登録公報2011-041

【出願番号】特願2011-515526(P2011-515526)

【国際特許分類】

C 0 7 D 487/04 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/02 (2006.01)

A 6 1 K 31/407 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 487/04 1 3 7

C 0 7 D 487/04 C S P

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 3/10

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 35/02

A 6 1 K 31/407

【手続補正書】

【提出日】平成24年6月12日(2012.6.12)

【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

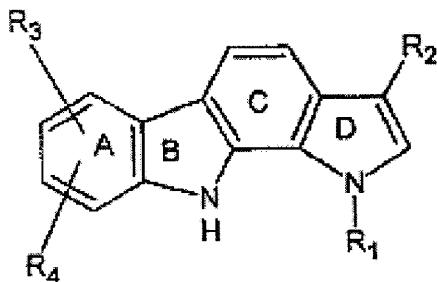
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

次の式I:

【化1】



式 I

(式中、

- R₁ はHまたはスルホフェニル基であり、

- R₂、R₃ およびR₄ は、同一または異なって、互いに独立して、水素原子、ハロゲン原子、またはニトロ、ニトリル、ヒドロキシ、一つ以上の基R₅で任意に置換されていてもよい

直鎖状もしくは分枝鎖状の $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、一つ以上の基 R_5 で任意に置換されていてもよい $C_5 \sim C_6$ シクロアルコキシ、一つ以上の基 R_5 で任意に置換されていてもよい5-もしくは6-員のヘテロシクロアルコキシ、-SH、一つ以上の基 R_5 で任意に置換されていてもよい直鎖状もしくは分枝鎖状の $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、一つ以上の基 R_5 で任意に置換されていてもよい C_6 アリール、一つ以上の基 R_5 で任意に置換されていてもよい C_6 アリールオキシ、 $-NR_aR_b$ 、 $-NR_aC(O)-T_1$ 、 $-C(N-OH)-T_3$ 、 $-C(O)-T_1$ 、 $-C(O)-C(O)-T_3$ 、 $-C(O)-NR_a-T_1$ 、 $-NR_a-C(O)-T_1$ 、 $-O-C(O)-T_1$ 、 $-C(O)-O-T_1$ 、 $-O-T_2-NR_aR_b$ 、 $-O-T_2-OR_a$ 、 $-O-T_2-CO_2R_a$ 、 $-NR_a-T_2-NR_aR_b$ 、 $-NR_a-T_2-OR_a$ 、 $-NR_a-T_2-CO_2R_a$ もしくは $-S(O)_t-R_a$ 、 $-S(O)_t-OR_a$ 、 $-S(O)_t-NR_aR_b$ 、 $-P(O)_t-R_a$ 、 $-P(O)_t-OR_a$ 、一つ以上の基 R_5 で任意に置換されていてもよい直鎖状もしくは分枝鎖状の $C_1 \sim C_6$ アルキル、一つ以上の基 R_5 で任意に置換されていてもよい直鎖状もしくは分枝鎖状の $C_1 \sim C_6$ アルケニル、一つ以上の基 R_5 で任意に置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキニル、一つ以上の基 R_5 で任意に置換されていてもよい5-もしくは6-員のヘテロアリール、一つ以上の基 R_5 で任意に置換されていてもよい5-もしくは6-員のヘテロシクロアルキル、一つ以上の基 R_5 で任意に置換されていてもよい5-もしくは6-員のヘテロアリールオキシの中から選択される基を表し、

- R_5 は、ハロゲン原子、または直鎖状もしくは分枝鎖状の $C_1 \sim C_6$ アルキル、 C_6 アリール、直鎖状もしくは分枝鎖状の $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $-OR_a$ 、 $-NR_aR_b$ 、 $-CO_2R_a$ 、 $-C(O)R_a$ および $-C(O)NR_aR_b$ 、ニトリル、ニトロ、 $-NR_aC(O)-T_1$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、オキシ、 $-S(O)_t-R_a$ 、 $-S(O)_t-OR_a$ 、 $-S(O)_t-NR_aR_b$ 、 $-P(O)_t-R_a$ 、 $-P(O)_t-OR_a$ の中から選択される基を表し、

- R_a および R_b は、同一または異なって、互いに独立して、水素原子、または直鎖状もしくは分枝鎖状の $C_1 \sim C_6$ アルキル、直鎖状もしくは分枝鎖状の $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルおよび C_6 アリールの中から選択される基を表し、 $R_a + R_b$ は、それらが結合する窒素原子と一緒にあって、飽和もしくは不飽和の、単環式もしくは二環式の、酸素および窒素から選択される第2のヘテロ原子を任意に環中に含んでいてもよく、一つ以上の基 R_5 で任意に置換されていてもよい5~10 原子の複素環を形成し、

- T_1 は、水素原子、ハロゲン原子、または $-OR_a$ 、 $-NR_aR_b$ 、 $-CO_2R_a$ 、 $-C(O)R_a$ および $-C(O)NR_aR_b$ から選択される基で任意に置換されていてもよい、直鎖状もしくは分枝鎖状の $C_1 \sim C_6$ アルキル基を表し、

- T_2 は直鎖状もしくは分枝鎖状の (C_1-C_6) アルキリデン鎖を表し、

- T_3 は、-ハロゲン、 $-OR_a$ 、 $-NR_aR_b$ 、 $-CO_2R_a$ 、 $-C(O)R_a$ および $-C(O)NR_aR_b$ (ここで、 R_a および R_b は前記で定義されたとおりである) から選択される基を表し、

- t は0~3の両端を含む整数を表し、

- A、B、CおよびDは、式Iの化合物を構成する環を示し、これらの環のそれぞれを特定するためだけのものである)

の少なくとも一つの化合物、またはその塩、光学異性体もしくはラセミ混合物の、少なくとも一つを含む、キナーゼPIM-1、PIM-2またはPIM-3の活性の阻害剤としての医薬組成物

。

【請求項2】

少なくとも一つの化合物が、式I:

ここで、

- R_1 はHまたはスルホフェニル基であり、

- R_2 はH、またはCHO、 $(CH_2)_nOH$ 、 $C(=O)NH_2$ 、 $C(=O)-CF_3$ 、 $(C=O)_2R_c$ 、 $(CH_2)_2NEt_2$ 、 $CH(OH)CH_2N(Et)_2$ 、 $C(NO_2)-(C=O)N(Et)_2$ 、 NO_2 およびBr (ここで、 $n = 1$ または2であり、 $R_c = O$ 、 CH_3 、 OC_2H_5 、 $N(C_2H_5)_2$ である)の中から選択される基を表し、

- R_3 および R_4 は、同一または異なって、互いに独立して、H、ハロゲン原子、OおよびNから選択される1つもしくは2つのヘテロ原子を含む、5-もしくは6-員のヘテロアリール基、直鎖状もしくは分枝鎖状の $C_1 \sim C_6$ アルキル、メトキシ、ニトロ、ニトリル、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、 SO_2R_d ; 基 $(C=O)CH_3$ 、フェニル、メトキシ、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチルおよびカルボキシから選択される基で

、または1もしくは2つのフッ素原子で、任意に置換されていてもよいC₆ アリールから選択され、ここで、R_d は基OH、CH₃ もしくはNH₂から選択される
を有することを特徴とする、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項3】

少なくとも一つの化合物が、式I：

ここで、

- R₁ はHまたはスルホフェニル基であり、

- R₂ はH、またはCHO、(CH₂)_nOH、C(=O)NH₂、C(=O)-CF₃、(C=O)₂R_c、(CH₂)₂NEt₂、CH(OH)CH₂N(Et)₂、C(NO₂)-(C=O)N(Et)₂、NO₂ およびBr (ここで、n = 1 または2であり、R_c は基OCH₃またはOC₂H₅またはN(C₂H₅)₂を表す)の中から選択される基を表し、

- R₃ およびR₄ は、同一または異なって、互いに独立して、H、ハロゲン原子ならびにメチル、エチル、ニトロ、ニトリル、トリフルオロメチル；基(C=O)CH₃、フェニル、メトキシ、トリフルオロメトキシおよびトリフルオロメチル基から選択される基で、または1つもしくは2つのフッ素原子で任意に置換されていてもよいC₆ アリールの中からの基から選択される

を有することを特徴とする、請求項1または2に記載の医薬組成物。

【請求項4】

式Iの少なくとも一つの化合物が、1,10-ジヒドロピロロ[2,3-a]カルバゾール、1,10-ジヒドロピロロ[2,3-a]カルバゾール-3-カルバルデヒド、1,10-ジヒドロピロロ[2,3-a]カルバゾール-3-カルボキサミド、1-(1,10-ジヒドロピロロ[2,3-a]カルバゾール-3-イル-2,2,2-トリフルオロエタノン、7-ブromo-1,10-ジヒドロピロロ[2,3-a]カルバゾール、7-ブromo-1,10-ジヒドロピロロ[2,3-a]カルバゾール-3-カルバルデヒド、7-(2,4-ジフルオロフェニル)-1,10-ジヒドロピロロ[2,3-a]カルバゾール-3-カルバルデヒド、6-ブromo-1,10-ジヒドロピロロ[2,3-a]カルバゾール-3-カルバルデヒド、9-ブromo-1,10-ジヒドロピロロ[2,3-a]カルバゾール-3-カルバルデヒド、7-フルオロ-1,10-ジヒドロピロロ[2,3-a]カルバゾール-3-カルバルデヒド、9-フルオロ-1,10-ジヒドロピロロ[2,3-a]カルバゾール-3-カルバルデヒド、6,8-ジクロロ-1,10-ジヒドロピロロ[2,3-a]カルバゾール-3-カルバルデヒド、9-エチル-1,10-ジヒドロピロロ[2,3-a]カルバゾール-3-カルバルデヒドおよび8-メチル-1,10-ジヒドロピロロ[2,3-a]カルバゾール-3-カルバルデヒドから選択されることを特徴とする、請求項1~3のいずれか一つに記載の医薬組成物。

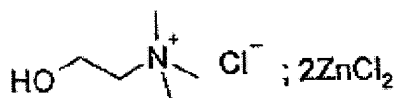
【請求項5】

式Iの少なくとも一つの化合物が、1,10-ジヒドロピロロ[2,3-a]カルバゾール、1,10-ジヒドロピロロ[2,3-a]カルバゾール-3-カルバルデヒドおよび1,10-ジヒドロピロロ[2,3-a]カルバゾール-3-カルボキサミドから選択されることを特徴とする、請求項1~4のいずれか一つに記載の医薬組成物。

【請求項6】

次の式III：

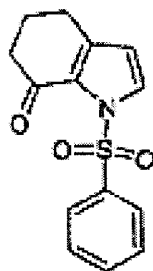
【化2】



式 III

の2/1 塩化亜鉛-塩化コリンであるイオン液体の存在下での、式II：

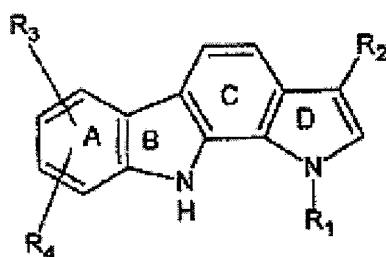
【化3】



式 II

の1-ベンゼンスルホニル-1,4,5,6-テトラヒドロ-7H-インドール-7-オンおよび、フェニルヒドラジンもしくはフェニルが一つ以上の基 R_5 で置換されたフェニルヒドラジンのフィッシャーインドール化を含むことを特徴とする、式I：

【化4】



式 I

(式中、

- R_1 はHまたはスルホフェニル基であり、
- R_2, R_3 および R_4 は、同一または異なって、互いに独立して、水素原子、ハロゲン原子、またはニトロ、ニトリル、ヒドロキシ、一つ以上の基 R_5 で任意に置換されていてもよい直鎖状もしくは分枝鎖状の $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、一つ以上の基 R_5 で任意に置換されていてもよい $C_5 \sim C_6$ シクロアルコキシ、一つ以上の基 R_5 で任意に置換されていてもよい5-もしくは6-員のヘテロシクロアルコキシ、-SH、一つ以上の基 R_5 で任意に置換されていてもよい直鎖状もしくは分枝鎖状の $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、一つ以上の基 R_5 で任意に置換されていてもよい C_6 アリール、一つ以上の基 R_5 で任意に置換されていてもよい C_6 アリールオキシ、 $-NR_aR_b$ 、 $-NR_aC(O)-T_1$ 、 $-C(N-OH)-T_3$ 、 $-C(O)-T_1$ 、 $-C(O)-C(O)-T_3$ 、 $-C(O)-NR_a-T_1$ 、 $-NR_a-C(O)-T_1$ 、 $-O-C(O)-T_1$ 、 $-C(O)-O-T_1$ 、 $-O-T_2-NR_aR_b$ 、 $-O-T_2-OR_a$ 、 $-O-T_2-CO_2R_a$ 、 $-NR_a-T_2-NR_aR_b$ 、 $-NR_a-T_2-OR_a$ 、 $-NR_a-T_2-CO_2R_a$ もしくは $-S(O)_t-R_a$ 、 $-S(O)_t-OR_a$ 、 $-S(O)_t-NR_aR_b$ 、 $-P(O)_t-R_a$ 、 $-P(O)_t-OR_a$ 、一つ以上の基 R_5 で任意に置換されていてもよい直鎖状もしくは分枝鎖状の $C_1 \sim C_6$ アルキル、一つ以上の基 R_5 で任意に置換されていてもよい直鎖状もしくは分枝鎖状の $C_1 \sim C_6$ アルケニル、一つ以上の基 R_5 で任意に置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキニル、一つ以上の基 R_5 で任意に置換されていてもよい5-もしくは6-員のヘテロアリール、一つ以上の基 R_5 で任意に置換されていてもよい5-もしくは6-員のヘテロシクロアルキル、一つ以上の基 R_5 で任意に置換されていてもよい5-もしくは6-員のヘテロアリールオキシの中から選択される基を表し、
- R_5 は、ハロゲン原子、または直鎖状もしくは分枝鎖状の $C_1 \sim C_6$ アルキル、 C_6 アリール、直鎖状もしくは分枝鎖状の $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $-OR_a$ 、 $-NR_aR_b$ 、 $-CO_2R_a$ 、 $-C(O)R_a$ および $-C(O)NR_aR_b$ 、ニトリル、ニトロ、 $-NR_aC(O)-T_1$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、オキシ、 $-S(O)_t-R_a$ 、 $-S(O)_t-OR_a$ 、 $-S(O)_t-NR_aR_b$ 、 $-P(O)_t-R_a$ 、 $-P(O)_t-OR_a$ の中から選択される基を表し、
- R_a および R_b は、同一または異なって、互いに独立して、水素原子、または直鎖状もしくは分枝鎖状の $C_1 \sim C_6$ アルキル、直鎖状もしくは分枝鎖状の $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルおよび C_6 アリールの中から選択される基を表し、 $R_a + R_b$ は、それらが結合する窒素原子と

一緒になって、飽和もしくは不飽和の、単環式もしくは二環式の、酸素および窒素から選択される第2のヘテロ原子を任意に環中に含んでもよく、一つ以上の基 R_5 で任意に置換されていてもよい5~10 原子の複素環を形成し、

- T_1 は、水素原子、ハロゲン原子、または $-OR_a$ 、 $-NR_aR_b$ 、 $-CO_2R_a$ 、 $-C(O)R_a$ および $-C(O)NR_aR_b$ から選択される基で任意に置換されていてもよい、直鎖状もしくは分枝鎖状の $C_1 \sim C_6$ アルキル基を表し、

- T_2 は直鎖状もしくは分枝鎖状の(C_1 - C_6)アルキリデン鎖を表し、

- T_3 は、 $-$ ハロゲン、 $-OR_a$ 、 $-NR_aR_b$ 、 $-CO_2R_a$ 、 $-C(O)R_a$ および $-C(O)NR_aR_b$ (ここで、 R_a および R_b は前記で定義されたとおりである) から選択される基を表し、

- t は0~3の両端を含む整数を表し、

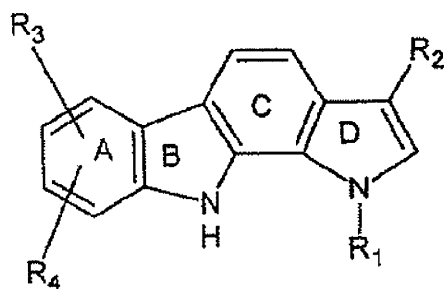
- A、B、CおよびDは、式Iの化合物を構成する環を示し、これらの環のそれぞれを特定するためだけのものである)

の化合物の合成方法。

【請求項7】

式I:

【化5】



(式中、

- R_1 はHまたはスルホフェニル基であり、

- R_2 、 R_3 および R_4 は、同一または異なって、互いに独立して、水素原子、ハロゲン原子、またはニトロ、ニトリル、ヒドロキシ、一つ以上の基 R_5 で任意に置換されていてもよい直鎖状もしくは分枝鎖状の $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、一つ以上の基 R_5 で任意に置換されていてもよい $C_5 \sim C_6$ シクロアルコキシ、一つ以上の基 R_5 で任意に置換されていてもよい5-もしくは6-員のヘテロシクロアルコキシ、 $-SH$ 、一つ以上の基 R_5 で任意に置換されていてもよい直鎖状もしくは分枝鎖状の $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、一つ以上の基 R_5 で任意に置換されていてもよい C_6 アリール、一つ以上の基 R_5 で任意に置換されていてもよい C_6 アリールオキシ、 $-NR_aR_b$ 、 $-NR_aC(O)-T_1$ 、 $-C(N-OH)-T_3$ 、 $-C(O)-T_1$ 、 $-C(O)-C(O)-T_3$ 、 $-C(O)-NR_a-T_1$ 、 $-NR_a-C(O)-T_1$ 、 $-O-C(O)-T_1$ 、 $-C(O)-O-T_1$ 、 $-O-T_2-NR_aR_b$ 、 $-O-T_2-OR_a$ 、 $-O-T_2-CO_2R_a$ 、 $-NR_a-T_2-NR_aR_b$ 、 $-NR_a-T_2-OR_a$ 、 $-NR_a-T_2-CO_2R_a$ もしくは $-S(O)_t-R_a$ 、 $-S(O)_t-OR_a$ 、 $-S(O)_t-NR_aR_b$ 、 $-P(O)_t-R_a$ 、 $-P(O)_t-OR_a$ 、一つ以上の基 R_5 で任意に置換されていてもよい直鎖状もしくは分枝鎖状の $C_1 \sim C_6$ アルキル、一つ以上の基 R_5 で任意に置換されていてもよい直鎖状もしくは分枝鎖状の $C_1 \sim C_6$ アルケニル、一つ以上の基 R_5 で任意に置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキニル、一つ以上の基 R_5 で任意に置換されていてもよい5-もしくは6-員のヘテロアリール、一つ以上の基 R_5 で任意に置換されていてもよい5-もしくは6-員のヘテロシクロアルキル、一つ以上の基 R_5 で任意に置換されていてもよい5-もしくは6-員のヘテロアリールオキシの中から選択される基を表し、

- R_5 は、ハロゲン原子、または直鎖状もしくは分枝鎖状の $C_1 \sim C_6$ アルキル、 C_6 アリール、直鎖状もしくは分枝鎖状の $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $-OR_a$ 、 $-NR_aR_b$ 、 $-CO_2R_a$ 、 $-C(O)R_a$ および $-C(O)NR_aR_b$ 、ニトリル、ニトロ、 $-NR_aC(O)-T_1$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、オキソ、 $-S(O)_t-R_a$ 、 $-S(O)_t-OR_a$ 、 $-S(O)_t-NR_aR_b$ 、 $-P(O)_t-R_a$ 、 $-P(O)_t-OR_a$ のの中から選択される基を表し、

- R_a および R_b は、同一または異なって、互いに独立して、水素原子、または直鎖状もしくは分枝鎖状の $C_1 \sim C_6$ アルキル、直鎖状もしくは分枝鎖状の $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルおよ

び C_6 アリールの中から選択される基を表し、 $R_a + R_b$ は、それらが結合する窒素原子と一緒にあって、飽和もしくは不飽和の、単環式もしくは二環式の、酸素および窒素から選択される第2のヘテロ原子を任意に環中に含んでいてもよく、一つ以上の基 R_5 で任意に置換されていてもよい5~10原子の複素環を形成し、

- T_1 は、水素原子、ハロゲン原子、または $-OR_a$ 、 $-NR_aR_b$ 、 $-CO_2R_a$ 、 $-C(O)R_a$ および $-C(O)NR_aR_b$ から選択される基で任意に置換されていてもよい、直鎖状もしくは分枝鎖状の $C_1 \sim C_6$ アルキル基を表し、

- T_2 は直鎖状もしくは分枝鎖状の(C_1-C_6)アルキリデン鎖を表し、

- T_3 は、 $-$ ハロゲン、 $-OR_a$ 、 $-NR_aR_b$ 、 $-CO_2R_a$ 、 $-C(O)R_a$ および $-C(O)NR_aR_b$ (ここで、 R_a および R_b は前記で定義されたとおりである)から選択される基を表し、

- t は0~3の両端を含む整数を表し、

- A 、 B 、 C および D は、式Iの化合物を構成する環を示し、これらの環のそれぞれを特定するためだけのものである、

但し、

- R_1 、 R_2 、 R_3 および R_4 は全て同時にHであることはなく、

- R_1 がスルホフェニル基であるとき、 R_2 、 R_3 および R_4 は全て同時にHであることはなく、

、

- R_2 がカルボキサミドまたはホルミル基であるとき、 R_1 、 R_3 および R_4 は全て同時にHであることはない)

の化合物。

【請求項8】

式Iにおいて、

- R_1 がHまたはスルホフェニル基であり、

- R_2 がH、またはCHO、 $(CH_2)_nOH$ 、 $C(=O)NH_2$ 、 $C(=O)-CF_3$ 、 $(C=O)_2R_c$ 、 $(CH_2)_2NEt_2$ 、 $CH(OH)CH_2N(Et)_2$ 、 $C(NO_2)-(C=O)N(Et)_2$ 、 NO_2 およびBr (ここで、 $n = 1$ または 2 であり、 $R_c = OC_2H_5$ 、 OC_2H_5 または $N(C_2H_5)_2$ である)の中から選択される基を表し、

- R_3 および R_4 は、同一または異なって、互いに独立して、H、ハロゲン原子、OおよびNから選択される1つまたは2つのヘテロ原子を含む5-もしくは6-員のヘテロアリール基、直鎖状もしくは分枝鎖状の $C_1 \sim C_6$ アルキル、メトキシ、ニトロ、ニトリル、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、 SO_2R_d ; 基 $(C=O)CH_3$ 、フェニル、メトキシ、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチルおよびカルボキシから選択される基で、または1もしくは2つのフッ素原子で、任意に置換されていてもよい C_6 アリールから選択され、ここで、 R_d は基OH、 CH_3 もしくは NH_2 から選択されることを特徴とする、請求項7に記載の式Iの化合物。

【請求項9】

式Iにおいて、

- R_1 がHまたはスルホフェニル基であり、

- R_2 がH、またはCHO、 $(CH_2)_nOH$ 、 $C(=O)NH_2$ 、 $C(O)-CF_3$ 、 $(C=O)_2R_c$ 、 $(CH_2)_2NEt_2$ 、 $CH(OH)CH_2N(Et)_2$ 、 $C(NO_2)-(C=O)N(Et)_2$ 、 NO_2 およびBr (ここで、 $n = 1$ または 2 であり、 R_c は基O CH_3 、 OC_2H_5 または $N(C_2H_5)_2$ を表す)の中から選択される基を表し、

- R_3 および R_4 は、同一または異なって、互いに独立して、H、ハロゲン原子ならびにメチル、エチル、ニトロ、ニトリル、トリフルオロメチル; 基 $(C=O)CH_3$ 、フェニル、メトキシ、トリフルオロメトキシおよびトリフルオロメチルから選択される基で、または1つもしくは2つのフッ素原子で、任意に置換されていてもよい C_6 アリールからの基から選択される

ことを特徴とする、請求項7または8に記載の化合物。

【請求項10】

式Iの化合物が、

- (1,10-ジヒドロピロロ[2,3-a]カルバゾール-3-イル)メタノール、

- 1-(1,10-ジヒドロピロロ[2,3-a]カルバゾール-3-イル)-2,2,2-トリフルオロエタノン、

- メチル 2-(1,10-ジヒドロピロロ[2,3-a]カルバゾール-3-イル)-2-オキソアセテート、
- エチル 2-(1,10-ジヒドロピロロ[2,3-a]カルバゾール-3-イル)-2-オキソアセテート、
- 2-(1,10-ジヒドロピロロ[2,3-a]カルバゾール-3-イル)エタノール、
- 2-(1,10-ジヒドロピロロ[2,3-a]カルバゾール-3-イル)-N,N-ジエチル-2-オキソアセトアミド、
- 2-(1,10-ジヒドロピロロ[2,3-a]カルバゾール-3-イル)-N,N-ジエチルエタンアミン、
- 1-(1,10-ジヒドロピロロ[2,3-a]カルバゾール-3-イル)-2-ジエチルアミノエタノール、
- 2-(1,10-ジヒドロピロロ[2,3-a]カルバゾール-3-イル)-N,N-ジエチル-2-ヒドロキシイミノエタンアミド、
- 1-ベンゼンスルホニル-7-プロモ-1,10-ジヒドロピロロ[2,3-a]カルバゾール、
- 7-プロモ-1,10-ジヒドロピロロ[2,3-a]カルバゾール、
- 7-プロモ-1,10-ジヒドロピロロ[2,3-a]カルバゾール-3-カルバルデヒド、
- 7-(4-アセチルフェニル)-1,10-ジヒドロピロロ[2,3-a]カルバゾール、
- 7-(3-メトキシフェニル)-1,10-ジヒドロピロロ[2,3-a]カルバゾール、
- 7-(4-ピフェニル)-1,10-ジヒドロピロロ[2,3-a]カルバゾール、
- 7-フェニル-1,10-ジヒドロピロロ[2,3-a]カルバゾール、
- 7-(4-フルオロフェニル)-1,10-ジヒドロピロロ[2,3-a]カルバゾール、
- 7-(2,4-ジフルオロフェニル)-1,10-ジヒドロピロロ[2,3-a]カルバゾール、
- 7-(4-トリフルオロメチルフェニル)-1,10-ジヒドロピロロ[2,3-a]カルバゾール、
- 7-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-1,10-ジヒドロピロロ[2,3-a]カルバゾール、
- 8-プロモ-1,10-ジヒドロピロロ[2,3-a]カルバゾール、
- 6-プロモ-1,10-ジヒドロピロロ[2,3-a]カルバゾール、
- 9-プロモ-1,10-ジヒドロピロロ[2,3-a]カルバゾール、
- 7-フルオロ-1,10-ジヒドロピロロ[2,3-a]カルバゾール、
- 9-フルオロ-1,10-ジヒドロピロロ[2,3-a]カルバゾール、
- 6,8-ジクロロ-1,10-ジヒドロピロロ[2,3-a]カルバゾール、
- 1,10-ジヒドロピロロ[2,3-a]カルバゾール-7-カルボニトリル、
- 7-ニトロ-1,10-ジヒドロピロロ[2,3-a]カルバゾール、
- 9-エチル-1,10-ジヒドロピロロ[2,3-a]カルバゾール、
- 9-(トリフルオロメチル)-1,10-ジヒドロピロロ[2,3-a]カルバゾール、
- 8-メチル-1,10-ジヒドロピロロ[2,3-a]カルバゾール、
- 7-(3-メトキシフェニル)-1,10-ジヒドロピロロ[2,3-a]カルバゾール-3-カルバルデヒド、
- 7-(4-ピフェニル)-1,10-ジヒドロピロロ[2,3-a]カルバゾール-3-カルバルデヒド、
- 7-フェニル-1,10-ジヒドロピロロ[2,3-a]カルバゾール-3-カルバルデヒド、
- 7-(4-フルオロフェニル)-1,10-ジヒドロピロロ[2,3-a]カルバゾール-3-カルバルデヒド、
- 7-(2,4-ジフルオロフェニル)-1,10-ジヒドロピロロ[2,3-a]カルバゾール-3-カルバルデヒド、
- 7-(4-トリフルオロメチルフェニル)-1,10-ジヒドロピロロ[2,3-a]カルバゾール-3-カルバルデヒド、
- 7-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-1,10-ジヒドロピロロ[2,3-a]カルバゾール-3-カルバルデヒド、
- 8-プロモ-1,10-ジヒドロピロロ[2,3-a]カルバゾール-3-カルバルデヒド、
- 6-プロモ-1,10-ジヒドロピロロ[2,3-a]カルバゾール-3-カルバルデヒド、
- 9-プロモ-1,10-ジヒドロピロロ[2,3-a]カルバゾール-3-カルバルデヒド、
- 7-フルオロ-1,10-ジヒドロピロロ[2,3-a]カルバゾール-3-カルバルデヒド、
- 9-フルオロ-1,10-ジヒドロピロロ[2,3-a]カルバゾール-3-カルバルデヒド、
- 6,8-ジクロロ-1,10-ジヒドロピロロ[2,3-a]カルバゾール-3-カルバルデヒド、
- 3-ホルミル-1,10-ジヒドロピロロ[2,3-a]カルバゾール-7-カルボニトリル、

- 7-ニトロ-1,10-ジヒドロピロロ[2,3-a]カルバゾール-3-カルバルデヒド、
 - 9-エチル-1,10-ジヒドロピロロ[2,3-a]カルバゾール-3-カルバルデヒド、
 - 8-メチル-1,10-ジヒドロピロロ[2,3-a]カルバゾール-3-カルバルデヒド
- から選択されることを特徴とする、請求項7～9のいずれか一つに記載の化合物。

【請求項11】

式Iの化合物が、

1,10-ジヒドロピロロ[2,3-a]カルバゾール-3-イル-2,2,2-トリフルオロエタノン、7-ブromo-1,10-ジヒドロピロロ[2,3-a]カルバゾール、7-ブromo-1,10-ジヒドロピロロ[2,3-a]カルバゾール-3-カルバルデヒド、7-(2,4-ジフルオロフェニル)-1,10-ジヒドロピロロ[2,3-a]カルバゾール-3-カルバルデヒド、6-ブromo-1,10-ジヒドロピロロ[2,3-a]カルバゾール-3-カルバルデヒド、9-ブromo-1,10-ジヒドロピロロ[2,3-a]カルバゾール-3-カルバルデヒド、7-フルオロ-1,10-ジヒドロピロロ[2,3-a]カルバゾール-3-カルバルデヒド、9-フルオロ-1,10-ジヒドロピロロ[2,3-a]カルバゾール-3-カルバルデヒド、6,8-ジクロロ-1,10-ジヒドロピロロ[2,3-a]カルバゾール-3-カルバルデヒド、9-エチル-1,10-ジヒドロピロロ[2,3-a]カルバゾール-3-カルバルデヒドおよび8-メチル-1,10-ジヒドロピロロ[2,3-a]カルバゾール-3-カルバルデヒドから選択されることを特徴とする、請求項7～9のいずれか一つに記載の化合物。