

【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21年3月12日(2009.3.12)

【公表番号】特表2008-520741(P2008-520741A)

【公表日】平成20年6月19日(2008.6.19)

【年通号数】公開・登録公報2008-024

【出願番号】特願2007-543449(P2007-543449)

【国際特許分類】

C 07 D 209/88 (2006.01)  
C 07 D 495/04 (2006.01)  
A 61 K 31/407 (2006.01)  
A 61 K 31/403 (2006.01)  
C 07 D 403/04 (2006.01)  
A 61 K 31/4035 (2006.01)  
C 07 D 405/12 (2006.01)  
A 61 K 31/5377 (2006.01)  
C 07 D 413/12 (2006.01)  
A 61 K 31/422 (2006.01)  
A 61 K 31/455 (2006.01)  
C 07 D 401/12 (2006.01)  
C 07 D 403/12 (2006.01)  
A 61 K 31/506 (2006.01)  
C 07 D 498/04 (2006.01)  
A 61 K 31/424 (2006.01)  
C 07 D 413/04 (2006.01)  
C 07 D 417/12 (2006.01)  
A 61 K 31/4245 (2006.01)  
A 61 K 31/433 (2006.01)  
C 07 D 403/14 (2006.01)  
C 07 D 307/91 (2006.01)  
C 07 D 487/04 (2006.01)  
A 61 K 31/4162 (2006.01)  
A 61 K 31/4188 (2006.01)  
A 61 K 31/4178 (2006.01)  
C 07 D 409/12 (2006.01)  
A 61 K 31/4184 (2006.01)  
C 07 D 487/06 (2006.01)  
A 61 K 31/4985 (2006.01)  
C 07 D 453/02 (2006.01)  
A 61 K 31/5517 (2006.01)  
A 61 K 31/496 (2006.01)  
A 61 K 31/541 (2006.01)  
A 61 K 31/4192 (2006.01)  
A 61 K 31/4196 (2006.01)  
C 07 D 209/94 (2006.01)  
A 61 P 3/04 (2006.01)  
A 61 P 3/10 (2006.01)  
A 61 P 9/00 (2006.01)  
A 61 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 17/06 (2006.01)  
A 6 1 P 19/02 (2006.01)  
A 6 1 P 27/02 (2006.01)  
A 6 1 P 29/00 (2006.01)  
A 6 1 P 35/00 (2006.01)  
A 6 1 P 43/00 (2006.01)

## 【 F I 】

C 0 7 D 209/88 C S P  
C 0 7 D 495/04 1 0 3  
A 6 1 K 31/407  
A 6 1 K 31/403  
C 0 7 D 403/04  
A 6 1 K 31/4035  
C 0 7 D 405/12  
A 6 1 K 31/5377  
C 0 7 D 413/12  
A 6 1 K 31/422  
A 6 1 K 31/455  
C 0 7 D 401/12  
C 0 7 D 403/12  
A 6 1 K 31/506  
C 0 7 D 498/04 1 0 3  
A 6 1 K 31/424  
C 0 7 D 413/04  
C 0 7 D 417/12  
A 6 1 K 31/4245  
A 6 1 K 31/433  
C 0 7 D 403/14  
C 0 7 D 307/91  
C 0 7 D 487/04 1 3 8  
A 6 1 K 31/4162  
A 6 1 K 31/4188  
A 6 1 K 31/4178  
C 0 7 D 409/12  
A 6 1 K 31/4184  
C 0 7 D 487/06  
A 6 1 K 31/4985  
C 0 7 D 453/02  
A 6 1 K 31/5517  
A 6 1 K 31/496  
A 6 1 K 31/541  
A 6 1 K 31/4192  
A 6 1 K 31/4196  
C 0 7 D 209/94  
A 6 1 P 3/04  
A 6 1 P 3/10  
A 6 1 P 9/00  
A 6 1 P 9/10  
A 6 1 P 17/06  
A 6 1 P 19/02

A 6 1 P 27/02  
 A 6 1 P 29/00  
 A 6 1 P 29/00 1 0 1  
 A 6 1 P 35/00  
 A 6 1 P 43/00 1 1 1

## 【手続補正書】

【提出日】平成21年1月19日(2009.1.19)

## 【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

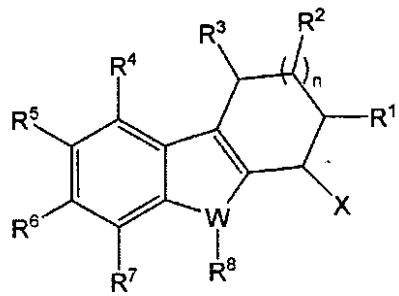
## 【補正の内容】

【特許請求の範囲】

## 【請求項1】

式(I)の化合物、

## 【化1】



式(I)

そのエナンチオマー、ジアステレオマー、薬学的に受容可能な塩、プロドラッグ、溶媒和物またはその混合物であって、

(a) Xは、-NR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>、-N(アルキル)-C(=O)-アリール、-N(アルキル)-C(=O)-ハロゲン置換アリール、オキソ、OR<sup>9</sup>、H、置換もしくは非置換フェニルアミノカルボニル、置換もしくは非置換フェニル、オキシム、置換もしくは非置換アルコキシカルボニル、ヒドロキシカルボニル、または置換もしくは非置換ヘテロ環式環であり；ここで、

R<sup>9</sup>およびR<sup>10</sup>は、各々独立してH、置換もしくは非置換C<sub>1</sub>~<sub>6</sub>アルキル、置換もしくは非置換C<sub>1</sub>~<sub>6</sub>アルコール、置換もしくは非置換カルボニル、置換もしくは非置換単環式もしくは二環式シクロアルキル、置換もしくは非置換単環式もしくは二環式ヘテロ環式環、置換もしくは非置換アリール、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換スルホニル、置換もしくは非置換アリールアルキル、置換もしくは非置換ヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換アミノチオカルボニルであって、ここで、R<sup>9</sup>およびR<sup>10</sup>の少なくとも1つがHであるか、

あるいは、R<sup>9</sup>およびR<sup>10</sup>は、それらが結合する原子と一緒に単環式もしくは二環式ヘテロ環式環を形成し、ここで、少なくとも1つの環が1つまたは2つのヘテロ原子を含み；

(b) R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>およびR<sup>3</sup>は、各々独立して、H、-OH、またはアルキルであって、ここで、R<sup>1</sup>は必要に応じて、Xとともに置換もしくは非置換5員~11員のモノヘテロ環式環またはビヘテロ環式環を形成し得、ここでXがオキソの場合、R<sub>1</sub>がアルキルであるか又はR<sub>5</sub>がハロアルコキシであり；

(c) nは、0、1、または2であって、ここで、nが0の場合、R<sup>2</sup>は、存在せず；

(d) R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>およびR<sup>7</sup>は、各々独立してH、-OH、置換もしくは非置換C<sub>1</sub>

~<sub>6</sub>アルキル、置換もしくは非置換カルボニル、置換もしくは非置換アルコキシ、ハロ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ニトロ、シアノ、置換もしくは非置換ヘテロ環式環、置換もしくは非置換アミノ、置換もしくは非置換フェニル、置換もしくは非置換フェノキシ、置換もしくは非置換シクロアルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、または置換もしくは非置換アルコキカルボニル、またはヒドロキシカルボニルであり；

(e) WはN、O、またはSであり；

(f) R<sup>8</sup>はH、C<sub>1~3</sub>アルキル、置換もしくは非置換シクロアルキル、置換もしくは非置換カルボニルであるか、またはXと一緒に置換もしくは非置換5員~11員の単環式ヘテロ環式環または二環式ヘテロ環式環を形成し、ただし、WがOまたはSである場合、R<sup>8</sup>は、存在せず、かつX、R<sup>9</sup>およびR<sup>10</sup>が、非置換ピロールを形成する場合、R<sup>8</sup>がHならば、R<sup>5</sup>は臭素ではなく、そして、R<sup>8</sup>はXと一緒に、置換もしくは非置換ヘテロ環式環を形成してもよい；

(g) ただし、式Iの化合物は、以下から選択される化合物ではない：

6-ブロモ-1-ピロール-1-イル-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール；

(6-ニトロ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-(4-フェニル-シクロヘキシル)アミン；

3-[(2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イルアミノ)-メチレン]-1,3-ジヒドロ-インドール-2-オン；

アダマンタン-1-イルメチル-(6-メチル-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-アミン；

(4-クロロ-ベンジル)-(6-メチル-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-アミン；

シクロヘキシル-(6-メチル-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-アミン；

8-メチル-3-ニトロソ-2,3,3a,4,5,6-ヘキサヒドロ-1H-ピラジノ[3,2,1-jk]カルバゾール；

3-ベンジル-2,3,3a,4,5,6-ヘキサヒドロ-1H-ピラジノ[3,2,1-jk]カルバゾール；

8-シクロヘキシル-1,2,3a,4,5,6-ヘキサヒドロ-ピラジノ[3,2,1-jk]カルバゾール-3-カルボチオ酸フェニルアミド；

(2,2-ジメトキシ-エチル)-(6-メチル-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-アミン；

8-(1-アザ-ビシクロ[2.2.2]オクタ-2-エン-3-イル)-3-ベンジル-2,3,3a,4,5,6-ヘキサヒドロ-1H-ピラジノ[3,2,1-jk]カルバゾール；

8-イソブトキシ-2,3,3a,4,5,6-ヘキサヒドロ-1H-ピラジノ[3,2,1-jk]カルバゾール；

2-(6-ブロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イルアミノ)-エタノール塩酸塩；

8-メチル-2,3,3a,4,5,6-ヘキサヒドロ-1H-ピラジノ[3,2,1-jk]カルバゾール塩酸塩；

2-[4-(フラン-2-カルボニル)-ピペラジン-1-イル]-1-(8-メチル-1,2,3a,4,5,6-ヘキサヒドロ-ピラジノ[3,2,1-jk]カルバゾール-3-イル)-エタノン；

(2-クロロ-フェニル)-(8-メチル-1,2,3a,4,5,6-ヘキサヒドロ-ピラジノ[3,2,1-jk]カルバゾール-3-イル)-メタノン；

8-メチル-1,2,3a,4,5,6-ヘキサヒドロ-ピラジノ[3,2,1-jk]カルバゾール-3-カルボチオ酸(4-メトキシ-フェニル)-アミド；

11-メチル-1,2,3,3a,4,5,6,7-オクタヒドロ-[1,4]ジアゼビノ[3,2,1-jk]カルバゾール；

N-ベンジル-N-(6-メチル-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-アセトアミド；

1-(8-メチル-1,2,3a,4,5,6-ヘキサヒドロ-ピラジノ[3,2,1-jk]カルバゾール-3-イル)-エタノン；

1-(8-メチル-1,2,3a,4,5,6-ヘキサヒドロ-ピラジノ[3,2,1-jk]カルバゾール-3-イル)-プロパン-2-オール；

3-(6-メチル-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イルアミノ)-プロパン-1-オール；

N-(6-メチル-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-アセトアミド

8-メチル-3-(1-フェニル-エチル)-2,3,3a,4,5,6-ヘキサヒドロ-1H-ピラジノ[3,2,1-jk]カルバゾール；

4-(3-クロロ-ベンジル)-11-メチル-1,2,3,3a,4,5,6,7-オクタヒドロ-[1,4]ジアゼビノ[3,2,1-ijk]カルバゾール；

N-[4-(11-メチル-1,2,3,3a,6,7-ヘキサヒドロ-5H-[1,4]ジアゼピノ[3,2,1-jk]カルバゾール-4-イルメチル)-フェニル]-アセトアミド；

チオ酢酸 S-[3-(8-メチル-1,2,3a,4,5,6-ヘキサヒドロ-ピラジノ[3,2,1-jk]カルバゾール-3-イル)-3-オキソ-プロピル] エステル；

3-(8-シクロヘキシル-1,2,3a,4,5,6-ヘキサヒドロ-ピラジノ[3,2,1-jk]カルバゾール-3-イル)-プロピオニ酸；

3-アセチル-2,3,3a,4,5,6-ヘキサヒドロ-1H-ピラジノ[3,2,1-jk]カルバゾール-8-カルボン酸；

エチル-(6-メチル-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-アミン;

2-(6-ブロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イルアミノ)-エタノール塩酸塩；

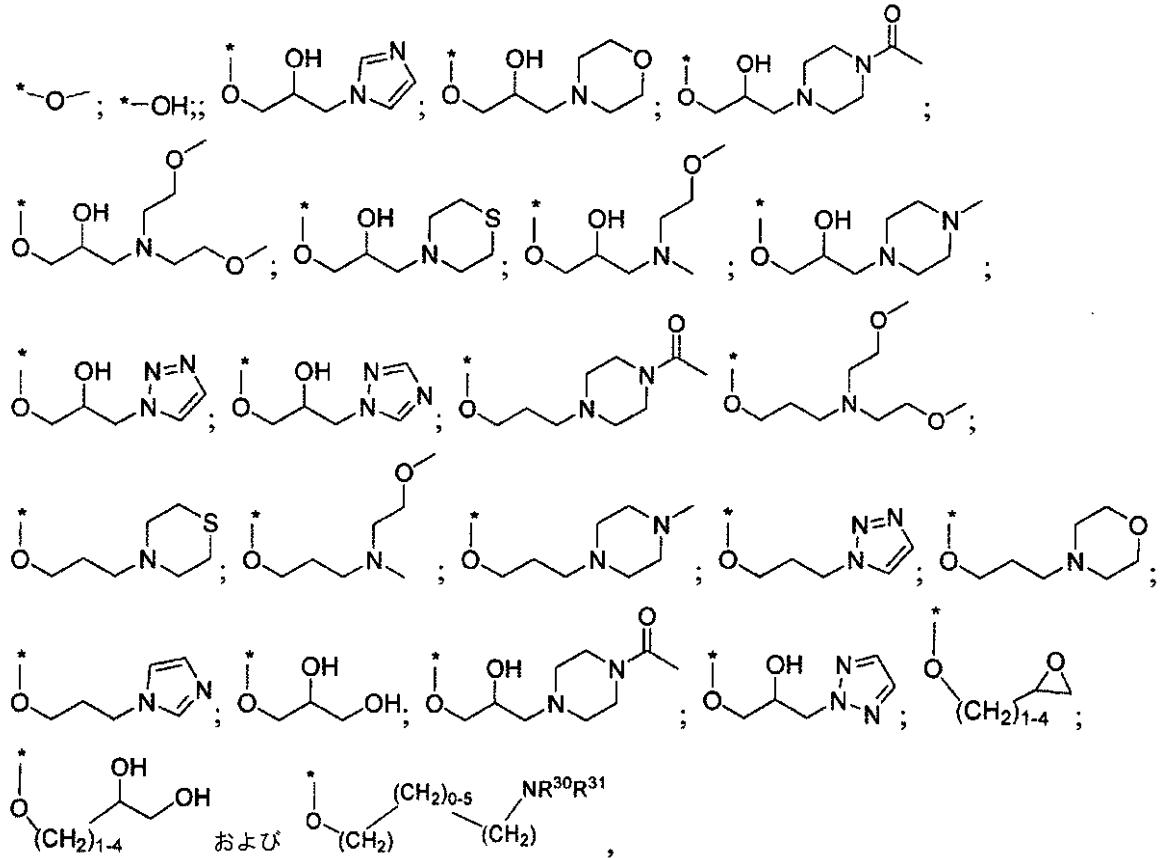
8-(4-メトキシ-フェノキシ)-2,3,3a,4,5,6-ヘキサヒドロ-1H-ピラジノ[3,2,1-jk]カルバゾールメタンスルホン酸；及び、

(Z)-6-プロモ-N-(4-(ジメチルアミノ)ベンジリデン)-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-アミン。

## 【請求項2】

X が、以下：

【化 2 】



からなる群から選択される置換基で置換されたフェニルであり； $R^5$ はBr、Cl又はトリフルオロメチルであり；nは1又は2であり； $R^1$ 、 $R^2$ 及び $R^3$ は各々独立してH又は

- O H であり； R<sup>4</sup>、 R<sup>6</sup>及び R<sup>7</sup>は H であり； W は N であり； R<sup>8</sup>は H 又は C<sub>1~3</sub>アルキルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

X が - N R<sup>9</sup> R<sup>10</sup> であり、ここで、

R<sup>9</sup> および R<sup>10</sup> は、各々独立して H、置換カルボニル、置換もしくは非置換単環式もしくは二環式シクロアルキル、置換もしくは非置換単環式もしくは二環式ヘテロ環式環、置換もしくは非置換アリール、置換もしくは非置換アリールアルキル、置換もしくは非置換ヘテロシクロアルキルであって、ここで、R<sup>9</sup> および R<sup>10</sup> の少なくとも 1 つが H であるか、

あるいは、R<sup>9</sup> および R<sup>10</sup> が、それらが結合する原子と一緒に単環式もしくは二環式ヘテロ環式環を形成し、ここで、少なくとも 1 つの環が 1 つまたは 2 つのヘテロ原子を含む、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 4】

X がオキソ、- O R<sup>9</sup>、置換もしくは非置換フェニルアミノカルボニル、置換もしくは非置換フェニル、オキシム、置換もしくは非置換アルコキシカルボニル、ヒドロキシカルボニル、または置換もしくは非置換ヘテロ環式環である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 5】

以下から選択される化合物、またはそのエナンチオマー、ジアステレオマー、薬学的に受容可能な塩、プロドラッグ、溶媒和物もしくはその混合物：

6 - プロモ - 1 - チエノ [ 2 , 3 - c ] ピロール - 5 - イル - 2 , 3 , 4 , 9 - テトラヒドロ - 1 H - カルバゾール；

( 6 - プロモ - 2 , 3 , 4 , 9 - テトラヒドロ - 1 H - カルバゾール - 1 - イル ) - フェニル - アミン；

( 6 - プロモ - 2 , 3 , 4 , 9 - テトラヒドロ - 1 H - カルバゾール - 1 - イル ) - ( 4 - クロロ - フェニル ) - アミン；

( 6 - プロモ - 2 , 3 , 4 , 9 - テトラヒドロ - 1 H - カルバゾール - 1 - イル ) - ( 4 - メトキシ - フェニル ) - アミン；

5 - ( 6 - プロモ - 2 , 3 , 4 , 9 - テトラヒドロ - 1 H - カルバゾール - 1 - イル ) - 4 , 5 - ジヒドロ - チエノ [ 2 , 3 - c ] ピロール - 6 - オン；

( 6 - プロモ - 2 , 3 , 4 , 9 - テトラヒドロ - 1 H - カルバゾール - 1 - イル ) - ( 4 - トリフルオロメチル - フェニル ) - アミン；

6 - プロモ - 1 - ( 1 , 3 - ジヒドロ - イソインドール - 2 - イル ) - 2 , 3 , 4 , 9 - テトラヒドロ - 1 H - カルバゾール；

( 6 - プロモ - 2 , 3 , 4 , 9 - テトラヒドロ - 1 H - カルバゾール - 1 - イル ) - ( 4 - イソプロピル - フェニル ) - アミン；

( 6 - プロモ - 2 , 3 , 4 , 9 - テトラヒドロ - 1 H - カルバゾール - 1 - イル ) - ( 4 - フェノキシ - フェニル ) - アミン；

( 6 - プロモ - 2 , 3 , 4 , 9 - テトラヒドロ - 1 H - カルバゾール - 1 - イル ) - ( 3 - メトキシ - フェニル ) - アミン；

( 6 - メチル - 2 , 3 , 4 , 9 - テトラヒドロ - 1 H - カルバゾール - 1 - イル ) - フェニル - アミン；

( 6 - プロモ - 2 , 3 , 4 , 9 - テトラヒドロ - 1 H - カルバゾール - 1 - イル ) - ( 3 - フルオロ - フェニル ) - アミン；

1 - ( 6 - プロモ - 1 - ピロール - 1 - イル - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - カルバゾール - 9 - イル ) - エタノン；

フェニル - ( 6 - トリフルオロメチル - 2 , 3 , 4 , 9 - テトラヒドロ - 1 H - カルバゾール - 1 - イル ) - アミン；

6 - プロモ - 1 - フェニル - 2 , 3 , 4 , 9 - テトラヒドロ - 1 H - カルバゾール；

6 - プロモ - 1 - ( 3 - メトキシ - フェニル ) - 2 , 3 , 4 , 9 - テトラヒドロ - 1 H - カルバゾール；

(6-プロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-  
 2-フルオロ-フェニル)-アミン;  
 ベンゾ[1,3]ジオキソール-5-イル-(6-プロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-アミン;  
 (6-プロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-  
 4-トリフルオロメトキシ-フェニル)-アミン;  
 (6-プロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-  
 3-クロロ-フェニル)-アミン;  
 N-(6-プロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)  
 -ベンズアミド;  
 N-(6-プロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)  
 -3-クロロ-ベンズアミド;  
 (6-プロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-  
 3,5-ジメチル-フェニル)-アミン;  
 (6-プロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-  
 4-フルオロ-フェニル)-アミン;  
 2-(6-プロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)  
 -2,3-ジヒドロ-イソインドール-1-オン;  
 1-(6-プロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)  
 -1H-ピロール-3-カルボン酸メチルエステル;  
 (6-プロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-  
 4-フェニル-シクロヘキシル)-アミン;  
 ピフェニル-4-イル-(6-プロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバ  
 ゾール-1-イル)-アミン;  
 (6-プロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-  
 2-クロロ-フェニル)-アミン;  
 N-(6-プロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)  
 -3-フェノキシ-ベンズアミド;  
 (6-プロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-ピ  
 ラジン-2-イル-アミン;  
 (6-プロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-  
 2,3-ジフルオロ-フェニル)-アミン;  
 (2-プロモ-5,6,7,8,9,10-ヘキサヒドロ-シクロヘプタ[b]インド  
 ル-6-イル)-フェニル-アミン;  
 フェニル-(6-トリフルオロメトキシ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カル  
 バゾール-1-イル)-アミン;  
 N-(6-プロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-4-フェノキシ-ベンズア  
 ミド;  
 (6-プロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-(3,4-ジクロロ-フェニル)  
 -アミン;  
 6-クロロ-1-ピロール-1-イル-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール;  
 1-(6-プロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-1H-ピロール-3-カルバ  
 ルデヒド;  
 N-(6-プロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-2,3-ジメトキシ-ベンズ  
 アミド;  
 (6-プロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-(4-モルホリン-4-イル-  
 フェニル)-アミン;  
 2-(6-プロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-イソインドール-1,3-ジ  
 オン;  
 1-(6-プロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-1H-ピロール-3-カルボ

ニトリル；

(5-ブロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-フェニル-アミン；

4-(6-ブロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イルアミノ)-ベンゾニトリル；

(6-ブロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-(2-メトキシ-フェニル)-アミン；

N-(6-ブロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-ベンゼンスルホニアミド；

(7-ブロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-フェニル-アミン；

5,6-ジクロロ-1-ピロール-1-イル-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール；

[1-(6-ブロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-1H-ピロール-3-イルメチル]-フェニル-アミン；

6-ブロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-カルバゾール-1-オン；

(6-ブロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-イソオキサゾール-3-イル-アミン；

N-(6-ブロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-6-クロロ-ニコチンアミド；

6-ブロモ-2,9-ジメチル-2,3,4,9-テトラヒドロ-カルバゾール-1-オン；

6-ブロモ-1-(4-フルオロ-フェノキシ)-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール；

(6-ブロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-(2,3-ジメトキシ-ベンジル)-アミン；

6-メトキシ-1-ピロール-1-イル-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール；

N-[4-(6-ブロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イルアミノ)-フェニル]-アセトアミド；

N-(6-ブロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-ニコチンアミド；

8-ピロール-1-イル-6,7,8,9-テトラヒドロ-5H-カルバゾール-3-カルボニトリル；

6-トリフルオロメチル-2,3,4,9-テトラヒドロ-カルバゾール-1-オン；

N-(6-ブロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-N',N'-ジメチル-ベンゼン-1,4-ジアミン；

ベンゾ[1,3]ジオキソール-5-イルメチル-(6-ブロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-アミン；

2-[3-(6-ブロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イルアミノ)-フェニル]-エタノール；

6-ブロモ-1-(3-モルホリン-4-イルメチル-ピロール-1-イル)-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール；

6-ブロモ-1-(2,5-ジヒドロ-ピロール-1-イル)-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール；

N-(6-ブロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-3-クロロ-N-メチル-ベンズアミド；

(6-ブロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-シクロヘキシリメチル-アミン；

(6-ブロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-フラン-2-イルメチル-アミン；

N-(6-ブロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-N-メチル-ベンズアミド；

6-ブロモ-1-(2,5-ジメチル-ピロール-1-イル)-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール；

6-メチル-2,3,4,9-テトラヒドロ-カルバゾール-1-オン；

(6-ブロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-ブチル-アミン；

6-トリフルオロメトキシ-2,3,4,9-テトラヒドロ-カルバゾール-1-オン；

ピラジン-2-カルボン酸(6-ブロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-ア

ミド;

(6-ブロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-カルバミン酸フェニルエステル;

6-クロロ-2,3,4,9-テトラヒドロ-カルバゾール-1-オン;

(6-ブロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-(テトラヒドロ-フラン-2-イルメチル)-アミン;

7-ブロモ-4,10-ジヒドロ-5H-1-オキサ-2,10-ジアザ-シクロペニタ[a]フルオリン;

(6-ブロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-(3,3-ジメチル-ブチル)-アミン;

6-ブロモ-1-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロ-カルバゾール-9-カルボン酸tert-ブチルエステル;

1-(6-ブロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-3-フェニル-ウレア;

6-ブロモ-9-メチル-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-オール;

6-ブロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-カルバゾール;

6-メトキシ-2,3,4,9-テトラヒドロ-カルバゾール-1-オンオキシム;

6-ブロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-カルボン酸;

1-(6-ブロモ-1,2,3,4-テトラヒドロ-カルバゾール-9-イル)-エタノン;

6-ブロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-カルバゾール-1-オンオキシム;

6-ブロモ-9-メチル-2,3,4,9-テトラヒドロ-カルバゾール-1-オン;

6-ブロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イルアミン;

6-ブロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-カルボン酸エチルエステル;

6-ブロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-カルボン酸フェニルアミド;

7-ブロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-カルバゾール-1-オンオキシム;

6-クロロ-9-メチル-2,3,4,9-テトラヒドロ-カルバゾール-1-オンオキシム;

7-ブロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イルアミン;

6-メトキシ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イルアミン;

6-クロロ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イルアミン;

8-ブロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-カルバゾール-1-オン;

8-ブロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-カルバゾール-1-オンオキシム;

8-ブロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イルアミン;

6-ブロモ-1-(5-メチル-[1,3,4]オキサジアゾール-2-イル)-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール;

ピロール-1-イル-(2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-アミン;

1-ピロール-1-イル-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール;

4-メチル-[1,2,3]チアジアゾール-5-カルボン酸(6-ブロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-アミド;

6-モルホリン-4-イル-1-ピロール-1-イル-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール;

8-ブロモ-2,3-ジヒドロ-1H-ジベンゾフラン-4-オン;

6-ピロリジン-1-イル-1-ピロール-1-イル-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール;

(8-ブロモ-1,2,3,4-テトラヒドロ-ジベンゾフラン-4-イル)-フェニル-アミン;

8-ブロモ-1,2,3,4-テトラヒドロ-ジベンゾフラン-4-オール;

7-ブロモ-1-フェニル-1,4,5,10-テトラヒドロ-1,2,10-トリアザ-シクロペニタ[a]フルオリン;

7-ブロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-カルバゾール-1-オン;

6-ブロモ-1-(5-フェニル-[1,3,4]オキサジアゾール-2-イル)-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール;

7-ブロモ-2-フェニル-2a,3,4,5-テトラヒドロ-2H-2,9b-ジアザ-シクロペニタ[jk]フルオレン-1-オン;

1-(6-ブロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-1H-ピロール-3-カルボン酸;

(6-ブロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-(3-イミダゾール-1-イル-プロピル)-アミン;

8-ピロール-1-イル-6,7,8,9-テトラヒドロ-5H-カルバゾール-3-カルボン酸メチルエステル;

6-ブロモ-1-ピロリジン-1-イル-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール;

6-ブロモ-9-メチル-1-ピロール-1-イル-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール;

8-ブロモ-1-ピロール-1-イル-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール;

8-ピロール-1-イル-6,7,8,9-テトラヒドロ-5H-カルバゾール-3-カルボン酸アミド;

8-ピロール-1-イル-6,7,8,9-テトラヒドロ-5H-カルバゾール-3-カルボン酸;

7-ブロモ-1-ピロール-1-イル-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール;

(6-ブロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-(2-モルホリン-4-イル-エチル)-アミン;

フラン-2-カルボン酸(6-ブロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-アミド;

ベンゾフラン-2-カルボン酸(6-ブロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-アミド;

5-(4-クロロ-フェニル)-フラン-2-カルボン酸(6-ブロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-アミド;

1H-ピロール-2-カルボン酸(6-ブロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-アミド;

1H-インドール-2-カルボン酸(6-ブロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-アミド;

チオフェン-2-カルボン酸(6-ブロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-アミド;

1-ベンゾオキサゾール-2-イル-6-ブロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール;

N-(6-ブロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-4-メトキシ-ベンズアミド;

N-(6-ブロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-4-トリフルオロメチル-ベンズアミド;

N-(6-ブロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-4-シアノ-ベンズアミド;

N-(6-ブロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-2,4-ジフルオロ-ベンズアミド;

N-(6-ブロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-4-クロロ-ベンズアミド;

(4-クロロ-フェニル)-(6-クロロ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-アミン;

(6-クロロ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-(4-メトキシ-フェニル)-アミン;

(6-クロロ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-(4-トリフルオロメチル-フェニル)-アミン;

(4-クロロ-フェニル)-(6-トリフルオロメチル-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-アミン;

(4-メトキシ-フェニル)-(6-トリフルオロメチル-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-アミン;

(4-トリフルオロメチル-フェニル)-(6-トリフルオロメチル-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-アミン;

(6-ブロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-ピリミジン-2-イル-アミン;

1-(1H-ベンゾイミダゾール-2-イル)-6-ブロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール

チオフェン-2-カルボン酸(6-クロロ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-アミド;  
フラン-2-カルボン酸(6-クロロ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-アミド;  
N-(6-クロロ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-4-メトキシ-ベンズアミド;  
5-ニトロ-フラン-2-カルボン酸(6-プロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-アミド;  
シクロプロパンカルボン酸(6-プロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-アミド;  
5-(6-クロロ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-4,5-ジヒドロ-チエノ[2,3-c]ピロール-6-オン;  
1-(6-プロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-1H-ピロール-3-カルバ  
ルデヒド オキシム;  
イソオキサゾール-5-カルボン酸(6-プロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-アミド;  
5-メチル-イソオキサゾール-3-カルボン酸(6-プロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバ  
ゾール-1-イル)-アミド;  
フラン-3-カルボン酸(6-プロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-アミ  
ド;  
チオフェン-3-カルボン酸(6-プロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-  
アミド;  
5-クロロ-チオフェン-2-カルボン酸(6-プロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール  
-1-イル)-アミド;  
1-メチル-1H-ピロール-2-カルボン酸(6-プロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾ  
ール-1-イル)-アミド;  
N-(6-プロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)-5-メチルイソオキサゾ  
ール-3-カルボキサミド;  
6-プロモ-1-(4-メトキシフェニル)-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール;  
4-(6-プロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)フェノール;  
6-プロモ-1-(4-(オキシラン-2-イルメトキシ)フェニル)-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カ  
ルバゾール;  
1-(4-(6-プロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)フェノキシ)-3-(1H-  
イミダゾール-1-イル)プロパン-2-オール;  
1-(4-(6-プロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)フェノキシ)-3-モル  
ホリノプロパン-2-オール;  
1-(4-(3-(4-(6-プロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)フェノキシ)-2  
-ヒドロキシプロピル)ピペラジン-1-イル)エタノン;  
1-(ビス(2-メトキシエチル)アミノ)-3-(4-(6-プロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバ  
ゾール-1-イル)フェノキシ)プロパン-2-オール;  
1-(4-(6-プロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)フェノキシ)-3-チオ  
モルホリノプロパン-2-オール;  
1-(4-(6-プロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)フェノキシ)-3-((2-  
メトキシエチル)(メチル)アミノ)プロパン-2-オール;  
1-(4-(6-プロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)フェノキシ)-3-(4-メ  
チルピペラジン-1-イル)プロパン-2-オール;  
1-(4-(6-プロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)フェノキシ)-3-(1H-1  
,2,3-トリアゾール-1-イル)プロパン-2-オール;  
1-(4-(6-プロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)フェノキシ)-3-(1H-1

,2,4-トリアゾール-1-イル)プロパン-2-オール;  
1-(4-(3-(4-(6-プロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)フェノキシ)プロピル)ピペラジン-1-イル)エタノン;  
3-(4-(6-プロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)フェノキシ)-N,N-ビス(2-メトキシエチル)プロパン-1-アミン;  
4-(3-(4-(6-プロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)フェノキシ)プロピル)チオモルホリン;  
3-(4-(6-プロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)フェノキシ)-N-(2-メトキシエチル)-N-メチルプロパン-1-アミン;  
6-プロモ-1-(4-(3-(4-メチルピペラジン-1-イル)プロポキシ)フェニル)-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール;  
1-(4-(3-(1H-1,2,3-トリアゾール-1-イル)プロポキシ)フェニル)-6-プロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール;  
4-(3-(4-(6-プロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)フェノキシ)プロピル)モルホリン;  
1-(4-(3-(1H-イミダゾール-1-イル)プロポキシ)フェニル)-6-プロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール;  
3-(4-(6-プロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)フェノキシ)プロパン-1,2-ジオール;  
3-(4-(6-クロロ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)フェノキシ)プロパン-1,2-ジオール;  
1-(4-(3-(4-(6-クロロ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)フェノキシ)-2-ヒドロキシプロピル)ピペラジン-1-イル)エタノン;  
1-(4-(6-クロロ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)フェノキシ)-3-モルホリノプロパン-2-オール;  
1-(ビス(2-メトキシエチル)アミノ)-3-(4-(6-クロロ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)フェノキシ)プロパン-2-オール;  
1-(4-(6-クロロ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)フェノキシ)-3-チオモルホリノプロパン-2-オール;  
1-(4-(6-クロロ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)フェノキシ)-3-((2-メトキシエチル)(メチル)アミノ)プロパン-2-オール;  
1-(4-(6-クロロ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)フェノキシ)-3-(4-メチルピペラジン-1-イル)プロパン-2-オール;  
1-(4-(6-クロロ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)フェノキシ)-3-(1H-イミダゾール-1-イル)プロパン-2-オール;  
1-(4-(6-クロロ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)フェノキシ)-3-(1H-1,2,3-トリアゾール-1-イル)プロパン-2-オール;  
1-(4-(6-クロロ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)フェノキシ)-3-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)プロパン-2-オール;  
4-(6-クロロ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)フェノール;  
6-クロロ-1-(4-(オキシラン-2-イルメトキシ)フェニル)-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール;  
1-(4-(2-プロモ-5,6,7,8,9,10-ヘキサヒドロシクロヘプタ[b]インドール-6-イル)フェノキシ)-3-モルホリノプロパン-2-オール;  
1-(4-(2-プロモ-5,6,7,8,9,10-ヘキサヒドロシクロヘプタ[b]インドール-6-イル)フェノキシ)-3-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)プロパン-2-オール;  
1-(4-(6-プロモ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-イル)フェノキシ)-3-(2H-1,2,3-トリアゾール-2-イル)プロパン-2-オール;  
1-(4-(2-クロロ-5,6,7,8,9,10-ヘキサヒドロシクロヘプタ[b]インドール-6-イル)フェノキシ)-3-モルホリノプロパン-2-オール;

2-クロロ-6-(4-メトキシフェニル)-5,6,7,8,9,10-ヘキサヒドロシクロヘプタ[b]インドール；

4-(2-クロロ-5,6,7,8,9,10-ヘキサヒドロシクロヘプタ[b]インドール-6-イル)フェノール；

1-(4-(2-クロロ-5,6,7,8,9,10-ヘキサヒドロシクロヘプタ[b]インドール-6-イル)フェノキシ)-3-(1H-イミダゾール-1-イル)プロパン-2-オール；

1-(4-(2-クロロ-5,6,7,8,9,10-ヘキサヒドロシクロヘプタ[b]インドール-6-イル)フェノキシ)-3-(1H-1,2,3-トリアゾール-1-イル)プロパン-2-オール；

1-(4-(2-クロロ-5,6,7,8,9,10-ヘキサヒドロシクロヘプタ[b]インドール-6-イル)フェノキシ)-3-チオモルホリノプロパン-2-オール；

1-(ビス(2-メトキシエチル)アミノ)-3-(4-(2-クロロ-5,6,7,8,9,10-ヘキサヒドロシクロヘプタ[b]インドール-6-イル)フェノキシ)プロパン-2-オール；

1-(4-(2-クロロ-5,6,7,8,9,10-ヘキサヒドロシクロヘプタ[b]インドール-6-イル)フェノキシ)-3-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)プロパン-2-オール；

6-ブロモ-1-フェニル-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-2-オール；

6-ブロモ-1-p-トリル-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-2-オール；

6-ブロモ-1-(4-クロロフェニル)-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-2-オール；  
及び、

6-ブロモ-1-(4-フルオロフェニル)-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-2-オール

。

#### 【請求項 6】

請求項 1 の化合物、またはその水和物、エナンチオマー、ジアステレオマー、薬学的に受容可能な塩、プロドラッグ、溶媒和物またはその混合物と、薬学的に受容可能な賦形剤とを含む、薬学的組成物。

#### 【請求項 7】

請求項 5 の化合物、またはその水和物、エナンチオマー、ジアステレオマー、薬学的に受容可能な塩、プロドラッグ、溶媒和物またはその混合物と、薬学的に受容可能な賦形剤とを含む、薬学的組成物。

#### 【請求項 8】

V E G F 生成または脈管形成に関連する悪性、虚血性、炎症性、又は免疫性の疾患の治療のための薬物の製造における請求項 1 の化合物の使用であって、疾前記疾患が癌、糖尿病性網膜症、関節リウマチ、乾癬、アテローム性動脈硬化症、肥満症、慢性炎症または渗出性黄斑変性から選択され、かつ前記化合物が V E G F 生成または脈管形成を阻害する、前記使用。

#### 【請求項 9】

V E G F 生成または脈管形成に関連する悪性、虚血性、炎症性、又は免疫性の疾患の治療のための薬物の製造における請求項 5 の化合物の使用であって、疾前記疾患が癌、糖尿病性網膜症、関節リウマチ、乾癬、アテローム性動脈硬化症、肥満症、慢性炎症または渗出性黄斑変性から選択され、かつ前記化合物が V E G F 生成または脈管形成を阻害する、前記使用。

#### 【請求項 10】

V E G F 生成または脈管形成に関連する悪性、虚血性、炎症性、又は免疫性の疾患の治療のための薬物の製造における請求項 6 又は 7 の薬学的組成物の使用であって、疾前記疾患が癌、糖尿病性網膜症、関節リウマチ、乾癬、アテローム性動脈硬化症、肥満症、慢性炎症または渗出性黄斑変性から選択され、かつ前記化合物が V E G F 生成または脈管形成を阻害する、前記使用。