

【公報種別】特許法第17条の2の規定による補正の掲載

【部門区分】第3部門第2区分

【発行日】平成18年4月20日(2006.4.20)

【公表番号】特表2002-518395(P2002-518395A)

【公表日】平成14年6月25日(2002.6.25)

【出願番号】特願2000-554735(P2000-554735)

【国際特許分類】

**C 0 7 D 487/04 (2006.01)**

**A 6 1 K 31/55 (2006.01)**

**A 6 1 P 35/00 (2006.01)**

**A 6 1 P 43/00 (2006.01)**

**C 0 7 D 471/04 (2006.01)**

**C 0 7 D 471/14 (2006.01)**

**C 0 7 D 487/14 (2006.01)**

**C 0 7 D 495/14 (2006.01)**

C 0 7 D 223/12 (2006.01)

C 0 7 D 207/32 (2006.01)

C 0 7 D 213/74 (2006.01)

C 0 7 D 223/16 (2006.01)

C 0 7 D 209/14 (2006.01)

C 0 7 D 333/36 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 487/04 1 5 0

A 6 1 K 31/55

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 43/00 1 1 1

C 0 7 D 471/04 1 2 1

C 0 7 D 471/14 1 0 1

C 0 7 D 487/14

C 0 7 D 495/14

C 0 7 D 471/14

C 0 7 D 223:12

C 0 7 D 207:32

C 0 7 D 213:74

C 0 7 D 487/04

C 0 7 D 223:16

C 0 7 D 209:14

C 0 7 D 495/14

C 0 7 D 223:12

C 0 7 D 209:14

C 0 7 D 333:36

【手続補正書】

【提出日】平成18年2月16日(2006.2.16)

【手続補正1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】特許請求の範囲

【補正方法】変更

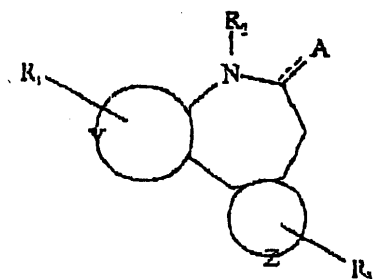
【補正の内容】

## 【特許請求の範囲】

## 【請求項 1】

下記の式で表される化合物：

## 【化 1】



上式で、Aは単結合または二重結合によって環に結合されている酸素または硫黄であり、YおよびZは共役環であり、Y環はアルコキシ、アミノ、アシル、脂肪族、シアノ、ニトロ、カルボキシル、ハロゲン、水素、ヒドロキシル、およびイミノからなる群より選択される置換基R<sub>1</sub>で置換された、少なくとも1個の炭素原子を有し；R<sub>2</sub>は水素、ベンジル、低級アルキル、および低級アルキルエステルからなる群より選択され；Z環は水素、および低級脂肪族からなる群より選択される置換基R<sub>3</sub>を有し；さらに、R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>が水素であり、かつZ環が炭素C<sub>8</sub>~C<sub>11</sub>を有する6員環に縮合した5員環を含む場合、該6員環は炭素原子C<sub>9</sub>およびC<sub>11</sub>の双方に臭素および塩素からなる群より選択される置換基を含むか、または双方に臭素もしくは塩素以外の置換基を含む。

## 【請求項 2】

Aが二重結合の酸素である、請求項 1 記載の化合物。

## 【請求項 3】

Y環が6員環であり、かつZ環が5員環である、請求項 1 記載の化合物。

## 【請求項 4】

Z環が共役6員環に縮合した共役5員環である、請求項 1 記載の化合物。

## 【請求項 5】

R<sub>2</sub>が水素である、請求項 1 記載の化合物。

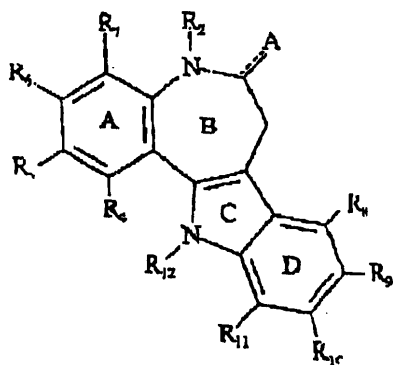
## 【請求項 6】

R<sub>2</sub>が水素であり、Y環がベンゼン環であり、かつZ環が6員環に縮合した5員環である、請求項 2 記載の化合物。

## 【請求項 7】

下記の式をさらに満たす、請求項 1 記載の化合物：

## 【化 2】



上式で、Aは単結合または二重結合によって環に結合されている酸素または硫黄であり；R

$R_2$ は水素、アリール、および低級脂肪族置換基からなる群より選択され； $R_4 \sim R_7$ はアルコキシ、アミノ、アシル、脂肪族、脂肪族アルコール、脂肪族ニトリル、シアノ、ニトロ、カルボキシル、ハロゲン、水素、ヒドロキシル、イミノおよび、不飽和ケトンからなる群より個別に選択され； $R_8 \sim R_{11}$ は脂肪族、脂肪族アルコール、アルコキシ、アシル、シアノ、ニトロ、エポキシ、ハロアルキル基、ハロゲン、水素およびヒドロキシルからなる群より個別に選択され； $R_{12}$ は脂肪族、脂肪族アルコール、カルボン酸、および水素からなる群より選択される。

【請求項 8】

Aが二重結合の酸素である、請求項 7 記載の化合物。

【請求項 9】

$R_2$ がH、 $-\text{CH}_2\text{COOCH}_3$ 、 $-\text{CH}_3$ 、および $-\text{CH}_2\text{Ph}$ からなる群より選択される、請求項 7 記載の化合物。

【請求項 10】

$R_2$ が水素である、請求項 7 記載の化合物。

【請求項 11】

$R_4 \sim R_7$ がアルコキシ、アミノ、アシル、アルキル、アルケニル、アルキニル、シアノ、ニトロ、カルボキシル、ハロゲン、水素、ヒドロキシルおよびイミノ、低級脂肪族アルコール、低級脂肪族ニトリル、ならびに、不飽和ケトンからなる群より個別に選択される、請求項 7 記載の化合物。

【請求項 12】

$R_4 \sim R_7$ が $-\text{H}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{NH})\text{NH}_2$ 、 $-\text{CO}_2\text{H}$ 、 $-\text{Br}$ 、 $-\text{OCH}_3$ 、シアノエチル、3-ヒドロキシ-1-プロピニル、3-オキソ-1-ブテニル、および2-(1-ヒドロキシシクロヘキシル)-エチニルからなる群より個別に選択される、請求項 7 記載の化合物。

【請求項 13】

$R_8 \sim R_{11}$ がアルコール、アルコキシ、アシル、アルキル、アルケニル、アルキニル、シアノ、ニトロ、エポキシ、ハロアルキル、ハロゲン、水素、およびヒドロキシルからなる群より個別に選択される、請求項 7 記載の化合物。

【請求項 14】

$R_8 \sim R_{11}$ が $-\text{H}$ 、ハロゲン、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{CH}_2\text{OH}$ 、 $-\text{CH}_2\text{CHOCH}_2$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CHOCH}_2$ 、 $-\text{CF}_3$ および $-\text{OCH}_3$ からなる群より個別に選択される、請求項 7 記載の化合物。

【請求項 15】

$R_{12}$ がアルコール、シアノ、ニトロ、カルボン酸、水素および低級アルキル基からなる群より選択される、請求項 7 記載の化合物。

【請求項 16】

$R_{12}$ が $-\text{H}$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OH}$ 、 $-\text{CH}_3$ および $-\text{CH}_2\text{CH}_3$ からなる群より選択される、請求項 7 記載の化合物。

【請求項 17】

10-プロモ-7,12-ジヒドロ-インドロ[3,2-d][1]ベンズアゼピン-6(5H)-オン、8-プロモ-6,11-ジヒドロ-チエノ[3',2':2,3アゼピノ[4,5-b]インドール-5(4H)-オン、9-プロモ-7,12-ジヒドロ-4-メトキシ-インドロ[3,2-d][1]ベンズアゼピン-6(5H)-オン、9-プロモ-7,12-ジヒドロ-4-ヒドロキシ-インドロ[3,2-d][1]ベンズアゼピン-6(5H)-オン、7,12-ジヒドロ-4-メトキシ-インドロ[3,2-d][1]ベンズアゼピン-6(5H)-オン、9-プロモ-7,12-ジヒドロ-2,3-ジメトキシ-インドロ[3,2-d][1]ベンズアゼピン-6(5H)-オン、9-プロモ-7,12-ジヒドロ-2,3-ジヒドロキシ-インドロ[3,2-d][1]ベンズアゼピン-6(5H)-オン、7,12-ジヒドロ-2,3-ジメトキシ-インドロ[3,2-d][1]ベンズアゼピン-6(5H)-オン、7,12-ジヒドロ-9-トリフルオロメチル-インドロ[3,2-d][1]ベンズアゼピン-6(5H)-オン、7,12-ジヒドロ-2,3-ジメトキシ-9-トリフルオロメチル-インドロ[3,2-d][1]ベンズアゼピン-6(5H)-オン、2-プロモ-7,12-ジヒドロ-9-トリフルオロメチル-インドロ[3,2-d][1]ベンズアゼピン-6(5H)-オン、9-プロモ-7,12-ジヒドロ-インドロ[3,2-d][1]ベンズアゼピン-6(5H)-チオン、9-プ

ロモ-5,12-ビス-(*t*-ブチルオキシカルボニル)-7,12-ジヒドロ-インドロ[3,2-*d*][1]ベンズアゼピン-6(5H)-オン、9-ブロモ-12-(*t*-ブチルオキシカルボニル)-7,12-ジヒドロ-インドロ[3,2-*d*][1]ベンズアゼピン-6(5H)-オン、9-ブロモ-5,7-ビス-(*t*-ブチルオキシカルボニル)-7,12-ジヒドロ-インドロ[3,2-*d*][1]ベンズアゼピン-6(5H)-オン、9-ブロモ-5,7,12-トリ-(*t*-ブチルオキシカルボニル)-7,12-ジヒドロ-インドロ[3,2-*d*][1]ベンズアゼピン-6(5H)-オン、9-ブロモ-7,12-ジヒドロ-5-メチルオキシカルボニルメチル-インドロ[3,2-*d*][1]ベンズアゼピン-6(5H)-オン、9-ブロモ-7,12-ジヒドロ-12-メチルオキシカルボニルメチル-インドロ[3,2-*d*][1]ベンズアゼピン-6(5H)-オン、9-ブロモ-7,12-ジヒドロ-12-(2-ヒドロキシエチル)-インドロ[3,2-*d*][1]ベンズアゼピン-6(5H)-オン、2,9-ジブロモ-7,12-ジヒドロ-インドロ[3,2-*d*][1]ベンズアゼピン-6(5H)-オン、8,10-ジクロロ-7,12-ジヒドロ-インドロ[3,2-*d*][1]ベンズアゼピン-6(5H)-オン、9-シアノ-7,12-ジヒドロ-インドロ[3,2-*d*][1]ベンズアゼピン-6(5H)-オン、9-ブロモ-7,12-ジヒドロ-5-メチル-インドロ[3,2-*d*][1]ベンズアゼピン-6(5H)-オン、5-ベンジル-9-ブロモ-7,12-ジヒドロ-5-メチル-インドロ[3,2-*d*][1]ベンズアゼピン-6(5H)-オン、9-ブロモ-7,12-ジヒドロ-12-メチル-インドロ[3,2-*d*][1]ベンズアゼピン-6(5H)-オン、9-ブロモ-12-エチル-7,12-ジヒドロ-インドロ[3,2-*d*][1]ベンズアゼピン-6(5H)-オン、9-ブロモ-7,12-ジヒドロ-12-(2-プロペニル)-インドロ[3,2-*d*][1]ベンズアゼピン-6(5H)-オン、7,12-ジヒドロ-9-メチル-インドロ[3,2-*d*][1]ベンズアゼピン-6(5H)-オン、7,12-ジヒドロ-9-メトキシ-インドロ[3,2-*d*][1]ベンズアゼピン-6(5H)-オン、9-フルオロ-7,12-ジヒドロ-12-(2-プロペニル)-インドロ[3,2-*d*][1]ベンズアゼピン-6(5H)-オン、9-ブロモ-7,12-ジヒドロ-2-(メチルイミノアミン)-インドロ[3,2-*d*][1]ベンズアゼピン-6(5H)-オン、9-ブロモ-7,12-ジヒドロ-2-(カルボン酸)-インドロ[3,2-*d*][1]ベンズアゼピン-6(5H)-オン、9-ブロモ-7,12-ジヒドロ-10-ヒドロキシ-インドロ[3,2-*d*][1]ベンズアゼピン-6(5H)-オン、9-ブロモ-7,12-ジヒドロ-11-ヒドロキシメチル-インドロ[3,2-*d*][1]ベンズアゼピン-6(5H)-オン、7,12-ジヒドロ-4-ヒドロキシ-インドロ[3,2-*d*][1]ベンズアゼピン-6(5H)-オンおよび7,12-ジヒドロ-2,3-ジヒドロキシ-インドロ[3,2-*d*][1]ベンズアゼピン-6(5H)-オン、2,3-ジメトキシ-9-ニトロ-7,12-ジヒドロ-インドロ[3,2-*d*][1]ベンズアゼピン-6(5H)-オン、9-シアノ-7,12-ジヒドロ-インドロ[3,2-*d*][1]ベンズアゼピン-6(5H)-オン、2,3-ジメトキシ,9-シアノ-7,12-ジヒドロ-インドロ[3,2-*d*][1]ベンズアゼピン-6(5H)-オン、9-ニトロ-7,12-ジヒドロ-インドロ[3,2-*d*][1]ベンズアゼピン-6(5H)-オン、3-(6-オキソ-9-トリフルオロメチル-5,6,7,12-テトラヒドロ-インドロ[3,2-*d*][1]ベンズアゼピン-2-イル)-プロピオニトリル、2-ブロモ-9-ニトロ-7,12-ジヒドロ-インドロ[3,2-*d*][1]ベンズアゼピン-6(5H)-オン、3-(6-オキソ-9-トリフルオロメチル-5,6,7,12-テトラヒドロ-インドロ[3,2-*d*][1]ベンズアゼピン-2-イル)-アクリロニトリル、2-(3-ヒドロキシ-1-プロピニル),9-トリフルオロメチル-7,12-ジヒドロ-インドロ[3,2-*d*][1]ベンズアゼピン-6(5H)-オン、2-ヨード-9-ブロモ-7,12-ジヒドロ-インドロ[3,2-*d*][1]ベンズアゼピン-6(5H)-オン、2-(3-オキソ-1-ブテニル),9-トリフルオロメチル-7,12-テトラヒドロ-インドロ[3,2-*d*][1]ベンズアゼピン-6(5H)-オン、8-クロロ-6,11-ジヒドロ-チエノ[3',2':2,3]アゼピノ[4,5-*b*]インドール-5(4H)-オン、2-ヨード,9-トリフルオロメチル-7,12-ジヒドロ-インドロ[3,2-*d*][1]ベンズアゼピン-6(5H)-オン、7,12-ジヒドロ-ピリド[3',2':4,5]ピロロ[3,2-*d*][1]ベンズアゼピン-6(5H)-オン、11-メチル-7,12-ジヒドロ-インドロ[3,2-*d*][1]ベンズアゼピン-6(5H)-オン、2-[2-(1-ヒドロキシシクロヘキシル)-エチニル],9-トリフルオロメチル-7,12-ジヒドロ-インドロ[3,2-*d*][1]ベンズアゼピン-6(5H)-オン、2-シアノ-7,12-ジヒドロ-インドロ[3,2-*d*][1]ベンズアゼピン-6(5H)-オン、2-ヨード-7,12-ジヒドロ-インドロ[3,2-*d*][1]ベンズアゼピン-6(5H)-オン、11-エチル-7,12-ジヒドロ-インドロ[3,2-*d*][1]ベンズアゼピン-6(5H)-オン、8-メチル-6,11-ジヒドロ-チエノ[3',2':2,3]アゼピノ[4,5-*b*]インドール-5(4H)-オン、3-(6-オキソ-9-トリフルオロメチル-5,6,7,12-テトラヒドロ-インドロ[3,2-*d*][1]ベンズアゼピン-2-イル)アクリル酸メチルエステルからなる群より選択される、請求項7記載の化合物。

【請求項18】

9-シアノ-7,12-ジヒドロ-インドロ[3,2-d][1]ベンズアゼピン-6(5H)-オン、9-ブromo-7,12-ジヒドロ-2,3-ジメトキシ-インドロ[3,2-d][1]ベンズアゼピン-6(5H)-オン、2-ブromo-7,12-ジヒドロ-9-トリフルオロメチル-インドロ[3,2-d][1]ベンズアゼピン-6(5H)-オン、7,12-ジヒドロ-2,3-ジメトキシ-9-トリフルオロメチル-インドロ[3,2-d][1]ベンズアゼピン-6(5H)-オン、2,9-ジブromo-7,12-ジヒドロ-インドロ[3,2-d][1]ベンズアゼピン-6(5H)-オン、7,12-ジヒドロ-9-トリフルオロメチル-インドロ[3,2-d][1]ベンズアゼピン-6(5H)-オン、8-ブromo-6,11-ジヒドロ-チエノ[3',2':2,3]アゼピノ[4,5-b]インドール-5(4H)-オン、7,12-ジヒドロ-9-メトキシ-インドロ[3,2-d][1]ベンズアゼピン-6(5H)-オン、10-ブromo-7,12-ジヒドロ-インドロ[3,2-d][1]ベンズアゼピン-6(5H)-オン、9-フルオロ-7,12-ジヒドロ-インドロ[3,2-d][1]ベンズアゼピン-6(5H)-オン、9-メチル-7,12-ジヒドロ-インドロ[3,2-d][1]ベンズアゼピン-6(5H)-オン、9-ブromo-7,12-ジヒドロ-インドロ[3,2-d][1]ベンズアゼピン-6(5H)-チオン、8,10-ジクロロ-7,12-ジヒドロ-インドロ[3,2-d][1]ベンズアゼピン-6(5H)-オン、9-ブromo-7,12-ジヒドロ-12-(2-ヒドロキシエチル)-インドロ[3,2-d][1]ベンズアゼピン-6(5H)-オン、9-ブromo-7,12-ジヒドロ-2,3-ジヒドロキシ-インドロ[3,2-d][1]ベンズアゼピン-6(5H)-オン、7,12-ジヒドロ-2,3-ジメトキシ-インドロ[3,2-d][1]ベンズアゼピン-6(5H)-オン、9-ブromo-7,12-ジヒドロ-12-メチル-インドロ[3,2-d][1]ベンズアゼピン-6(5H)-オン、9-ブromo-7,12-ジヒドロ-5-メチルオキシカルボニルメチル-インドロ[3,2-d][1]ベンズアゼピン-6(5H)-オンおよび7,12-ジヒドロ-インドロ[3,2-d][1]ベンズアゼピン-6(5H)-オンからなる群より選択される、請求項7記載の化合物。

【請求項19】

9-シアノ-7,12-ジヒドロ-インドロ[3,2-d][1]ベンズアゼピン-6(5H)-オン、9-ブromo-7,12-ジヒドロ-2,3-ジメトキシ-インドロ[3,2-d][1]ベンズアゼピン-6(5H)-オン、2-ブromo-7,12-ジヒドロ-9-トリフルオロメチル-インドロ[3,2-d][1]ベンズアゼピン-6(5H)-オン、7,12-ジヒドロ-2,3-ジメトキシ-9-トリフルオロメチル-インドロ[3,2-d][1]ベンズアゼピン-6(5H)-オン、2,9-ジブromo-7,12-ジヒドロ-インドロ[3,2-d][1]ベンズアゼピン-6(5H)-オン、7,12-ジヒドロ-9-トリフルオロメチル-インドロ[3,2-d][1]ベンズアゼピン-6(5H)-オン、9-クロロ-7,12-ジヒドロ-インドロ[3,2-d][1]ベンズアゼピン-6(5H)-オン、8-ブromo-6,11-ジヒドロ-チエノ[3',2':2,3]アゼピノ[4,5-b]インドール-5(4H)-オン、7,12-ジヒドロ-9-メトキシ-インドロ[3,2-d][1]ベンズアゼピン-6(5H)-オンからなる群より選択される、請求項7記載の化合物。

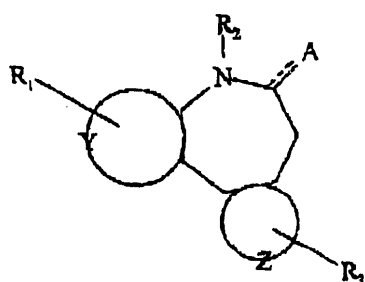
【請求項20】

9-ニトロ-7,12-ジヒドロ-インドロ[3,2-d][1]ベンズアゼピン-6(5H)-オンである、請求項7記載の化合物。

【請求項21】

下記の式1の化合物の有効な量を含む組成物：

【化3】



式 1

上式で、Aは単結合または二重結合によって環に結合されている酸素または硫黄であり、YおよびZは共役環であり、Y環はアルコキシ、アミノ、アシル、脂肪族、シアノ、ニトロ、

カルボキシル、ハロゲン、水素、ヒドロキシル、およびイミノからなる群より選択される置換基 $R_1$ で置換された、少なくとも1個の炭素原子を有し； $R_2$ は水素、ベンジル、低級アルキル、および低級アルキルエステルからなる群より選択され；Z環は水素、および低級脂肪族からなる群より選択される置換基 $R_3$ を有し；さらに、 $R_1$ および $R_2$ が水素であり、かつZ環が炭素 $C_8 \sim C_{11}$ を有する6員環に縮合した5員環を含む場合、該6員環は炭素原子 $C_9$ および $C_{11}$ の双方に臭素および塩素からなる群より選択される置換基を含むか、または双方に臭素もしくは塩素以外の置換基を含む。

【請求項 2 2】

Aが酸素に二重結合されている、請求項 2 1 記載の組成物。

【請求項 2 3】

Y環が6員環であり、かつZ環が5員環である、請求項 2 1 記載の組成物。

【請求項 2 4】

Z環が6員環に縮合した5員環である、請求項 2 1 記載の組成物。

【請求項 2 5】

$R_2$ が水素である、請求項 2 1 記載の組成物。

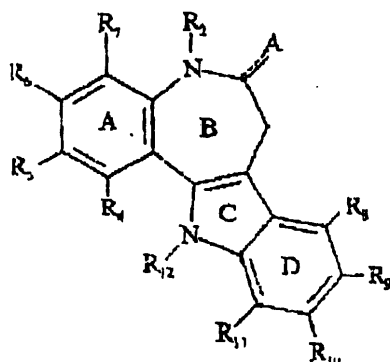
【請求項 2 6】

$R_2$ が水素であり、Y環がベンゼン環であり、かつZ環が6員環に縮合した5員環である、請求項 2 1 記載の組成物。

【請求項 2 7】

下記の式をさらに満たす、請求項 2 1 記載の組成物：

【化 4】



上式で、Aは単結合または二重結合によって環に結合されている酸素または硫黄であり； $R_2$ は水素、アリール、および低級脂肪族置換基からなる群より選択され； $R_4 \sim R_7$ はアルコキシ、アミノ、アシル、脂肪族、脂肪族アルコール、脂肪族ニトリル、シアノ、ニトロ、カルボキシル、ハロゲン、水素、ヒドロキシル、イミノおよび、不飽和ケトンからなる群より個別に選択され； $R_8 \sim R_{11}$ は脂肪族、脂肪族アルコール、アルコキシ、アシル、シアノ、ニトロ、エポキシ、ハロアルキル基、ハロゲン、水素およびヒドロキシルからなる群より個別に選択され； $R_{12}$ は脂肪族、脂肪族アルコール、カルボン酸、および水素からなる群より選択される。

【請求項 2 8】

Aが酸素に二重結合されている、請求項 2 7 記載の組成物。

【請求項 2 9】

$R_2$ がH、 $-\text{CH}_2\text{COOCH}_3$ 、 $-\text{CH}_3$ 、および $-\text{CH}_2\text{Ph}$ からなる群より選択される、請求項 2 7 記載の組成物。

【請求項 3 0】

$R_2$ が水素である、請求項 2 7 記載の組成物。

【請求項 3 1】

$R_4 \sim R_7$ がアルコキシ、アミノ、アシル、アルキル、アルケニル、アルキニル、シアノ、ニ

トロ、カルボキシル、ハロゲン、水素、ヒドロキシル、イミノ、低級脂肪族アルコール、低級脂肪族ニトリル、および、不飽和ケトンからなる群より個別に選択される、請求項 2.7 記載の組成物。

【請求項 3.2】

$R_4 \sim R_7$  が -H、-OH、 $-C(=NH)NH_2$ 、 $-CO_2H$ 、-Br、 $-OCH_3$ 、シアノエチル、3-ヒドロキシ-1-プロピニル、3-オキソ-1-ブテニル、および 2-(1-ヒドロキシシクロヘキシル)-エチニルからなる群より個別に選択される、請求項 2.7 記載の組成物。

【請求項 3.3】

$R_8 \sim R_{11}$  がアルコール、アルコキシ、アシル、アルキル、アルケニル、アルキニル、シアノ、ニトロ、エポキシ、ハロアルキル、ハロゲン、水素、ヒドロキシル、および低級アルキルからなる群より個別に選択される、請求項 2.7 記載の組成物。

【請求項 3.4】

$R_8 \sim R_{11}$  が -H、ハロゲン、-OH、 $-CH_2OH$ 、 $-CH_2CHOCH_2$ 、 $-CH_2CH_2CHOCH_2$ 、 $-CF_3$  および  $-OCH_3$  からなる群より個別に選択される、請求項 2.7 記載の組成物。

【請求項 3.5】

$R_{12}$  がアルコール、カルボン酸、水素および低級アルキル基からなる群より選択される、請求項 2.7 記載の組成物。

【請求項 3.6】

$R_{12}$  が -H、 $-CH_2CH_2OH$ 、 $-CH_3$  および  $-CH_2CH_3$  からなる群より選択される、請求項 2.7 記載の組成物。

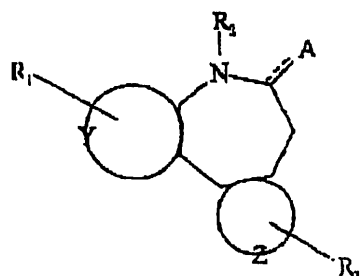
【請求項 3.7】

不活性担体、賦形剤、診断薬、直接圧縮結合剤、緩衝剤、安定化剤、充填剤、崩壊剤、着香剤、着色剤、潤滑剤、他の活性成分、薬学的組成物の調合において都合よく用いられる他の物質、およびその混合物をさらに含む、請求項 2.7 記載の組成物。

【請求項 3.8】

対象者における生細胞の増殖を阻害する方法であって、下記の式 1 の化合物、または該化合物を含む組成物を提供する段階と、対象者における生細胞の増殖を阻害するために、該化合物、または該化合物を含む組成物の有効な量を対象者に投与する段階とを含む方法：

【化 5】



上式で、Aは単結合または二重結合によって環に結合されている酸素または硫黄であり、YおよびZは共役環であり、Y環はアルコキシ、アミノ、アシル、脂肪族、シアノ、ニトロ、カルボキシル、ハロゲン、水素、ヒドロキシル、およびイミノからなる群より選択される置換基 $R_1$ で置換された、少なくとも1個の炭素原子を有し； $R_2$ は水素、ベンジル、低級アルキル、および低級アルキルエステルからなる群より選択され；Z環は水素、および低級脂肪族置換基からなる群より選択される置換基 $R_3$ を有し；さらに、 $R_1$ および $R_2$ が水素であり、Z環が6員環に縮合した5員環を含む場合、該6員環は臭素以外の置換基を含む。

【請求項 3.9】

投与の段階が化合物または組成物を局所、経口、筋肉内、鼻腔内、皮下、腹腔内、病巣内または静脈内に投与することを含む、請求項 3.8 記載の方法。

## 【請求項 4 0】

有効な量が化合物の約0.1グラムから約3.0グラムを含む、請求項 3 8 記載の方法。

## 【請求項 4 1】

有効な量が1回の投与につき対象者の体重1kgあたり約30mgから約400mgを含む、請求項 3 8 記載の方法。

## 【請求項 4 2】

Aが二重結合の酸素である、請求項 3 8 記載の方法。

## 【請求項 4 3】

Y環が6員環であり、かつZ環が5員環である、請求項 3 8 記載の方法。

## 【請求項 4 4】

Z環が共役6員環に縮合した共役5員環である、請求項 3 8 記載の方法。

## 【請求項 4 5】

R<sub>2</sub>が水素である、請求項 3 8 記載の方法。

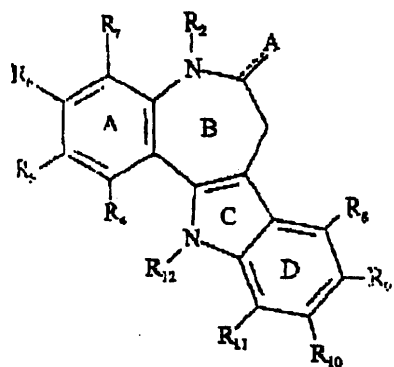
## 【請求項 4 6】

R<sub>2</sub>が水素であり、Y環がベンゼン環であり、かつZ環が共役6員環に縮合した5員環である、請求項 3 8 記載の方法。

## 【請求項 4 7】

化合物が下記の式をさらに満たす、請求項 3 8 記載の方法：

## 【化 6】



上式で、Aは単結合または二重結合によって右に結合されている酸素または硫黄であり；R<sub>2</sub>は水素、アリール、低級脂肪族からなる群より選択され；R<sub>4</sub>～R<sub>7</sub>はアルコキシ、アミノ、アシル、脂肪族、脂肪族アルコール、脂肪族ニトリル、シアノ、ニトロ、カルボキシル、ハロゲン、水素、ヒドロキシル、イミノおよび、不飽和ケトンからなる群より個別に選択され；R<sub>8</sub>～R<sub>11</sub>は脂肪族、脂肪族アルコール、アルコキシ、アシル、シアノ、ニトロ、エポキシ、ハロアルキル基、ハロゲン、水素およびヒドロキシルからなる群より個別に選択され；R<sub>12</sub>は脂肪族、脂肪族アルコール、カルボン酸、および水素からなる群より選択される。

## 【請求項 4 8】

Aが酸素である、請求項 4 7 記載の方法。

## 【請求項 4 9】

R<sub>2</sub>がH、-CH<sub>2</sub>COOCH<sub>3</sub>、-CH<sub>3</sub>、および-CH<sub>2</sub>Phからなる群より選択される、請求項 4 7 記載の方法。

## 【請求項 5 0】

R<sub>2</sub>が水素である、請求項 4 7 記載の方法。

## 【請求項 5 1】

R<sub>4</sub>～R<sub>7</sub>がアルコキシ、アミノ、カルボキシル、ハロゲン、水素、ヒドロキシル、イミノ、

低級脂肪族アルコール、低級脂肪族ニトリル、および、不飽和ケトンからなる群より個別に選択される、請求項 4 7 記載の方法。

【請求項 5 2】

$R_4 \sim R_7$  が -H、-OH、 $-C(=NH)NH_2$ 、 $-CO_2H$ 、-Br、 $-OCH_3$ 、シアノエチル、3-ヒドロキシ-1-プロピニル、3-オキソ-1-ブテニル、および 2-(1-ヒドロキシシクロヘキシル)-エチニルからなる群より個別に選択される、請求項 4 7 記載の方法。

【請求項 5 3】

$R_8 \sim R_{11}$  がアルコール、アルコキシ、エポキシ、ハロアルキル基、ハロゲン、水素、ヒドロキシル、および低級アルキル基からなる群より個別に選択される、請求項 4 7 記載の方法。

【請求項 5 4】

$R_8 \sim R_{11}$  が -H、ハロゲン、-OH、 $-CH_2OH$ 、 $-CH_2CHOCH_2$ 、 $-CH_2CH_2CHOCH_2$ 、 $-CF_3$  および  $-OCH_3$  からなる群より個別に選択される、請求項 4 7 記載の方法。

【請求項 5 5】

$R_{12}$  がアルコール、カルボン酸、水素および低級アルキル基からなる群より選択される、請求項 4 7 記載の方法。

【請求項 5 6】

$R_{12}$  が -H、 $-CH_2CH_2OH$ 、 $-CH_3$  および  $-CH_2CH_3$  からなる群より選択される、請求項 4 7 記載の方法。

【請求項 5 7】

細胞が過増殖性である、請求項 3 8 記載の方法。

【請求項 5 8】

細胞が新生物である、請求項 3 8 記載の方法。

【請求項 5 9】

細胞が悪性腫瘍である、請求項 3 8 記載の方法。

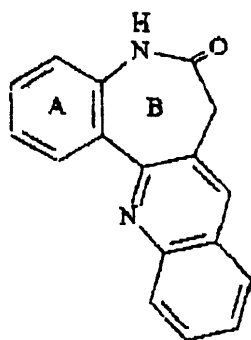
【請求項 6 0】

8-プロモ-6,11-ジヒドロ-チエノ[3',2':2,3]アゼピノ[4,5-b]インドール-5(4H)-オン、8-トリフルオロメチル-6,11-ジヒドロ-チエノ[3',2':2,3]アゼピノ[4,5-b]インドール-5(4H)-オン、8-クロロ-6,11-ジヒドロ-チエノ[3',2':2,3]アゼピノ[4,5-b]インドール-5(4H)-オン、8-メチル-6,11-ジヒドロ-チエノ[3',2':2,3]アゼピノ[4,5-b]インドール-5(4H)-オン、からなる群より選択される、請求項 1 記載の化合物。

【請求項 6 1】

下記の式を有する、請求項 1 記載の化合物：

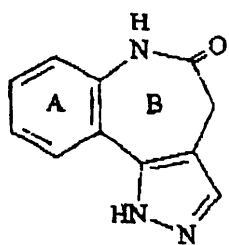
【化 7】



【請求項 6 2】

下記の式を有する、請求項 1 記載の化合物：

【化 8】



【請求項 6 3】

下記の式を有する、請求項 1 記載の化合物：

【化 9】

