

【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6月29日(2006.6.29)

【公表番号】特表2005-529090(P2005-529090A)

【公表日】平成17年9月29日(2005.9.29)

【年通号数】公開・登録公報2005-038

【出願番号】特願2003-579827(P2003-579827)

【国際特許分類】

C 0 7 D 239/94 (2006.01)

A 6 1 K 31/505 (2006.01)

A 6 1 K 31/517 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

A 6 1 K 31/553 (2006.01)

A 6 1 P 1/00 (2006.01)

A 6 1 P 1/04 (2006.01)

A 6 1 P 1/16 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

A 6 1 P 11/06 (2006.01)

A 6 1 P 11/08 (2006.01)

A 6 1 P 27/16 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/08 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

C 0 7 D 401/12 (2006.01)

C 0 7 D 401/14 (2006.01)

C 0 7 D 403/12 (2006.01)

C 0 7 D 405/12 (2006.01)

C 0 7 D 405/14 (2006.01)

C 0 7 D 413/12 (2006.01)

C 0 7 D 413/14 (2006.01)

C 0 7 D 491/08 (2006.01)

C 0 7 D 498/08 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 239/94

A 6 1 K 31/505

A 6 1 K 31/517

A 6 1 K 31/5377

A 6 1 K 31/553

A 6 1 P 1/00

A 6 1 P 1/04

A 6 1 P 1/16

A 6 1 P 11/00

A 6 1 P 11/06

A 6 1 P 11/08

A 6 1 P 27/16

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 37/08

A 6 1 P 43/00

C 0 7 D 401/12

C 0 7 D 401/14
 C 0 7 D 403/12
 C 0 7 D 405/12 C S P
 C 0 7 D 405/14
 C 0 7 D 413/12
 C 0 7 D 413/14
 C 0 7 D 491/08
 C 0 7 D 498/08

【手続補正書】

【提出日】平成18年3月23日(2006.3.23)

【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

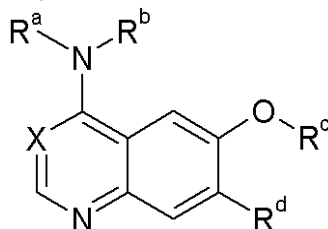
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

一般式

【化1】



(I)

の二環式複素環グループ、それらの互変異性体、それらの立体異性体、それらの混合物又はそれらの塩。

〔式中、

R^a は水素原子又は C_{1-4} -アルキル基を表し、

R^b はフェニル基又は1-フェニルエチル基を表し、そのフェニル核は夫々の場合に基 $R^1 \sim R^3$ により置換されており、

R^1 及び R^2 (これらは同じであってもよく、また異なってもよい)は夫々の場合に水素原子、フッ素原子、塩素原子、臭素原子又はヨウ素原子、

C_{1-4} -アルキル基、ヒドロキシ基、 C_{1-4} -アルコキシ基、 C_{2-3} -アルケニル基又は C_{2-3} -アルキニル基、

アリール基、アリールオキシ基、アリールメチル基又はアリールメトキシ基、

ヘテロアリール基、ヘテロアリールオキシ基、ヘテロアリールメチル基又はヘテロアリールメトキシ基、

1~3個のフッ素原子により置換されたメチル基もしくはメトキシ基又は

シアノ基、ニトロ基又はアミノ基を表し、かつ

R^3 は水素原子、フッ素原子、塩素原子もしくは臭素原子又は

メチル基もしくはトリフルオロメチル基を表し、

R^c はシクロブチル基、シクロペンチル基又はシクロヘキシル基〔これは夫々の場合に基 R^4-N-R^5 により置換されており、

R^4 は水素原子又は C_{1-3} -アルキル基を表し、かつ

R^5 は水素原子又は C_{1-3} -アルキル基、

アミノカルボニル- C_{1-3} -アルキル基、 C_{1-3} -アルキルアミノカルボニル- C_{1-3} -アルキル

基、ジ-(C_{1-3} -アルキル)アミノカルボニル- C_{1-3} -アルキル基、ピロリジン-1-イルカルボニル- C_{1-3} -アルキル基、ピペリジン-1-イルカルボニル- C_{1-3} -アルキル基、ホモピペリジン-1-イルカルボニル- C_{1-3} -アルキル基、モルホリン-4-イルカルボニル- C_{1-3} -アルキル基、ホモモルホリン-4-イルカルボニル- C_{1-3} -アルキル基、ピペラジン-1-イルカルボニル- C_{1-3} -アルキル基、4- C_{1-3} -アルキル-ピペラジン-1-イルカルボニル- C_{1-3} -アルキル基、ホモピペラジン-1-イルカルボニル- C_{1-3} -アルキル基又は4- C_{1-3} -アルキル-ホモピペラジン-1-イルカルボニル- C_{1-3} -アルキル基、

ヒドロキシ- C_{2-4} -アルキル基、 C_{1-3} -アルキルオキシ- C_{2-4} -アルキル基、 C_{1-4} -アルキルオキシ-カルボニルアミノ- C_{2-4} -アルキル基、アミノ- C_{2-4} -アルキル基、 C_{1-3} -アルキルアミノ- C_{2-4} -アルキル基、ジ-(C_{1-3} -アルキル)アミノ- C_{2-4} -アルキル基、 C_{1-3} -アルキルカルボニルアミノ- C_{2-4} -アルキル基、アミノカルボニルアミノ- C_{2-4} -アルキル基、 C_{1-3} -アルキルアミノカルボニルアミノ- C_{2-4} -アルキル基、ジ-(C_{1-3} -アルキル)アミノ-カルボニルアミノ- C_{2-4} -アルキル基、ピロリジン-1-イルカルボニルアミノ- C_{2-4} -アルキル基、ピペリジン-1-イルカルボニルアミノ- C_{2-4} -アルキル基、モルホリン-4-イルカルボニルアミノ- C_{2-4} -アルキル基、 C_{1-3} -アルキルスルホニル- C_{2-4} -アルキル基又は C_{1-3} -アルキルスルホニルアミノ- C_{2-4} -アルキル基、

(2-オキソ-ピロリジン-1-イル)- C_{2-4} -アルキル基、(2-オキソピペリジン-1-イル)- C_{2-4} -アルキル基、(3-オキソ-モルホリン-4-イル)- C_{2-4} -アルキル基、(2-オキソ-イミダゾリジン-1-イル)- C_{2-4} -アルキル基、(2-オキソ-3- C_{1-3} -アルキル-イミダゾリジン-1-イル)- C_{2-4} -アルキル基、(2-オキソ-ヘキサヒドロピリミジン-1-イル)- C_{2-4} -アルキル基又は(2-オキソ-3- C_{1-3} -アルキル-ヘキサヒドロピリミジン-1-イル)- C_{2-4} -アルキル基、

C_{1-4} -アルキルスルホニル基、クロロ- C_{1-4} -アルキルスルホニル基、プロモ- C_{1-4} -アルキルスルホニル基、アミノ- C_{1-4} -アルキルスルホニル基、 C_{1-3} -アルキルアミノ- C_{1-4} -アルキルスルホニル基、ジ-(C_{1-3} -アルキル)アミノ- C_{1-4} -アルキルスルホニル基、(ピロリジン-1-イル)- C_{1-4} -アルキルスルホニル基、(ピペリジン-1-イル)- C_{1-4} -アルキルスルホニル基、(ホモピペリジン-1-イル)- C_{1-4} -アルキルスルホニル基、(モルホリン-4-イル)- C_{1-4} -アルキル-スルホニル基、(ホモモルホリン-4-イル)- C_{1-4} -アルキルスルホニル基、(ピペラジン-1-イル)- C_{1-4} -アルキルスルホニル基、(4- C_{1-3} -アルキル-ピペラジン-1-イル)- C_{1-4} -アルキルスルホニル基、(ホモピペラジン-1-イル)- C_{1-4} -アルキルスルホニル基又は(4- C_{1-3} -アルキル-ホモピペラジン-1-イル)- C_{1-4} -アルキルスルホニル基、

C_{1-4} -アルキルオキシカルボニル基、

ホルミル基、 C_{1-4} -アルキル-カルボニル基、 C_{1-3} -アルキルオキシ- C_{1-4} -アルキル-カルボニル基、テトラヒドロフラニルカルボニル基、テトラヒドロピラニルカルボニル基、アミノ- C_{1-4} -アルキルカルボニル基、 C_{1-3} -アルキルアミノ- C_{1-4} -アルキル-カルボニル基、ジ-(C_{1-3} -アルキル)アミノ- C_{1-4} -アルキル-カルボニル基、ピロリジン-1-イル- C_{1-4} -アルキル-カルボニル基、ピペリジン-1-イル- C_{1-4} -アルキル-カルボニル基、(ホモピペリジン-1-イル)- C_{1-4} -アルキル-カルボニル基、モルホリン-4-イル- C_{1-4} -アルキル-カルボニル基、(ホモモルホリン-4-イル)- C_{1-4} -アルキル-カルボニル基、(ピペラジン-1-イル)- C_{1-4} -アルキル-カルボニル基、(4- C_{1-3} -アルキル-ピペラジン-1-イル)- C_{1-4} -アルキル-カルボニル基、(ホモピペラジン-1-イル)- C_{1-4} -アルキル-カルボニル基、(4- C_{1-3} -アルキル-ホモピペラジン-1-イル)- C_{1-4} -アルキル-カルボニル基又は C_{1-3} -アルキルスルホニル- C_{1-4} -アルキル-カルボニル基、

シアノ基、アミノカルボニル基、 C_{1-3} -アルキル-アミノカルボニル基、ジ-(C_{1-3} -アルキル)アミノ-カルボニル基、(C_{1-3} -アルキルオキシ- C_{2-4} -アルキル)アミノカルボニル基、N-(C_{1-3} -アルキル)-N-(C_{1-3} -アルキルオキシ- C_{2-4} -アルキル)アミノカルボニル基、アリアルアミノカルボニル基、ピロリジン-1-イルカルボニル基、ピペリジン-1-イルカルボニル基、ホモピペリジン-1-イルカルボニル基、モルホリン-4-イルカルボニル基、ホモモルホリン-4-イルカルボニル基、2-オキサ-5-アザ-ピシクロ〔2.2.1〕ヘプト-5-イルカルボニル基、3-オキサ-8-アザ-ピシクロ〔3.2.1〕オクト-8-イルカルボニル基、8-オキサ-3

-アザ-ピシクロ〔3.2.1〕オクト-3-イルカルボニル基、ピペラジン-1-イルカルボニル基、4- C_{1-3} -アルキル-ピペラジン-1-イルカルボニル基、ホモピペラジン-1-イルカルボニル基、4- C_{1-3} -アルキル-ホモピペラジン-1-イルカルボニル基、アミノスルホニル基、 C_{1-3} -アルキル-アミノスルホニル基、ジ-(C_{1-3} -アルキル)アミノ-スルホニル基、ピロリジン-1-イル-スルホニル基、ピペリジン-1-イルスルホニル基、ホモピペリジン-1-イルスルホニル基、モルホリン-4-イルスルホニル基、ホモモルホリン-4-イルスルホニル基、ピペラジン-1-イルスルホニル基、4- C_{1-3} -アルキル-ピペラジン-1-イルスルホニル基、ホモピペラジン-1-イルスルホニル基又は4- C_{1-3} -アルキル-ホモピペラジン-1-イルスルホニル基を表す)、

シクロブチル基、シクロペンチル基又はシクロヘキシル基(これは夫々の場合に基 R^6 により置換されており、

R^6 は2-オキソ-ピロリジン-1-イル基、2-オキソピペリジン-1-イル基、3-オキソ-モルホリン-4-イル基、2-オキソ-イミダゾリジン-1-イル基、2-オキソ-3- C_{1-3} -アルキル-イミダゾリジン-1-イル基、2-オキソ-ヘキサヒドロピリミジン-1-イル基又は2-オキソ-3- C_{1-3} -アルキル-ヘキサヒドロピリミジン-1-イル基を表す)、

アゼチジン-3-イル基(これは1位で基 R^5 により置換されており、 R^5 は先に定義されたとおりである)、

ピロリジン-3-イル基(これは1位で基 R^5 により置換されており、 R^5 は先に定義されたとおりである)、

ピペリジン-3-イル基(これは1位で基 R^5 により置換されており、 R^5 は先に定義されたとおりである)、

ピペリジン-4-イル基(これは1位で基 R^5 により置換されており、 R^5 は先に定義されたとおりである)、又は

テトラヒドロフラン-3-イル基、テトラヒドロピラン-3-イル基もしくはテトラヒドロピラン-4-イル基を表し、

R^d は水素原子又はフッ素原子、塩素原子もしくは臭素原子、ヒドロキシ基、

C_{1-4} -アルキルオキシ基、

1~3個のフッ素原子により置換されたメトキシ基、

1~5個のフッ素原子により置換されたエチルオキシ基、

基 R^6 又は R^7 により置換されている C_{2-4} -アルキルオキシ基(R^6 は先に定義されたとおりであり、かつ

R^7 はヒドロキシ基、 C_{1-3} -アルキルオキシ基、 C_{3-6} -シクロアルキルオキシ基、アミノ基、 C_{1-3} -アルキルアミノ基、ジ-(C_{1-3} -アルキル)アミノ基、ビス-(2-メトキシエチル)-アミノ基、ピロリジン-1-イル基、ピペリジン-1-イル基、ホモピペリジン-1-イル基、モルホリン-4-イル基、ホモモルホリン-4-イル基、2-オキサ-5-アザ-ピシクロ〔2.2.1〕ヘプト-5-イル基、3-オキサ-8-アザ-ピシクロ〔3.2.1〕オクト-8-イル基、8-オキサ-3-アザ-ピシクロ〔3.2.1〕オクト-3-イル基、ピペラジン-1-イル基、4- C_{1-3} -アルキル-ピペラジン-1-イル基、ホモピペラジン-1-イル基もしくは C_{1-3} -アルキル-ホモピペラジン-1-イル基、又は

ホルミルアミノ基、 C_{1-4} -アルキルカルボニルアミノ基、 C_{1-3} -アルキルオキシ- C_{1-3} -アルキル-カルボニルアミノ基、 C_{1-4} -アルキルオキシカルボニルアミノ基、アミノカルボニルアミノ基、 C_{1-3} -アルキルアミノカルボニルアミノ基、ジ-(C_{1-3} -アルキル)アミノカルボニルアミノ基、ピロリジン-1-イルカルボニルアミノ基、ピペリジン-1-イルカルボニルアミノ基、ピペラジン-1-イルカルボニルアミノ基、4- C_{1-3} -アルキル-ピペラジン-1-イルカルボニルアミノ基、モルホリン-4-イルカルボニルアミノ基もしくは C_{1-4} -アルキルスルホニルアミノ基を表す)、

C_{3-7} -シクロアルキルオキシ基又は C_{3-7} -シクロアルキル- C_{1-4} -アルキルオキシ基、

テトラヒドロフラン-3-イルオキシ基、テトラヒドロピラン-3-イルオキシ基又はテトラヒドロピラン-4-イルオキシ基、

テトラヒドロフラン- C_{1-4} -アルキルオキシ基又はテトラヒドロピラニル- C_{1-4} -アルキルオキシ基、

C_{1-4} -アルコキシ基（これは1位で基 R^8 により置換されたピロリジニル基、ピペリジニル基又はホモピペリジニル基により置換されており、

R^8 は水素原子又は C_{1-3} -アルキル基を表す）、又は

C_{1-4} -アルコキシ基（これは4位で基 R^8 により置換されたモルホリニル基により置換されており、 R^8 は先に定義されたとおりである）

を表し、かつ

Xはシアノ基により置換されたメチン基又は窒素原子を表し、

上記基の定義に記載されたアリール基は夫々の場合に R^9 により一置換又は二置換されているフェニル基を意味し、これらの置換基は同じであってもよく、また異なってもよく、また

R^9 は水素原子、フッ素原子、塩素原子、臭素原子もしくはヨウ素原子又は C_{1-3} -アルキル基、ヒドロキシ基、 C_{1-3} -アルキルオキシ基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、ジフルオロメトキシ基、トリフルオロメトキシ基もしくはシアノ基を表し、

上記基の定義に記載されたヘテロアリール基はピリジル基、ピリダジニル基、ピリミジニル基又はピラジニル基を意味し、上記ヘテロアリール基は夫々基 R^9 により一置換又は二置換されており、これらの置換基は同じであってもよく、また異なってもよく、また R^9 は先に定義されたとおりであり、かつ

上記ピロリジニル基、ピペリジニル基、ピペラジニル基及びモルホリニル基は夫々の場合に1個又は2個の C_{1-3} -アルキル基により置換されていてもよく、かつ

特にことわらない限り、上記アルキル基は直鎖であってもよく、また分岐していてもよく、

但し、化合物4-〔(3-クロロ-4-フルオロ-フェニル)アミノ〕-6-((S)-テトラヒドロフラン-3-イルオキシ)-7-ヒドロキシ-キナゾリンが除かれることを条件とする〕

【請求項2】

R^a が水素原子を表し、

R^b が基 $R^1 \sim R^3$ により置換されたフェニル基を表し、

R^1 が水素原子、フッ素原子、塩素原子又は臭素原子、メチル基、トリフルオロメチル基又はエチニル基、

フェニルオキシ基又はフェニルメトキシ基（上記基のフェニル部分は必要によりフッ素原子又は塩素原子により置換されていてもよい）、又は

ピリジルオキシ基又はピリジニルメトキシ基（上記基のピリジニル部分は必要によりメチル基又はトリフルオロメチル基により置換されていてもよい）

を表し、

R^2 が水素原子、フッ素原子もしくは塩素原子又はメチル基を表し、かつ

R^3 が水素原子を表し、

R^c がシクロペンチル基〔これは3位で基 R^4 -N- R^5 により置換されており、

R^4 は水素原子又は C_{1-3} -アルキル基を表し、かつ

R^5 は水素原子又は C_{1-3} -アルキル基、

アミノカルボニル- C_{1-3} -アルキル基、 C_{1-3} -アルキルアミノカルボニル- C_{1-3} -アルキル基、ジ-(C_{1-3} -アルキル)アミノカルボニル- C_{1-3} -アルキル基、ピロリジン-1-イルカルボニル- C_{1-3} -アルキル基、ピペリジン-1-イルカルボニル- C_{1-3} -アルキル基、ピペラジン-1-イルカルボニル- C_{1-3} -アルキル基、4- C_{1-3} -アルキル-ピペラジン-1-イル-カルボニル- C_{1-3} -アルキル基又はモルホリン-4-イルカルボニル- C_{1-3} -アルキル基、

ヒドロキシ- C_{2-4} -アルキル基、 C_{1-3} -アルキルオキシ- C_{2-4} -アルキル基、 C_{1-4} -アルキルオキシ-カルボニルアミノ- C_{2-4} -アルキル基、アミノ- C_{2-4} -アルキル基、 C_{1-3} -アルキルアミノ- C_{2-4} -アルキル基、ジ-(C_{1-3} -アルキル)アミノ- C_{2-4} -アルキル基、 C_{1-3} -アルキルカルボニルアミノ- C_{2-4} -アルキル基、アミノカルボニルアミノ- C_{2-4} -アルキル基、 C_{1-3} -アルキルアミノカルボニルアミノ- C_{2-4} -アルキル基、ジ-(C_{1-3} -アルキル)アミノ-カルボニル

ルアミノ-C₂₋₄-アルキル基、モルホリン-4-イルカルボニルアミノ-C₂₋₄-アルキル基、C₁₋₃-アルキルスルホニル-C₂₋₄-アルキル基又はC₁₋₃-アルキルスルホニルアミノ-C₂₋₄-アルキル基、

(2-オキソ-ピロリジン-1-イル)-C₂₋₄-アルキル基、(2-オキソピペリジン-1-イル)-C₂₋₄-アルキル基、(3-オキソ-モルホリン-4-イル)-C₂₋₄-アルキル基、(2-オキソ-イミダゾリジン-1-イル)-C₂₋₄-アルキル基、(2-オキソ-3-メチル-イミダゾリジン-1-イル)-C₂₋₄-アルキル基、(2-オキソ-ヘキサヒドロピリミジン-1-イル)-C₂₋₄-アルキル基又は(2-オキソ-3-メチル-ヘキサヒドロピリミジン-1-イル)-C₂₋₄-アルキル基、

C₁₋₃-アルキルスルホニル基、クロロ-C₂₋₄-アルキルスルホニル基、プロモ-C₂₋₄-アルキルスルホニル基、アミノ-C₂₋₄-アルキルスルホニル基、C₁₋₃-アルキルアミノ-C₂₋₄-アルキルスルホニル基、ジ-(C₁₋₃-アルキル)アミノ-C₂₋₄-アルキルスルホニル基、(ピロリジン-1-イル)-C₂₋₄-アルキルスルホニル基、(ピペリジン-1-イル)-C₂₋₄-アルキルスルホニル基又は(モルホリン-4-イル)-C₂₋₄-アルキルスルホニル基、

C₁₋₄-アルキルオキシ-カルボニル基、

ホルミル基、C₁₋₃-アルキル-カルボニル基、C₁₋₃-アルキルオキシ-C₁₋₃-アルキル-カルボニル基、テトラヒドロフランカルボニル基、テトラヒドロピランカルボニル基、アミノ-C₁₋₃-アルキルカルボニル基、C₁₋₃-アルキルアミノ-C₁₋₃-アルキル-カルボニル基、ジ-(C₁₋₃-アルキル)アミノ-C₁₋₃-アルキル-カルボニル基、ピロリジン-1-イル-C₁₋₃-アルキル-カルボニル基、ピペリジン-1-イル-C₁₋₃-アルキル-カルボニル基、ピペラジン-1-イル-C₁₋₃-アルキル-カルボニル基、4-C₁₋₃-アルキル-ピペラジン-1-イル-C₁₋₃-アルキル-カルボニル基、モルホリン-4-イル-C₁₋₃-アルキル-カルボニル基又はC₁₋₃-アルキルスルホニル-C₁₋₃-アルキル-カルボニル基、

シアノ基、アミノカルボニル基、C₁₋₃-アルキル-アミノカルボニル基、ジ-(C₁₋₃-アルキル)アミノ-カルボニル基、(C₁₋₃-アルキルオキシ-C₂₋₄-アルキル)アミノカルボニル基、N-(C₁₋₃-アルキル)-N-(C₁₋₃-アルキルオキシ-C₂₋₄-アルキル)アミノカルボニル基、フェニルアミノカルボニル基、ピロリジン-1-イルカルボニル基、ピペリジン-1-イルカルボニル基、モルホリン-4-イルカルボニル基、C₁₋₃-アルキル-モルホリン-4-イルカルボニル基、ジ-(C₁₋₃-アルキル)モルホリン-4-イルカルボニル基、ホモモルホリン-4-イルカルボニル基、2-オキサ-5-アザ-ピシクロ〔2.2.1〕ヘプト-5-イルカルボニル基、3-オキサ-8-アザ-ピシクロ〔3.2.1〕オクト-8-イルカルボニル基、8-オキサ-3-アザ-ピシクロ〔3.2.1〕オクト-3-イルカルボニル基、ピペラジン-1-イルカルボニル基、4-(C₁₋₃-アルキル)-ピペラジン-1-イルカルボニル基、アミノスルホニル基、C₁₋₃-アルキル-アミノスルホニル基、ジ-(C₁₋₃-アルキル)アミノ-スルホニル基、ピロリジン-1-イル-スルホニル基、ピペリジン-1-イルスルホニル基又はモルホリン-4-イルスルホニル基を表す)、又は

シクロペンチル基(これは3位で基R⁶により置換されており、

R⁶は2-オキソ-ピロリジン-1-イル基、2-オキソピペリジン-1-イル基、3-オキソ-モルホリン-4-イル基、2-オキソ-イミダゾリジン-1-イル基、2-オキソ-3-メチル-イミダゾリジン-1-イル基、2-オキソ-ヘキサヒドロピリミジン-1-イル基又は2-オキソ-3-メチル-ヘキサヒドロピリミジン-1-イル基を表す)、

シクロヘキシル基(これは3位又は4位で基R⁴-N-R⁵により置換されており、R⁴及びR⁵は先に定義されたとおりである)、

シクロヘキシル基(これは3位又は4位で基R⁶により置換されており、R⁶は先に定義されたとおりである)、

ピロリジン-3-イル基(これは1位で基R⁵により置換されており、R⁵は先に定義されたとおりである)、

ピペリジン-3-イル基(これは1位で基R⁵により置換されており、R⁵は先に定義されたとおりである)、

ピペリジン-4-イル基(これは1位で基R⁵により置換されており、R⁵は先に定義されたとおりである)、又は

テトラヒドロフラン-3-イル基、テトラヒドロピラン-3-イル基もしくはテトラヒドロピ

ラン-4-イル基を表し、

R^d が水素原子、

C_{1-3} -アルキルオキシ基、

1 ~ 3 個のフッ素原子により置換されているメトキシ基、

2 位で基 R^6 又は R^7 により置換されているエチルオキシ基

(R^6 は先に定義されたとおりであり、かつ

R^7 はヒドロキシ基、 C_{1-3} -アルキルオキシ基、アミノ基、 C_{1-3} -アルキルアミノ基、ジ-(C_{1-3} -アルキル)アミノ基、ビス-(2-メトキシエチル)-アミノ基、ピロリジン-1-イル基、ピペリジン-1-イル基、モルホリン-4-イル基、ホモモルホリン-4-イル基、2-オキサ-5-アザ-ピシクロ〔2.2.1〕ヘプト-5-イル基、3-オキサ-8-アザ-ピシクロ〔3.2.1〕オクト-8-イル基、8-オキサ-3-アザ-ピシクロ〔3.2.1〕オクト-3-イル基、ピペラジン-1-イル基又は4- C_{1-3} -アルキル-ピペラジン-1-イル基、又は

ホルミルアミノ基、 C_{1-4} -アルキルカルボニルアミノ基、 C_{1-3} -アルキルオキシ- C_{1-3} -アルキル-カルボニルアミノ基、 C_{1-4} -アルキルオキシカルボニルアミノ基、アミノカルボニルアミノ基、 C_{1-3} -アルキルアミノカルボニルアミノ基、ジ-(C_{1-3} -アルキル)アミノカルボニルアミノ基、ピロリジン-1-イルカルボニルアミノ基、ピペリジン-1-イルカルボニルアミノ基、ピペラジン-1-イルカルボニルアミノ基、4- C_{1-3} -アルキル-ピペラジン-1-イルカルボニルアミノ基、モルホリン-4-イルカルボニルアミノ基もしくは C_{1-4} -アルキルスルホニルアミノ基を表す)、

プロピルオキシ基 (これは3位で基 R^6 又は R^7 により置換されており、 R^6 及び R^7 は先に定義されたとおりである)、又は

ブチルオキシ基 (これは4位で基 R^6 又は R^7 により置換されており、 R^6 及び R^7 は先に定義されたとおりである)

を表し、かつ

X が窒素原子を表し、

特にことわらない限り、上記アルキル基は直鎖であってもよく、また分岐していてもよい、請求項1記載の一般式Iの二環式複素環グループ、それらの互変異性体、それらの立体異性体、それらの混合物又はそれらの塩。

【請求項3】

R^a が水素原子を表し、

R^b が3-エチルフェニル基、3-ブromoフェニル基、3,4-ジフルオロフェニル基又は3-クロロ-4-フルオロ-フェニル基、

3-クロロ-4-ベンジルオキシ-フェニル基、3-クロロ-4-〔(3-フルオロ-ベンジル)オキシ〕-フェニル基、4-(ピリジン-3-イルオキシ)-フェニル基、4-〔(6-メチル-ピリジン-3-イル)オキシ〕-フェニル基、3-メチル-4-(ピリジン-3-イルオキシ)-フェニル基、3-メチル-4-〔(6-メチル-ピリジン-3-イル)オキシ〕-フェニル基、3-クロロ-4-(ピリジン-3-イルオキシ)-フェニル基又は3-クロロ-4-〔(6-メチル-ピリジン-3-イル)オキシ〕-フェニル基を表し、

R^c がシクロヘキシル基 (これは3位又は4位で基 R^4 -N- R^5 により置換されており、

R^4 が水素原子、メチル基又はエチル基を表し、かつ

R^5 が水素原子、メチル基、アミノカルボニルメチル基、メチルアミノカルボニルメチル基、ジメチルアミノカルボニルメチル基、ピロリジン-1-イルカルボニルメチル基、ピペリジン-1-イルカルボニルメチル基、ピペラジン-1-イルカルボニルメチル基、4-メチルピペラジン-1-イルカルボニルメチル基、モルホリン-4-イルカルボニルメチル基、2-(モルホリン-4-イル-カルボニル)エチル基又は3-(モルホリン-4-イル-カルボニル)プロピル基

、エチル基、プロピル基、2-ヒドロキシエチル基、3-ヒドロキシプロピル基、2-メトキシエチル基、3-メトキシプロピル基、2-(ブチルオキシカルボニルアミノ)-エチル基、2-アミノエチル基、3-アミノプロピル基、2-(アセチルアミノ)エチル基、3-(アセチルアミノ)プロピル基、2-(エチルカルボニルアミノ)エチル基、3-(エチルカルボニルアミノ)プロピル

ル基、2-(プロピルカルボニルアミノ)エチル基、3-(プロピルカルボニルアミノ)プロピル基、2-(エチルアミノカルボニルアミノ)エチル基、3-(エチルアミノカルボニルアミノ)プロピル基、2-(ジメチルアミノカルボニルアミノ)エチル基、3-(ジメチルアミノカルボニルアミノ)プロピル基、2-(モルホリン-4-イルカルボニルアミノ)エチル基、3-(モルホリン-4-イルカルボニルアミノ)プロピル基、2-(メチルスルホニル)エチル基、3-(メチルスルホニル)プロピル基、2-(メチルスルホニルアミノ)エチル基又は3-(メチルスルホニルアミノ)プロピル基、

2-(2-オキソ-ピロリジン-1-イル)エチル基、2-(2-オキソピペリジン-1-イル)エチル基、2-(3-オキソモルホリン-4-イル)エチル基、2-(2-オキソ-イミダゾリジン-1-イル)エチル基、2-(2-オキソ-3-メチル-イミダゾリジン-1-イル)エチル基、2-(2-オキソ-ヘキサヒドロピリミジン-1-イル)エチル基又は2-(2-オキソ-3-メチル-ヘキサヒドロピリミジン-1-イル)エチル基、

3-(2-オキソ-ピロリジン-1-イル)プロピル基、3-(2-オキソピペリジン-1-イル)プロピル基、3-(3-オキソモルホリン-4-イル)プロピル基、3-(2-オキソ-イミダゾリジン-1-イル)プロピル基、3-(2-オキソ-3-メチル-イミダゾリジン-1-イル)プロピル基、3-(2-オキソ-ヘキサヒドロピリミジン-1-イル)プロピル基又は3-(2-オキソ-3-メチル-ヘキサヒドロピリミジン-1-イル)プロピル基、

メチルスルホニル基、エチルスルホニル基、3-クロロプロピルスルホニル基、2-(モルホリン-4-イル)-エチルスルホニル基又は3-(モルホリン-4-イル)-プロピルスルホニル基

、
プロピルオキシカルボニル基又はブチルオキシカルボニル基、

ホルミル基、アセチル基、エチルカルボニル基、プロピルカルボニル基、メトキシアセチル基、(2-メトキシエチル)カルボニル基、(3-メトキシプロピル)カルボニル基、テトラヒドロフラン-2-イルカルボニル基、テトラヒドロピラン-4-イルカルボニル基、アミノアセチル基、メチルアミノアセチル基、ジメチルアミノアセチル基、モルホリン-4-イルアセチル基、〔2-(モルホリン-4-イル)エチル〕カルボニル基、〔3-(モルホリン-4-イル)プロピル〕カルボニル基又はメチルスルホニルアセチル基、

シアノ基、アミノカルボニル基、メチルアミノカルボニル基、ジメチルアミノカルボニル基、エチルアミノカルボニル基、ジエチルアミノカルボニル基、プロピルアミノカルボニル基、(2-メトキシエチル)アミノカルボニル基、N-メチル-N-(2-メトキシエチル)-アミノカルボニル基、(3-メトキシプロピル)アミノカルボニル基、N-メチル-N-(3-メトキシプロピル)-アミノカルボニル基、フェニルアミノカルボニル基、ピロリジン-1-イルカルボニル基、ピペリジン-1-イルカルボニル基、モルホリン-4-イルカルボニル基、2-メチルモルホリン-4-イルカルボニル基、2,6-ジメチルモルホリン-4-イルカルボニル基、ホモモルホリン-4-イルカルボニル基、2-オキサ-5-アザ-ピシクロ〔2.2.1〕ヘプト-5-イルカルボニル基、3-オキサ-8-アザ-ピシクロ〔3.2.1〕オクト-8-イルカルボニル基、8-オキサ-3-アザ-ピシクロ〔3.2.1〕オクト-3-イルカルボニル基、4-メチルピペラジン-1-イルカルボニル基、アミノスルホニル基、メチルアミノスルホニル基、ジメチルアミノスルホニル基又はモルホリン-4-イルスルホニル基を表す)、

シクロヘキシル基(これは3位又は4位で基 R^6 により置換されており、

R^6 は2-オキソ-ピロリジン-1-イル基、2-オキソピペリジン-1-イル基、3-オキソ-モルホリン-4-イル基、2-オキソ-イミダゾリジン-1-イル基、2-オキソ-3-メチル-イミダゾリジン-1-イル基、2-オキソ-ヘキサヒドロピリミジン-1-イル基又は2-オキソ-3-メチル-ヘキサヒドロピリミジン-1-イル基を表す)、

ピロリジン-3-イル基(これは1位で基 R^5 により置換されており、 R^5 は先に定義されたとおりである)、

ピペリジン-3-イル基(これは1位で基 R^5 により置換されており、 R^5 は先に定義されたとおりである)、

ピペリジン-4-イル基(これは1位で基 R^5 により置換されており、 R^5 は先に定義されたとおりである)、

テトラヒドロフラン-3-イル基、テトラヒドロピラン-3-イル基又はテトラヒドロピラン-4-イル基を表し、

R^d が水素原子、

メトキシ基、ジフルオロメトキシ基又はエチルオキシ基、

エチルオキシ基（これは2位で基 R^6 又は R^7 により置換されており、

R^6 は先に定義されたとおりであり、かつ

R^7 はヒドロキシ基、メトキシ基、エトキシ基、アミノ基、ジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基、ビス-(2-メトキシエチル)-アミノ基、ピロリジン-1-イル基、ピペリジン-1-イル基、モルホリン-4-イル基、ホモモルホリン-4-イル基、2-オキサ-5-アザ-ピシクロ〔2.2.1〕ヘプト-5-イル基、3-オキサ-8-アザ-ピシクロ〔3.2.1〕オクト-8-イル基、8-オキサ-3-アザ-ピシクロ〔3.2.1〕オクト-3-イル基、ピペラジン-1-イル基、4-メチルピペラジン-1-イル基もしくは4-エチルピペラジン-1-イル基、又は

アセチルアミノ基、エチルカルボニルアミノ基、プロピルカルボニルアミノ基、ブチルカルボニルアミノ基、メトキシアセチルアミノ基、ブチルオキシカルボニルアミノ基、エチルアミノカルボニルアミノ基、ジメチルアミノカルボニルアミノ基、ピロリジン-1-イルカルボニルアミノ基、ピペリジン-1-イルカルボニルアミノ基、モルホリン-4-イルカルボニルアミノ基、メチルスルホニルアミノ基、エチルスルホニルアミノ基又はブチルスルホニルアミノ基を表す)、

プロピルオキシ基（これは3位で基 R^6 又は R^7 により置換されており、 R^6 及び R^7 は先に定義されたとおりである）、又は

ブチルオキシ基（これは4位で基 R^6 又は R^7 により置換されており、 R^6 及び R^7 は先に定義されたとおりである）を表し、かつ

Xが窒素原子を表し、

特にことわらない限り、上記アルキル基は直鎖であってもよく、また分岐していてもよい、請求項1記載の一般式Iの二環式複素環グループ、それらの互変異性体、それらの立体異性体、それらの混合物又はそれらの塩。

【請求項4】

R^a が水素原子を表し、

R^b が3-プロモフェニル基、3,4-ジフルオロフェニル基、3-クロロ-4-フルオロ-フェニル基もしくは3-エチルフェニル基、又は

3-クロロ-4-ベンジルオキシ-フェニル基、3-クロロ-4-〔(3-フルオロ-ベンジル)オキシ〕-フェニル基、4-(ピリジン-3-イルオキシ)-フェニル基、4-〔(6-メチル-ピリジン-3-イル)オキシ〕-フェニル基、3-メチル-4-(ピリジン-3-イルオキシ)-フェニル基、3-メチル-4-〔(6-メチル-ピリジン-3-イル)オキシ〕-フェニル基、3-クロロ-4-(ピリジン-3-イルオキシ)-フェニル基又は3-クロロ-4-〔(6-メチル-ピリジン-3-イル)オキシ〕-フェニル基を表し、

R^c がシクロヘキシル基（これは3位でアミノ基、アセチルアミノ基、tert.-ブチルオキシカルボニルアミノ基又はメチルスルホニルアミノ基により置換されている）、

シクロヘキシル基（これは4位でアミノ基、メチルアミノ基、エチルアミノ基、ジメチルアミノ基、アミノカルボニルメチルアミノ基、メチルアミノカルボニルメチルアミノ基、ジメチルアミノカルボニルメチルアミノ基、モルホリン-4-イルカルボニルメチルアミノ基、〔3-(モルホリン-4-イルカルボニル)プロピル〕アミノ基、〔2-(メチルスルホニル)エチル〕アミノ基、〔3-(メチルスルホニル)プロピル〕アミノ基又は〔2-(メチルスルホニルアミノ)エチル〕アミノ基により置換されている）、

シクロヘキシル基（これは4位で〔2-(2-オキソ-ピロリジン-1-イル)エチル〕アミノ基、〔2-(2-オキソピペリジン-1-イル)エチル〕アミノ基、〔2-(2-オキソ-イミダゾリジン-1-イル)エチル〕アミノ基、〔2-(2-オキソ-3-メチル-イミダゾリジン-1-イル)エチル〕アミノ基、〔2-(2-オキソ-ヘキサヒドロピリミジン-1-イル)エチル〕アミノ基又は〔2-(2-オキソ-3-メチル-ヘキサヒドロピリミジン-1-イル)エチル〕アミノ基により置換されている）、

シクロヘキシル基（これは4位で〔3-(2-オキソ-ピロリジン-1-イル)プロピル〕アミノ基、〔3-(2-オキソピペリジン-1-イル)プロピル〕アミノ基、〔3-(2-オキソ-イミダゾリジン-1-イル)プロピル〕アミノ基、〔3-(2-オキソ-3-メチル-イミダゾリジン-1-イル)プロピル〕アミノ基、〔3-(2-オキソ-ヘキサヒドロピリミジン-1-イル)プロピル〕アミノ基又は〔3-(2-オキソ-3-メチル-ヘキサヒドロピリミジン-1-イル)プロピル〕アミノ基により置換されている）、

シクロヘキシル基（これは4位でアセチルアミノ基、N-(アセチル)-メチルアミノ基、アミノメチルカルボニルアミノ基、メチルアミノメチルカルボニルアミノ基、ジメチルアミノメチルカルボニルアミノ基、モルホリン-4-イルメチルカルボニルアミノ基、メトキシアセチルアミノ基、N-(メトキシアセチル)-メチルアミノ基、テトラヒドロピラン-4-イルカルボニルアミノ基、N-(テトラヒドロピラン-4-イルカルボニル)-メチルアミノ基、tert.-ブチルオキシカルボニルアミノ基、N-(tert.-ブチルオキシカルボニル)-メチルアミノ基、アミノカルボニルアミノ基、メチルアミノカルボニルアミノ基、N-(エチルアミノカルボニル)-メチルアミノ基、ジメチルアミノカルボニルアミノ基、N-(ジメチルアミノカルボニル)-メチルアミノ基、N-(ピペリジン-1-イルカルボニル)-メチルアミノ基、モルホリン-4-イルカルボニルアミノ基、N-(モルホリン-4-イルカルボニル)-メチルアミノ基又はN-(4-メチルピペラジン-1-イルカルボニル)-メチルアミノ基により置換されている）、

シクロヘキシル基（これは4位で2-オキソ-ピロリジン-1-イル基、2-オキソピペリジン-1-イル基、3-オキソ-モルホリン-4-イル基、2-オキソ-イミダゾリジン-1-イル基、2-オキソ-3-メチル-イミダゾリジン-1-イル基、2-オキソ-ヘキサヒドロピリミジン-1-イル基又は2-オキソ-3-メチル-ヘキサヒドロピリミジン-1-イル基により置換されている）、

シクロヘキシル基（これは4位でメチルスルホニルアミノ基、N-(メチルスルホニル)-メチルアミノ基、エチルスルホニルアミノ基、N-(エチルスルホニル)-メチルアミノ基、ジメチルアミノスルホニルアミノ基、N-(ジメチルアミノスルホニル)-メチルアミノ基、モルホリン-4-イルスルホニルアミノ基、N-(モルホリン-4-イルスルホニル)-メチルアミノ基、3-クロロプロピルスルホニルアミノ基、〔2-(モルホリン-4-イル)-エチル〕スルホニルアミノ基又は〔3-(モルホリン-4-イル)-プロピル〕スルホニルアミノ基により置換されている）、

ピロリジン-3-イル基、

ピロリジン-3-イル基（これは1位でメチル基、アセチル基、メトキシアセチル基、tert.-ブチルオキシカルボニル基、モルホリン-4-イルカルボニル基又はメチルスルホニル基により置換されている）、

ピペリジン-3-イル基、

ピペリジン-3-イル基（これは1位でメチル基、アセチル基、メトキシアセチル基、tert.-ブチルオキシカルボニル基、モルホリン-4-イルカルボニル基又はメチルスルホニル基により置換されている）、

ピペリジン-4-イル基（これは1位でメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、2-ヒドロキシエチル基、2-メトキシエチル基、3-メトキシプロピル基、2-(メチルスルホニル)-エチル基、3-(メチルスルホニル)-プロピル基、2-(tert.-ブチルオキシカルボニルアミノ)-エチル基、2-アミノエチル基、2-(アセチルアミノ)-エチル基、2-(エチルカルボニルアミノ)-エチル基、2-(プロピルカルボニルアミノ)-エチル基、2-(エチルアミノカルボニルアミノ)-エチル基、2-(ジメチルアミノカルボニルアミノ)-エチル基、2-(モルホリン-4-イルカルボニルアミノ)-エチル基、3-(アセチルアミノ)-プロピル基、3-(エチルカルボニルアミノ)-プロピル基、3-(プロピルカルボニルアミノ)-プロピル基、3-(エチルアミノカルボニルアミノ)-プロピル基、3-(ジメチルアミノカルボニルアミノ)-プロピル基、3-(モルホリン-4-イルカルボニルアミノ)-プロピル基、2-(メチルスルホニルアミノ)-エチル基、3-(メチルスルホニルアミノ)-プロピル基、(アミノカルボニル)メチル基、(メチルアミノカルボニル)メチル基、(ジメチルアミノカルボニル)メチル基、(ピロリジン-1-イルカルボニル)メチル基、(モルホリン-4-イルカルボニル)メチル基、

2-(モルホリン-4-イルカルボニル)-エチル基又は3-(モルホリン-4-イルカルボニル)-プロピル基により置換されている)、

ピペリジン-4-イル基(これは1位で2-(2-オキソ-ピロリジン-1-イル)-エチル基、2-(2-オキソピペリジン-1-イル)-エチル基、2-(3-オキソモルホリン-4-イル)-エチル基、2-(2-オキソ-イミダゾリジン-1-イル)-エチル基、2-(2-オキソ-3-メチル-イミダゾリジン-1-イル)-エチル基、2-(2-オキソ-ヘキサヒドロピリミジン-1-イル)-エチル基又は2-(2-オキソ-3-メチル-ヘキサヒドロピリミジン-1-イル)-エチル基により置換されている)、

ピペリジン-4-イル基(これは1位で3-(2-オキソ-ピロリジン-1-イル)-プロピル基、3-(2-オキソピペリジン-1-イル)-プロピル基、3-(3-オキソモルホリン-4-イル)-プロピル基、3-(2-オキソ-イミダゾリジン-1-イル)-プロピル基、3-(2-オキソ-3-メチル-イミダゾリジン-1-イル)-プロピル基、3-(2-オキソ-ヘキサヒドロピリミジン-1-イル)-プロピル基又は3-(2-オキソ-3-メチル-ヘキサヒドロピリミジン-1-イル)-プロピル基により置換されている)、

ピペリジン-4-イル基(これは1位でホルミル基、アセチル基、メトキシアセチル基、(2-メトキシエチル)カルボニル基、(3-メトキシプロピル)カルボニル基、メチルスルホニルアセチル基、アミノアセチル基、メチルアミノアセチル基、(ジメチルアミノ)アセチル基、(モルホリン-4-イル)アセチル基、〔2-(モルホリン-4-イル)-エチル〕カルボニル基、〔3-(モルホリン-4-イル)-プロピル〕カルボニル基、テトラヒドロフラン-2-イルカルボニル基又はテトラヒドロピラン-4-イルカルボニル基により置換されている)、

ピペリジン-4-イル基(これは1位でシアノ基、アミノカルボニル基、メチルアミノカルボニル基、エチルアミノカルボニル基、(2-メトキシエチル)アミノカルボニル基、N-メチル-N-(2-メトキシエチル)-アミノカルボニル基、(3-メトキシプロピル)アミノカルボニル基、N-メチル-N-(3-メトキシプロピル)-アミノカルボニル基、イソプロピルアミノカルボニル基、フェニルアミノカルボニル基、ジメチルアミノカルボニル基、ジエチルアミノカルボニル基、ピロリジン-1-イルカルボニル基、ピペリジン-1-イルカルボニル基、モルホリン-4-イルカルボニル基、2-メチルモルホリン-4-イルカルボニル基、2,6-ジメチルモルホリン-4-イルカルボニル基、ホモモルホリン-4-イルカルボニル基、2-オキサ-5-アザ-ピシクロ〔2.2.1〕ヘプト-5-イルカルボニル基、3-オキサ-8-アザ-ピシクロ〔3.2.1〕オクト-8-イルカルボニル基、8-オキサ-3-アザ-ピシクロ〔3.2.1〕オクト-3-イルカルボニル基、4-メチルピペラジン-1-イルカルボニル基、イソプロピルオキシカルボニル基又はtert.-ブチルオキシカルボニル基により置換されている)、

ピペリジン-4-イル基(これは1位でメチルスルホニル基、エチルスルホニル基、〔2-(モルホリン-4-イル)-エチル〕スルホニル基、〔3-(モルホリン-4-イル)-プロピル〕スルホニル基、アミノスルホニル基、メチルアミノスルホニル基、ジメチルアミノスルホニル基又はモルホリン-4-イルスルホニル基により置換されている)、又は

テトラヒドロフラン-3-イル基、テトラヒドロピラン-3-イル基又はテトラヒドロピラン-4-イル基を表し、

R^dが水素原子、

メトキシ基、ジフルオロメトキシ基又はエチルオキシ基、

2-(モルホリン-4-イル)エチルオキシ基、3-(モルホリン-4-イル)プロピルオキシ基又は4-(モルホリン-4-イル)ブチルオキシ基、

3-(ジメチルアミノ)プロピルオキシ基、3-(ジエチルアミノ)プロピルオキシ基、3-〔ピス-(2-メトキシエチル)-アミノ〕プロピルオキシ基、3-(ピペラジン-1-イル)プロピルオキシ基、3-(4-メチルピペラジン-1-イル)プロピルオキシ基又は3-(4-エチルピペラジン-1-イル)プロピルオキシ基、

3-(ホモモルホリン-4-イル)-プロピルオキシ基、3-(2-オキサ-5-アザ-ピシクロ〔2.2.1〕ヘプト-5-イル)-プロピルオキシ基、3-(3-オキサ-8-アザ-ピシクロ〔3.2.1〕オクト-8-イル)-プロピルオキシ基又は3-(8-オキサ-3-アザ-ピシクロ〔3.2.1〕オクト-3-イル)-プロピルオキシ基、

2-(2-オキソ-ピロリジン-1-イル)-エチルオキシ基、2-(2-オキソピペリジン-1-イル)-

エチルオキシ基、2-(3-オキソモルホリン-4-イル)-エチルオキシ基、2-(2-オキソ-イミダゾリジン-1-イル)-エチルオキシ基、2-(2-オキソ-3-メチル-イミダゾリジン-1-イル)-エチルオキシ基、2-(2-オキソ-ヘキサヒドロピリミジン-1-イル)-エチルオキシ基又は2-(2-オキソ-3-メチル-ヘキサヒドロピリミジン-1-イル)-エチルオキシ基、

3-(2-オキソ-ピロリジン-1-イル)-プロピルオキシ基、3-(2-オキソピペリジン-1-イル)-プロピルオキシ基、3-(3-オキソモルホリン-4-イル)-プロピルオキシ基、3-(2-オキソ-イミダゾリジン-1-イル)-プロピルオキシ基、3-(2-オキソ-3-メチル-イミダゾリジン-1-イル)-プロピルオキシ基、3-(2-オキソ-ヘキサヒドロピリミジン-1-イル)-プロピルオキシ基又は3-(2-オキソ-3-メチル-ヘキサヒドロピリミジン-1-イル)-プロピルオキシ基、

2-(メトキシ)-エチルオキシ基、2-(tert.-ブチルオキシカルボニルアミノ)-エチルオキシ基、2-(アミノ)-エチルオキシ基、2-(アセチルアミノ)-エチルオキシ基、2-(エチルカルボニルアミノ)-エチルオキシ基、2-(プロピルカルボニルアミノ)-エチルオキシ基、2-(イソブチルカルボニルアミノ)-エチルオキシ基、2-(メトキシアセチルアミノ)-エチルオキシ基、2-(エチルアミノカルボニルアミノ)-エチルオキシ基、2-(ジメチルアミノカルボニルアミノ)-エチルオキシ基、2-(ピロリジン-1-イルカルボニルアミノ)-エチルオキシ基、2-(ピペリジン-1-イルカルボニルアミノ)-エチルオキシ基、2-(モルホリン-4-イルカルボニルアミノ)-エチルオキシ基、2-(メチルスルホニルアミノ)-エチルオキシ基、2-(エチルスルホニルアミノ)-エチルオキシ基又は2-(ブチルスルホニルアミノ)-エチルオキシ基、又は

3-(tert.-ブチルオキシカルボニルアミノ)-プロピルオキシ基、3-(アミノ)-プロピルオキシ基、3-(アセチルアミノ)-プロピルオキシ基又は3-(メチルスルホニルアミノ)-プロピルオキシ基を表し、かつ

Xが窒素原子を表す、請求項1記載の一般式Iの二環式複素環グループ、それらの互変異性体、それらの立体異性体、それらの混合物又はそれらの塩。

【請求項5】

R^aが水素原子を表し、

R^bが3-クロロ-4-フルオロ-フェニル基又は3-エチニルフェニル基を表し、

R^cがシクロヘキシル基（これは3位でアミノ基、アセチルアミノ基、tert.-ブチルオキシカルボニルアミノ基又はメチルスルホニルアミノ基により置換されている）、

シクロヘキシル基（これは4位でアミノ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、アセチルアミノ基、N-(アセチル)-メチルアミノ基、メトキシアセチルアミノ基、N-(メトキシアセチル)-メチルアミノ基、テトラヒドロピラン-4-イルカルボニルアミノ基、N-(テトラヒドロピラン-4-イルカルボニル)-メチルアミノ基、tert.-ブチルオキシカルボニルアミノ基、N-(tert.-ブチルオキシカルボニル)-メチルアミノ基、N-(エチルアミノカルボニル)-メチルアミノ基、ジメチルアミノカルボニルアミノ基、N-(ジメチルアミノカルボニル)-メチルアミノ基、N-(ピペリジン-1-イルカルボニル)-メチルアミノ基、モルホリン-4-イルカルボニルアミノ基、N-(モルホリン-4-イルカルボニル)-メチルアミノ基、N-(4-メチルピペラジン-1-イルカルボニル)-メチルアミノ基、メチルスルホニルアミノ基、N-(メチルスルホニル)-メチルアミノ基、エチルスルホニルアミノ基、N-(エチルスルホニル)-メチルアミノ基、ジメチルアミノスルホニルアミノ基、N-(ジメチルアミノスルホニル)-メチルアミノ基、モルホリン-4-イルスルホニルアミノ基、N-(モルホリン-4-イルスルホニル)-メチルアミノ基、3-クロロプロピルスルホニルアミノ基、又は〔3-(モルホリン-4-イル)-プロピル〕スルホニルアミノ基により置換されている）、

ピロリジン-3-イル基、

ピロリジン-3-イル基（これは1位でtert.-ブチルオキシカルボニル基又はメチルスルホニル基により置換されている）、

ピペリジン-3-イル基、

ピペリジン-3-イル基（これは1位でtert.-ブチルオキシカルボニル基又はメチルスルホニル基により置換されている）、

ピペリジン-4-イル基、

ピペリジン-4-イル基（これは1位でメチル基、（アミノカルボニル）メチル基、（ジメチルアミノカルボニル）メチル基、（モルホリン-4-イルカルボニル）メチル基、2-(tert.-ブチルオキシカルボニルアミノ)エチル基、2-アミノエチル基、2-(アセチルアミノ)エチル基、2-(メチルスルホニルアミノ)エチル基、シアノ基、アセチル基、メトキシアセチル基、（ジメチルアミノ）アセチル基、（モルホリン-4-イル）アセチル基、テトラヒドロピラン-4-イルカルボニル基、エチルアミノカルボニル基、イソプロピルアミノカルボニル基、フェニルアミノカルボニル基、ジメチルアミノカルボニル基、ジエチルアミノカルボニル基、ピロリジン-1-イルカルボニル基、ピペリジン-1-イルカルボニル基、モルホリン-4-イルカルボニル基、2-メチルモルホリン-4-イルカルボニル基、2,6-ジメチルモルホリン-4-イルカルボニル基、ホモモルホリン-4-イルカルボニル基、4-メチルピペラジン-1-イルカルボニル基、イソプロピルオキシカルボニル基、tert.-ブチルオキシカルボニル基、メチルスルホニル基、ジメチルアミノスルホニル基又はモルホリン-4-イルスルホニル基により置換されている）、又は

テトラヒドロフラン-3-イル基、テトラヒドロピラン-3-イル基又はテトラヒドロピラン-4-イル基を表し、

R^dが水素原子、

メトキシ基又はエチルオキシ基、

2-(モルホリン-4-イル)エチルオキシ基、3-(モルホリン-4-イル)プロピルオキシ基又は4-(モルホリン-4-イル)ブチルオキシ基、

2-(3-メチル-2-オキソ-ヘキサヒドロピリミジン-1-イル)-エチルオキシ基、

2-(メトキシ)-エチルオキシ基、2-(tert.-ブチルオキシカルボニルアミノ)-エチルオキシ基、2-アミノ-エチルオキシ基、2-(アセチルアミノ)-エチルオキシ基又は2-(メチルスルホニルアミノ)-エチルオキシ基又は

3-(tert.-ブチルオキシカルボニルアミノ)-プロピルオキシ基、3-アミノ-プロピルオキシ基、3-(アセチルアミノ)-プロピルオキシ基又は3-(メチルスルホニルアミノ)-プロピルオキシ基を表し、かつ

Xが窒素原子を表す、請求項1記載の一般式Iの二環式複素環グループ、それらの互変異性体、それらの立体異性体、それらの混合物又はそれらの塩。

【請求項6】

(a) 4-[(3-クロロ-4-フルオロ-フェニル)アミノ]-6-((S)-テトラヒドロフラン-3-イルオキシ)-7-メトキシ-キナゾリン、

(b) 4-[(3-クロロ-4-フルオロ-フェニル)アミノ]-6-(テトラヒドロピラン-4-イルオキシ)-7-メトキシ-キナゾリン、

(c) 4-[(3-クロロ-4-フルオロ-フェニル)アミノ]-6-((R)-テトラヒドロフラン-3-イルオキシ)-7-メトキシ-キナゾリン、

(d) 4-[(3-クロロ-4-フルオロ-フェニル)アミノ]-6-(トランス-4-アミノ-シクロヘキサン-1-イルオキシ)-7-メトキシ-キナゾリン、

(e) 4-[(3-クロロ-4-フルオロ-フェニル)アミノ]-6-(トランス-4-メタンスルホニルアミノ-シクロヘキサン-1-イルオキシ)-7-メトキシ-キナゾリン、

(f) 4-[(3-クロロ-4-フルオロ-フェニル)アミノ]-6-(ピペリジン-4-イルオキシ)-7-メトキシ-キナゾリン、

(g) 4-[(3-クロロ-4-フルオロ-フェニル)アミノ]-6-(1-メタンスルホニル-ピペリジン-4-イルオキシ)-7-メトキシ-キナゾリン、

(h) 4-[(3-クロロ-4-フルオロ-フェニル)アミノ]-6-(シス-4-[[3-(モルホリン-4-イル)-プロピル]スルホニルアミノ]-シクロヘキサン-1-イルオキシ)-7-メトキシ-キナゾリン、

(i) 4-[(3-クロロ-4-フルオロ-フェニル)アミノ]-6-(テトラヒドロピラン-3-イルオキシ)-7-メトキシ-キナゾリン、

(k) 4-[(3-クロロ-4-フルオロ-フェニル)アミノ]-6-(トランス-4-[[3-(モルホリン-4-イル)-プロピル]スルホニルアミノ]-シクロヘキサン-1-イルオキシ)-7-メトキシ-キ

ナゾリン、

(l) 4-〔(3-クロロ-4-フルオロ-フェニル)アミノ〕-6-(1-メチル-ピペリジン-4-イルオキシ)-7-メトキシ-キナゾリン、

(m) 4-〔(3-クロロ-4-フルオロ-フェニル)アミノ〕-6-{1-〔(モルホリン-4-イル)カルボニル〕-ピペリジン-4-イルオキシ}-7-メトキシ-キナゾリン、

(n) 4-〔(3-クロロ-4-フルオロ-フェニル)アミノ〕-6-{1-〔(メトキシメチル)カルボニル〕-ピペリジン-4-イルオキシ}-7-メトキシ-キナゾリン、

(o) 4-〔(3-クロロ-4-フルオロ-フェニル)アミノ〕-6-(1-シアノ-ピペリジン-4-イルオキシ)-7-メトキシ-キナゾリン、

(p) 4-〔(3-クロロ-4-フルオロ-フェニル)アミノ〕-6-{1-〔(モルホリン-4-イル)スルホニル〕-ピペリジン-4-イルオキシ}-7-メトキシ-キナゾリン、

(q) 4-〔(3-クロロ-4-フルオロ-フェニル)アミノ〕-6-〔1-(2-アセチルアミノ-エチル)-ピペリジン-4-イルオキシ〕-7-メトキシ-キナゾリン、

(r) 4-〔(3-クロロ-4-フルオロ-フェニル)アミノ〕-6-{トランス-4-〔(ジメチルアミノ)スルホニルアミノ〕-シクロヘキサン-1-イルオキシ}-7-メトキシ-キナゾリン、

(s) 4-〔(3-クロロ-4-フルオロ-フェニル)アミノ〕-6-{トランス-4-〔(モルホリン-4-イル)カルボニルアミノ〕-シクロヘキサン-1-イルオキシ}-7-メトキシ-キナゾリン、

(t) 4-〔(3-クロロ-4-フルオロ-フェニル)アミノ〕-6-{トランス-4-〔(モルホリン-4-イル)スルホニルアミノ〕-シクロヘキサン-1-イルオキシ}-7-メトキシ-キナゾリン、

(u) 4-〔(3-クロロ-4-フルオロ-フェニル)アミノ〕-6-(テトラヒドロピラン-4-イルオキシ)-7-(2-アセチルアミノ-エトキシ)-キナゾリン、

(v) 4-〔(3-クロロ-4-フルオロ-フェニル)アミノ〕-6-(テトラヒドロピラン-4-イルオキシ)-7-(2-メタンズルホニルアミノ-エトキシ)-キナゾリン及び

(w) 4-〔(3-クロロ-4-フルオロ-フェニル)アミノ〕-6-(テトラヒドロピラン-4-イルオキシ)-7-(2-メトキシ-エトキシ)-キナゾリン、

又はこれらの塩である、請求項 1 記載の一般式 I の化合物。

【請求項 7】

無機又は有機の酸又は塩基との請求項 1 から 6 の少なくとも一つに記載の化合物の生理学上許される塩。

【請求項 8】

必要により一種以上の不活性担体及び/又は希釈剤と一緒に請求項 1 から 6 の少なくとも一つに記載の化合物又は請求項 7 記載の生理学上許される塩を含むことを特徴とする医薬組成物。

【請求項 9】

良性又は悪性腫瘍を治療し、気道及び肺の疾患を予防し、また治療し、また胃腸道、胆管及び胆嚢の疾患を治療するのに適している医薬組成物を調製するための請求項 1 から 7 の少なくとも一つに記載の化合物の使用。

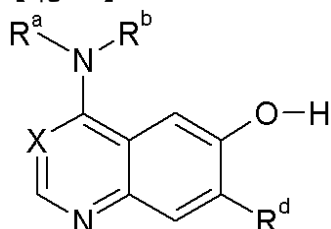
【請求項 10】

請求項 1 から 7 の少なくとも一つに記載の化合物を非化学的方法により一種以上の不活性担体及び/又は希釈剤に混入することを特徴とする、請求項 8 記載の医薬組成物の調製方法。

【請求項 11】

a) 一般式

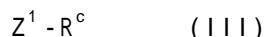
【化2】



(II)

(式中、 R^a 、 R^b 、 R^d 及び X は請求項1から6に定義されたとおりである)

の化合物を一般式



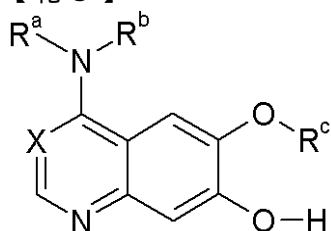
(式中、 R^c は請求項1から6に定義されたとおりであり、かつ Z^1 は脱離基を表す)

の化合物と反応させ、又は

b) R^d が請求項1から6に記載の必要により置換されていてもよいアルキルオキシ基の一つを表す一般式Iの化合物を調製するために、

一般式

【化3】



(IV)

(式中、 R^a 、 R^b 、 R^c 及び X は請求項1から6に定義されたとおりである)

の化合物を一般式



(式中、 $R^{d'1}$ は C_{1-4} -アルキル基、1~3個のフッ素原子により置換されたメチル基、1~5個のフッ素原子により置換されたエチル基、基 R^6 又は R^7 により置換された C_{2-4} -アルキル基(R^6 及び R^7 は請求項1から6に定義されたとおりである)、 C_{1-4} -アルキル基(これは1位で基 R^8 により置換されたピロリジニル基、ピペリジニル基又はホモピペリジニル基により置換されている)、又は C_{1-4} -アルキル基(これは4位で基 R^8 により置換されたモルホリニル基により置換されている)(R^8 は夫々の場合に請求項1から6に定義されたとおりである)を表し、かつ

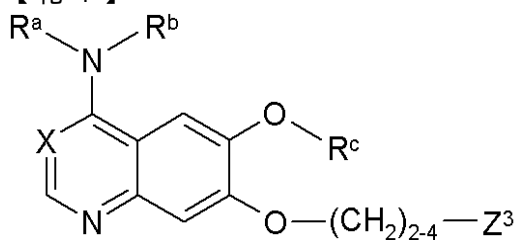
Z^2 は脱離基を表す)

の化合物と反応させ、又は

c) R^d が請求項1から6に記載のアルキルオキシ基の一つ(これは必要により置換されていてもよいアミノ基、アルキルアミノ基もしくはジアルキルアミノ基又はイミノ窒素原子を介して結合された必要により置換されていてもよい複素環基により置換されている)を表す一般式Iの化合物を調製するために、

一般式

【化 4】



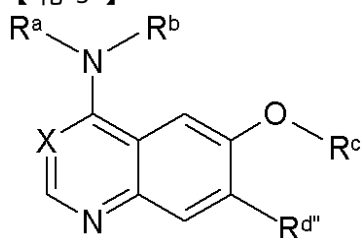
(VI)

(式中、 R^a 、 R^b 、 R^c 及び X は請求項1から6に定義されたとおりであり、かつ Z^3 は脱離基を表す)

の化合物をアンモニア、相当する、必要により置換されていてもよいアルキルアミン、ジアルキルアミンもしくはイミノ化合物又はこれらの適当な塩もしくは誘導体と反応させ、又は

d) R^d がヒドロキシ基を表す一般式Iの化合物を調製するために、
保護基を一般式

【化 5】



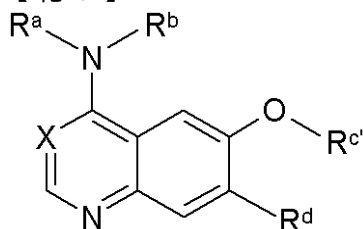
(VII)

(式中、 R^a 、 R^b 、 R^c 及び X は請求項1から6に定義されたとおりであり、かつ $R^{d''}$ はヒドロキシ基に変換し得る基を表す)

の化合物から開裂し、又は

e) R^c が-NH-基を含む一般式Iの化合物を調製するために、
保護基を一般式

【化 6】



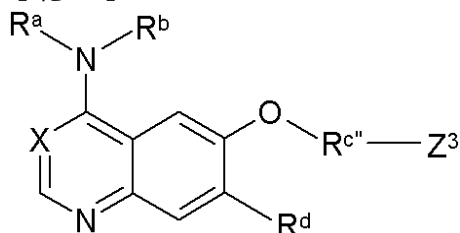
(VIII)

(式中、 R^a 、 R^b 、 R^d 及び X は請求項1から6に定義されたとおりであり、かつ $R^{c'}$ は請求項1から6に R^c について示された意味を有し、但し、 R^c が保護された窒素原子を含むことを条件とする)

の化合物から開裂し、又は

f) R^c が必要により置換されていてもよいアミノ基、アルキルアミノ基もしくはジアルキルアミノ基又は窒素原子を介して結合された必要により置換されていてもよい複素環基により置換されたアルキル基を含む一般式Iの化合物を調製するために、
一般式

【化 7】



(IX)

(式中、 R^a 、 R^b 、 R^d 及び X は請求項1から6に定義されたとおりであり、 Z^3 は脱離基を表し、かつ $R^{c''}$ は請求項1から6に R^c について示された意味を有し、但し、脂肪族炭素原子に結合された水素原子が基 Z^3 により置換されていることを条件とする)

の化合物をアンモニア、相当する、必要により置換されていてもよいアルキルアミン、ジアルキルアミンもしくはイミノ化合物又はこれらの適当な塩もしくは誘導体と反応させ、そして、

所望により、アミノ基、アルキルアミノ基又はイミノ基を含むこうして得られた一般式Iの化合物をアシル化、シアン化又はスルホニル化により一般式Iの相当するアシル化合物、シアノ化合物又はスルホニル化合物に変換し、かつ/又は

アミノ基、アルキルアミノ基又はイミノ基を含むこうして得られた一般式Iの化合物をアルキル化又は還元アルキル化により一般式Iの相当するアルキル化合物に変換し、かつ/又は

クロロ- C_{1-4} -アルキルスルホニル基又はブromo- C_{1-4} -アルキルスルホニル基を含むこうして得られた一般式Iの化合物をアミンとの反応により相当するアミノ- C_{1-4} -アルキルスルホニル化合物に変換し、かつ/又は

tert.-ブチルオキシカルボニルアミノ基、N-アルキル-N-(tert.-ブチルオキシカルボニル)アミノ基又はN-tert.-ブチルオキシカルボニルイミノ基を含むこうして得られた一般式Iの化合物を酸による処理により一般式Iの相当するアミノ化合物、アルキルアミノ化合物又はイミノ化合物に変換し、かつ/又は

必要により、上記反応に使用した保護基を再度開裂し、かつ/又は

所望により、こうして得られた一般式Iの化合物をその立体異性体に分割し、かつ/又は

こうして得られた一般式Iの化合物をその塩、特に医薬上の使用のためにその生理学上許される塩に変換することを特徴とする、請求項1から6に記載の一般式Iの化合物の調製方法。