

【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29年3月9日(2017.3.9)

【公表番号】特表2016-519091(P2016-519091A)

【公表日】平成28年6月30日(2016.6.30)

【年通号数】公開・登録公報2016-039

【出願番号】特願2016-503776(P2016-503776)

【国際特許分類】

C 07 D 215/46	(2006.01)
C 07 D 401/04	(2006.01)
C 07 D 401/06	(2006.01)
C 07 D 401/12	(2006.01)
C 07 D 215/52	(2006.01)
C 07 D 215/18	(2006.01)
A 61 K 31/4709	(2006.01)
A 61 K 31/5377	(2006.01)
A 61 K 31/47	(2006.01)
A 61 K 45/00	(2006.01)
A 61 K 9/51	(2006.01)
A 61 K 47/34	(2017.01)
A 61 K 47/50	(2017.01)
A 61 P 35/00	(2006.01)
A 61 P 35/02	(2006.01)

【F I】

C 07 D 215/46	C S P
C 07 D 401/04	
C 07 D 401/06	
C 07 D 401/12	
C 07 D 215/52	
C 07 D 215/18	
A 61 K 31/4709	
A 61 K 31/5377	
A 61 K 31/47	
A 61 K 45/00	
A 61 K 9/51	
A 61 K 47/34	
A 61 K 47/48	
A 61 P 35/00	
A 61 P 35/02	

【手続補正書】

【提出日】平成29年2月6日(2017.2.6)

【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

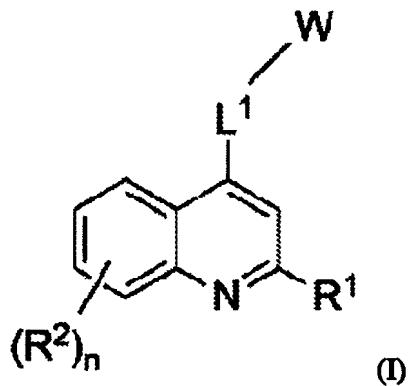
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)の化合物であって、
【化1】



式中、

R¹が、所望により置換されたアリール、所望により置換されたヘテロアリール、O、N及びSから独立して選択される1、2又は3個のヘテロ原子を含む、所望により置換されたヘテロ芳香族の5～9員環から選択され；

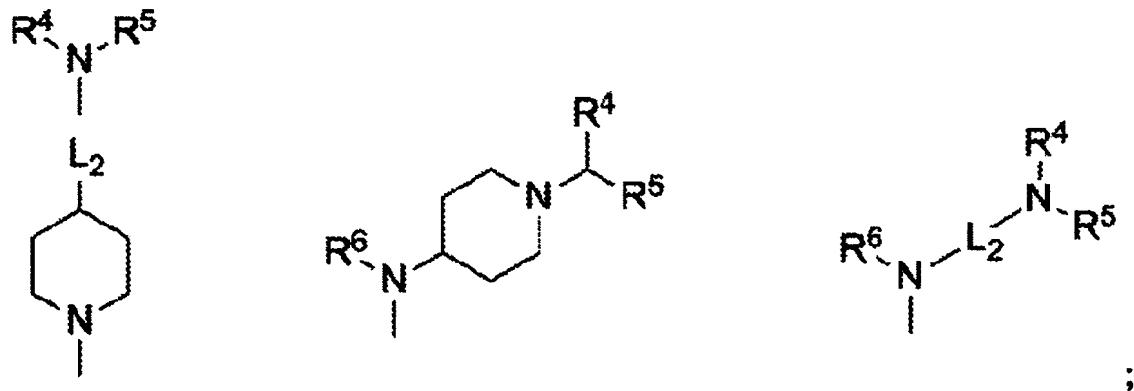
R²が、C1、F、I、Br、C₁～C₆アルキル、一つ又は複数のハロゲン、C₁～C₆アルコキシ、ヒドロキシ、ニトロ又はNR⁷R⁸と置換されたC₁～C₆アルキル、NR⁷-(CO)-R⁸、NR⁷-(CO)-O-R⁸、NR⁷-(CO)-NR⁷R⁸、O-(CO)R⁷、O-(CO)-O-R⁷、O-(CO)-NR⁷R⁸、(CO)R⁷、(CO)-O-R⁷、(CO)-NR⁷R⁸、SO₂-R⁷、SO₂NR⁷R⁸、NR⁷-SO₂-R⁸から選択され、R⁷及びR⁸が、独立して水素、C₁～C₆アルキル、フェニル(C1、F、I、Br、C₁～C₆アルキル、一つ又は複数のハロゲン、C₁～C₆アルコキシ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ又はNR⁷R⁸と置換されたC₁～C₆アルキルから選択される一つ又は複数の置換基と所望により置換された)又はベンジル(C1、F、I、Br、C₁～C₆アルキル、一つ又は複数のハロゲン、C₁～C₆アルコキシ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ又はNR⁷R⁸と置換されたC₁～C₆アルキルから選択される一つ又は複数の置換基と所望により置換された)、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルケニル、シクロアルキニルアリール及びヘテロアリールを表し；

L¹が、結合又は所望により置換されたC₁～C₁₄アルキル(-R³)、N(-R³)、C=O、(CO)-O、(CO)-NR⁷、及びOから選択され；

nが、0、1、2、3又は4であり；

Wが、

【化2】



から選択され、式中、

L_2 が、結合、又は所望により置換された $C_1 \sim C_{14}$ アルキル(- R^3)、 $N(-R^3)$ 、 $C=O$ 、 $(CO)-O$ 、 $(CO)-NR^7$ 、及び O から選択され；式中、 R^3 は H 、所望により置換されたアリール、所望により置換されたヘテロアリール、所望により置換されたヘテロシクロアルキル、所望により置換された $C_1 \sim C_8$ -アルキル、所望により置換された $C_2 \sim C_8$ -アルケニル、所望により置換された $C_2 \sim C_8$ -アルキニル、所望により置換された $C_3 \sim C_{12}$ シクロアルキル、及び所望により置換された $C_3 \sim C_{12}$ シクロアルケニルから選択され；式中、 R^7 は上記の定義の通りであり；

R^4 及び R^5 が、独立して、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又はフェニル(C_1 、 F 、 I 、 Br 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、一つ又は複数のハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ又は NR^7R^8 と置換された $C_1 \sim C_6$ アルキルから選択される一つ又は複数の置換基と所望により置換された)又はベンジル(フェニル基が C_1 、 F 、 I 、 Br 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、一つ又は複数のハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ又は NR^7R^8 と置換された $C_1 \sim C_6$ アルキルから選択される一つ又は複数の置換基で所望により置換された)又は CH_2-CH_2 -フェニル(フェニル基が C_1 、 F 、 I 、 Br 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、一つ又は複数のハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ又は NR^7R^8 と置換された $C_1 \sim C_6$ アルキルから選択される一つ又は複数の置換基で所望により置換された)、 $(CO)-R^7$ 、 $(CO)-OR^7$ 、 $(CO)-NR^7R^8$ 、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルケニル、シクロアルキニル、アリール、単環式又は二環式ヘテロアリールから選択され、あるいは、 R^4 及び R^5 は連結して複素環式基を形成しており；

R^6 が、 H 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、単環式又は二環式シクロアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール及びヘテロアリールから選択され；

用語「所望により置換された」が、 C_1 、 F 、 I 、 Br 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、一つ又は複数のハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ又は NR^7R^8 と置換された $C_1 \sim C_6$ アルキルから独立して選択された一つ又は複数の置換基と所望により置換されていることを意味し、 R^7 及び R^8 は、独立して、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、フェニル(C_1 、 F 、 I 、 Br 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、一つ又は複数のハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ又は NR^7R^8 と置換された $C_1 \sim C_6$ アルキルから選択される一つ又は複数の置換基と所望により置換された)又はベンジル(C_1 、 F 、 I 、 Br 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、一つ又は複数のハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ又は NR^7R^8 と置換された $C_1 \sim C_6$ アルキルから選択される一つ又は複数の置換基と所望により置換された)、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルケニル、シクロアルキニルアリール及びヘテロアリールを表す；

式(I)の化合物、並びにそのあらゆる薬剤的に許容できる塩、溶媒和化合物又はプロド

ラッグ。

【請求項 2】

以下から選択される、請求項 1 に記載の化合物：

2 - フェニル - 4 - (4 - N , N - ジエチルアミノ - ピペリジン - 1 - イル) キノリン (I - 3) ;
 7 - クロロ - 2 - フェニル - 4 - (4 - N , N - ジエチルアミノ - ピペリジン - 1 - イル) キノリン (II - 3) ;
 2 - フェニル - 4 - ([1 , 4 '] - ビペリジン - 1 ' - イル) キノリン (III - 3) ;
 2 - フェニル - 4 - (4 - N - t e r t - プチルアミノ - ピペリジン - 1 - イル) キノリン (IV - 1) ;
 2 - フェニル - 4 - [(4 - モルフォリン - 4 - イル) ピペリジン - 1 イル] キノリン (V - 1) ;
 2 - (2 - ナフチル) - 4 - (4 - N , N - ジエチルアミノ - ピペリジン - 1 - イル) キノリン (VI - 5) ;
 2 - (4 - ブロモ - フェニル) - 7 - クロロ - 4 - (4 - N , N - ジエチルアミノ - ピペリジン - 1 - イル) キノリン (VII - 4) ;
 2 - (4 - ブロモ - フェニル) - 4 - (4 - N , N - ジエチルアミノ - ピペリジン - 1 - イル) キノリン (VII - 5) ;
 2 - (1 , 1 ' - ビフェニル) - 4 - イル - 4 - (4 - N , N - ジエチルアミノ - ピペリジン - 1 - イル) キノリン (IX - 1) ;
 2 - (4 - クロロ - フェニル) - 4 - (4 - N , N - ジエチルアミノ - ピペリジン - 1 - イル) キノリン (X - 5) ;
 2 - (1 , 1 ' - ビフェニル) - 4 - イル - 7 - クロロ - 4 - (4 - N , N - ジエチルアミノ - ピペリジン - 1 - イル) キノリン (XI - 1) ;
 2 - (4 - クロロ - フェニル) - 4 - (4 - N - t e r t - プチルアミノ - ピペリジン - 1 - イル) キノリン (XII - 3) ;
 2 - (4 - メチル - フェニル) - 4 - (4 - N - t e r t - プチルアミノ - ピペリジン - 1 - イル) キノリン (XII - 7) ;
 2 - (3 , 4 - ジクロロ - フェニル) - 4 - (4 - N - t e r t - プチルアミノ - ピペリジン - 1 - イル) キノリン (XIX - 7) ;
 2 - (4 - メトキシ - フェニル) - 4 - (4 - N - t e r t - プチルアミノ - ピペリジン - 1 - イル) キノリン (XV - 7) ;
 7 - クロロ - 2 - フェニル - 4 - { 1 - [4 - (N , N - ジエチルアミノ) - ピペリジン - 1 - イル] - エタ - 1 - イル } キノリン (XVI - 3) ;
 7 - クロロ - 2 - フェニル - 4 - [4 - (N , N - ジエチルアミノ) - ピペリジン - 1 - イルメチル] キノリン (XVI - 5) ;
 4 - [4 - (N , N - ジエチルアミノ) ピペリジン - 1 - イルカルボニル] - 2 - フェニル - キノリン (XVII - 1) ;
 2 - フェニル - 4 - { 1 - [4 - (N , N - ジエチルアミノ) - ピペリジン - 1 - イル] - エタ - 1 - イル } キノリン (XI - 2) ;
 2 - フェニル - 4 - [4 - (N , N - ジエチルアミノ) - ピペリジン - 1 - イルメチル] キノリン (XX - 4) ;
 2 - フェニル - 4 - { 1 - { 4 - [ベンジル (フェネチル) アミノ] - ピペリジン - 1 - イル } - エタ - 1 - イル } キノリン (XXI - 3) ;
 2 - フェニル - 4 - { 1 - [(1 , 4 ' - ビペリジン) - 1 ' - イル] - エタ - 1 - イル } キノリン (XXII - 3) ;
 2 - フェニル - 4 - { 1 - [4 - (t e r t - プチルアミノ) - ピペリジン - 1 - イル] - エタ - 1 - イル } キノリン (XXIII - 1) ;
 2 - (2 - ナフチル) - 4 - { 1 - [4 - (N , N - ジエチルアミノ) - ピペリジン - 1 - イル] - エタ - 1 - イル } キノリン (XXIV - 1) ;

- イル] - エタ - 1 - イル } キノリン (X X I V - 2) ;
 2 - フェニル - 4 - { 2 - [4 - (N , N - ジエチルアミノ) - ピペリジン - 1 - イル]
 - プロパン - 2 - イル } キノリントリフルオロ酢酸塩 (X X V - 6) .
 7 - クロロ - 2 - フェニル - 4 - [4 - (N , N - ジエチルアミノメチル) - ピペリジン
 - 1 イル] キノリン (X X V I - 3) ;
 2 - フェニル - 4 - [4 - (N , N - ジエチルアミノメチル) - ピペリジン - 1 - イル]
 キノリン (X X V I I - 1) ;
 7 - クロロ - 2 - フェニル - 4 - [(N - ベンジルピペリジン - 4 - イル) - アミノ] キ
 ノリン (X X V I I I - 1) ;
 7 - クロロ - 2 - フェニル - 4 - [N - メチル - N - (N - ベンジルピペリジン - 4 - イ
 ル) - アミノ] キノリン (X X I X - 1) ;
 7 - クロロ - 2 - フェニル - 4 - [N - メチル - N - (N - 1 - フェニルエチル - ピペリ
 ジン - 4 - イル) - アミノ] キノリン (X X X - 2) ;
 2 - フェニル - 4 - [N - メチル - N - (N - 1 - フェニルエチル - ピペリジン - 4 - イ
 ル) - アミノ] キノリン (X X X I - 1) ;
 N - (1 - ベンジルピペリジン - 4 - イル) - 7 - クロロ - 2 - フェニルキノリン - 4 -
 カルボキサミド (X X X I I - 1) ;
 7 - クロロ - 2 - フェニル - 4 - [(N - ベンジル - ピペリジン - 4 - イル) アミノメチ
 ル] キノリン (X X X I I I - 1) ;
 2 - フェニル - 4 - { 1 - [(N - ベンジル - ピペリジン - 4 - イル) アミノ] - エタ -
 1 - イル } キノリン (X X X I V - 1) ;
 7 - クロロ - 2 - フェニル - 4 - { 1 - [(N - ベンジル - ピペリジン - 4 - イル) アミ
 ノ] - エタ - 1 - イル } キノリン (X X X V - 1) ;
 N¹ , N¹ - ジメチル - N² - (2 - ナフタレン - 2 - イル - キノリン - 4 - イル) - エタ
 ン - 1 , 2 - ジアミン (X X X V I - 1) ;
 N¹ , N¹ , N² - トリメチル - N² - (2 - ナフタレン - 2 - イル - キノリン - 4 - イル)
 - エタン - 1 , 2 - ジアミン (X X X V I I - 1) ;
 N¹ , N¹ , N² - トリメチル - N² - (2 - フェニル - 7 - クロロ - キノリン - 4 - イルメ
 チル) - エタン - 1 , 2 - ジアミン (X X X V I I I - 1) ;
 N¹ , N¹ , N³ - トリメチル - N³ - [2 - (ナフタレン - 2 - イル) - キノリン - 4 - イ
 ル] - プロパン - 1 , 3 - ジアミン (X X X I X - 1) ;
 N¹ , N¹ - ジメチル - N³ - (2 - フェニルキノリン - 4 - イル) プロパン - 1 , 3 - ジ
 アミントリフルオロ酢酸塩 (X L - 2) ;
 N¹ , N¹ - ジメチル - N³ - (2 - フェニルキノリン - 4 - イル) プロパン - 1 , 3 - ジ
 アミン (X L I - 1) ;
 N¹ , N¹ - ジメチル - N³ - [2 - (ナフタレン - 2 - イル) キノリン - 4 - イル] プロ
 パン - 1 , 3 - ジアミン (X L I I - 1) ;
 N - [3 - (ジメチルアミノ) プロピル] - 7 - クロロ - 2 - フェニルキノリン - 4 - カ
 ルボキサミド (X L I I I - 1) ;
 N¹ , N¹ - ジメチル - N³ - (7 - クロロ - 2 - フェニルキノリン - 4 - イルメチル) -
 プロパン - 1 , 3 - ジアミン (X L I V - 1) ;
 2 - フェニル - 4 - { 1 - [4 - (モルホリノ) - ピペリジニル] - エタ - 1 - イル } キ
 ノリン (X L V - 1) 。

【請求項 3】

以下から選択される、請求項 1 に記載の化合物：

2 - フェニル - 4 - (4 - N , N - ジエチルアミノ - ピペリジン - 1 - イル) キノリン塩
 酸塩 (I - 4) ;
 7 - クロロ - 2 - フェニル - 4 - (4 - N , N - ジエチルアミノ - ピペリジン - 1 - イル
) キノリン塩酸塩 (I I - 4) ;
 2 - フェニル - 4 - ([1 , 4 '] - ビピペリジン - 1 ' - イル) キノリン塩酸塩 (I I

I - 4) ;
 2 - フェニル - 4 - (4 - N - t e r t - プチルアミノ - ピペリジン - 1 - イル) キノリン塩酸塩 (I V - 2) ;
 2 - フェニル - 4 - [(4 - モルフォリン - 4 - イル) ピペリジン - 1 イル] キノリン塩酸塩 (V - 2) ;
 2 - (2 - ナフチル) - 4 - (4 - N , N - ジエチルアミノ - ピペリジン - 1 - イル) キノリン塩酸塩 (V I - 6) ;
 2 - (4 - ブロモ - フェニル) - 7 - クロロ - 4 - (4 - N , N - ジエチルアミノ - ピペリジン - 1 - イル) キノリン塩酸塩 (V I I - 5) ;
 2 - (4 - ブロモ - フェニル) - 4 - (4 - N , N - ジエチルアミノ - ピペリジン - 1 - イル) キノリン塩酸塩 (V I I I - 6) ;
 2 - (1 , 1 ' - ビフェニル) - 4 - イル - 4 - (4 - N , N - ジエチルアミノ - ピペリジン - 1 - イル) キノリン塩酸塩 (I X - 2) ;
 2 - (4 - クロロ - フェニル) - 4 - (4 - N , N - ジエチルアミノ - ピペリジン - 1 - イル) キノリン塩酸塩 (X - 6) ;
 2 - (1 , 1 ' - ビフェニル) - 4 - イル - 7 - クロロ - 4 - (4 - N , N - ジエチルアミノ - ピペリジン - 1 - イル) キノリン塩酸塩 (X I - 2) ;
 2 - (4 - クロロ - フェニル) - 4 - (4 - N - t e r t - プチルアミノ - ピペリジン - 1 - イル) キノリン塩酸塩 (X I I - 4) ;
 2 - (4 - メチル - フェニル) - 4 - (4 - N - t e r t - プチルアミノ - ピペリジン - 1 - イル) キノリン塩酸塩 (X I I I - 8) ;
 2 - (3 , 4 - ジクロロ - フェニル) - 4 - (4 - N - t e r t - プチルアミノ - ピペリジン - 1 - イル) キノリン塩酸塩 (X I V - 8) ;
 2 - (4 - メトキシ - フェニル) - 4 - (4 - N - t e r t - プチルアミノ - ピペリジン - 1 - イル) キノリン塩酸塩 (X V - 8) ;
 7 - クロロ - 2 - フェニル - 4 - { 1 - [4 - (N , N - ジエチルアミノ) - ピペリジン - 1 - イル] - エタ - 1 - イル } キノリン塩酸塩 (X V I - 4) ;
 7 - クロロ - 2 - フェニル - 4 - [4 - (N , N - ジエチルアミノ) - ピペリジン - 1 - イルメチル] キノリン塩酸塩 (X V I I - 6) ;
 4 - [4 - (N , N - ジエチルアミノ) ピペリジン - 1 - イルカルボニル] - 2 - フェニル - キノリン塩酸塩 (X V I I I - 2) ;
 2 - フェニル - 4 - { 1 - [4 - (N , N - ジエチルアミノ) - ピペリジン - 1 - イル] - エタ - 1 - イル } キノリン塩酸塩 (X I X - 3) ;
 2 - フェニル - 4 - [4 - (N , N - ジエチルアミノ) - ピペリジン - 1 - イルメチル] キノリン塩酸塩 (X X - 5) ;
 2 - フェニル - 4 - { 1 - { 4 - [ベンジル (フェネチル) アミノ] - ピペリジン - 1 - イル } - エタ - 1 - イル } キノリン塩酸塩 (X X I - 4) ;
 2 - フェニル - 4 - { 1 - [(1 . 4 ' - ピペリジン) - 1 ' - イル] - エタ - 1 - イル } キノリン塩酸塩 (X X I I - 4) ;
 2 - フェニル - 4 - { 1 - [4 - (t e r t - プチルアミノ) - ピペリジン - 1 - イル] - エタ - 1 - イル } キノリン塩酸塩 (X X I I I - 2) ;
 2 - (2 - ナフチル) - 4 - { 1 - [4 - (N , N - ジエチルアミノ) - ピペリジン - 1 - イル] - エタ - 1 - イル } キノリン塩酸塩 (X X I V - 3) ;
 2 - フェニル - 4 - { 2 - [4 - (N , N - ジエチルアミノ) - ピペリジン - 1 - イル] - プロパン - 2 - イル } キノリントリフルオロ酢酸塩 (X X V - 6) .
 7 - クロロ - 2 - フェニル - 4 - [4 - (N , N - ジエチルアミノメチル) - ピペリジン - 1 - イル] キノリン塩酸塩 (X X V I - 4) ;
 2 - フェニル - 4 - [4 - (N , N - ジエチルアミノメチル) - ピペリジン - 1 - イル] キノリン塩酸塩 (X X V I I - 2) ;
 7 - クロロ - 2 - フェニル - 4 - [(N - ベンジルピペリジン - 4 - イル) - アミノ] キ

ノリン塩酸塩 (X X V I I I - 2) ;
 7 - クロロ - 2 - フェニル - 4 - [N - メチル - N - (N - ベンジルピペリジン - 4 - イル) - アミノ] キノリン塩酸塩 (X X I X - 2) ;
 7 - クロロ - 2 - フェニル - 4 - [N - メチル - N - (N - 1 - フェニルエチル - ピペリジン - 4 - イル) - アミノ] キノリン塩酸塩 (X X X - 3) ;
 2 - フェニル - 4 - [N - メチル - N - (N - 1 - フェニルエチル - ピペリジン - 4 - イル) - アミノ] キノリン塩酸塩 (X X X I - 2) ;
 N - (1 - ベンジルピペリジン - 4 - イル) - 7 - クロロ - 2 - フェニルキノリン - 4 - カルボキサミド塩酸塩 (X X X I I - 2) ;
 7 - クロロ - 2 - フェニル - 4 - [(N - ベンジル - ピペリジン - 4 - イル) アミノメチル] キノリン塩酸塩 (X X X I I I - 2) ;
 2 - フェニル - 4 - { 1 - [(N - ベンジル - ピペリジン - 4 - イル) アミノ] - エタ - 1 - イル } キノリン塩酸塩 (X X X I V - 2) ;
 7 - クロロ - 2 - フェニル - 4 - { 1 - [(N - ベンジル - ピペリジン - 4 - イル) アミノ] - エタ - 1 - イル } キノリン塩酸塩 (X X X V - 2) ;
 N¹, N¹ - ジメチル - N² - (2 - ナフタレン - 2 - イル - キノリン - 4 - イル) - エタン - 1, 2 - ジアミン塩酸塩 (X X X V I - 2) ;
 N¹, N¹, N² - トリメチル - N² - (2 - ナフタレン - 2 - イル - キノリン - 4 - イル) - エタン - 1, 2 - ジアミン塩酸塩 (X X X V I I - 2) ;
 N¹, N¹, N² - トリメチル - N² - (2 - フェニル - 7 - クロロ - キノリン - 4 - イルメチル) - エタン - 1, 2 - ジアミン塩酸塩 (X X X V I I I - 2) ;
 N¹, N¹, N³ - トリメチル - N³ - [2 - (ナフタレン - 2 - イル) - キノリン - 4 - イル] - プロパン - 1, 3 - ジアミン塩酸塩 (X X X I X - 2) ;
 N¹, N¹ - ジメチル - N³ - (2 - フェニルキノリン - 4 - イル) プロパン - 1, 3 - ジアミントリフルオロ酢酸塩 (X L - 2) ;
 N¹, N¹ - ジメチル - N³ - (2 - フェニルキノリン - 4 - イル) プロパン - 1, 3 - ジアミン塩酸塩 (X L I - 2) ;
 N¹, N¹ - ジメチル - N³ - [2 - (ナフタレン - 2 - イル) キノリン - 4 - イル] プロパン - 1, 3 - ジアミン塩酸塩 (X L I I - 2) ;
 N - [3 - (ジメチルアミノ) プロピル] - 7 - クロロ - 2 - フェニルキノリン - 4 - カルボキサミド塩酸塩 (X L I I I - 2) ;
 N¹, N¹ - ジメチル - N³ - (7 - クロロ - 2 - フェニルキノリン - 4 - イルメチル) - プロパン - 1, 3 - ジアミン塩酸塩 (X L I V - 2) ;
 2 - フェニル - 4 - { 1 - [4 - (モルホリノ) - ピペリジニル] - エタ - 1 - イル } キノリン塩酸塩 (X L V - 1) ;

【請求項4】

請求項1～3のいずれか一項に記載の治療有効量の化合物、又はその薬剤的に許容できる塩、溶媒和化合物もしくはプロドラッグ、及び薬剤的に許容できるアジュバント、希釈剤又は担体を含む、医薬組成物。

【請求項5】

一つ又は複数の抗悪性腫瘍薬を併せてさらに含む、請求項4に記載の医薬組成物。

【請求項6】

請求項1～3のいずれか一項に記載の治療有効量の化合物がナノ粒子内で製剤化又は共製剤化される、請求項4及び5のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項7】

ナノ粒子が高分子生分解性組成物を含む、請求項6に記載の医薬組成物。

【請求項8】

ナノ粒子がリソソーム (Lisosomal) 生分解性組成物、又は生体適合性の重合体又は共重合体を含む、請求項6に記載の医薬組成物。

【請求項9】

ナノ粒子がポリエチレングリコール(PEG)と共有結合的又は非共有結合的に結合している、請求項6～8のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項10】

ナノ粒子が約80～約600nmの平均サイズを有する、請求項6～9のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項11】

請求項1～3のいずれか一項に記載の化合物が少なくとも1つの治療効果のある抗がん剤と結合(associated with)している、請求項6～10のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項12】

ナノ粒子がPLGAナノ粒子、PLGA-PEGナノ粒子(ブロック体AB、BA、ABA又はBAB、ここでA=PLGA及びB=PEG)及び標的化ナノ粒子から選択される物品を含む、請求項6に記載の医薬組成物。

【請求項13】

ナノ粒子がシグナル伝達モチーフを含有する標的化ナノ粒子である、請求項12に記載の医薬組成物。

【請求項14】

請求項1～3のいずれか一項に記載の治療有効量の化合物及び治療有効量の一つ又は複数の抗悪性腫瘍薬の組み合わせを含む医薬組成物であって、前記組み合わせを構成する成分ががん治療における同時使用、個別使用又は順次使用のためのものである、上記医薬組成物。

【請求項15】

抗悪性腫瘍薬が、エベロリムス、クロロキン、ヒドロキシクロロキン、トラベクテジン、アブラキサン、TLK286、AV-299、DN-101、パゾパニブ、GSK690693、RTA744、ON0910.Na、AZD6244(ARRY-142886)、AMN-107、TKI-258、GSK461364、AZD1152、エンザスタウリン、バンデタニブ、ARQ-197、MK-0457、MLN8054、PHA-739358、R-763、AT-9263、ペメトレキセド、エルロチニブ、ダサチニブ(dasatanib)、ニロチニブ、デカタニブ(decatanib)、パニツムマブ、アムルビシン、オレゴボマブ、Lep-e tu、ノラトレキシド、azd2171、バタブリン(batubulin)、オファツムマブ、ザノリムマブ、エドテカリン、テトランドリン(tetrandrine)、ルビテカン、テスミリフェン、オブリメルセン、チシリムマブ(ticilimumab)、イピリムマブ、ゴシポール、Bio111、131-I-TM-601、ALT-110、BIO140、CC8490、シレンジタード、ジャイマテカン.IL13-PE38QQR、TNO1001、IPdR1-KRX-0402、ルカントン、LY317615、ネウラジアブ(neuradiab)、ビテスパン(vitespan)、Rta744、Sdx102、タランパネル(talampanel)、アトラセンタン、Xr311、ロミデプシン、ADS-100380、スニチニブ、5-フルオロウラシル、ボリノスタット、エトポシド、ゲムシタビン、ドキソルビシン、イリノテカン、リポソームドキソルビシン、5'-デオキシ-5-フルオロウリジン、ビンクリスチン、テモゾロミド、ZK-304709、セリシクリブ、PD0325901、AZD-6244、カペシタビン、L-グルタミン酸、N-[4-[2-(2-アミノ-4,7-ジヒドロ-4-オキソ-1H-ピロロ[2,3-d]ピリミジン-5-イル)エチル]ベンゾイル]-ニナトリウム塩(七水和物)、カンプトテシン、PEG標識イリノテカン、タモキシフェン、クエン酸トレミフェン、アナストロゾール(anastrazole)、エキセメスタン、レトロゾール、DES(ジエチルスチルベストロール)、エストラジオール、エストロゲン、結合型エストロゲン、ベバシズマブ、IMC-1C11、CHIR-258、3-[5-(メチルスルホニル)ビペラジンメチル]-インドリル]-キノロン、バタラニブ、AG-013736、AVE-0005、[D-Ser(But)₆,A_{zg1y10}](pyro-Glu-His-Trp-Ser-Tyr-D-Ser(But)-Leu-Arg-Pro-Azg1y-NH₂)-酢

酸塩 [$C_{59}H_{84}N_{18}O_{14} - (C_2H_4O_2)_x$] の酢酸塩、酢酸ゴセレリン、酢酸ロイプロリド、トリプトレリンパモ酸塩、酢酸メドロキシプロゲステロン、カプロン酸ヒドロキシプロゲステロン、酢酸メゲストロール、ラロキシフェン、ビカルタミド、フルタミド、ニルタミド、酢酸メゲストロール、C P - 7 2 4 7 1 4 ; T A K - 1 6 5 、 H K I - 2 7 2 、 エルロチニブ、ラパタニブ (lapatanib) 、 カネルチニブ、A B X - E G F 抗体、エルビタックス (erbitux) 、 E K B - 5 6 9 、 P K I - 1 6 6 、 G W - 5 7 2 0 1 6 、 ロナファミブ、B M S - 2 1 4 6 6 2 、 チピファルニブ；アミホスチン、N V P - L A Q 8 2 4 、 スベロイルアニリドヒドロキサム酸 (suberoyl analide hydroxamic acid) 、 バルプロ酸、トリコスタチン A 、 F K - 2 2 8 、 S U 1 1 2 4 8 、 ソラフェニブ、K R N 9 5 1 、 アミノグルテチミド、アムサクリン、アナグレリド、L - アスパラギナーゼ、カルメット・ゲラン桿菌 (B C G) ワクチン、ブレオマイシン、ブセレリン、ブスルファン、カルボプラチニン、カルムスチン、クロラムブシル、シスプラチニン、クラドリビン、クロドロネート、シプロテロン、シタラビン、ダカルバジン、ダクチノマイシン、ダウノルビシン、ジエチルスチルベストロール、エビルビシン、フルダラビン、フルドロコルチゾン、フルオキシメステロン、フルタミド、ゲムシタビン、グリベック (gleevec) 、 ヒドロキシウレア、イダルビシン、イホスファミド、イマチニブ、リュープロリド、レバミゾール、ロムスチン、メクロレタミン、メルファラン、6 - メルカプトプリン、メスナ、メトトレキサート、マイトマイシン、ミトタン、ミトキサントロン、ニルタミド、オクトレオチド、オキサリプラチニン、パミドロン酸、ペントスタチン、プリカマイシン、ポルフィマー、プロカルバジン、ラルチトレキセド、リツキシマブ、ストレプトゾシン、テニポシド、テストステロン、サリドマイド、チオグアニン、チオテバ、トレチノイン、ビンデシン、13 - シス - レチノイン酸、フェニルアラニンマスターード、ウラシルマスターード、エストラムスチン、アルトレタミン、フロクスウリジン、5 - デオキシリジン (5-deoxyuridine) 、 シトシンアラビノシド、6 - メルカプトプリン (6-mecaptopurine) 、 デオキシコホルマイシン、カルシトリオール、バルルビシン、ミトラマイシン、ビンプラスチン、ビノレルビン、トポテカン、ラゾキシン (razoxin) 、 マリマstatt (marimastat) 、 C O L - 3 、 ネオバstatt (neovastat) 、 B M S - 2 7 5 2 9 1 、 スクアラミン、エンドスタチン、S U 5 4 1 6 、 S U 6 6 6 8 、 E M D 1 2 1 9 7 4 、 インターロイキン - 1 2 、 1 M 8 6 2 、 アンジオスタチン、ビタキシン (vitaxin) 、 ドロキシフェン、イドキシフェン (idoxyfene) 、 スピロノラクトン、フィナステリド、シメチジン (cimitidine) 、 トラスツズマブ、デニロイキンジフチトクス、ゲフィチニブ、ボルテゾミブ (bortezomib) 、 パクリタキセル、イリノテカン、トポテカン、ドキソルビシン、ドセタキセル、ビノレルビン、ベバシズマブ (モノクローナル抗体) 及びエルビタックス (erbitux) 、 クレモフォール非含有パクリタキセル、エポチロン B (epithilone B) 、 B M S - 2 4 7 5 5 0 、 B M S - 3 1 0 7 0 5 、 ドロキシフェン、4 - ヒドロキシタモキシフェン、ピペンドキシフェン、E R A - 9 2 3 、 アルゾキシフェン、フルベストラント、アコルビフェン、ラソフォキシフェン、イドキシフェン、T S E - 4 2 4 、 H M R - 3 3 3 9 、 Z K 1 8 6 6 1 9 、 P T K 7 8 7 / Z K 2 2 2 5 8 4 、 V X - 7 4 5 、 P D 1 8 4 3 5 2 、 ラパマイシン、4 0 - O - (2 - ヒドロキシエチル) - ラパマイシン、テムシロリムス、A P - 2 3 5 7 3 、 R A D 0 0 1 、 A B T - 5 7 8 、 B C - 2 1 0 、 L Y 2 9 4 0 0 2 、 L Y 2 9 2 2 2 3 、 L Y 2 9 2 6 9 6 、 L Y 2 9 3 6 8 4 、 L Y 2 9 3 6 4 6 、 ワートマニン、Z M 3 3 6 3 7 2 、 L - 7 7 9 , 4 5 0 、 P E G - フィルグラスチム、ダルベポエチン、エリスロポエチン、顆粒球コロニー刺激因子、ゾレドロン酸 (zolendronate) 、 プレドニゾン、セツキシマブ、顆粒球マクロファージコロニー刺激因子、ヒストレリン、ペグインターフェロン - 2 a 、 インターフェロン - 2 a 、 ペグインターフェロン - 2 b 、 インターフェロン - 2 b 、 アザシチジン、P E G - L - アスパラギナーゼ、レナリドマイド、ゲムツズマブ、ヒドロコルチゾン、インターロイキン - 1 1 、 デクスラゾキサン、アレムツズマブ、オールトランスレチノイン酸、ケトコナゾール、インターロイキン - 2 、 メゲストロール、ナイトロジエンマスターード、メチルプレドニゾロン、イブリツモマブ・チウキセタン (ibritumomab tiuxetan) 、 アンドロゲン、デ

シタビン、ヘキサメチルメラミン、ベキサロテン、トシツモマブ、三酸化ヒ素、コルチゾン、エチドロン酸 (editronate)、ミトタン、シクロスボリン、リポソームダウノルビシン、Edwina - アスパラギナーゼ、ストロンチウム 89、カソピタント、ネツピタント、NK - 1受容体拮抗薬、パロノセトロン、アプレピタント、ジフェンヒドラミン、ヒドロキシジン、メトクロプラミド、ロラゼパム、アルプラゾラム、ハロペリドール、ドロペリドール、ドロナビノール、デキサメタゾン、メチルプレドニゾロン、プロクロルペラジン、グラニセトロン、オンドンセトロン、ドラセトロン、トロピセトロン、ssペグフィルグラストム (sspegfilgrastim)、エポエチナルファ及びダルベポエチナルファ、イピリムマブ (ipilimumab)、ベムラフェニブ、FLT - 3 阻害剤、VEGFR 阻害剤、EGFR TK 阻害剤、オーロラキナーゼ阻害剤、PIK - 1 修飾薬、mTOR 阻害剤、Bcl - 2 阻害剤、HDAC 阻害剤、c - MET 阻害剤、PARP 阻害剤、CDK 阻害剤、EGFR TK 阻害剤、IGFR - TK 阻害剤、抗HGF 抗体、PI3 キナーゼ阻害剤、AKT 阻害剤、JAK / STAT 阻害剤、チェックポイント - 1 又は 2 阻害剤、接着斑キナーゼ阻害剤、Map キナーゼキナーゼ (mek) 阻害剤、VEGF 捕捉抗体、並びにこれらの混合物からなる群から選択される、請求項 5 又は請求項 14 に記載の医薬組成物。

【請求項 16】

治療用の、請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 17】

増殖性疾患及び / 又は腫瘍性疾患の治療及び / 又は予防のための治療活性物質として使用するための、請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 18】

増殖性疾患及び / 又は腫瘍性疾患が、癌腫；食道、頭部、腎臓、肝臓、肺、鼻咽頭、頸部、卵巣、脾臓、前立腺、又は胃のがん；白血病（例えば、急性骨髓性白血病、急性リンパ性白血病、急性前骨髓球性白血病（APL）、急性T細胞リンパ芽球性白血病、成人T細胞白血病、好塩基球性白血病、好酸球性白血病、顆粒球性白血病、毛様細胞性白血病、白血球減少性白血病、リンパ性白血病、リンパ芽球性白血病、リンパ球性白血病、巨核球性白血病、小骨髓芽球性白血病、単球性白血病、好中球性白血病及び幹細胞性白血病）；悪性リンパ腫、悪性黒色腫；骨髓増殖性疾患；肉腫；中枢神経系の腫瘍；生殖系腫瘍；精巣がん；甲状腺がん；星状細胞腫；結腸がん、メラノーマ、並びに新形成の混合型からなる群から選択される、請求項 17 に記載の化合物の使用。

【請求項 19】

増殖性疾患及び / 又は腫瘍性疾患の治療及び / 又は予防のための方法であって、治療有効量の、請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の化合物、又は請求項 4 ~ 15 のいずれか一項に記載の医薬組成物を、それを必要とするヒト又は動物に投与するステップを含む、上記方法。

【請求項 20】

がん幹細胞 (CSC)、腫瘍始原細胞、がんと関連する間葉状細胞、間葉系がん性細胞、又は間葉系細胞の増殖又は分化を阻害する方法であって、治療有効量の、請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の化合物、又は請求項 4 ~ 15 のいずれか一項に記載の医薬組成物を、それを必要とするヒト又は動物に投与するステップを含む、上記方法。