

【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19年4月26日(2007.4.26)

【公表番号】特表2006-522119(P2006-522119A)

【公表日】平成18年9月28日(2006.9.28)

【年通号数】公開・登録公報2006-038

【出願番号】特願2006-509028(P2006-509028)

【国際特許分類】

C 07 D 239/94	(2006.01)
A 61 K 31/517	(2006.01)
C 07 D 403/04	(2006.01)
C 07 D 401/04	(2006.01)
A 61 K 31/5377	(2006.01)
A 61 K 31/675	(2006.01)
C 07 D 413/12	(2006.01)
C 07 D 471/04	(2006.01)
C 07 D 498/04	(2006.01)
C 07 D 413/04	(2006.01)
C 07 D 239/95	(2006.01)
C 07 D 409/04	(2006.01)
C 07 D 405/12	(2006.01)
C 07 D 403/12	(2006.01)
C 07 D 401/12	(2006.01)
A 61 K 31/541	(2006.01)
A 61 K 31/55	(2006.01)
C 07 D 409/12	(2006.01)
C 07 D 403/10	(2006.01)
A 61 K 31/551	(2006.01)
C 07 D 401/14	(2006.01)
C 07 D 409/14	(2006.01)
C 07 D 417/14	(2006.01)
C 07 D 417/12	(2006.01)
C 07 D 487/04	(2006.01)
A 61 K 31/553	(2006.01)
C 07 D 417/04	(2006.01)
C 07 D 405/04	(2006.01)
A 61 P 25/04	(2006.01)
A 61 P 29/00	(2006.01)
A 61 P 19/02	(2006.01)
A 61 P 25/06	(2006.01)
A 61 P 25/08	(2006.01)
A 61 P 25/28	(2006.01)
A 61 P 25/22	(2006.01)
A 61 P 25/24	(2006.01)
A 61 P 21/02	(2006.01)
A 61 P 9/06	(2006.01)
A 61 P 25/14	(2006.01)
A 61 P 25/00	(2006.01)
A 61 P 1/04	(2006.01)

A 6 1 P 7/12 (2006.01)
A 6 1 P 43/00 (2006.01)
C 0 7 F 9/6561 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 239/94 C S P
A 6 1 K 31/517
C 0 7 D 403/04
C 0 7 D 401/04
A 6 1 K 31/5377
A 6 1 K 31/675
C 0 7 D 413/12
C 0 7 D 471/04 1 0 6 H
C 0 7 D 498/04 1 0 5
C 0 7 D 413/04
C 0 7 D 239/95
C 0 7 D 409/04
C 0 7 D 405/12
C 0 7 D 403/12
C 0 7 D 401/12
A 6 1 K 31/541
A 6 1 K 31/55
C 0 7 D 409/12
C 0 7 D 403/10
A 6 1 K 31/551
C 0 7 D 401/14
C 0 7 D 409/14
C 0 7 D 417/14
C 0 7 D 417/12
C 0 7 D 487/04 1 4 0
C 0 7 D 471/04 1 1 7 A
C 0 7 D 487/04 1 5 0
A 6 1 K 31/553
C 0 7 D 417/04
C 0 7 D 405/04
A 6 1 P 25/04
A 6 1 P 29/00
A 6 1 P 19/02
A 6 1 P 25/06
A 6 1 P 25/08
A 6 1 P 25/28
A 6 1 P 25/22
A 6 1 P 25/24
A 6 1 P 21/02
A 6 1 P 9/06
A 6 1 P 25/14
A 6 1 P 25/00
A 6 1 P 1/04
A 6 1 P 7/12
A 6 1 P 43/00 1 1 1
C 0 7 F 9/6561 A

【手続補正書】

【提出日】平成19年3月1日(2007.3.1)

【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

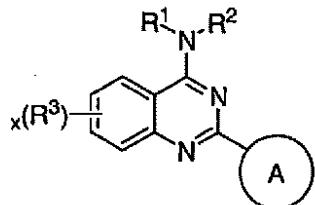
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式IAの化合物：

【化1】

**IA**

または、その薬学的に受容可能な塩であって、ここで：

R^1 および R^2 は、これらが結合する窒素原子と一緒にになって、必要に応じて置換された3員～12員の単環式または二環式の飽和、部分的に不飽和、または完全に不飽和な環を形成し、該環は、硫黄、または酸素より独立して選択される0個～3個のさらなるヘテロ原子を有する環を形成し、ここで、 R^1 および R^2 が一緒にになって形成される該環は、必要に応じて一以上の置換可能な炭素原子、窒素原子、または硫黄原子において、 R^4 の z 個の独立した存在で置換され、ここで、 z は0～5であり：

環Aは、窒素、酸素、もしくは硫黄より独立して選択される0個～3個のヘテロ原子を有する5員～7員の単環式アリール環または8員～10員の二環式アリール環であるか、または窒素、酸素もしくは硫黄より独立して選択される0個～3個のヘテロ原子を有する、3員～12員の飽和もしくは部分的に不飽和の単環式環であり、ここで、環Aは、必要に応じて、 R^5 の y 個の独立した存在で置換され、ここで、 y は、0～5であり、さらに、必要に応じて、 R^{5a} の q 個の独立した存在で置換され、ここで、 q は、0～2であり；

x は、0～4であり：

R^3 、 R^4 、および R^5 の各存在は、独立して $Q - R^X$ であり；ここで、 Q は、結合であるか、または C_1 ～ C_6 アルキリデン鎖であり、ここで、 Q の2までの非隣接メチレン単位が、必要に応じてかつ独立して、-NR-、-S-、-O-、-CS-、-CO₂-、-OCO-、-CO-、-COCO-、-CONR-、-NRCO-、-NR₂CO₂-、-SO₂NR-、-NRSO₂-、-CONRNR-、-NRCONR-、-OCONR-、-NRNR-、-NRSO₂NR-、-SO-、-SO₂-、-PO-、-PO₂-、-OP(O)(OR)-、または-POR-により置換され；そして R^X の各存在は、 R' 、ハロゲン、=O、=NR'、-NO₂、-CN、-OR'、-SR'、-N(R')₂、-NR'COR'、-NR'CON(R')₂、-NR'CO₂R'、-COR'、-CO₂R'、-OCOR'、-CON(R')₂、-OCON(R')₂、-SO₂R'、-SO₂N(R')₂、-NR'SO₂R'、-NR'SO₂N(R')₂、-COCOR'、-COCH₂COR'、-OP(O)(OR')₂、-P(O)(OR')₂、-P(O)₂OR'、-OP(O)₂OR'、-P(O)₂OR'、-PO(R')₂、または-OPO(R')₂より独立して選択され；

R^{5a} の各存在は、独立して、必要に応じて置換された C_1 ～ C_6 脂肪族基、ハロゲン

、 - O R ' 、 - S R ' 、 - N (R ')₂ 、 - N R ' C O R ' 、 - N R ' C O N (R ')₂
 、 - N R ' C O₂ R ' 、 - C O R ' 、 - C O₂ R ' 、 - O C O R ' 、 - C O N (R ')₂
 、 - O C O N (R ')₂ 、 - S O R ' 、 - S O₂ R ' 、 - S O₂ N (R ')₂ 、 - N R '
 S O₂ R ' 、 - N R ' S O₂ N (R ')₂ 、 - C O C O R ' 、 - C O C H₂ C O R ' 、 -
 O P (O) (O R ')₂ 、 - P (O) (O R ')₂ 、 - O P (O)₂ O R ' 、 - P (O)
 O R ' 、 - P O (R ')₂ 、 または - O P O (R ')₂ であり；そして

R の各存在は、独立して、水素または必要に応じて置換された C₁ ~ 6 脂肪族基であり；そして R ' の各存在は、独立して、水素もしくは必要に応じて置換された C₁ ~ 6 脂肪族基、3員～8員の飽和、部分的に不飽和、もしくは完全に不飽和な単環式環であって、該環は、窒素、酸素もしくは硫黄より独立して選択される 0 個～3 個のヘテロ原子を有するか、または、窒素、酸素、もしくは硫黄より独立して選択される 0 個～5 個のヘテロ原子を有する 8 員～12 員の飽和、部分的に不飽和、または完全に不飽和な二環式系である；または、R および R ' 、2つの R の存在、もしくは 2 つの R ' の存在は、これらが結合する原子と一緒にになって、必要に応じて置換された 3 員～12 員の飽和、部分的に不飽和、または十分に不飽和な単環式または二環式環であって、該環は、窒素、酸素、もしくは硫黄より独立して選択される 0 個～4 個のヘテロ原子を有し、ただし：

a . R¹ および R² が、これらが結合する窒素原子と一緒にになって、必要に応じて置換される 4 員の単環式の飽和または部分的に不飽和な環を形成し、該環が、窒素、硫黄、または酸素より独立して選択される 0 個～3 個の追加のヘテロ原子を有する場合；2 - オキサゾリジノン、3 - [(3 R , 4 R) - 2 - オキソ - 1 - (2 - フェニル - 4 - キナゾリニル) - 4 - [2 - (3 - ピリジニル) エテニル] - 3 - アゼチジニル] - 4 - フェニル - , (4 S) - が除外され；

b . R¹ および R² が、これらが結合する窒素原子と一緒にになって、必要に応じて置換された 5 員の単環式の飽和または部分的に不飽和な環を形成し、該環が、窒素、硫黄、または酸素より独立して選択される 0 個～3 個の追加のヘテロ原子を有する場合；

i . 環 A は、必要に応じて置換されたヘキサヒドロ - 1 H - 1 , 4 - ジアゼピン - 1 - イルではなく；かつ、

i i . ベンゼンスルホンアミド、2 - メトキシ - 5 - [2 [[1 - (2 - フェニル - 4 - キナゾリニル) - 3 - ピロリジニル] アミノ] エチル] - , (R) , ピス (トリフルオロアセテート) 、ベンゼンスルホンアミド、2 - メトキシ - 5 - [2 - [[1 - (2 - フェニル - 4 - キナゾリニル) - 3 - ピロリジニル] アミノ] エチル] - , (S) , ピス (トリフルオロアセテート) が除外され；

i i i . 3 - ピロリジンアミン、1 - (2 - フェニル - 4 - キナゾリニル) - 、および (R) - 3 - ピロリジンアミン、1 - (2 - フェニル - 4 - キナゾリニル) - , (S) - が除外され；

i v . R¹ および R² が、一緒にになって、非置換のピロリジン - 1 - イルであり、環 A が非置換のフェニルであり、そして x が 1 である場合、R³ は、6 - O M e でも 6 - O H でもなく；

v . R¹ および R² が、一緒にになって、非置換のピロリジン - 1 - イルであり、環 A が非置換のフェニルであり、そして x が 2 である場合、2 の R³ 基は、6 - O M e および 7 - O M e でなく；

v i . R¹ および R² が、一緒にになって、非置換のピロリジン - 1 - イルである場合、環 A は、非置換のピロリジン - 1 - イルでも、必要に応じて置換されたピペラジン - 1 - イルでも、非置換のモルホリン - 1 - イルでも、非置換のピペリジン - 1 - イルでもなく；

v i i . R¹ および R² が、一緒にになって、ピロリジン - 1 - イルであり、かつ x が 0 であり、そして環 A が非置換のフェニルである場合、該ピロリジン - 1 - イル基は、3 位にて - O H でも 2 - メトキシ - フエノキシでも置換されず；

v i i i . R¹ および R² が、一緒にになって、非置換のピロリジン - 1 - イルであり、そして x が 0 である場合、環 A は、2 , 3 - キシリルでも、3 - メチルフェニルでも、

非置換のフェニルでも、4 - プロモフェニルでも、4 - クロロフェニルでも、3 - ニトロフェニルでも、非置換のピリド - 3 - イルでも、2 , 4 - ジクロロフェニルでも、3 , 4 - ジクロロフェニルでも、4 - プロポキシフェニルでも、3 - メチルフェニルでも、3 , 4 , 5 - トリメトキシフェニルでも、2 - クロロフェニルでも、非置換のピリド - 4 - イルでも、2 - ヒドロキシフェニルでも、4 - (1 , 1 - ジメチルエチル) フェニルでもなく；

c. R^1 および R^2 が、これらが結合する窒素原子と一緒にになって、必要に応じて置換される 6 員の単環式または二環式の飽和または部分的に不飽和な環を形成し、該環が、窒素、硫黄、または酸素より独立して選択される 0 個～3 個の追加のヘテロ原子を有する場合；

i . R¹ および R² が、一緒になって、非置換のモルホリノ環を形成し、かつ、環 A が非置換のフェニルである場合、x は 0 でないか、あるいは x が 1 または 2 である場合、R³ は、以下： 6 - フルオロでも、6 , 7 - ジメトキシでも、6 - ニトロでも、6 - Ac H N でも、6 - メトキシ (methoxy) でも、6 - NH₂ でも、6 - OCHN でも、6 - OH でも、6 - AcMeN - でも、6 - TsHN - でも、6 - Me₂N - でも、7 - OH でも、6 - アミノ - チアゾール - 2 - イルでも、6 - NHCOOCOOEt でも、6 - (4 - フェニル - アミノ - チアゾール - 2 - イル) でもなく；

i i . R¹ および R² が、一緒になって、非置換のモルホリノ環を形成し、そして環 A が、非置換のシクロヘキシリ、非置換のピリド-3-イル、非置換の2-フリル、2-フルオロフェニル、3-チエニル、ベンゾフラン、ピリダジン、フェニル環の3位、4位、もしくは5位の1箇所以上で置換されたフェニルであり、そして x が 1 または 2 である場合、R³ は、6-NH₂ でも、6-OHCHN でも、6-OH でも、7-OH でも、6-MsHN- でも、6-AcHN- でも、6-フルオロでも、6-OMe でもなく；

i i i . R¹ および R² が、一緒にになって、ピペリド - 4 - オン、ピペリド - 4 - オール、もしくはチオモルホリノ、またはジメチル置換モルホリノ環を形成し、環 A が非置換のフェニルであり、かつ、x が 1 である場合、R³ は、6 - OH ではなく；

i \vee *x* が 0 であり、かつ、A が非置換のフェニル、3, 4, 5-トリメトキシフェニル、または 3, 4-ジメトキシフェニルである場合、 R^1 および R^2 は、一緒になって、必要に応じて置換されたピペリジニルでも必要に応じて置換されたピペラジニルでもなく：

v . x が 2 または 3 であり、かつ、 R^3 が 6 , 7 -ジOME または 6 , 7 , 8 -トリOME である場合、 R^1 および R^2 は、一緒にになって、必要に応じて置換されたピペリジン-1-イルでも、ピペラジン-1-イルでも、モルホリン-1-イルでもなく；

v i . x が 0 であり、かつ、環 A が非置換のフェニルである場合、R¹ および R² は、一緒にになって、必要に応じて置換されたピペラジニルでも縮合したピペラジニルでもなく；

v i i . x が 0 であり、かつ、環 A が、フェニル環の 3 位、4 位、または 5 位の 1 箇所以上で必要に応じて置換されたフェニルである場合、R¹ および R² は、一緒になつて、必要に応じて置換されたピペラジン - 1 - イルでもモルホリン - 1 - イルでもなく；

² v i i i . x が 0 であり、かつ、環 A が 2 - F - フェニルである場合、R¹ および R² は、一緒になって、4 - (2 - C1 - フェニル) - ピペラジン - 1 - イルでも、4 - (3 - C1 - フェニル) - ピペラジン - 1 - イルでも、または非置換のモルホリン - 1 - イルでもなく：

i × . *x* が 0 であり、かつ、環 A が 2 - C 1 - フェニルである場合、R¹ および R² は、一緒にになって、非置換のモルホリン - 1 - イルでも、4 - Me - ピペラジン - 1 - イルでも、4 - Et - ピペラジン - 1 - イルでも、4 - フェニル - ピペラジン - 1 - イルでも、4 - CH₂ Ph₂ - ピペラジン - 1 - イルでもなく；

x . x が 0 であり、かつ、環 A が 2 - OH フェニルである場合、R¹ および R² は、一緒にになって、非置換のモルホリン - 1 - イルでも、4 - (2 - OMe - フェニル) - ピペラジン - 1 - イルでも、4 - CH₂Ph - ピペラジン - 1 - イルでも、4 - Et - ピペ

ラジン - 1 - イルでも、4 - M e - ピペラジン - 1 - イルでもなく；

x i . x が 0 であるか、x が 1 であってかつ R³ が 6 - B r であるか、または x が 2 であってかつ R³ が 6 - 7 - ジ O M e であり、そして環 A が必要に応じて置換された 2 - チエニルまたは 3 - チエニルである場合、R¹ および R² は、一緒になって、4 - P h - ピペラジン - 1 - イルでも、4 - (3 - C F₃ - フェニル) - ピペラジン - 1 - イルでも、4 - (2 - O E t - フェニル) - ピペラジン - 1 - イルでも、4 - M e - ピペラジニルでも、非置換のモルホリン - 1 - イルでもなく；

x i i . x が 0 であり、かつ、環 A が非置換のピリド - 3 - イルまたはピリド - 4 - イルである場合、R¹ および R² は、一緒になって、必要に応じて置換されたモルホリン - 1 - イルでも、必要に応じて置換されたピペラジン - 1 - イルでもなく；

x i i i . x が 0 であり、かつ、環 A が必要に応じて置換された 1 H - イミダゾール - 2 - イルまたは 1 H - イミダゾール - 1 - イルである場合、R¹ および R² は、一緒になって、非置換のモルホリン 1 - イルでも、4 - M e - ピペラジン - 1 - イルでも、4 - C H₂ C H₂ O H - ピペラジン - 1 - イルでもなく；

x i v . x が 0 であり、かつ、環 A が 5 - N O₂ - チアゾール - 2 - イルである場合、R¹ および R² は、一緒になって、4 - M e - ピペラジン - 1 - イルではなく；

x v . x が 0 であり、かつ、環 A が 5 - N O₂ - 2 - フラニルである場合、R¹ および R² は、一緒になって、4 - C H₂ C H₂ O H - ピペラジン - 1 - イルでも、4 - M e - ピペラジン - 1 - イルでも、非置換のモルホリン - 1 - イルでもなく；

x v i . x が 1 であり、R³ が 6 - O H であり、かつ、環 A が非置換のフェニルである場合、R¹ および R² は、一緒になって、非置換のモルホリン - 1 - イルでも、4 - M e - ピペラジン - 1 - イルでもなく；

x v i i . x が 0 であり、かつ、R¹ および R² が、一緒になって、非置換のピペリジニルである場合、環 A は、2 - O H - フェニルでも、4 - O M e フェニルでも、4 - F - フェニルでも、4 - N O₂ - フェニルでも、ピリド - 3 - イルでも、ピリド - 4 - イルでも、2 - C l - フェニルでも、4 - O_n P r - フェニルでも、3 , 4 - ジクロロフェニルでも、2 - F - フェニルでも、4 - B r - フェニルでも、4 - C l - フェニルでも、3 - N O₂ - フェニルでも、2 , 4 - ジクロロフェニルでもなく；

x v i i i . x が 0 であり、環 A が 4 - B r - フェニル、2 - F - フェニル、2 - C l - フェニル、4 - C l - フェニル、4 - O n P r - フェニル、2 , 4 - ジクロロフェニル、3 , 4 - ジクロロフェニル、4 - M e - フェニル、3 - M e - フェニル、ピリド - 3 - イル、ピリド - 4 - イル、2 - O H - フェニル、4 - N O₂ - フェニル、4 - t B u - フェニルである場合、R¹ および R² は、一緒になって、2 - M e - ピペリジン - 1 - イルでも、4 - C H₂ - P h - ピペリジン - 1 - イルでも、4 - M e - ピペリジン - 1 - イルでも、3 - C O O E t - ピペリジン - 1 - イルでも、4 - C O O E t - ピペリジン - 1 - イルでも、2 - E t - ピペリジン - 1 - イルでも、3 - M e - ピペリジン - 1 - イルでも、3 , 5 - ジ M e - ピペリジン - 1 - イルでも、4 - C O N H₂ - ピペリジン - 1 - イルでも、(4 - ピペリジニル、4 - カルボキサミド) - ピペリジン - 1 - イルでも、1 , 4 - ジオキサ - 8 - アザスピロ [4 . 5] デカンでも、3 , 4 - ジヒドロ - 2 (1 H) - イソキノリニルでも、またはピペリジン - 4 - オンでもなく；

x i x . x が 1 であり、R³ が 6 - B r 、6 - C l 、6 - O H 、6 - O M e 、または 6 - M e であり、かつ、環 A が、4 - プロモフェニル、4 - C H₂ P (O) (O H) (O E t) フェニル、または非置換のフェニルである場合、R¹ および R² は、必要に応じて置換されたピペリジニルではなく；

x x . x が 2 であり、R³ が 6 , 7 - ジメトキシであり、かつ、A が非置換のフェニルである場合、R¹ および R² は、一緒になって、1 , 4 - ジオキサ - 8 - アザスピロ [4 . 5] デカンでも 3 , 4 - ジヒドロ - 2 (1 H) - イソキノリニルでもなく；

x x i . x が 3 であり、R³ の 3 個の存在が 5 - O A c 、6 - O A c および 8 - ピペリジニルであり、そして環 A が、非置換のフェニルである場合、R¹ および R² は、一緒になって、非置換のピペリジニル環ではなく；

$\times \times i i . \times$ が 3 であり、かつ、 R^3 の 3 個の存在が 6 - M e 、 7 - C O O E t 、 および 8 - M e であり、かつ、環 A が、2 - C 1 - フェニルである場合、 R^1 および R^2 は、一緒になって、4 - フェニル - ピペラジン - 1 - イルでも、4 - (4 - C 1 - フェニル) - ピペラジン - 1 - イルでも、非置換のピペラジン - 1 - イルでも、4 - C H₂ P h - ピペラジン - 1 - イルでも、4 (2 - C 1 - フェニル) ピペラジン - 1 - イルでも、4 - C O O E t - ピペラジン - 1 - イルでもなく；

c . R^1 および R^2 が、これらが結合する窒素原子と一緒にになって、必要に応じて置換される 7 員の単環式または二環式の飽和または部分的に不飽和な環を形成し、該環は、窒素、硫黄、または酸素より独立して選択される 0 個～3 個の追加のヘテロ原子を有する場合；

i . ベンゼンスルホンアミド、2 - メトキシ - 5 - [2 - [5 - (2 - フェニル - 4 - キナゾリニル) - 2 , 5 - ジアザビシクロ [2 . 2 . 1] ヘプト - 2 - イル] エチル] - 、およびビス(トリフルオロアセテート)2 , 5 - ジアザビシクロ [2 . 2 . 1] ヘプタン、2 - (2 - フェニル - 4 - キナゾリニル) - が除外され；

i i . \times が 2 であり、かつ、 R^3 の両方の存在が O M e であり、かつ、環 A が、4 - C 1 - フェニルである場合、 R^1 および R^2 は、一緒になって、非置換のヘキサヒドロ - 1 H - アゼピン - 1 - イルでなく；

i i i . \times が 0 であり、かつ、 R^1 および R^2 が、一緒になって、非置換のヘキサヒドロ - 1 H - アゼピン - 1 - イルである場合、環 A は、非置換のフェニルでも、4 - F - フェニルでも、4 - N O₂ - フェニルでも、ピリド - 4 - イルでも、3 , 4 - ジ C 1 - フェニルでも、2 - C 1 - フェニルでも、2 , 4 - ジ C 1 - フェニルでも、2 , 4 - ジ C 1 - フェニルでも、3 - N O₂ - フェニルでも、4 - C 1 - フェニルでも、4 - O_n P r - フェニルでも、3 - M e - フェニルでも、3 , 4 - O M e - フェニルでも、3 , 4 , 5 - O M e - フェニルでも、ピリド - 3 - イルでも、2 - O H - フェニルでもなく；

d . R^1 および R^2 が、これらが結合する窒素原子と一緒にになって、必要に応じて置換される 8 員の単環式または二環式の飽和または部分的に不飽和な環を形成し、該環が、窒素、硫黄、または酸素より独立して選択される 0 個～3 個の追加のヘテロ原子を有する場合；

i . ベンゼンスルホンアミド、2 - メトキシ - 5 - [2 - [8 - (2 - フェニル - 4 - キナゾリニル) - 3 , 8 - ジアザビシクロ [3 . 2 . 1] オクト - 3 - イル] エチル] - 、ビス(トリフルオロアセテート)3 , 8 - ジアザビシクロ [3 . 2 . 1] オクタン、3 - (フェニルメチル) - 8 - (2 - フェニル - 4 - キナゾリニル) - 3 , 8 - ジアザビシクロ [3 . 2 . 1] オクタン、8 - (2 - フェニル - 4 - キナゾリニル) - ；キナゾリン；2 - (3 - メチルフェニル) - 4 - (1 , 3 , 3 - トリメチル - 6 - アザビシクロ [3 . 2 . 1] オクト - 6 - イル - 、モノヒドロクロリド；キナゾリン；2 - (4 - ニトロフェニル) - 4 - (1 , 3 , 3 - トリメチル - 6 - アザビシクロ [3 . 2 . 1] オクト - 6 - イル) - ；モノヒドロクロリド；キナゾリン；2 - (3 - メチルフェニル) - 4 - (1 , 3 , 3 - トリメチル - 6 - アザビシクロ [3 . 2 . 1] オクト - 6 - イル) - ；キナゾリン；2 - (4 - メチルフェニル) - 4 - (1 , 3 , 3 - トリメチル - 6 - アザビシクロ [3 . 2 . 1] オクト - 6 - イル) - ；およびキナゾリン；2 - (4 - ニトロフェニル) - 4 - (1 , 3 , 3 - トリメチル - 6 - アザビシクロ [3 . 2 . 1] オクト - 6 - イル) - が除外され；そして

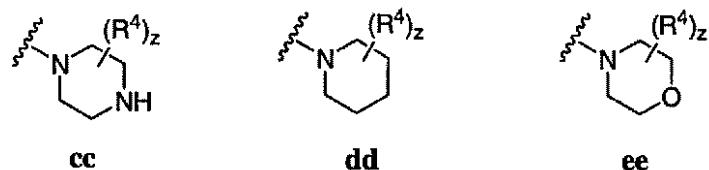
e . R^1 および R^2 が、これらが結合する窒素原子と一緒にになって、必要に応じて置換される 9 員の単環式または二環式の飽和または部分的に不飽和な環を形成し、該環が、窒素、硫黄、または酸素より独立して選択される 0 ~ 3 のヘテロ原子をさらに有する場合；ピペラジン、1 - [4 - (1 , 3 - ジヒドロ - 1 , 3 - ジオキソ - 2 H - イソインドール - 2 - イル) - 6 , 7 - ジメトキシ - 2 - キナゾリニル] - 4 - (2 - フラニルカルボニル) - が除外される；

化合物またはその薬学的に受容可能な塩。

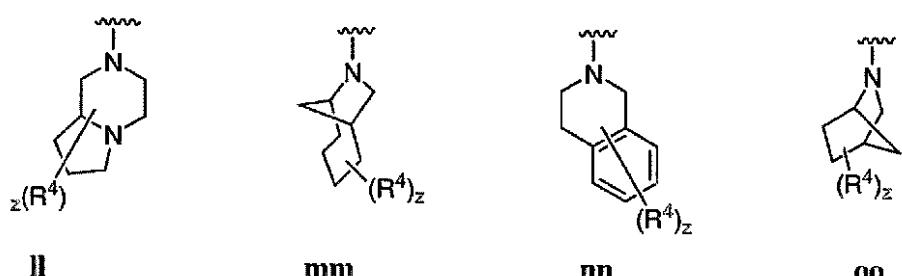
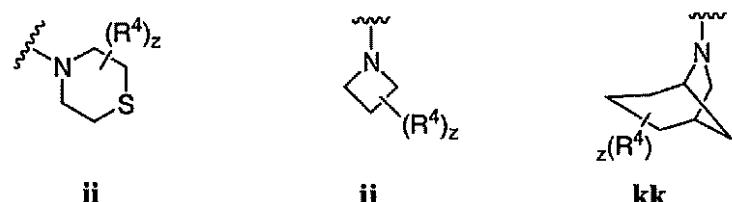
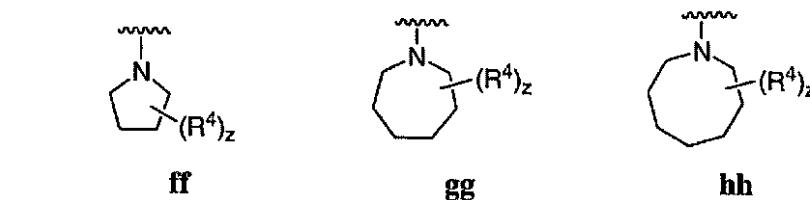
【請求項 2】

請求項 1 に記載の化合物であって、ここで、一緒になった R^1 および R^2 により形成される前記環が：

【化 2】



【化 3】



より選択され、ここで、一緒になった R^1 および R^2 により形成される該環が、1 個以上の適切な炭素原子、窒素原子、または硫黄原子において、 $-R^4$ の z 個の独立した存在で必要に応じて置換され、かつ z が 0 ~ 5 である、化合物。

【請求項 3】

請求項 2 に記載の化合物であって、ここで、一緒になった R^1 および R^2 が、アゼチジン - 1 - イル (j j) 、ピロリジン - 1 - イル (f f) 、ピペリジン - 1 - イル (d d) 、ピペラジン - 1 - イル (c c) 、またはモルホリン - 4 - イル (e e) より選択される必要に応じて置換された環である、化合物。

【請求項 4】

請求項 2 に記載の化合物であって、ここで、一緒になった R^1 および R^2 が、アゼチジン - 1 - イル (j j) 、ピロリジン - 1 - イル (f f) 、ピペリジン - 1 - イル (d d) 、またはピペラジン - 1 - イル (c c) より選択される必要に応じて置換された環である、化合物。

【請求項 5】

請求項 2 に記載の化合物であって、ここで、一緒になった R^1 および R^2 が、以下：
 a . z が 1 または 2 であり、そして少なくとも 1 個の R^4 の存在が、 $-N R S O_2 R'$ 、 $-N R C O O R'$ 、または $-N R C O R'$ である、必要に応じて置換されたアゼチジン - 1 - イル (j j) ；

b . z が 1 であり、そして R⁴ が、 - N R S O₂ R' である、必要に応じて置換されたアゼチジン - 1 - イル (j j) ;

c . z が 1 であり、そして R⁴ が、 - N R C O O R' である、必要に応じて置換されたアゼチジン - 1 - イル (j j) ;

d . z が 1 であり、そして R⁴ が、 - N R C O R' である、必要に応じて置換されたアゼチジン - 1 - イル (j j) ;

e . z が 1 または 2 であり、そして R⁴ が、 Cl、Br、F、CF₃、CH₃、-CH₂CH₃、-OR'、または -CH₂OR' である、必要に応じて置換されたピロリジン - 1 - イル (f f) ;

f . z が 1 または 2 であり、そして少なくとも 1 個の R⁴ の存在が、Cl、Br、F、CF₃、CH₃、-CH₂CH₃、-OR' もしくは -CH₂OR'、-NRSO₂R'、-NRCOOR' または -OC(=O)(R')₂ である、必要に応じて置換されたピペリジン - 1 - イル (d d) ;

g . z が 1 であり、そして R⁴ が F、CF₃、CH₃、-CH₂CH₃、-OR'、または -CH₂OR' である、必要に応じて置換されたピペリジン - 1 - イル (d d) ;

h . z が 1 であり、そして R⁴ が -NRSO₂R' である、必要に応じて置換されたピペリジン - 1 - イル (d d) ;

i . z が 1 であり、そして R⁴ が -NRCOOR' である、必要に応じて置換されたピペリジン - 1 - イル (d d) ;

j . z が 1 または 2 であり、そして少なくとも 1 個の R⁴ の存在が、-SOR'、-CON(R')₂、-SO₂N(R')₂、-COR'、または -COOR' である、必要に応じて置換されたピペラジン - 1 - イル (c c) ;

k . z が 1 であり、そして R⁴ が、-SOR' である、必要に応じて置換されたピペラジン - 1 - イル (c c) ;

l . z が 1 であり、そして R⁴ が、-COOR' である、必要に応じて置換されたピペラジン - 1 - イル (c c) ;

m . z が 1 であり、そして R⁴ が、-CON(R')₂ である、必要に応じて置換されたピペラジン - 1 - イル (c c) ;

n . z が 1 であり、そして R⁴ が、-SO₂N(R')₂ である、必要に応じて置換されたピペラジン - 1 - イル (c c) ; あるいは

o . z が 1 であり、そして R⁴ が、-COR' である、必要に応じて置換されたピペラジン - 1 - イル (c c) ;

より選択される、化合物。

【請求項 6】

請求項 1 に記載の化合物であって、ここで、z が 0 ~ 5 であり、そして R⁴ 基が、存在する場合、各々独立して、ハロゲン、CN、NO₂、-NR'₂、-CH₂N(R')₂、-OR'、-CH₂OR'、-SR'、-CH₂SR'、-COOR'、-NRCOR'、-CON(R')₂、-OC(=O)(R')₂、COR'、-NHCOOR'、-SO₂R'、-SO₂N(R')₂、または、必要に応じて置換された基であって、該基が、C₁ ~ C₆ 脂肪族、アリール、ヘテロアリール、シクロ脂肪族、ヘテロシクロ脂肪族、アリール C₁ ~ C₆ アルキル、ヘテロアリール C₁ ~ C₆ アルキル、シクロ脂肪族 C₁ ~ C₆ アルキル、もしくはヘテロシクロ脂肪族 C₁ ~ C₆ アルキルより選択される、化合物。

【請求項 7】

請求項 1 に記載の化合物であって、ここで、z が 0 ~ 5 であり、そして R⁴ 基が、各々独立して、Cl、Br、F、CF₃、CH₃、-CH₂CH₃、CN、-COOH、-N(CH₃)₂、-N(Et)₂、-N(ipr)₂、-O(CH₂)₂OCH₃、-CO NH₂、-COOCH₃、-OH、-CH₂OH、-NHCOCH₃、-SO₂NH₂、-SO₂(CH₂)₃CH₃、-SO₂CH(CH₃)₂、-SO₂N(CH₃)₂、-SO₂CH₂CH₃、-C(O)OCH₂CH(CH₃)₂、-C(O)NHCH₂CH(CH₃)₂、-NHC(=O)CH₃、-C(O)C(CH₃)₃、-COO(CH₂)₂

CH_3 、- $\text{C}(\text{O})\text{NHCH}(\text{CH}_3)_2$ 、- $\text{C}(\text{O})\text{CH}_2\text{CH}_3$ 、または、必要に応じて置換された基であって、該基が、-ピペリジニル(*piperidinyl*)、ピペリジニル(*piperiziny1*)、モルホリノ、 $\text{C}_{1\sim 4}$ アルコキシ、フェニル、フェニルオキシ、ベンジル、ベンジルオキシ、- CH_2 シクロヘキシリル、ピリジル、- CH_2 ピリジル、もしくは- CH_2 チアゾリルより選択される、化合物。

【請求項8】

請求項1に記載の化合物であって、ここで、 x が0~4であり、そして、 R^3 基が、存在する場合、各々独立して、ハロゲン、CN、NO₂、-N(R')₂、-CH₂N(R')₂、-OR'、-CH₂OR'、-SR'、-CH₂SR'、-COOR'、-NRCOR'、-CON(R')₂、-OCON(R')₂、COR'、-NHCOOR'、-SO₂R'、-SO₂N(R')₂、または、必要に応じて選択された基であって、該基が、C₁~C₆脂肪族、アリール、ヘテロアリール、シクロ脂肪族、ヘテロシクロ脂肪族、アリールC₁~C₆アルキル、ヘテロアリールC₁~C₆アルキル、シクロ脂肪族C₁~C₆アルキル、もしくはヘテロシクロ脂肪族C₁~C₆アルキルより選択される、化合物。

【請求項9】

請求項1に記載の化合物であって、ここで、 x が1または2であり、そしてR³の各存在が、独立して、Cl、Br、F、CF₃、-OCF₃、Me、Et、CN、-COOH、-NH₂、-N(CH₃)₂、-N(Et)₂、-N(ipr)₂、-O(CH₂)₂OCH₃、-CONH₂、-COOCH₃、-OH、-OCH₃、-OCH₂CH₃、-CH₂OH、-NHCOCH₃、-NHCOC₂(CH₃)₂、-SO₂NH₂、-CONH(シクロプロピル)、-CONHCH₃、-C(O)NHCH₂CH₃、または、必要に応じて置換された基であって、該基が、-ピペリジニル(*piperidinyl*)、ピペリジニル(*piperiziny1*)、モルホリノ、フェニル、フェニルオキシ、ベンジル、もしくはベンジルオキシより選択される、化合物。

【請求項10】

請求項1に記載の化合物であって、ここで、 x が1または2であり、そして、各R³基が、独立して、ハロゲン、CN、必要に応じて置換されたC₁~C₆アルキル、OR'、N(R')₂、CON(R')₂、またはNRCOR'である、化合物。

【請求項11】

請求項1に記載の化合物であって、ここで、 x が1または2であり、そして、各R³基が、-Cl、-CH₃、-CH₂CH₃、-F、-CF₃、-OCF₃、-CONHCH₃、-CONHCH₂CH₃、-CONH(シクロプロピル)、-OCH₃、-NH₂、-OCH₂CH₃、または-CNである、化合物。

【請求項12】

請求項1に記載の化合物であって、ここで、 x が1であり、そして、R³が、前記キナゾリン環の6位に存在し、-Cl、-CH₃、-CH₂CH₃、-F、-CF₃、-OCF₃、-CONHCH₃、-CONHCH₂CH₃、-CONH(シクロプロピル)、-OCH₃、-NH₂、-OCH₂CH₃、または-CNである、化合物。

【請求項13】

請求項1に記載の化合物であって、ここで、 x が1であり、そして、R³が、前記キナゾリン環の7位に存在し、-Cl、-CH₃、-CH₂CH₃、-F、-CF₃、-OCF₃、-CONHCH₃、-CONHCH₂CH₃、-CONH(シクロプロピル)、-OCH₃、-NH₂、-OCH₂CH₃、または-CNである、化合物。

【請求項14】

請求項1に記載の化合物であって、ここで、 x が1であり、そして、R³が、前記キナゾリン環の6位に存在し、そして、-Cl、-CH₃、-CH₂CH₃、-F、-CF₃、-OCF₃、-OCH₃、または-OCH₂CH₃である、化合物。

【請求項15】

請求項1に記載の化合物であって、ここで、 x が1であり、そして、R³が、前記キナ

ゾリン環の7位に存在し、かつ、-C1、-CH₃、-CH₂CH₃、-F、-CF₃、-OCF₃、-OCH₃、または-OCH₂CH₃である、化合物。

【請求項16】

請求項1に記載の化合物であって、ここで、xが1であり、そして、R³が、前記キナゾリン環の6位に存在し、かつ、-CON(R')₂またはNRCOR'である、化合物。

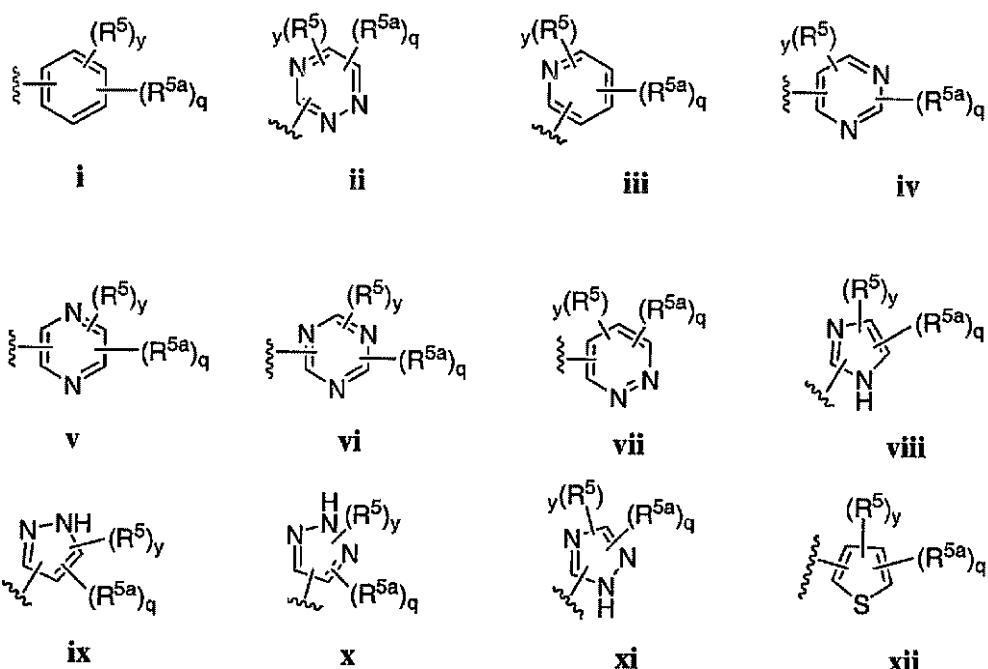
【請求項17】

請求項1に記載の化合物であって、ここで、xが1であり、そして、R³が、前記キナゾリン環の7位に存在し、かつ-C1、-CH₃、-CH₂CH₃、-F、-CF₃、-OCF₃、-OCH₃、または-OCH₂CH₃である、化合物。

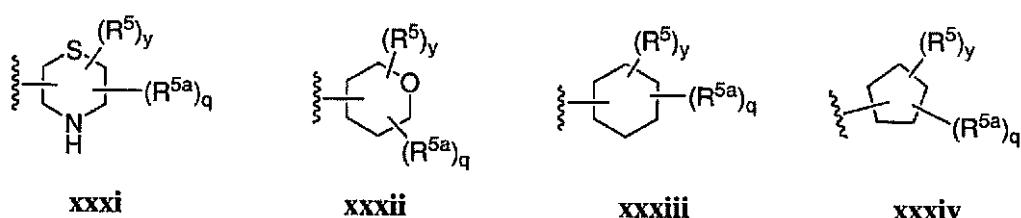
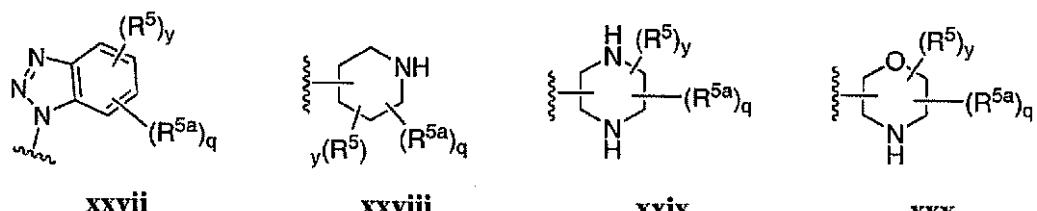
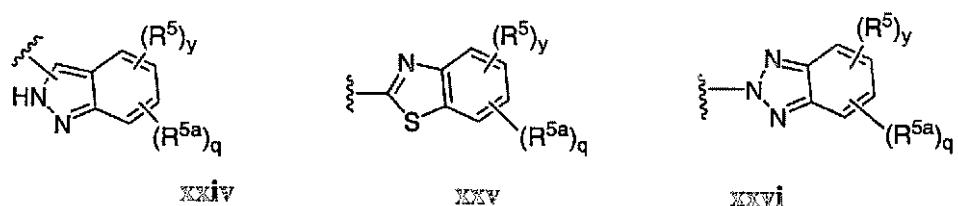
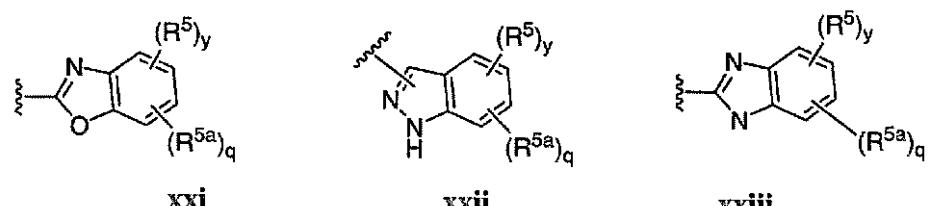
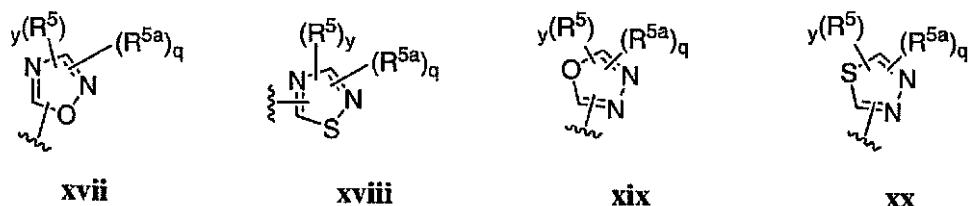
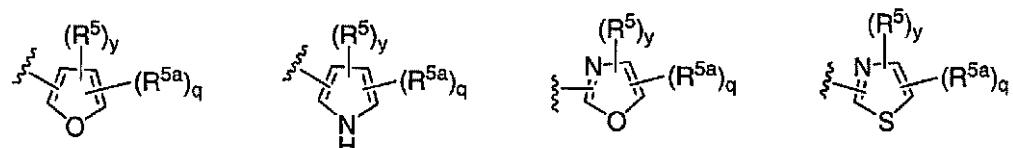
【請求項18】

請求項1に記載の化合物であって、ここで、環Aが、以下：

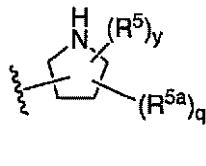
【化4】



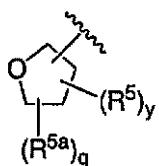
【化5】



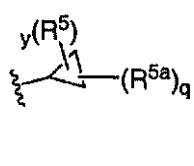
【化6】



XXXV



XXXVI



XXXVII

より選択される基である、化合物。

【請求項19】

請求項17に記載の化合物であって、ここで、環Aが、必要に応じて置換されたフェニル、2-ピリジル、3-ピリジル、もしくは4-ピリジル、またはピロール-1-イルである、化合物。

【請求項20】

請求項1に記載の化合物であって、ここで、yが0～5であり、qが0～2であり、そしてR⁵基およびR^{5a}基が、存在する場合、各々独立して、ハロゲン、CN、NO₂、-N(R')₂、-CH₂N(R')₂、-OR'、-CH₂OR'、-SR'、-CH₂SR'、--NRCOR'、-CON(R')₂、-S(O)₂N(R')₂、-OCOR'、-COR'、-CO₂R'、-OCON(R')₂、-NR'SO₂R'、-OP(O)(OR')₂、-P(O)(OR')₂、-P(O)(OR')₂、-OP(O)OR'、-PO(R')₂、-OPO(R')₂、または、必要に応じて置換された基であって、該基が、C₁～C₆脂肪族、アリール、ヘテロアリール、シクロ脂肪族、ヘテロシクロ脂肪族、アリールC₁～C₆アルキル、ヘテロアリールC₁～C₆アルキル、シクロ脂肪族C₁～C₆アルキル、もしくはヘテロシクロ脂肪族C₁～C₆アルキルより選択される、化合物。

【請求項21】

請求項1に記載の化合物であって、ここで、yが0～5であり、そしてqが1または2であり、そしてR^{5a}の各存在が、独立して、Cl、Br、F、CF₃、Me、Et、C₂N、-COOH、-NH₂、-N(CH₃)₂、-N(Et)₂、-N(iPr)₂、-O(CH₂)₂OCH₃、-CONH₂、-COOCH₃、-OH、-OCH₃、-OC(H₂C₆H₃)₂OCH₃、-CH₂OH、-NHCOCH₃、-SO₂NH₂、-SO₂NHC(CH₃)₂、-OCOC(CH₃)₃、-OCOCH₂C(CH₃)₃、-O(CH₂)₂N(CH₃)₂、4-CH₃-ピペラジン-1-イル、OCOCH(CH₃)₂、OCO(シクロペンチル)、-COCH₃、必要に応じて置換されたフェノキシ、または必要に応じて置換されたベンジルオキシである、化合物。

【請求項22】

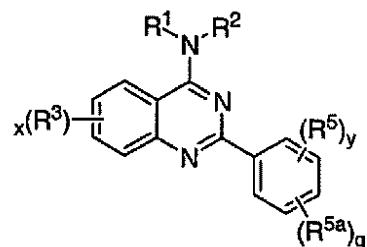
請求項1に記載の化合物であって、ここで：

- a . yが0であり、そしてqが1でかつR^{5a}がFであるか；
- b . yが0であり、qが1であり、そしてR^{5a}がOR'であるか；
- c . yが0であり、qが1であり、そしてR^{5a}がOHであるか；
- d . yが0であり、qが2であり、そしてR^{5a}の一方の存在がOR'であり、そしてR^{5a}のもう一方の存在がFであるか；あるいは、
- e . yが0であり、qが2であり、そしてR^{5a}の一方の存在がOHであり、そしてR^{5a}のもう一方の存在がFである、化合物。

【請求項23】

請求項1に記載の化合物であって、ここで、環Aが、必要に応じて置換されたフェニルであり、そして化合物が、構造IA-i：

【化7】



を有し、ここで：

y が 0 ~ 5 であり；

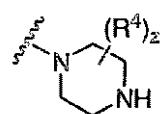
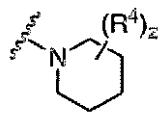
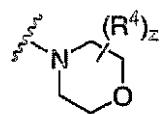
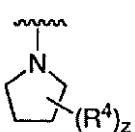
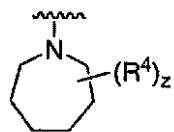
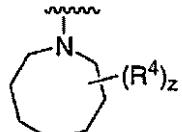
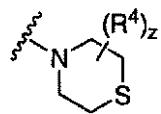
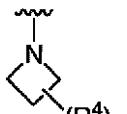
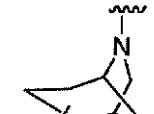
q が 0 ~ 2 であり；そして

R^{5a} の各存在が、独立して、必要に応じて置換された $C_1 \sim C_6$ 脂肪族基、ハロゲン、 $-OR'$ 、 $-SR'$ 、 $-N(R')、 $-NR'COR'$ 、 $-NR'CON(R')_2$ 、 $-NR'CO_2R'$ 、 $-COR'$ 、 $-CO_2R'$ 、 $-OCOR'$ 、 $-CON(R')_2$ 、 $-OCON(R')_2$ 、 $-SOR'$ 、 $-SO_2R'$ 、 $-SO_2N(R')_2$ 、 $-NR'SO_2N(R')_2$ 、 $-COCOR'$ 、 $-COCH_2COR'$ 、 $-OP(O)(OR')_2$ 、 $-P(O)(OR')_2$ 、 $-OP(O)_2OR'$ 、 $-P(O)_2OR'$ 、 $-PO(R')_2$ 、または $-OPO(R')_2$ である、化合物。$

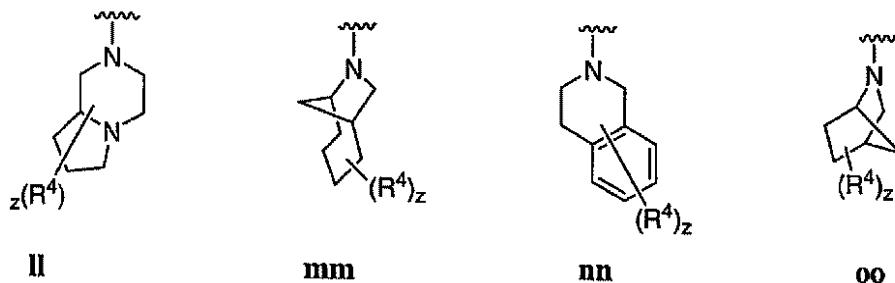
【請求項 24】

請求項 23 に記載の化合物であって、ここで、一緒になった R^1 および R^2 により形成された前記環が、以下：

【化8】

**cc****dd****ee****ff****gg****hh****ii****jj****kk**

【化9】



より選択され、ここで、一緒になった R^1 および R^2 により形成される該環が、1個以上の置換可能な炭素原子、窒素原子、または硫黄原子において、- R^4 の z 個の独立した存在で必要に応じて置換され、そして z が 0 ~ 5 である、化合物。

【請求項25】

請求項24に記載の化合物であって、ここで、一緒になった R^1 および R^2 が、必要に応じて置換された環であり、該環が、アゼチジン-1-イル($j\ j$)、ピロリジン-1-イル($f\ f$)、ピペリジン-1-イル($d\ d$)、ピペラジン-1-イル($c\ c$)、またはモルホリン-4-イル($e\ e$)より選択される環である、化合物。

【請求項26】

請求項24に記載の化合物であって、ここで、一緒になった R^1 および R^2 が、必要に応じて置換された環であり、該環が、アゼチジン-1-イル($j\ j$)、ピロリジン-1-イル($f\ f$)、ピペリジン-1-イル($d\ d$)、またはピペラジン-1-イル($c\ c$)より選択される環である、化合物。

【請求項27】

請求項23に記載の化合物であって、ここで、 z が 0 ~ 5 であり、そして R^4 基が、存在する場合、各々独立して、ハロゲン、CN、NO₂、-NR'、-CH₂N(R')₂、-OR'、-CH₂OR'、-SR'、-CH₂SR'、-COOR'、-NRCO R'、-CON(R')₂、-OC(=O)N(R')₂、COR'、-NHCOOR'、-SO₂R'、-SO₂N(R')₂、または、必要に応じて置換された基であって、該基が、C₁ ~ C₆ 脂肪族、アリール、ヘテロアリール、シクロ脂肪族、ヘテロシクロ脂肪族、アリールC₁ ~ C₆ アルキル、ヘテロアリールC₁ ~ C₆ アルキル、シクロ脂肪族C₁ ~ C₆ アルキル、もしくはヘテロシクロ脂肪族C₁ ~ C₆ アルキルより選択される、化合物。

【請求項28】

請求項23に記載の化合物であって、ここで、 z が 0 ~ 5 であり、そして R^4 基が、各々独立して、Cl、Br、F、CF₃、CH₃、-CH₂CH₃、CN、-COOH、-N(CH₃)₂、-N(Et)₂、-N(iPr)₂、-O(CH₂)₂OCH₃、-CONH₂、-COOCH₃、-OH、-CH₂OH、-NHCOCH₃、-SO₂NH₂、-SO₂(CH₂)₃CH₃、-SO₂CH(CH₃)₂、-SO₂N(CH₃)₂、-SO₂CH₂CH₃、-C(O)OCH₂CH(CH₃)₂、-C(O)NHC₂CH(CH₃)₂、-NHC(O)OCH₃、-C(O)C(CH₃)₃、-COO(CH₂)₂CH₃、-C(O)NHC(H₃)₂、-C(O)CH₂CH₃、または、必要に応じて置換された基であって、該基が、-ピペリジニル(piperidinyl)、ピペリジニル(piperazineyl)、モルホリノ、C₁ ~ C₄ アルコキシ、フェニル、フェニルオキシ、ベンジル、ベンジルオキシ、-CH₂シクロヘキシル、ピリジル、-CH₂ピリジル、もしくは-CH₂チアゾリルより選択される、化合物。

【請求項29】

請求項23に記載の化合物であって、ここで、一緒になった R^1 および R^2 が、以下：
a. z が 1 または 2 であり、そして少なくとも 1 個の R^4 の存在が、-NRSO₂R'、-NRCOOR'、または-NRCOR' である、必要に応じて置換されたアゼチジン

- 1 - イル (j j) ;

b . z が 1 であり、そして R^4 が、 - N R S O₂ R' である、必要に応じて置換されたアゼチジン - 1 - イル (j j) ;

c . z が 1 であり、そして R^4 が、 - N R C O O R' である、必要に応じて置換されたアゼチジン - 1 - イル (j j) ;

d . z が 1 であり、そして R^4 が、 - N R C O R' である、必要に応じて置換されたアゼチジン - 1 - イル (j j) ;

e . z が 1 または 2 であり、そして R^4 が、 Cl、Br、F、CF₃、CH₃、- CH₂CH₃、- OR'、または - CH₂OR' である、必要に応じて置換されたピロリジン - 1 - イル (f f) ;

f . z が 1 または 2 であり、そして少なくとも 1 個の R^4 の存在が、Cl、Br、F、CF₃、CH₃、- CH₂CH₃、- OR' もしくは - CH₂OR'、- N R S O₂ R'、- N R C O O R' または - OCON(R')₂ である、必要に応じて置換されたピペリジン - 1 - イル (d d) ;

g . z が 1 であり、そして R^4 が F、CF₃、CH₃、- CH₂CH₃、- OR'、または - CH₂OR' である、必要に応じて置換されたピペリジン - 1 - イル (d d) ;

h . z が 1 であり、そして R^4 が - N R S O₂ R' である、必要に応じて置換されたピペリジン - 1 - イル (d d) ;

i . z が 1 であり、そして R^4 が - N R C O O R' である、必要に応じて置換されたピペリジン - 1 - イル (d d) ;

j . z が 1 または 2 であり、そして少なくとも 1 個の R^4 の存在が、- SOR'、- CON(R')₂、- SO₂N(R')₂、- COR'、または - COOR' である、必要に応じて置換されたピペラジン - 1 - イル (c c) ;

k . z が 1 であり、そして R^4 が、- SOR' である、必要に応じて置換されたピペラジン - 1 - イル (c c) ;

l . z が 1 であり、そして R^4 が、- COOR' である、必要に応じて置換されたピペラジン - 1 - イル (c c) ;

m . z が 1 であり、そして R^4 が、- CON(R')₂ である、必要に応じて置換されたピペラジン - 1 - イル (c c) ;

n . z が 1 であり、そして R^4 が、- SO₂N(R')₂ である、必要に応じて置換されたピペラジン - 1 - イル (c c) ; あるいは

o . z が 1 であり、そして R^4 が、- COR' である、必要に応じて置換されたピペラジン - 1 - イル (c c) ;

より選択される、化合物。

【請求項 3 0】

請求項 2 3 に記載の化合物であって、ここで、z が 0 ~ 4 であり、そして R^3 基が、存在する場合、各々独立して、ハロゲン、CN、NO₂、- NR'₂、- CH₂N(R')₂、- OR'、- CH₂OR'、- SR'、- CH₂SR'、- COOR'、- NRCOR'、- CON(R')₂、- OCON(R')₂、COR'、- NHCOOR'、- SO₂R'、- SO₂N(R')₂、または、必要に応じて置換された基であって、該基が、C₁ ~ C₆ 脂肪族、アリール、ヘテロアリール、シクロ脂肪族、ヘテロシクロ脂肪族、アリール C₁ ~ C₆ アルキル、ヘテロアリール C₁ ~ C₆ アルキル、シクロ脂肪族 C₁ ~ C₆ アルキル、もしくはヘテロシクロ脂肪族 C₁ ~ C₆ アルキルより選択される、化合物。

【請求項 3 1】

請求項 2 3 に記載の化合物であって、ここで、x が 1 または 2 であり、そして R^3 の各存在が、独立して、Cl、Br、F、CF₃、- OC₂H₅、Me、Et、CN、- COO H、- NH₂、- N(CH₃)₂、- N(Et)₂、- N(iPr)₂、- O(CH₂)₂OCH₃、- CONH₂、- COOCH₃、- OH、- OCH₃、- OCH₂CH₃、- CH₂OH、- NHCOCH₃、- NHCOCH(CH₃)₂、- SO₂NH₂、- C

ONH(シクロプロピル)、-CONHCH₃、-C(O)NHC₂CH₃、または、必要に応じて置換された基であって、該基が、-ペリジニル(piperidinyl)、ペリジニル(piperizinyl)、モルホリノ、フェニル、フェニルオキシ、ベンジル、もしくはベンジルオキシより選択される、化合物。

【請求項32】

請求項23に記載の化合物であって、ここで、xが1または2であり、そして、各R³基が、独立して、ハロゲン、CN、必要に応じて置換されたC₁~C₆アルキル、OR'、N(R')₂、CON(R')₂、またはNRCOR'である、化合物。

【請求項33】

請求項23に記載の化合物であって、ここで、xが1または2であり、そして、各R³基が、-Cl、-CH₃、-CH₂CH₃、-F、-CF₃、-OCF₃、-CONHCH₃、-CONHCH₂CH₃、-CONH(シクロプロピル)、-OCH₃、-NH₂、-OCH₂CH₃、または-CNである、化合物。

【請求項34】

請求項23に記載の化合物であって、ここで、xが1であり、そして、R³が、前記キナゾリン環の6位に存在し、-Cl、-CH₃、-CH₂CH₃、-F、-CF₃、-OCF₃、-CONHCH₃、-CONHCH₂CH₃、-CONH(シクロプロピル)、-OCH₃、-NH₂、-OCH₂CH₃、または-CNである、化合物。

【請求項35】

請求項23に記載の化合物であって、ここで、xが1であり、そして、R³が、前記キナゾリン環の7位に存在し、-Cl、-CH₃、-CH₂CH₃、-F、-CF₃、-OCF₃、-CONHCH₃、-CONHCH₂CH₃、-CONH(シクロプロピル)、-OCH₃、-NH₂、-OCH₂CH₃、または-CNである、化合物。

【請求項36】

請求項23に記載の化合物であって、ここで、xが1であり、そして、R³が、前記キナゾリン環の6位に存在し、そして、-Cl、-CH₃、-CH₂CH₃、-F、-CF₃、-OCF₃、-OCH₃、または-OCH₂CH₃である、化合物。

【請求項37】

請求項23に記載の化合物であって、ここで、xが1であり、そして、R³が、前記キナゾリン環の7位に存在し、かつ、-Cl、-CH₃、-CH₂CH₃、-F、-CF₃、-OCF₃、-OCH₃、または-OCH₂CH₃である、化合物。

【請求項38】

請求項23に記載の化合物であって、ここで、xが1であり、そして、R³が、前記キナゾリン環の6位に存在し、かつ、-CON(R')₂またはNRCOR'である、化合物。

【請求項39】

請求項23に記載の化合物であって、ここで、xが1であり、そして、R³が、前記キナゾリン環の7位に存在し、かつ、-CON(R')₂またはNRCOR'である、化合物。

【請求項40】

請求項23に記載の化合物であって、ここで、yが0~5であり、qが0~2であり、そしてR⁵基およびR^{5a}基が、存在する場合、各々独立して、ハロゲン、CN、NO₂、-N(R')₂、-CH₂N(R')₂、-OR'、-CH₂OR'、-SR'、-CH₂SR'、-NRCOR'、-CON(R')₂、-S(O)₂N(R')₂、-OCOR'、-COR'、-CO₂R'、-OCON(R')₂、-NR'SO₂R'、-OP(O)(OR')₂、-P(O)(OR')₂、-P(O)(OR')₂、-OP(O)₂OR'、-P(O)₂OR'、-PO(R')₂、-OPO(R')₂、または、必要に応じて置換された基であって、該基が、C₁~C₆脂肪族、アリール、ヘテロアリール、シクロ脂肪族、ヘテロシクロ脂肪族、アリールC₁~C₆アルキル、ヘテロアリールC₁~C₆アルキル、シクロ脂肪族C₁~C₆アルキル、もしくはヘテロシクロ脂肪族

C₁ ~ C₆ アルキルより選択される、化合物。

【請求項 4 1】

請求項 2 3 に記載の化合物であって、ここで、y が 0 ~ 5 であり、そして q が 1 または 2 であり、そして R^{5a} の各存在が、独立して、C1、Br、F、CF₃、Me、Et、CN、-COOH、-NH₂、-N(CH₃)₂、-N(Et)₂、-N(iPr)₂、-O(CH₂)₂OCH₃、-CONH₂、-COOCH₃、-OH、-OCH₃、-OCH₂CH₃、-CH₂OH、-NHCOCH₃、-SO₂NH₂、-SO₂NHC(CH₃)₂、-OCOC(CH₃)₃、-OCOCH₂C(CH₃)₃、-O(CH₂)₂N(CH₃)₂、4-CH₃-ピペラジン-1-イル、OCOCH(C₂H₅)₂、OCO(シクロペンチル)、-COCH₃、必要に応じて置換されたフェノキシ、または必要に応じて置換されたベンジルオキシである、化合物。

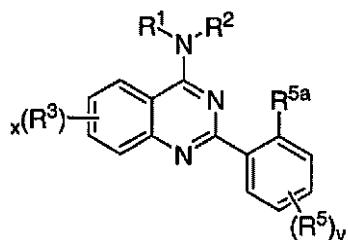
【請求項 4 2】

請求項 2 3 に記載の化合物であって、ここで：
f. y が 0 であり、そして q が 1 でかつ R^{5a} が、前記フェニル環の 2 位において置換された F であるか；
g. y が 0 であり、q が 1 であり、そして R^{5a} が、該フェニル環の 2 位において置換された OR' であるか；
h. y が 0 であり、q が 1 であり、そして R^{5a} が、該フェニル環の 2 位において置換された OH であるか；
i. y が 0 であり、q が 2 であり、そして R^{5a} の一方の存在が、該フェニル環の 2 位において置換された OR' であり、そして R^{5a} のもう一方の存在が、該フェニル環の 6 位において置換された F であるか；または、
j. y が 0 であり、q が 2 であり、そして R^{5a} の一方の存在が、該フェニル環の 2 位において置換された OH であり、そして R^{5a} のもう一方の存在が、該フェニル環の 6 位において置換された F である、化合物。

【請求項 4 3】

請求項 2 3 に記載の化合物であって、ここで、q が 1 であり、かつ R^{5a} が、前記フェニル環の 2 位に存在し、そして化合物が、以下の構造 IA-i i :

【化 1 0】

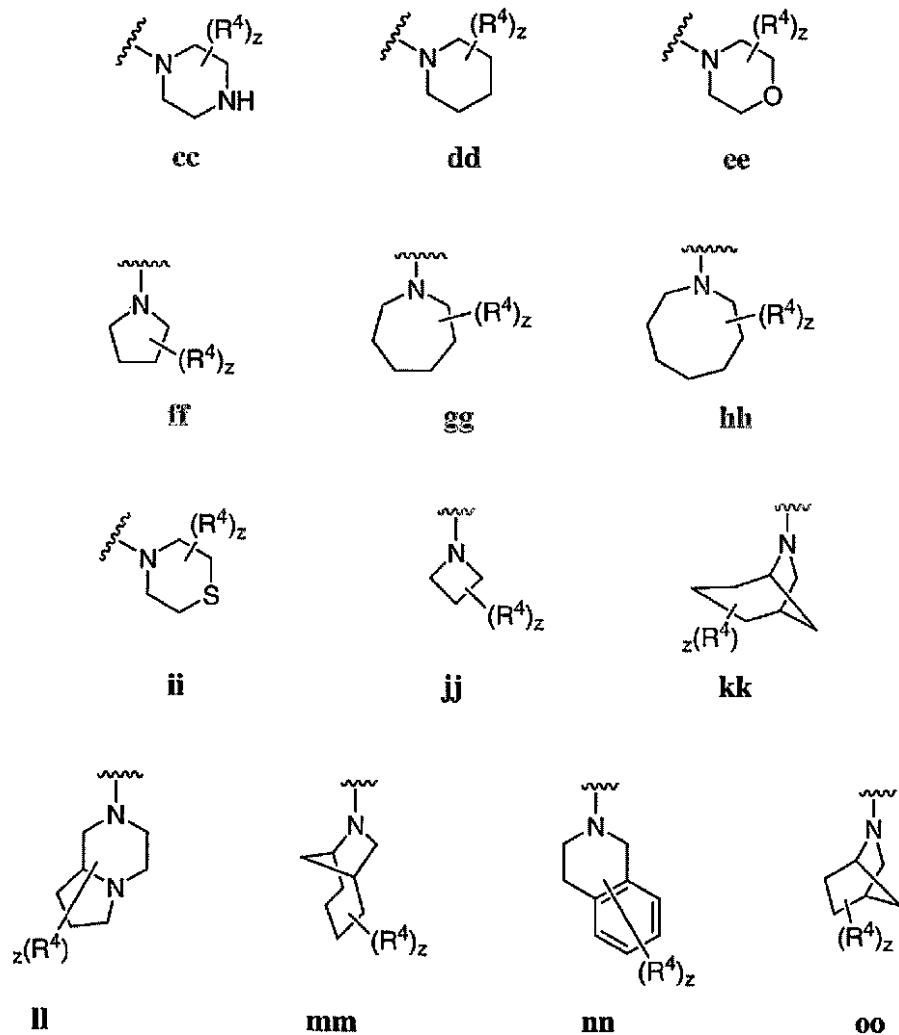


IA-ii

を有し、ここで：

a) 一緒になった R¹ および R² により形成される環が、以下：

【化11】



より選択され、および一緒になった R^1 および R^2 により形成される該環が、必要に応じて、1個以上の置換可能な炭素原子、窒素原子、もしくは硫黄原子において、 $-R^4$ の z 個の独立した存在で置換され、そして、 z は 0 ~ 5 であり；

b) z が 0 ~ 5 であり、そして R^4 基が、存在する場合、各々独立して、ハロゲン、CN、NO₂、-NR'₂、-CH₂N(R')₂、-OR'、-CH₂OR'、-SR'、-CH₂SR'、-COOR'、-NRCOR'、-CON(R')₂、-OC(=O)N(R')₂、COR'、-NHCOOR'、-SO₂R'、-SO₂N(R')₂、または、必要に応じて置換された基であって、該基が、C₁ ~ C₆ 脂肪族、アリール、ヘテロアリール、シクロ脂肪族、ヘテロシクロ脂肪族、アリールC₁ ~ C₆ アルキル、ヘテロアリールC₁ ~ C₆ アルキル、シクロ脂肪族C₁ ~ C₆ アルキル、もしくはヘテロシクロ脂肪族C₁ ~ C₆ アルキルより選択され；

c) x が 0 ~ 4 であり、そして、 R^3 基が、存在する場合、各々独立して、ハロゲン、CN、NO₂、-N(R')₂、-CH₂N(R')₂、-OR'、-CH₂OR'、-SR'、-CH₂SR'、-COOR'、-NRCOR'、-CON(R')₂、-OC(=O)N(R')₂、COR'、-NHCOOR'、-SO₂R'、-SO₂N(R')₂、または、必要に応じて選択された基であって、該基が、C₁ ~ C₆ 脂肪族、アリール、ヘテロアリール、シクロ脂肪族、ヘテロシクロ脂肪族、アリールC₁ ~ C₆ アルキル、ヘテロアリールC₁ ~ C₆ アルキル、シクロ脂肪族C₁ ~ C₆ アルキル、もしくはヘテロシクロ脂肪族C₁ ~ C₆ アルキルより選択され；

d) y が 0 ~ 5 であり、そして R^5 基が、存在する場合、各々独立して、ハロゲン、CN、NO₂、-N(R')₂、-CH₂N(R')₂、-OR'、-CH₂OR'、-S

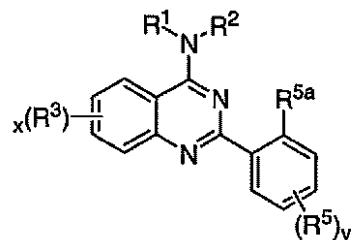
R'、-CH₂SR'、--NRCOR'、-CON(R')₂、-S(O)₂N(R')₂、-OCOR'、-COR'、-CO₂R'、-OCON(R')₂、-NR'SO₂R'、-OP(O)(OR')₂、-P(O)(OR')₂、-P(O)(OR')₂、-OP(O)₂OR'、-P(O)₂OR'、-PO(R')₂、-OPO(R')₂、または、必要に応じて置換された基であって、該基が、C₁～C₆脂肪族、アリール、ヘテロアリール、シクロ脂肪族、ヘテロシクロ脂肪族、アリールC₁～C₆アルキル、ヘテロアリールC₁～C₆アルキル、シクロ脂肪族C₁～C₆アルキル、もしくはヘテロシクロ脂肪族C₁～C₆アルキルより選択され；そして

e) R^{5a}が、C1、Br、F、CF₃、Me、Et、CN、-COOH、-NH₂、-N(CH₃)₂、-N(Et)₂、-N(iPr)₂、-O(CH₂)₂OCH₃、-CONH₂、-COOCH₃、-OH、-OCH₃、-OCH₂CH₃、-CH₂OH、-NHCOCH₃、-SO₂NH₂、-SO₂NHC(CH₃)₂、-OCOC(CH₃)₃、-OCOCH₂C(CH₃)₃、-O(CH₂)₂N(CH₃)₂、4-CH₃-ピペラジン-1-イル、OCOCH(CH₃)₂、OCO(シクロベンチル)、-COCH₃、必要に応じて置換されたフェノキシ、または必要に応じて置換されたベンジルオキシである、化合物。

【請求項44】

請求項23に記載の化合物であって、ここで、qが1であり、かつ、R^{5a}が前記フェニル環の2位に存在し、そして化合物が、以下の構造IA-i i :

【化12】



IA-ii

を有し、ここで：

a) 一緒にになったR¹およびR²が、必要に応じて置換された環であり、該環が、アゼチジン-1-イル(jj)、ピロリジン-1-イル(ff)、ピペリジン-1-イル(dd)、またはピペラジン-1-イル(cc)より選択され；

b) zが0～5であり、そしてR⁴基が、各々独立して、C1、Br、F、CF₃、CH₃、-CH₂CH₃、CN、-COOH、-N(CH₃)₂、-N(Et)₂、-N(iPr)₂、-O(CH₂)₂OCH₃、-CONH₂、-COOCH₃、-OH、-CH₂OH、-NHCOCH₃、-SO₂NH₂、-SO₂(CH₂)₃CH₃、-SO₂CH(CH₃)₂、-SO₂N(CH₃)₂、-SO₂CH₂CH₃、-C(O)OCH₂CH(CH₃)₂、-C(O)NHCH₂CH(CH₃)₂、-NHCOOCH₃、-C(O)C(CH₃)₃、-COO(CH₂)₂CH₃、-C(O)NHC(H₃)₂、-C(O)CH₂CH₃、または、必要に応じて置換された基であって、該基が、-ピペリジニル(piperidinyl)、ピペリジニル(piperizinyl)、モルホリノ、C₁～₄アルコキシ、フェニル、フェニルオキシ、ベンジル、ベンジルオキシ、-CH₂シクロヘキシリル、ピリジル、-CH₂ピリジル、もしくは-CH₂チアゾリルより選択され；

c) xが1または2であり、そしてR³の各存在が、独立して、C1、Br、F、CF₃、-OCF₃、Me、Et、CN、-COOH、-NH₂、-N(CH₃)₂、-N(Et)₂、-N(iPr)₂、-O(CH₂)₂OCH₃、-CONH₂、-COOCH₃、-OH、-OCH₃、-OCH₂CH₃、-CH₂OH、-NHCOCH₃、-NHCOCH(CH₃)₂、-SO₂NH₂、-CONH(シクロプロピル)、-CONHC

H_3 、 $-\text{CONHCH}_2\text{CH}_3$ 、または、必要に応じて置換された基であって、該基が、
-ピペリジニル(piperidinyl)、ピペリジニル(piperizinyl)、モルホリノ、フェニル、フェニルオキシ、ベンジル、もしくはベンジルオキシより選択され；

d) y が 0 ~ 4 であり、そして R^5 基が、存在する場合、各々独立して、Cl、Br、F、CF₃、Me、Et、CN、-COOH、-NH₂、-N(CH₃)₂、-N(Et)₂、-N(ipr)₂、-O(CH₂)₂OCH₃、-CONH₂、-COOCH₃、-OH、-OCH₃、-OCH₂CH₃、-CH₂OH、-NHCOC₂H₅、-SO₂NH₂、-SO₂NHC(CH₃)₂、-OCOC(CH₃)₃、-OCOCH₂C(CH₃)₃、-O(CH₂)₂N(CH₃)₂、4-CH₃-ピペラジン-1-イル、OCOC(CH₃)₂、OCO(シクロペンチル)、-COCH₃、必要に応じて置換されたフェノキシ、または必要に応じて置換されたベンジルオキシであり；そして

e) R^{5a} が、Cl、F、CF₃、Me、Et、-OH、-OCH₃、-OCH₂CH₃、-CH₂OH、-SO₂NH₂、-SO₂NHC(CH₃)₂、-OCOC(CH₃)₃、-OCOCH₂C(CH₃)₃、-O(CH₂)₂N(CH₃)₂、4-CH₃-ピペラジン-1-イル、OCOCH(CH₃)₂、OCO(シクロペンチル)、または-COCH₃ である、化合物。

【請求項 4 5】

請求項 4 4 に記載の化合物であって、ここで、 x が 1 であり、そして、 R^3 が、前記キナゾリン環の 6 位に存在し、-Cl、-CH₃、-CH₂CH₃、-F、-CF₃、-OCF₃、-CONHCH₃、-CONHCH₂CH₃、-CONH(シクロプロピル)、-OCH₃、-NH₂、-OCH₂CH₃、または-CN である、化合物。

【請求項 4 6】

請求項 4 4 に記載の化合物であって、ここで、 x が 1 であり、そして、 R^3 が、前記キナゾリン環の 7 位に存在し、-Cl、-CH₃、-CH₂CH₃、-F、-CF₃、-OCF₃、-CONHCH₃、-CONHCH₂CH₃、-CONH(シクロプロピル)、-OCH₃、-NH₂、-OCH₂CH₃、または-CN である、化合物。

【請求項 4 7】

請求項 4 4 に記載の化合物であって、ここで、 x が 1 であり、そして、 R^3 が、前記キナゾリン環の 6 位に存在し、そして、-Cl、-CH₃、-CH₂CH₃、-F、-CF₃、-OCF₃、-OCH₃、または-OCH₂CH₃ である、化合物。

【請求項 4 8】

請求項 4 4 に記載の化合物であって、ここで、 x が 1 であり、そして、 R^3 が、前記キナゾリン環の 7 位に存在し、かつ、-Cl、-CH₃、-CH₂CH₃、-F、-CF₃、-OCF₃、-OCH₃、または-OCH₂CH₃ である、化合物。

【請求項 4 9】

請求項 4 4 に記載の化合物であって、ここで、 x が 1 であり、そして、 R^3 が、前記キナゾリン環の 6 位に存在し、かつ、-CON(R')₂ またはNRCOR' である、化合物。

【請求項 5 0】

請求項 4 4 に記載の化合物であって、ここで、 x が 1 であり、そして、 R^3 が、前記キナゾリン環の 7 位に存在し、かつ、-CON(R')₂ またはNRCOR' である、化合物。

【請求項 5 1】

請求項 4 4 に記載の化合物であって、ここで、 R^{5a} が、Cl、F、CF₃、Me、Et、-OH、OR'，-OCH₃、-OCH₂CH₃ である、化合物。

【請求項 5 2】

請求項 4 4 に記載の化合物であって、ここで、 R^{5a} が、OR' である、化合物。

【請求項 5 3】

請求項 4 4 に記載の化合物であって、ここで、 R^{5a} が、OH である、化合物。

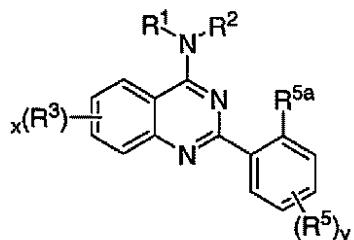
【請求項 5 4】

請求項 4 4 に記載の化合物であって、ここで、 R^{5a} が、F である、化合物。

【請求項 5 5】

請求項 2 3 に記載の化合物であって、ここで、q が 1 であり、かつ、 R^{5a} が、前記フェニル環の 2 位に存在し、そして化合物が、以下の構造 IA-i i :

【化 1 3】

**IA-ii**

ここで：

a) 一緒になった R^1 および R^2 が、必要に応じて置換された環であり、該環が、アゼチジン - 1 - イル (j j)、ピロリジン - 1 - イル (f f)、ピペリジン - 1 - イル (d d)、ピペラジン - 1 - イル (c c) より選択され；

b) z が 0 ~ 5 であり、そして R^4 基が、各々独立して、Cl、Br、F、CF₃、CH₃、-CH₂CH₃、CN、-COOH、-N(CH₃)₂、-N(Et)₂、-N(iPr)₂、-O(CH₂)₂OCH₃、-CONH₂、-COOCH₃、-OH、-CH₂OH、-NHCOCH₃、-SO₂NH₂、-SO₂(CH₂)₃CH₃、-SO₂CH(CH₃)₂、-SO₂N(CH₃)₂、-SO₂CH₂CH₃、-C(O)OCH₂CH(CH₃)₂、-C(O)NHCH₂CH(CH₃)₂、-NHCOOCH₃、-C(O)C(CH₃)₃、-COO(CH₂)₂CH₃、-C(O)NHCH(CH₃)₂、-C(O)CH₂CH₃、または、必要に応じて置換された基であって、該基が、-ピペリジニル (peridinyl)、ピペリジニル (perizinyl)、モルホリノ、C₁ ~ 4 アルコキシ、フェニル、フェニルオキシ、ベンジル、ベンジルオキシ、-CH₂シクロヘキシリ、ピリジル、-CH₂ピリジル、もしくは-CH₂チアゾリルより選択され；

c) x が 1 であり、 R^3 の各存在が、独立して、Cl、Br、F、CF₃、-OCF₃、Me、Et、CN、-COOH、-OH、または-OCH₃ であり；

d) y が 0 または 1 であり、そして、 R^5 基が、存在する場合、各々独立して、Cl、Br、F、CF₃、Me、-OH、-OCH₃、-OCH₂CH₃、-CH₂OH、-NHCOCH₃、-SO₂NH₂、-SO₂NHC(CH₃)₂ であり；そして

e) R^{5a} が F、-OR' または NHSOR' である、化合物。

【請求項 5 6】

請求項 5 5 に記載の化合物であって、ここで、x が 1 であり、そして、 R^3 が、前記キナゾリン環の 6 位に存在し、-Cl、-CH₃、-CH₂CH₃、-F、-CF₃、-OCF₃、-CONHCH₃、-CONHCH₂CH₃、-CONH(シクロプロピル)、-OCH₃、-NH₂、-OCH₂CH₃、または-CN である、化合物。

【請求項 5 7】

請求項 5 5 に記載の化合物であって、ここで、x が 1 であり、そして、 R^3 が、前記キナゾリン環の 7 位に存在し、-Cl、-CH₃、-CH₂CH₃、-F、-CF₃、-OCF₃、-CONHCH₃、-CONHCH₂CH₃、-CONH(シクロプロピル)、-OCH₃、-NH₂、-OCH₂CH₃、または-CN である、化合物。

【請求項 5 8】

請求項 5 5 に記載の化合物であって、ここで、x が 1 であり、そして、 R^3 が、前記キ

ナゾリン環の6位に存在し、そして、-C1、-CH₃、-CH₂CH₃、-F、-CF₃、-OCF₃、-OCH₃、または-OCH₂CH₃である、化合物。

【請求項59】

請求項55に記載の化合物であって、ここで、xが1であり、そして、R³が、前記キナゾリン環の7位に存在し、かつ、-C1、-CH₃、-CH₂CH₃、-F、-CF₃、-OCF₃、-OCH₃、または-OCH₂CH₃である、化合物。

【請求項60】

請求項55に記載の化合物であって、ここで、xが1であり、そして、R³が、前記キナゾリン環の6位に存在し、かつ、-CON(R')₂またはNRCOR'である、化合物。

【請求項61】

請求項55に記載の化合物であって、ここで、xが1であり、そして、R³が、前記キナゾリン環の7位に存在し、かつ、-CON(R')₂またはNRCOR'である、化合物。

【請求項62】

請求項55に記載の化合物であって、ここで、R^{5a}がOR'であり、そしてxが1であり、そしてR³が前記キナゾリン環の6位に存在し、そして-C1、-CH₃、-CH₂CH₃、-F、-CF₃、-OCF₃、-OCH₃、または-OCH₂CH₃である、化合物。

【請求項63】

請求項55に記載の化合物であって、ここで、R^{5a}がOR'であり、そしてxが1であり、そしてR³が前記キナゾリン環の7位に存在し、そして-C1、-CH₃、-CH₂CH₃、-F、-CF₃、-OCF₃、-OCH₃、または-OCH₂CH₃である、化合物。

【請求項64】

請求項55に記載の化合物であって、ここで、一緒になったR¹およびR²が、以下：
a . zが1または2であり、そして少なくとも1個のR⁴の存在が、-NRSO₂R'、-NRCOOR'、または-NRCOR'である、必要に応じて置換されたアゼチジン-1-イル(jj)；

b . zが1であり、そしてR⁴が、-NRSO₂R'である、必要に応じて置換されたアゼチジン-1-イル(jj)；

c . zが1であり、そしてR⁴が、-NRCOOR'である、必要に応じて置換されたアゼチジン-1-イル(jj)；

d . zが1であり、そしてR⁴が、-NRCOR'である、必要に応じて置換されたアゼチジン-1-イル(jj)；

e . zが1または2であり、そしてR⁴が、C1、Br、F、CF₃、CH₃、-CH₂CH₃、-OR'、または-CH₂OR'である、必要に応じて置換されたピロリジン-1-イル(ff)；

f . zが1または2であり、そして少なくとも1個のR⁴の存在が、C1、Br、F、CF₃、CH₃、-CH₂CH₃、-OR'もしくは-CH₂OR'、-NRSO₂R'、-NRCOOR'または-OCON(R')₂である、必要に応じて置換されたピペリジン-1-イル(dd)；

g . zが1であり、そしてR⁴がF、CF₃、CH₃、-CH₂CH₃、-OR'、または-CH₂OR'である、必要に応じて置換されたピペリジン-1-イル(dd)；

h . zが1であり、そしてR⁴が-NRSO₂R'である、必要に応じて置換されたピペリジン-1-イル(dd)；

i . zが1であり、そしてR⁴が-NRCOOR'である、必要に応じて置換されたピペリジン-1-イル(dd)；

j . zが1または2であり、そして少なくとも1個のR⁴の存在が、-SOR'、-CON(R')₂、-SO₂N(R')₂、-COR'、または-COOOR'である、必要

に応じて置換されたピペラジン - 1 - イル (c c) ;

k . z が 1 であり、そして R⁴ が、 - S O R ' である、必要に応じて置換されたピペラジン - 1 - イル (c c) ;

l . z が 1 であり、そして R⁴ が、 - C O O R ' である、必要に応じて置換されたピペラジン - 1 - イル (c c) ;

m . z が 1 であり、そして R⁴ が、 - C O N (R ')₂ である、必要に応じて置換されたピペラジン - 1 - イル (c c) ;

n . z が 1 であり、そして R⁴ が、 - S O₂ N (R ')₂ である、必要に応じて置換されたピペラジン - 1 - イル (c c) ; あるいは

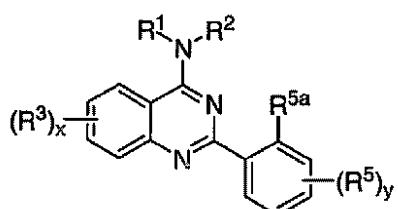
o . z が 1 であり、そして R⁴ が、 - C O R ' である、必要に応じて置換されたピペラジン - 1 - イル (c c) ;

より選択される、化合物。

【請求項 6 5】

式 IA - i i の化合物 :

【化 1 4】



IA-ii

であって、ここで、R¹ および R² は、各々独立して、C₁ ~ ₆ 脂肪族、C y¹ より選択される必要に応じて置換された基であり、ここで、C y¹ は、窒素、酸素、もしくは硫黄より独立して選択される 0 個 ~ 3 個のヘテロ原子を有する、5 員 ~ 7 員の単環式アリール環もしくは 8 員 ~ 10 員の二環式アリール環であるか、または、窒素、酸素、もしくは硫黄より独立して選択される 0 個 ~ 3 個のヘテロ原子を有する、3 員 ~ 12 員の飽和もしくは部分的に不飽和な単環式環であって、ここで、C y¹ は、窒素原子に直接的に結合されるか、または、必要に応じて置換された C₁ ~ ₄ 脂肪族基を通して結合され、ここで、該 C₁ ~ ₄ 脂肪族基における 1 以上のメチレン単位は、- N R - 、- O - 、- C O O 、- O C O - 、- N R C O - 、- C O N R - 、- S O₂ N R - 、もしくは - N R S O₂ - で必要に応じて置換され；ここで、R¹ および R² は、各々必要に応じてかつ独立して、1 個以上の置換可能な炭素原子、窒素原子、もしくは硫黄原子において、- R⁴ の z 個の独立した存在で置換され、ここで、z は 0 ~ 5 であり；

x が 0 ~ 4 であり；

y が 0 ~ 4 であり；

R³ 、R⁴ 、および R⁵ の各存在は、独立して Q - R^X であり；ここで、Q は、結合であるか、または C₁ ~ C₆ アルキリデン鎖であり、ここで、Q の 2 までの非隣接メチレン単位は、必要に応じてかつ独立して、- N R - 、- S - 、- O - 、- C S - 、- C O₂ - 、- O C O - 、- C O - 、- C O C O - 、- C O N R - 、- N R C O - 、- N R C O₂ - 、- S O₂ N R - 、- N R S O₂ - 、- C O N R N R - 、- N R C O N R - 、- O C O N R - 、- N R N R - 、- N R S O₂ N R - 、- S O - 、- S O₂ - 、- P O - 、- P O₂ - 、- O P (O) (O R) - 、または - P O R - により置換され；そして R^X の各存在は、R' 、= O 、= N R' 、ハロゲン、- N O₂ 、- C N 、- O R' 、- S R' 、- N (R')₂ 、- N R' C O R' 、- N R' C O N (R')₂ 、- N R' C O₂ R' 、- C O R' 、- C O₂ R' 、- O C O R' 、- C O N (R')₂ 、- O C O N (R')₂ 、- S O R' 、- S O₂ R' 、- S O₂ N (R')₂ 、- N R' S O₂ R' 、- N R' S O₂ N (R')₂ 、- C O C O R' 、- C O C H₂ C O R' 、- O P (O) (O R')₂ 、- P (O) (O R')₂ 、- O P (O)₂ O R' 、- P (O)₂ O R' 、- P O (R')₂ 、ま

たは - OPO(R')₂ から独立して選択され；

R^{5a} は、必要に応じて置換された C₁ ~ C₆ 脂肪族基、ハロゲン、-OR'、-SR'、-N(R')₂、-NR'COR'、-NR'CON(R')₂、-NR'CO₂R'、-COR'、-CO₂R'、-OCOR'、-CON(R')₂、-OCON(R')₂、-SOR'、-SO₂R'、-SO₂N(R')₂、-NR'SO₂R'、-NR'SO₂N(R')₂、-COCOR、-COCH₂COR'、-OP(O)(OR')₂、-P(O)(OR')₂、-OP(O)₂OR'、-P(O)₂OR'、-PO(R')₂、または -OPO(R')₂ であり；そして

R の各存在は、独立して、水素または必要に応じて置換された C₁ ~ C₆ 脂肪族基であり；そして R' の各存在は、独立して、水素もしくは必要に応じて置換された C₁ ~ C₆ 脂肪族基であるか、窒素、酸素もしくは硫黄から独立して選択される 0 個 ~ 3 個のヘテロ原子を有する 3 員 ~ 8 員の飽和、部分的に不飽和、もしくは完全に不飽和な単環式環であるか、または、窒素、酸素、もしくは硫黄から独立して選択される 0 個 ~ 5 個のヘテロ原子を有する 8 員 ~ 12 員の飽和、部分的に不飽和、もしくは完全に不飽和な二環式系であり；あるいは、R および R'、2 つの R の存在、または 2 つの R' の存在は、これらが結合する原子と一緒にになって、必要に応じて置換された 3 員 ~ 12 員の飽和、部分的に不飽和、または完全に不飽和な単環式または二環式環であって、該環は、窒素、酸素、もしくは硫黄から独立して選択される 0 個 ~ 4 個のヘテロ原子を有し、ただし：

a . x が 0 であり、R¹ が水素であり、そして R^{5a} が Cl、Me、CF₃、Br または F である場合、R² は、(CH₂)₂-4-Cy¹ でも、-SO₂CH₂Cy¹ でも、-CH₂SO₂Cy¹ でもなく、ここで、Cy¹ は、窒素、酸素もしくは硫黄より独立して選択される 0 個 ~ 3 個のヘテロ原子を有する、5 員 ~ 7 員の単環式アリール環もしくは 8 員 ~ 10 員の二環式アリール環であるか、または、窒素、酸素、もしくは硫黄より独立して選択される 0 個 ~ 3 個のヘテロ原子を有する、3 員 ~ 8 員の飽和もしくは部分的に不飽和な単環式環であり；

b . x が 0 であり、そして R^{5a} が Cl、Me、NO₂、または OH である場合：

i . R¹ が水素である場合、R² は、Me でも、iBu でも、nBu でも、-COC_H₃ でも、-CH₂COOEt でも、-CH₂COOMe でも、-CH₂CH₂OH でも、iPr でも、-CH₂-ピリジルでも、-CH₂Ph でも、-(CH₂)₃NH₂ でも、-(CH₂)₂-モルホリニルでも、-CH₂CH₂Ph でもなく；

ii . R¹ および R² は同時に Et でも Me でもなく；そして

iii . R¹ が Et である場合、R² は、4-Me-フェニルでも、4-OMe-フェニルでも、2-Me-フェニルでもなく；

c . x が 1 であり、かつ R³ が 6-Cl、もしくは 7-F であるか、または、x が 0 であり、かつ R^{5a} が -OPr_n もしくは Cl である場合、R¹ が水素である場合、R² は、-(CH₂)₂-モルホリノでも、-(CH₂)ベンゾフランでもなく；そして

d . x が 2 であり、そして R³ の一方の存在が、6-OMe であり、そしてもう一方の R³ の存在が 7-OMe であり、そして R^{5a} が F である場合、R¹ が水素である場合、R² は、-(CH₂)₃N(CH₃)₂ ではない；

化合物。

【請求項 6 6】

請求項 6 5 に記載の化合物であって、ここで、

a) R¹ または R² の一方が水素であり、かつ R¹ および R² のもう一方が、以下：

i) Cy¹ であって、ここで、Cy¹ が、窒素原子に直接的に結合されるか、もしくは、必要に応じて置換された C₁ ~ C₄ 脂肪族基を通じて結合され、ここで、該 C₁ ~ C₄ 脂肪族基における 1 以上のメチレン単位は、-NR-、-O-、-COO-、-OCO-、-NRCO-、-CONR-、-SO₂NR-、もしくは -NRSO₂- により必要に応じて置換される、Cy¹ であるか；または

ii) 必要に応じて置換された C₁ ~ C₄ 脂肪族基であって、ここで、該 C₁ ~ C₄ 脂肪族基における 1 以上のメチレン単位は、必要に応じて、-NR-、-O-、-COO-、-

OCO- 、 -NRCO- 、 -CONR- 、 $\text{-SO}_2\text{NR-}$ 、もしくは -NRSO_2- で置換された、必要に応じて置換された C_{1-4} 脂肪族基より選択されるか、あるいは；

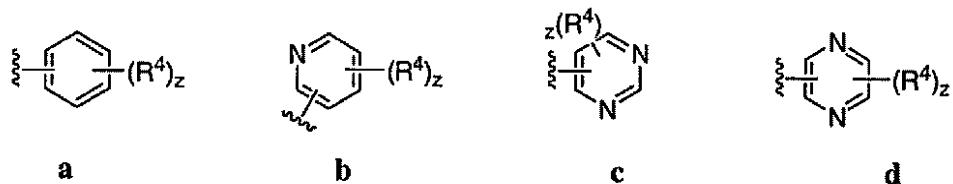
b) R^1 および R^2 が、各々独立して、 Cy^1 であって、ここで、 Cy^1 は、該窒素原子に直接的に結合されるか、または必要に応じて置換された C_{1-4} 脂肪族基を通して結合され、ここで、該 C_{1-4} 脂肪族基における1以上のメチレン単位は、必要に応じて、 -NR- 、 -O- 、 -COO- 、 -OCO- 、 -NRCO- 、 -CONR- 、 $\text{-SO}_2\text{NR-}$ 、もしくは -NRSO_2- で置換された、 Cy^1 ；または、 C_{1-4} 脂肪族基であって、該 C_{1-4} 脂肪族基における1以上のメチレン単位が必要に応じて -NR- 、 -O- 、 -COO- 、 -OCO- 、 -NRCO- 、 -CONR- 、 $\text{-SO}_2\text{NR-}$ 、もしくは -NRSO_2 により置換された必要に応じて置換された、 C_{1-4} 脂肪族基より選択される

、化合物。

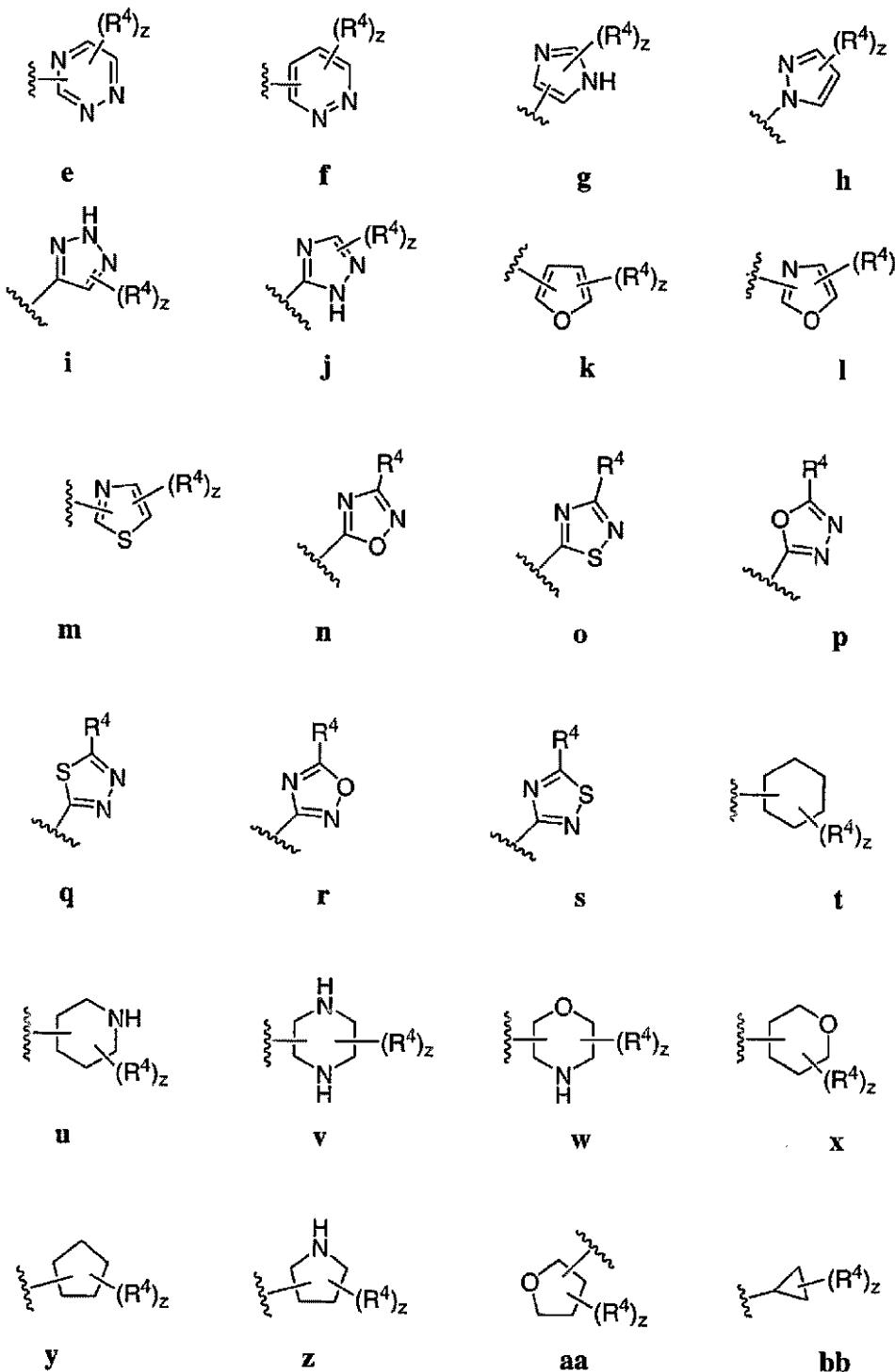
【請求項 6 7】

請求項 6 5 に記載の化合物であって、ここで、 Cy^1 は、以下：

【化 1 5】



【化16】

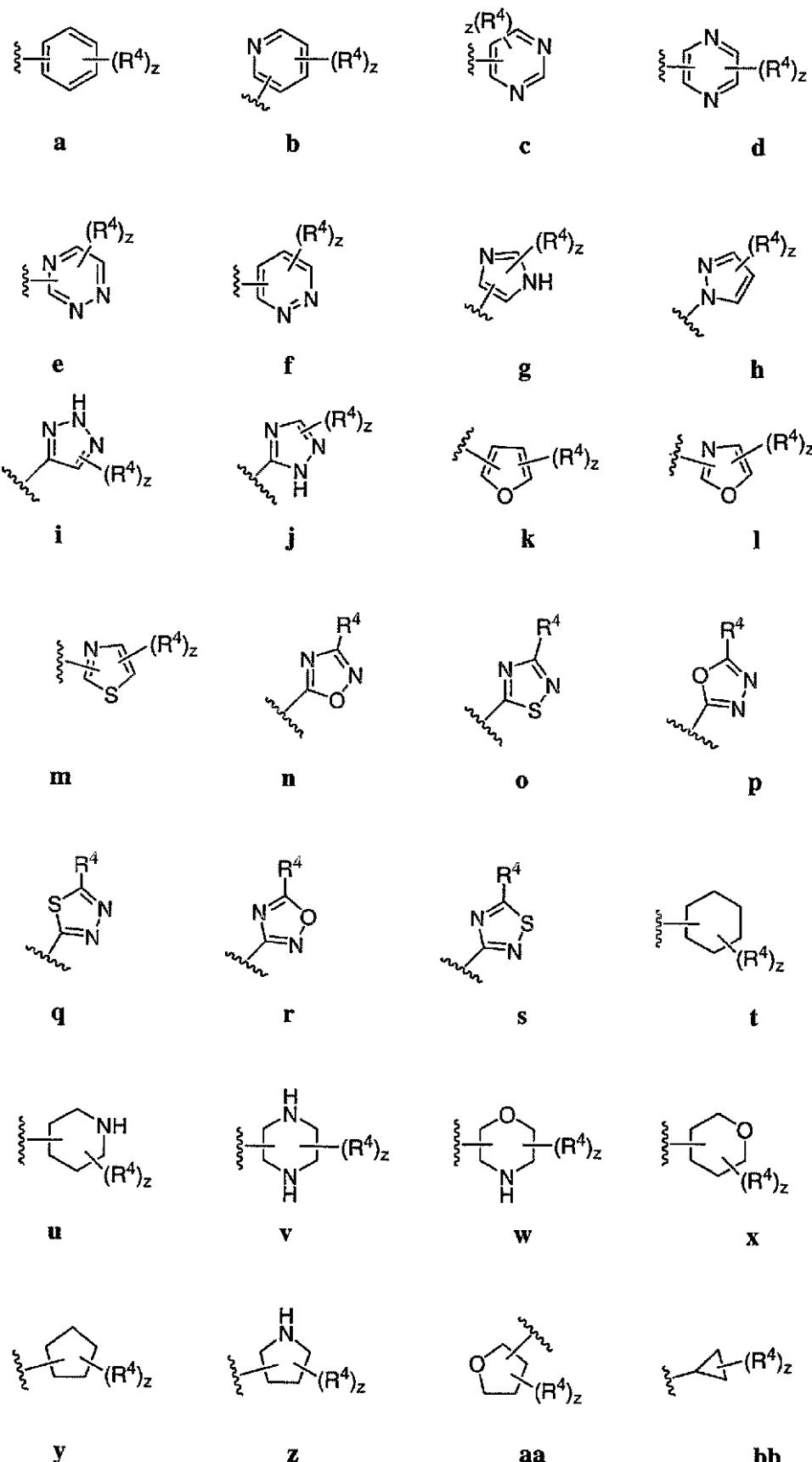


である、化合物。

【請求項 6 8】

請求項 6 5 に記載の化合物であって、ここで、 R^1 は、水素または必要に応じて置換された $C_1 \sim C_4$ 脂肪族基であり、そして R^2 は、 $-CH_2R-Cy^1$ であり、ここで、 R は、水素または $C_1 \sim C_4$ アルキルであり、 Cy^1 は、以下：

【化17】



である、化合物。

【請求項 6 9】

請求項 6 5 に記載の化合物であって、ここで、 R^1 基および R^2 基は、各々独立して、

必要に応じて置換された C₁ ~ C₄ 脂肪族基であり、そして、各々独立して、必要に応じて置換されたメチル、エチル、シクロプロピル、n-プロピル、プロペニル、シクロブチル、(CO)OCH₂CH₃、(CH₂)₂OCH₃、CH₂CO)OCH₂CH₃、CH₂(CO)OCH₃、CH(CH₃)CH₂CH₃、または n-ブチルより選択される、化合物。

【請求項 7 0】

請求項 6 5 に記載の化合物であって、ここで、z は 0 ~ 5 であり、そして R⁴ 基は、存在する場合、各々独立して、ハロゲン、CN、NO₂、-N(R')₂、-CH₂N(R')₂、-OR'、-CH₂OR'、-SR'、-CH₂SR'、-COOR'、-NRCOR'、-CON(R')₂、-OCON(R')₂、COR'、-NHCOOR'、-SO₂R'、-SO₂N(R')₂、または、C₁ ~ C₆ 脂肪族、アリール、ヘテロアリール、シクロ脂肪族、ヘテロシクロ脂肪族、アリール C₁ ~ C₆ アルキル、ヘテロアリール C₁ ~ C₆ アルキル、シクロ脂肪族 C₁ ~ C₆ アルキル、もしくはヘテロシクロ脂肪族 C₁ ~ C₆ アルキルより選択される、必要に応じて置換された基である、化合物。

【請求項 7 1】

請求項 6 5 に記載の化合物であって、ここで、z は 0 ~ 5 であり、そして R⁴ 基は、各々独立して、Cl、Br、F、CF₃、CH₃、-CH₂CH₃、CN、-COOH、-N(CH₃)₂、-N(Et)₂、-N(ipr)₂、-O(CH₂)₂OCH₃、-CONH₂、-COOCH₃、-OH、-CH₂OH、-NHCOCH₃、-SO₂NH₂、-SO₂(CH₂)₃CH₃、-SO₂CH(CH₃)₂、-SO₂N(CH₃)₂、-SO₂CH₂CH₃、-C(O)OCH₂CH(CH₃)₂、-C(O)NHCH₂CH(CH₃)₂、-NHCOOCH₃、-C(O)C(CH₃)₃、-COO(CH₂)₂CH₃、-C(O)NHCH(CH₃)₂、-C(O)CH₂CH₃、または、-ピペリジニル(piperidinyl)、ピペリジニル(piperizinyl)、モルホリノ、C₁ ~ C₄ アルコキシ、フェニル、フェニルオキシ、ベンジル、ベンジルオキシ、-CH₂シクロヘキシリ、ビリジル、-CH₂ピリジル、もしくは -CH₂チアゾリルより選択される、必要に応じて置換された基である、化合物。

【請求項 7 2】

請求項 6 5 に記載の化合物であって、ここで、x が 0 ~ 4 であり、そして、R³ 基が、存在する場合、各々独立して、ハロゲン、CN、NO₂、-N(R')₂、-CH₂N(R')₂、-OR'、-CH₂OR'、-SR'、-CH₂SR'、-COOR'、-NRCOR'、-CON(R')₂、-OCON(R')₂、COR'、-NHCOOR'、-SO₂R'、-SO₂N(R')₂、または、必要に応じて置換された基であって、該基が、C₁ ~ C₆ 脂肪族、アリール、ヘテロアリール、シクロ脂肪族、ヘテロシクロ脂肪族、アリール C₁ ~ C₆ アルキル、ヘテロアリール C₁ ~ C₆ アルキル、シクロ脂肪族 C₁ ~ C₆ アルキル、もしくはヘテロシクロ脂肪族 C₁ ~ C₆ アルキルより選択される基である、化合物。

【請求項 7 3】

請求項 6 5 に記載の化合物であって、ここで、x が 1 または 2 であり、そして、R³ の各存在が、独立して、Cl、Br、F、CF₃、-OCF₃、Me、Et、CN、-COOH、-NH₂、-N(CH₃)₂、-N(Et)₂、-N(ipr)₂、-O(CH₂)₂OCH₃、-CONH₂、-COOCH₃、-OH、-OCH₃、-OCH₂CH₃、-CH₂OH、-NHCOCH₃、-NHCOCH(CH₃)₂、-SO₂NH₂、-CONH(シクロプロピル)、-CONHCH₃、-CONHCH₂CH₃、または、必要に応じて置換された基であって、該基が、-ピペリジニル(piperidinyl)、ピペリジニル(piperizinyl)、モルホリノ、フェニル、フェニルオキシ、ベンジル、もしくはベンジルオキシより選択される基である、化合物。

【請求項 7 4】

請求項 6 5 に記載の化合物であって、ここで、x が 1 または 2 であり、そして各 R³ 基が、独立して、ハロゲン、CN、必要に応じて置換された C₁ ~ C₆ アルキル、OR'、

$N(R')$ ₂、 $CON(R')$ ₂、または $NRCOR'$ である、化合物。

【請求項 7 5】

請求項 6 5 に記載の化合物であって、ここで、 x が 1 または 2 であり、かつ各 R^3 基が、-Cl、-CH₃、-CH₂CH₃、-F、-CF₃、-OCF₃、-CONHCH₃、-CONHCH₂CH₃、-CONH(シクロプロピル)、-OCH₃、-NH₂、-OCH₂CH₃、または-CN である、化合物。

【請求項 7 6】

請求項 6 5 に記載の化合物であって、ここで、 x が 1 であり、そして、 R^3 が、前記キナゾリン環の 6 位に存在し、かつ、-Cl、-CH₃、-CH₂CH₃、-F、-CF₃、-OCF₃、-CONHCH₃、-CONHCH₂CH₃、-CONH(シクロプロピル)、-OCH₃、-NH₂、-OCH₂CH₃、または-CN である、化合物。

【請求項 7 7】

請求項 6 5 に記載の化合物であって、ここで、 x が 1 であり、そして、 R^3 が、前記キナゾリン環の 7 位に存在し、かつ、-Cl、-CH₃、-CH₂CH₃、-F、-CF₃、-OCF₃、-CONHCH₃、-CONHCH₂CH₃、-CONH(シクロプロピル)、-OCH₃、-NH₂、-OCH₂CH₃、または-CN である、化合物。

【請求項 7 8】

請求項 6 5 に記載の化合物であって、ここで、 x が 1 であり、そして、 R^3 が、前記キナゾリン環の 6 位に存在し、そして、-Cl、-CH₃、-CH₂CH₃、-F、-CF₃、-OCF₃、-OCH₃、または-OCH₂CH₃ である、化合物。

【請求項 7 9】

請求項 6 5 に記載の化合物であって、ここで、 x が 1 であり、そして、 R^3 が、前記キナゾリン環の 7 位に存在し、かつ、-Cl、-CH₃、-CH₂CH₃、-F、-CF₃、-OCF₃、-OCH₃、または-OCH₂CH₃ である、化合物。

【請求項 8 0】

請求項 6 5 に記載の化合物であって、ここで、 x が 1 であり、そして、 R^3 が、前記キナゾリン環の 6 位に存在し、かつ、-CON(R')₂ または $NRCOR'$ である、化合物。

【請求項 8 1】

請求項 6 5 に記載の化合物であって、ここで、 x が 1 であり、そして、 R^3 が、前記キナゾリン環の 7 位に存在し、そして、-CON(R')₂ または $NRCOR'$ である、化合物。

【請求項 8 2】

請求項 6 5 に記載の化合物であって、ここで、 y が 0 ~ 4 であり、 q が 0 ~ 2 であり、そして R^5 基および R^{5a} 基が、存在する場合、各々独立して、ハロゲン、CN、NO₂、-N(R')₂、-CH₂N(R')₂、-OR'、-CH₂OR'、-SR'、-CH₂SR'、-NRCOR'、-CON(R')₂、-S(O)₂N(R')₂、-OCOR'、-COR'、-CO₂R'、-OCON(R')₂、-NR'SO₂R'、-OP(O)(OR')₂、-P(O)(OR')₂、-OP(O)₂OR'、-P(O)₂OR'、-PO(R')₂、-OPO(R')₂、または、必要に応じて置換された基であって、該基が、C₁ ~ C₆ 脂肪族、アリール、ヘテロアリール、シクロ脂肪族、ヘテロシクロ脂肪族、アリールC₁ ~ C₆ アルキル、ヘテロアリールC₁ ~ C₆ アルキル、シクロ脂肪族C₁ ~ C₆ アルキル、もしくはヘテロシクロ脂肪族C₁ ~ C₆ アルキルより選択される基である、化合物。

【請求項 8 3】

請求項 6 5 に記載の化合物であって、ここで、 y が 0 ~ 4 であり、そして q が 1 または 2 であり、そして R^{5a} の各存在が、独立して、Cl、Br、F、CF₃、Me、Et、CN、-COOH、-NH₂、-N(CH₃)₂、-N(Et)₂、-N(iPr)₂、-O(CH₂)₂OCH₃、-CONH₂、-COOCH₃、-OH、-OCH₃、-OCH₂CH₃、-CH₂OH、-NHCOCH₃、-SO₂NH₂、-SO₂NHC(C

H_3C_2 、 $-\text{OCOC}(\text{CH}_3)_3$ 、 $-\text{OCOCH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_3$ 、 $-\text{O}(\text{CH}_2)_2\text{N}(\text{CH}_3)_2$ 、 $4-\text{CH}_3$ -ピペラジン-1-イル、 $\text{OCOCH}(\text{CH}_3)_2$ 、 OCO (シクロペンチル)、 $-\text{COCH}_3$ 、必要に応じて置換されたフェノキシ、または必要に応じて置換されたベンジルオキシである、化合物。

【請求項 8 4】

請求項 6 5 に記載の化合物であって、ここで：

y が 0 であり、 q が 1 であり、そして R^{5a} が F であるか；

y が 0 であり、 q が 1 であり、そして R^{5a} が OR' であるか；

y が 0 であり、 q が 1 であり、そして R^{5a} が OH であるか；

y が 1 であり、 R^{5a} が OR' であり、そして R^5 が F であり、ここで、 OR' が、前記フェニル環の 2 位において置換され、そして F が、該フェニル環の 6 位において置換されているか；または

y が 1 であり、 R^{5a} が OH であり、そして R^5 が F であり、ここで、 OH が、該フェニル環の 2 位において置換され、そして F が、該フェニル環の 6 位において置換されている、

化合物。

【請求項 8 5】

請求項 6 5 に記載の化合物であって、ここで：

a) R^1 または R^2 の一方が水素であり、 R^1 および R^2 のもう一方が、 Cy^1 であって、ここで、 Cy^1 は、前記窒素原子に直接的に結合されるか、もしくは必要に応じて置換された $C_{1~4}$ 脂肪族基を通して結合された Cy^1 であって、ここで、該 $C_{1~4}$ 脂肪族基における 1 以上のメチレン単位が、必要に応じて、 $-NR-$ 、 $-O-$ 、 $-COO-$ 、 $-OCO-$ 、 $-NRCO-$ 、 $-CONR-$ 、 $-SO_2NR-$ 、もしくは $-NRSO_2$ により置換された、 Cy^1 、または、必要に応じて置換された $C_{1~4}$ 脂肪族基であって、該 $C_{1~4}$ 脂肪族基における 1 以上のメチレン単位が、必要に応じて、 $-NR-$ 、 $-O-$ 、 $-COO-$ 、 $-NRCO-$ 、 $-CONR-$ 、 $-SO_2NR-$ 、もしくは $-NRSO_2$ で置換された、必要に応じて置換された $C_{1~4}$ 脂肪族基、より選択されるか；あるいは、 R^1 および R^2 は、各々独立して、必要に応じて置換された $C_{1~4}$ 脂肪族基であって、ここで、該 $C_{1~4}$ 脂肪族基における 1 以上のメチレン単位が、必要に応じて、 $-NR-$ 、 $-O-$ 、 $-COO-$ 、 $-OCO-$ 、 $-NRCO-$ 、 $-CONR-$ 、 $-SO_2NR-$ 、もしくは $-NRSO_2$ で置換された、必要に応じて置換された $C_{1~4}$ 脂肪族基；または、 Cy^1 であって、ここで、 Cy^1 が該窒素原子に直接的に結合されるか、もしくは必要に応じて置換された $C_{1~4}$ 脂肪族基を通して結合された Cy^1 であって、ここで、該 $C_{1~4}$ 脂肪族基における 1 以上のメチレン単位が、必要に応じて、 $-NR-$ 、 $-O-$ 、 $-COO-$ 、 $-OCO-$ 、 $-NRCO-$ 、 $-CONR-$ 、 $-SO_2NR-$ 、もしくは $-NRSO_2$ で置換された Cy^1 、より選択され；

b) z が 0 ~ 5 であり、そして R^4 基が、各々独立して、 Cl 、 Br 、 F 、 CF_3 、 CH_3 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_3$ 、 CN 、 $-\text{COOH}$ 、 $-\text{N}(\text{CH}_3)_2$ 、 $-\text{N}(\text{Et})_2$ 、 $-\text{N}(\text{iPr})_2$ 、 $-\text{O}(\text{CH}_2)_2\text{OCH}_3$ 、 $-\text{CONH}_2$ 、 $-\text{COOCH}_3$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{CH}_2\text{OH}$ 、 $-\text{NHCOCH}_3$ 、 $-\text{SO}_2\text{NH}_2$ 、 $-\text{SO}_2(\text{CH}_2)_3\text{CH}_3$ 、 $-\text{SO}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ 、 $-\text{C(O)OCH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ 、 $-\text{NHCOOCH}_3$ 、 $-\text{C(O)C(CH}_3)_3$ 、 $-\text{COO}(\text{CH}_2)_2\text{CH}_3$ 、 $-\text{C(O)NHC(H}_3)_2$ 、 $-\text{C(O)CH}_2\text{CH}_3$ 、または、必要に応じて置換された基であって、該基が、-ピペリジニル(piperidinyl)、ピペリジニル(piperizinyl)、モルホリノ、 $C_{1~4}$ アルコキシ、フェニル、フェニルオキシ、ベンジル、ベンジルオキシ、 $-\text{CH}_2$ シクロヘキシリ、ピリジル、 $-\text{CH}_2$ ピリジル、もしくは $-\text{CH}_2$ チアゾリルより選択される基であり；

c) x が 0、1 または 2 であり、そして R^3 の各存在が、独立して、 Cl 、 Br 、 F 、 CF_3 、 $-\text{OCF}_3$ 、 Me 、 Et 、 CN 、 $-\text{COOH}$ 、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{N}(\text{CH}_3)_2$ 、 $-\text{O}(\text{CH}_2)_2\text{OCH}_3$ 、 $-\text{CONH}_2$ 、 $-\text{COOCH}_3$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{CH}_2\text{OH}$ 、 $-\text{NHCOCH}_3$ 、 $-\text{SO}_2\text{NH}_2$ 、 $-\text{SO}_2(\text{CH}_2)_3\text{CH}_3$ 、 $-\text{SO}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ 、 $-\text{C(O)OCH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ 、 $-\text{NHCOOCH}_3$ 、 $-\text{C(O)C(CH}_3)_3$ 、 $-\text{COO}(\text{CH}_2)_2\text{CH}_3$ 、 $-\text{C(O)NHC(H}_3)_2$ 、 $-\text{C(O)CH}_2\text{CH}_3$ 、または、必要に応じて置換された基であって、該基が、-ピペリジニル(piperidinyl)、ピペリジニル(piperizinyl)、モルホリノ、 $C_{1~4}$ アルコキシ、フェニル、フェニルオキシ、ベンジル、ベンジルオキシ、 $-\text{CH}_2$ シクロヘキシリ、ピリジル、 $-\text{CH}_2$ ピリジル、もしくは $-\text{CH}_2$ チアゾリルより選択される基であり；

N(Et)₂、-N(iPr)₂、-O(CH₂)₂OCH₃、-CONH₂、-COOCH₃、-OH、-OCH₃、-OCH₂CH₃、-CH₂OH、-NHCOCH₃、-NHCOCH(CH₃)₂、-SO₂NH₂、-CONH(シクロプロピル)、-CONHC₂CH₃、または、必要に応じて置換された基であって、該基が、-ペリジニル(piperidinyl)、ペリジニル(piperizinyl)、モルホリノ、フェニル、フェニルオキシ、ベンジル、もしくはベンジルオキシより選択される基であり；

d) yが0～4であり、そしてR⁵基が、存在する場合、各々独立して、Cl、Br、F、CF₃、Me、Et、CN、-COOH、-NH₂、-N(CH₃)₂、-N(Et)₂、-N(iPr)₂、-O(CH₂)₂OCH₃、-CONH₂、-COOCH₃、-OH、-OCH₃、-OCH₂CH₃、-CH₂OH、-NHCOCH₃、-SO₂NH₂、-SO₂NHC(CH₃)₂、-OCOC(CH₃)₃、-OCOCH₂C(CH₃)₃、-O(CH₂)₂N(CH₃)₂、4-CH₃-ペラジン-1-イル、OCOCH(C₂H₅)₂、OCO(シクロペンチル)、-COCH₃、必要に応じて置換されたフェノキシ、または必要に応じて置換されたベンジルオキシであり；そして

e) R⁵^aが、Cl、F、CF₃、Me、Et、-OH、-OCH₃、-OCH₂CH₃、-CH₂OH、-SO₂NH₂、-SO₂NHC(CH₃)₂、-OCOC(CH₃)₃、-OCOCH₂C(CH₃)₃、-O(CH₂)₂N(CH₃)₂、4-CH₃-ペラジン-1-イル、OCOCH(CH₃)₂、OCO(シクロペンチル)、または-COCH₃である、化合物。

【請求項86】

請求項85に記載の化合物であって、ここで、xが1であり、そして、R³が、前記キナゾリン環の6位に存在し、かつ、-Cl、-CH₃、-CH₂CH₃、-F、-CF₃、-OCF₃、-CONHC₂CH₃、-CONHCH₂CH₃、-CONH(シクロプロピル)、-OCH₃、-NH₂、-OCH₂CH₃、または-CNである、化合物。

【請求項87】

請求項85に記載の化合物であって、ここで、xが1であり、そして、R³が、前記キナゾリン環の7位に存在し、かつ、-Cl、-CH₃、-CH₂CH₃、-F、-CF₃、-OCF₃、-CONHC₂CH₃、-CONHCH₂CH₃、-CONH(シクロプロピル)、-OCH₃、-NH₂、-OCH₂CH₃、または-CNである、化合物。

【請求項88】

請求項85に記載の化合物であって、ここで、xが1であり、そして、R³が、前記キナゾリン環の6位に存在し、かつ、-Cl、-CH₃、-CH₂CH₃、-F、-CF₃、-OCF₃、-OCH₃、または-OCH₂CH₃である、化合物。

【請求項89】

請求項85に記載の化合物であって、ここで、xが1であり、そして、R³が、前記キナゾリン環の7位に存在し、そして、-Cl、-CH₃、-CH₂CH₃、-F、-CF₃、-OCF₃、-OCH₃、または-OCH₂CH₃である、化合物。

【請求項90】

請求項85に記載の化合物であって、ここで、xが1であり、そして、R³が、前記キナゾリン環の6位に存在し、そして、-CON(R')₂またはNR₂COR'である、化合物。

【請求項91】

請求項85に記載の化合物であって、ここで、xが1であり、そして、R³が、前記キナゾリン環の7位に存在し、そして、-CON(R')₂またはNR₂COR'である、化合物。

【請求項92】

請求項85に記載の化合物であって、ここで、R⁵^aが、Cl、F、CF₃、Me、Et、-OH、-OCH₃、-OCH₂CH₃である、化合物。

【請求項93】

請求項 8 5に記載の化合物であって、ここで：

y が 0 であり、 q が 1 であり、そして R^{5^a} が F であるか；

y が 0 であり、 q が 1 であり、そして R^{5^a} が OR' であるか；

y が 0 であり、 q が 1 であり、そして R^{5^a} が OH であるか；

y が 1 であり、 R^{5^a} が OR' であり、そして R^5 が F であり、ここで、OR' が、前記フェニル環の 2 位において置換され、そして F が、該フェニル環の 6 位において置換されているか；または

y が 1 であり、 R^{5^a} が OH であり、そして R^5 が F であり、ここで、OH が、該フェニル環の 2 位において置換され、そして F が、該フェニル環の 6 位において置換されている、

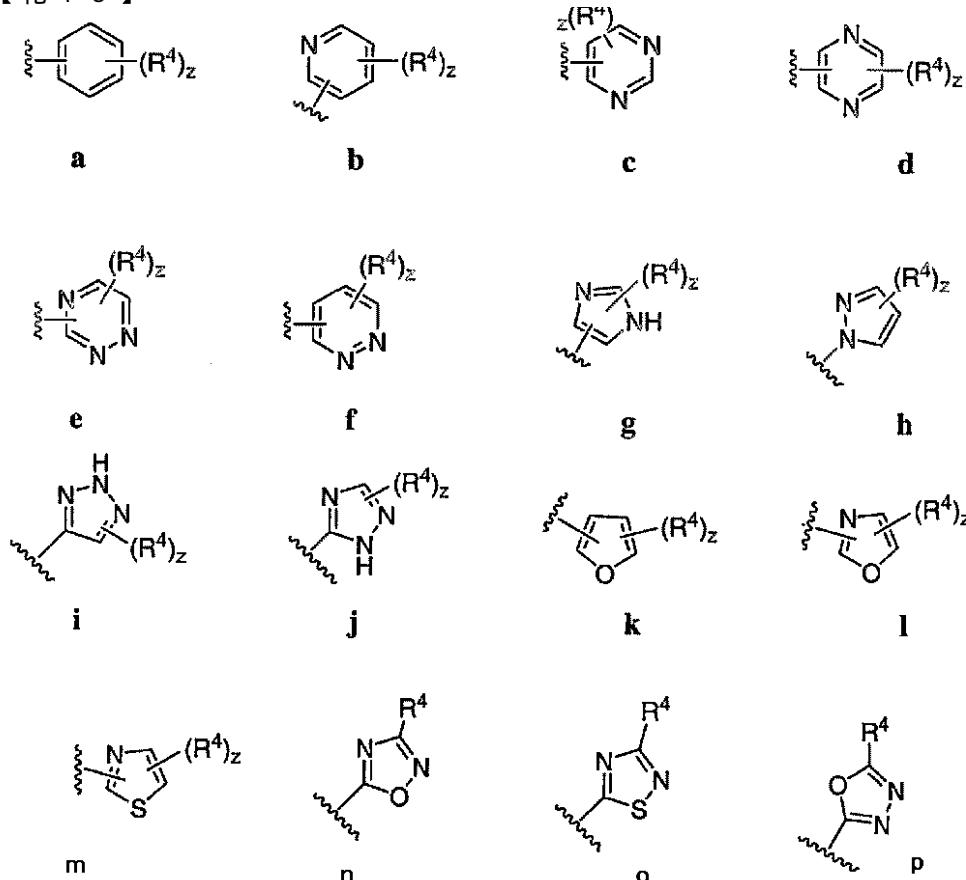
化合物。

【請求項 9 4】

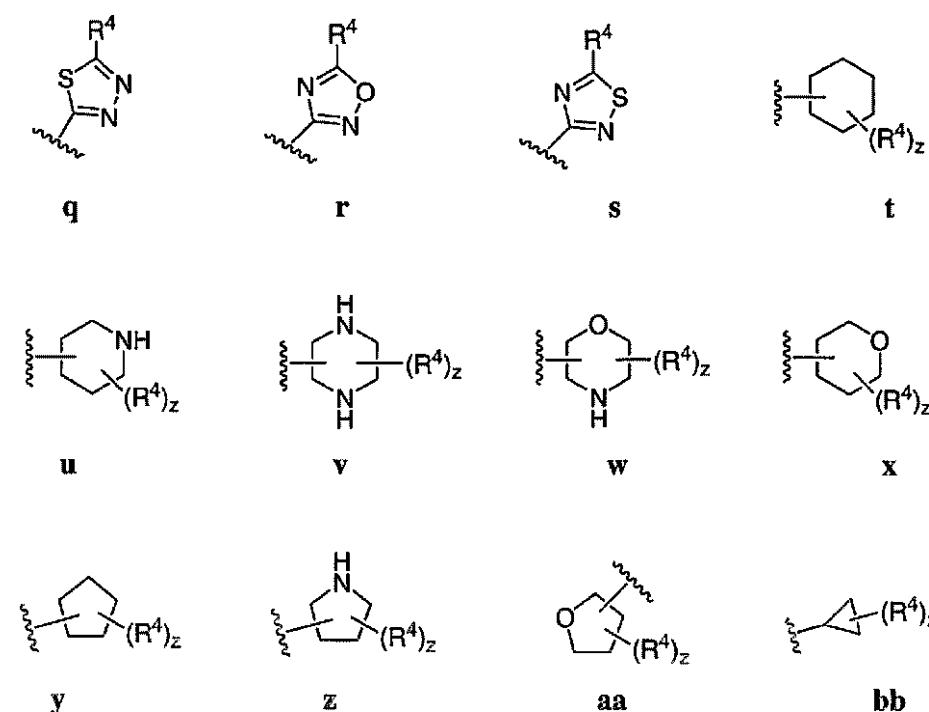
請求項 8 5に記載の化合物であって、ここで：

a) R^1 または R^2 の一方が水素であり、 R^1 および R^2 のもう一方が、Cy¹ であって、ここで、Cy¹ は、前記窒素原子に直接的に結合されるか、もしくは必要に応じて置換された $C_{1~4}$ 脂肪族基を通して結合された Cy¹ であって、ここで、該 $C_{1~4}$ 脂肪族基における 1 以上のメチレン単位が、必要に応じて、-NR-、-O-、-COO-、-OCO-、-NRCO-、-CONR-、-SO₂NR-、もしくは -NRSO₂ により置換された、Cy¹、または、必要に応じて置換された $C_{1~4}$ 脂肪族基であって、該 $C_{1~4}$ 脂肪族基における 1 以上のメチレン単位が、必要に応じて、-NR-、-O-、-COO-、-OCO-、-NRCO-、-CONR-、-SO₂NR-、もしくは -NRSO₂- で置換された、必要に応じて置換された $C_{1~4}$ 脂肪族基より選択されるか；あるいは、 R^1 および R^2 は、各々独立して、必要に応じて置換された $C_{1~4}$ 脂肪族基であって、ここで、該 $C_{1~4}$ 脂肪族基における 1 以上のメチレン単位が、必要に応じて、-NR-、-O-、-COO-、-OCO-、-NRCO-、-CONR-、-SO₂NR-、もしくは -NRSO₂- で置換された、必要に応じて置換された $C_{1~4}$ 脂肪族基；または、Cy¹ であって、ここで、Cy¹ が該窒素原子に直接的に結合されるか、もしくは必要に応じて置換された $C_{1~4}$ 脂肪族基を通して結合された Cy¹ であって、ここで、該 $C_{1~4}$ 脂肪族基における 1 以上のメチレン単位が、必要に応じて、-NR-、-O-、-COO-、-OCO-、-NRCO-、-CONR-、-SO₂NR-、もしくは -NRSO₂- で置換された Cy¹ であって、そして Cy¹ が、以下：

【化18】



【化19】



より選択される、Cや 1 より選択されるか、あるいは、R 1 およびR 2 が、各々独立して、必要に応じて置換されたC₁～₄脂肪族基であり、かつ各々独立して、必要に応じて

置換されたメチル、エチル、シクロプロピル、n-プロピル、プロペニル、シクロブチル、(CO)OCH₂CH₃、(CH₂)₂OCH₃、CH₂CO)OCH₂CH₃、CH₂(CO)OCH₃、CH(CH₃)CH₂CH₃、またはn-ブチルであり；

b) zが0～5であり、そしてR⁴基が、各々独立して、Cl、Br、F、CF₃、CH₃、-CH₂CH₃、CN、-COOH、-N(CH₃)₂、-N(Et)₂、-N(iPr)₂、-O(CH₂)₂OCH₃、-CONH₂、-COOCH₃、-OH、-CH₂OH、-NHCOCH₃、-SO₂NH₂、-SO₂(CH₂)₃CH₃、-SO₂CH(CH₃)₂、-SO₂N(CH₃)₂、-SO₂CH₂CH₃、-C(O)OCH₂CH(CH₃)₂、-C(O)NHCH₂CH(CH₃)₂、-NHCOOCH₃、-C(O)C(CH₃)₃、-COO(CH₂)₂CH₃、-C(O)NHCH(CH₃)₂、-C(O)CH₂CH₃、または、必要に応じて置換された基であって、該基が、-ペペリジニル(piperidinyl)、ペペリジニル(piperizinyl)、モルホリノ、C₁～₄アルコキシ、フェニル、フェニルオキシ、ベンジル、ベンジルオキシ、-CH₂シクロヘキシル、ピリジル、-CH₂ピリジル、もしくは-CH₂チアゾリルより選択される基であり；

c) xが0、1または2であり、そしてR³の各存在が、独立して、Cl、Br、F、CF₃、-OCF₃、Me、Et、CN、-COOH、-NH₂、-N(CH₃)₂、-N(Et)₂、-N(iPr)₂、-O(CH₂)₂OCH₃、-CONH₂、-COOCH₃、-OH、-OCH₃、-OCH₂CH₃、-CH₂OH、-NHCOCH₃、-NHCOCH(CH₃)₂、-SO₂NH₂、-CONH(シクロプロピル)、-CONHC₂CH₃、または、必要に応じて置換された基であって、該基が、-ペペリジニル(piperidinyl)、ペペリジニル(piperizinyl)、モルホリノ、フェニル、フェニルオキシ、ベンジル、もしくはベンジルオキシより選択される基であり；

d) ここで、yは0～4であり、そしてR⁵基が、存在する場合、各々独立して、Cl、Br、F、CF₃、Me、Et、CN、-COOH、-NH₂、-N(CH₃)₂、-N(Et)₂、-N(iPr)₂、-O(CH₂)₂OCH₃、-CONH₂、-COOCH₃、-OH、-OCH₃、-OCH₂CH₃、-CH₂OH、-NHCOCH₃、-SO₂NH₂、-SO₂NHC(CH₃)₂、-OCOC(CH₃)₃、-OCOCH₂C(CH₃)₃、-O(CH₂)₂N(CH₃)₂、4-CH₃-ピペラジン-1-イル、OCOCH(CH₃)₂、OCO(シクロペンチル)、-COCH₃、必要に応じて置換されたフェノキシ、または必要に応じて置換されたベンジルオキシであり；そして、

e) R⁵^aが、Cl、F、CF₃、Me、Et、-OH、-OCH₃、-OCH₂CH₃、-CH₂OH、-SO₂NH₂、-SO₂NHC(CH₃)₂、-OCOC(CH₃)₃、-OCOCH₂C(CH₃)₃、-O(CH₂)₂N(CH₃)₂、4-CH₃-ピペラジン-1-イル、OCOCH(CH₃)₂、OCO(シクロペンチル)、または-COCH₃である、化合物。

【請求項95】

請求項94に記載の化合物であって、ここで、xが1であり、そしてR³が、前記キナゾリン環の6位に存在し、かつ-Cl、-CH₃、-CH₂CH₃、-F、-CF₃、-OCF₃、-CONHCH₃、-CONHC₂CH₃、-CONH(シクロプロピル)、-OCH₃、-NH₂、-OCH₂CH₃、または-CNである、化合物。

【請求項96】

請求項94に記載の化合物であって、ここで、xが1であり、そしてR³が、前記キナゾリン環の7位に存在し、そして-Cl、-CH₃、-CH₂CH₃、-F、-CF₃、-OCF₃、-CONHCH₃、-CONHC₂CH₃、-CONH(シクロプロピル)、-OCH₃、-NH₂、-OCH₂CH₃、または-CNである、化合物。

【請求項97】

請求項94に記載の化合物であって、ここで、xが1であり、そして、R³が、前記キナゾリン環の6位に存在し、-Cl、-CH₃、-CH₂CH₃、-F、-CF₃、-O

C_F_3 、 $-\text{OCH}_3$ 、または $-\text{OCH}_2\text{CH}_3$ である、化合物。

【請求項 9 8】

請求項 9 4 に記載の化合物であって、ここで、 x が 1 であり、そして、 R^3 が、前記キナゾリン環の 7 位に存在し、 $-\text{Cl}$ 、 $-\text{CH}_3$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_3$ 、 $-\text{F}$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OCH}_3$ 、または $-\text{OCH}_2\text{CH}_3$ である、化合物。

【請求項 9 9】

請求項 9 4 に記載の化合物であって、ここで、 x が 1 であり、そして、 R^3 が、前記キナゾリン環の 6 位に存在し、そして、 $-\text{CON}(R')$ または NRCOR' である、化合物。

【請求項 100】

請求項 9 4 に記載の化合物であって、ここで、 x が 1 であり、そして、 R^3 が、前記キナゾリン環の 7 位に存在し、そして、 $-\text{CON}(R')$ または NRCOR' である、化合物。

【請求項 101】

請求項 9 4 に記載の化合物であって、ここで、 R^{5a} が、 Cl 、 F 、 CF_3 、 Me 、 Et 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{OCH}_3$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CH}_3$ である、化合物。

【請求項 102】

請求項 9 4 に記載の化合物であって、ここで：

y が 0 であり、 q が 1 であり、そして R^{5a} が F であるか；

y が 0 であり、 q が 1 であり、そして R^{5a} が OR' であるか；

y が 0 であり、 q が 1 であり、そして R^{5a} が OH であるか；

y が 1 であり、 R^{5a} が OR' であり、そして R^5 が F であり、ここで、 OR' が、前記フェニル環の 2 位において置換され、そして F が、該フェニル環の 6 位において置換されているか；または、

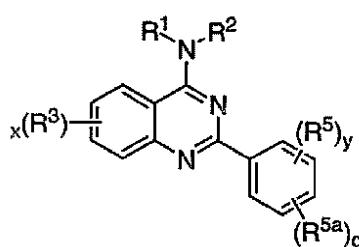
y が 1 であり、 R^{5a} が OH であり、そして R^5 が F であり、ここで、 OH が、該フェニル環の 2 位において置換され、そして F が、該フェニル環の 6 位において置換されている、

化合物。

【請求項 103】

式 IA-i の化合物：

【化 20】



IA-i

またはその薬学的に受容可能な塩であって、

ここで、 R^1 および R^2 が、各々独立して、 $C_{1 \sim 6}$ 脂肪族、 Cy^1 より選択される、必要に応じて置換される基であり、ここで、 Cy^1 は、窒素、酸素、もしくは硫黄より独立して選択される 0 個～3 個のヘテロ原子を有する、5 員～7 員の単環式アリール環もしくは 8 員～10 員の二環式アリール環であるか、または、窒素、酸素、もしくは硫黄より独立して選択される 0 個～3 個のヘテロ原子を有する、3 員～12 員の飽和または部分的に不飽和な单環式環であって、ここで、 Cy^1 は、前記窒素原子に直接的に結合されるか、または、必要に応じて置換された $C_{1 \sim 4}$ 脂肪族基を通して結合されるかであり、ここで、該 $C_{1 \sim 4}$ 脂肪族基における 1 以上のメチレン単位が、 $-\text{NR}-$ 、 $-\text{O}-$ 、 $-\text{COO}$ 、 $-\text{OCO}-$ 、 $-\text{NRCO}-$ 、 $-\text{CONR}-$ 、 $-\text{SO}_2\text{NR}-$ 、もしくは $-\text{NRSO}_2-$ で必要に応じて置換され；ここで、 R^1 および R^2 が、各々必要に応じてかつ独立して、1

個以上の置換可能な炭素原子、窒素原子、または硫黄原子において、 $-R^4$ の z 個の独立した存在で置換され、ここで、 z が $0 \sim 5$ であり；

x が 1 であり、そして R^3 が前記キナゾリン環の 6 位または 7 位のいずれかにおいて置換され；

y が $0 \sim 4$ であり；

q が 0、1、または 2 であり；

R^3 、 R^4 、および R^5 の各存在は、独立して $Q - R^X$ であり；ここで、 Q は、結合であるか、または $C_1 \sim C_6$ アルキリデン鎖であり、ここで、 Q の 2 までの非隣接メチレン単位が、必要に応じてかつ独立して、 $-NR-$ 、 $-S-$ 、 $-O-$ 、 $-CS-$ 、 $-CO_2-$ 、 $-OCO-$ 、 $-CO-$ 、 $-COCO-$ 、 $-CONR-$ 、 $-NRCO-$ 、 $-NRCO_2-$ 、 $-SO_2NR-$ 、 $-NRSO_2-$ 、 $-CONRNR-$ 、 $-NRCONR-$ 、 $-OCONR-$ 、 $-NRNR-$ 、 $-NRSO_2NR-$ 、 $-SO-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-PO-$ 、 $-PO_2-$ 、 $-OP(O)(OR)-$ 、または $-POR-$ により置換され；そして R^X の各存在は、 R' 、 $=O$ 、 $=NR'$ 、ハロゲン、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-OR'$ 、 $-SR'$ 、 $-N(R')$ ₂、 $-NR'COR'$ 、 $-NR'CON(R')_2$ 、 $-NR'CO_2R'$ 、 $-COR'$ 、 $-CO_2R'$ 、 $-OCOR'$ 、 $-CON(R')_2$ 、 $-OCON(R')_2$ 、 $-SOR'$ 、 $-SO_2N(R')_2$ 、 $-NRSO_2R'$ 、 $-NR'SO_2N(R')_2$ 、 $-COCOR'$ 、 $-COCH_2COR'$ 、 $-OP(O)(OR')_2$ 、 $-P(O)(OR')_2$ 、 $-OP(O)_2OR'$ 、 $-P(O)_2OR'$ 、 $-PO(R')_2$ 、または $-OPO(R')_2$ より独立して選択され；

R^5 ^a の各存在は、独立して、必要に応じて置換された $C_1 \sim C_6$ 脂肪族基、ハロゲン、 $-OR'$ 、 $-SR'$ 、 $-N(R')_2$ 、 $-NR'COR'$ 、 $-NR'CON(R')_2$ 、 $-NR'CO_2R'$ 、 $-COR'$ 、 $-CO_2R'$ 、 $-OCOR'$ 、 $-CON(R')_2$ 、 $-OCON(R')_2$ 、 $-SOR'$ 、 $-SO_2R'$ 、 $-SO_2N(R')_2$ 、 $-NRSO_2R'$ 、 $-NRSO_2N(R')_2$ 、 $-COCOR'$ 、 $-COCH_2COR'$ 、 $-OP(O)(OR')_2$ 、 $-P(O)(OR')_2$ 、 $-OP(O)_2OR'$ 、 $-P(O)_2OR'$ 、 $-PO(R')_2$ 、または $-OPO(R')_2$ であり；そして

R の各存在は、独立して、水素または必要に応じて置換された $C_1 \sim C_6$ 脂肪族基であり；そして R' の各存在は、独立して、水素もしくは必要に応じて置換された $C_1 \sim C_6$ 脂肪族基、3員～8員の飽和、部分的に不飽和、もしくは完全に不飽和な单環式環であって、該環は、窒素、酸素もしくは硫黄より独立して選択される 0 個～3 個のヘテロ原子を有する单環式環、または、窒素、酸素、もしくは硫黄より独立して選択される 0 個～5 個のヘテロ原子を有する 8 員～12 員の飽和、部分的に不飽和、または完全に不飽和な二環式系である；または、 R および R' 、2 つの R の存在、もしくは 2 つの R' の存在は、これらが結合する原子と一緒にになって、必要に応じて置換された 3 員～12 員の飽和、部分的に不飽和、または完全に不飽和な单環式または二環式環であって、該環は、窒素、酸素、もしくは硫黄より独立して選択される 0 個～4 個のヘテロ原子を有する单環式または二環式環であり、ただし：

a) R^3 が、該キナゾリン環の 7 位に存在する場合；

i) R^3 が、 C_1 または M_e であり、環 A が、非置換のナフチルであり、そして R^1 が水素である場合、 R^2 が $-(CH_2)_3NMe_2$ であり；

ii) R^3 が C_1 であり、 q および y の合計が 1 であり、そして前記フェニル環が、4 位において Br で置換され、そして R^1 が水素である場合、 R^2 は、 Cy^1 ではなく、ここで、 Cy^1 は、該窒素原子に、必要に応じて置換された $C_1 \sim C_4$ 脂肪族基を通して結合され、ここで、該 $C_1 \sim C_4$ 脂肪族基の 1 以上のメチレン単位が、 $-NR-$ 、 $-O-$ 、 $-COO$ 、 $-OCO-$ 、 $-NRCO-$ 、 $-CONR-$ 、 $-SO_2NR-$ 、または $-NRSO_2-$ で必要に応じて置換され；

iii) R^3 が C_1 または OMe である場合、 q および y の合計が 1 であり、そして該フェニル環が、4 位において OMe または C_1 のいずれかで置換され、そして R^1 が水素である場合、 R^2 は、 $CH(CH_3)(CH_2)_3N(Et)_2$ ではなく；

i v) R^3 が Me、 OMe、 または NO_2 であり、 そして q および y が 0 である場合、 R^1 および R^2 は、 両方ともメチルではなく；

v) R^3 が OMe であり、 q および y が 0 であり、 そして R^1 が水素である場合、 R^2 は、 - SO_2 (4-Me-フェニル) ではなく；

v i) R^3 が F であり、 q および y の合計が、 1 であり、 該フェニル環が 2 位において Cl で置換され、 そして R^1 が水素である場合、 R^2 は、 - (CH₂) モルホリノではなく； そして

b) a) R^3 が、 該キナゾリン環の 6 位に存在する場合：

i) R^3 が NH₂、 Me、 Cl、 Br、 - N H A c である場合、 q および y の合計が 1 であり、 そして該フェニル環が、 4 位において F で置換される場合、 または、 環 A がナフチルであり、 そして R^1 が水素である場合、 R^2 は、 - (CH₃)₃ - 4 N (R')₂ ではなく；

i i) R^3 が、 - OCH₂ Ph または - OH であり、 そして q および y が 0 である場合、 R^1 が水素である場合、 R^2 は、 Me でも、 nBu でも、 - (CH₂)₂ モルホリノでもないか、 または R^1 および R^2 が、 同時に Me でも Et でもなく；

i i i) R^3 が、 Me または Cl であり、 q および y の合計が 1 である場合、 該フェニル環が、 4 位において Br で置換されず；

i v) R^3 が Cl であり、 q および y が 0 であり、 そして R^1 が水素である場合、 R^2 は、 - SO₂ (4-Me-フェニル) ではなく；

v) R^3 が OMe であり、 q および y が 0 であり、 そして R^1 が水素である場合、 R^2 は、 - CH₂ CH₂ OH でも、 - CH₂ CH₂ ピロリジニルでもなく；

v i) R^3 が Cl または Br であり、 q および y の合計が 1 であり、 そして該フェニル環が、 4 位において - CH₂ PO(OR')₂ で置換される場合、 R^1 は、 R^2 が - Me である場合に、 水素ではないか、 または R^1 および R^2 は、 同時に Me でも Et でもなく；

v i i) R^3 が OH であり、 q および y の合計が 0 である場合、 R^1 および R^2 は、 同時に - CH₂ CH₂ OMe ではなく；

v i i i) R^3 が Cl であり、 q および y の合計が 1 であり、 該フェニル環が、 2 位において OnPr で置換され、 そして R^1 が水素である場合、 R^2 は、 - CH₂ (1,3-ベンゾジオキソール) ではなく；

i x) R^3 が OMe、 OH、 Br、 Cl、 NO₂、 Me であり、 そして q および y が 0 である場合、 R^1 が水素である場合、 R^2 は、 Me でも、 - CH₂ CH₂ COOMe でも、 - CH₂ COOMe でも、 - (CH₂)₃ CH₃ でもないか、 R^1 および R^2 が同時に Me でなく； そして

x) R^3 が Cl であり、 q および y の合計が 1 であり、 該フェニル環が 4 位において Cl で置換される場合、 R^1 および R^2 は、 同時に Me でも iPr でもない、 化合物。

【請求項 104】

請求項 103 に記載の化合物であって、 ここで、

a) R^1 および R^2 の一方が水素であり、 そして R^1 および R^2 のもう一方が、 以下：

i) Cy¹ であって、 前記窒素原子に直接的に結合されるか、 もしくは必要に応じて置換された C_{1~4} 脂肪族基を通して結合され、 ここで、 該 C_{1~4} 脂肪族基における 1 以上のメチレン単位が、 - NR - 、 - O - 、 - COO 、 - OCO - 、 - NRCO - 、 - CONR - 、 - SO₂ NR - 、 もしくは - NRSO₂ - で必要に応じて置換される Cy¹ ； または、

i i) 必要に応じて置換された C_{1~4} 脂肪族基であって、 該 C_{1~4} 脂肪族基における 1 以上のメチレン単位が、 必要に応じて、 - NR - 、 - O - 、 - COO 、 - OCO - 、 - NRCO - 、 - CONR - 、 - SO₂ NR - 、 もしくは - NRSO₂ - で置換された C_{1~4} 脂肪族基； あるいは、

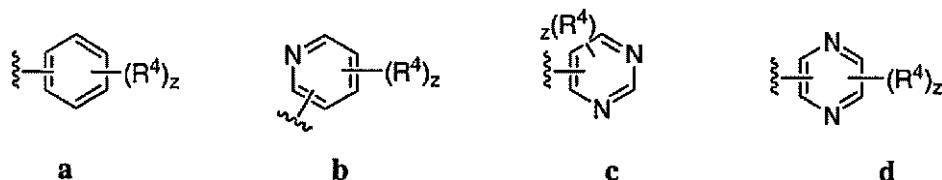
b) R^1 および R^2 が、 各々独立して、 Cy¹ より選択され、 ここで、 Cy¹ が、 該窒

素原子に直接的に結合されるか、または該 C₁ ~ C₄ 脂肪族基における 1 以上のメチレン単位が、必要に応じて、 - N R - 、 - O - 、 - C O O - 、 - O C O - 、 - N R C O - 、 - C O N R - 、 - S O₂ N R - 、もしくは - N R S O₂ - で置換される、必要に応じて置換された C₁ ~ C₄ 脂肪族基；または、必要に応じて置換された C₁ ~ C₄ 脂肪族基であって、該 C₁ ~ C₄ 脂肪族基における 1 以上のメチレン単位が、必要に応じて、 - N R - 、 - O - 、 - C O O - 、 - O C O - 、 - N R C O - 、 - C O N R - 、 - S O₂ N R - 、もしくは - N R S O₂ - により置換された C₁ ~ C₄ 脂肪族基を通して結合される、化合物。

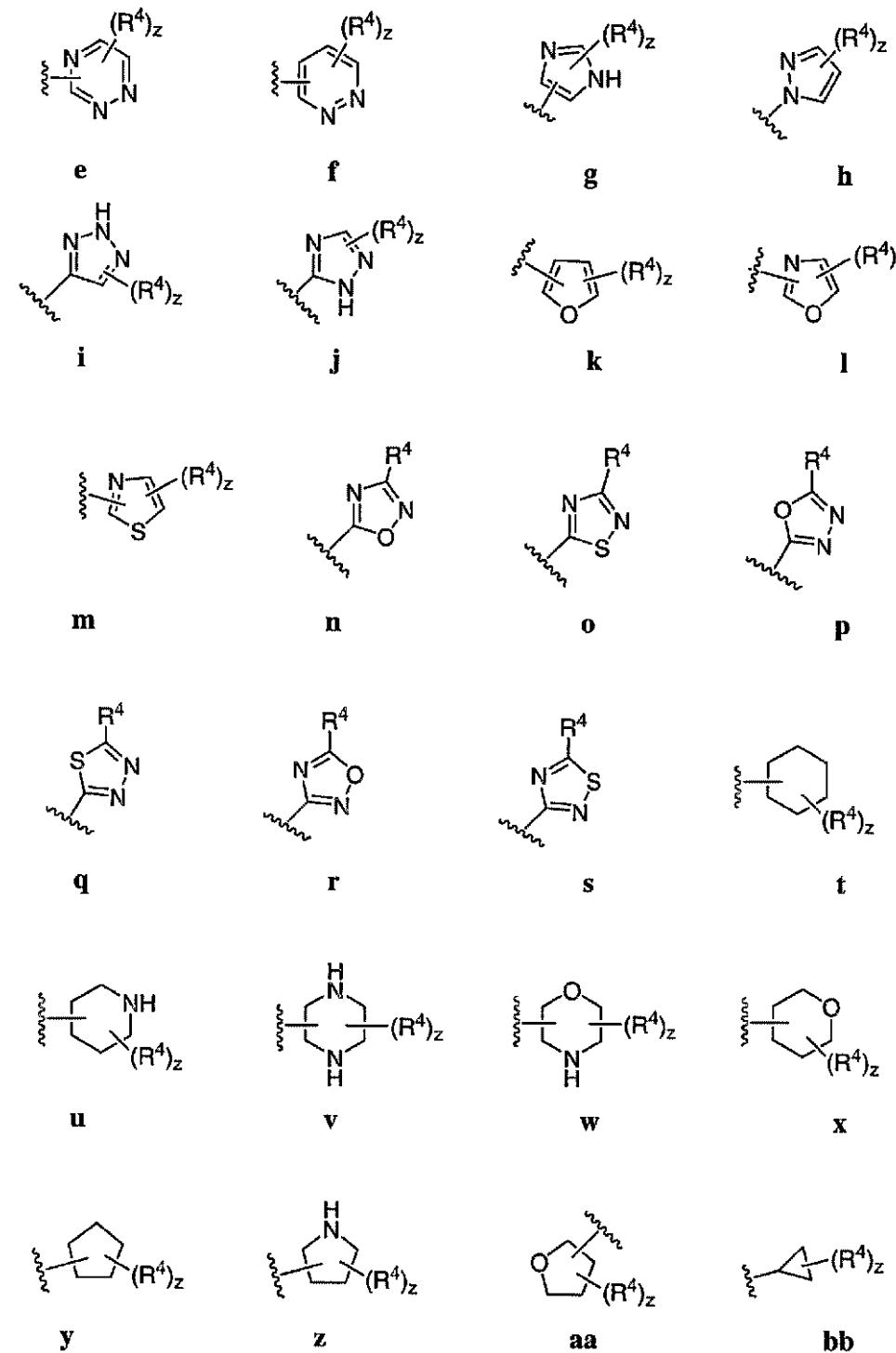
【請求項 105】

請求項 103 に記載の化合物であって、ここで、 C_y¹ が、以下：

【化 21】



【化22】

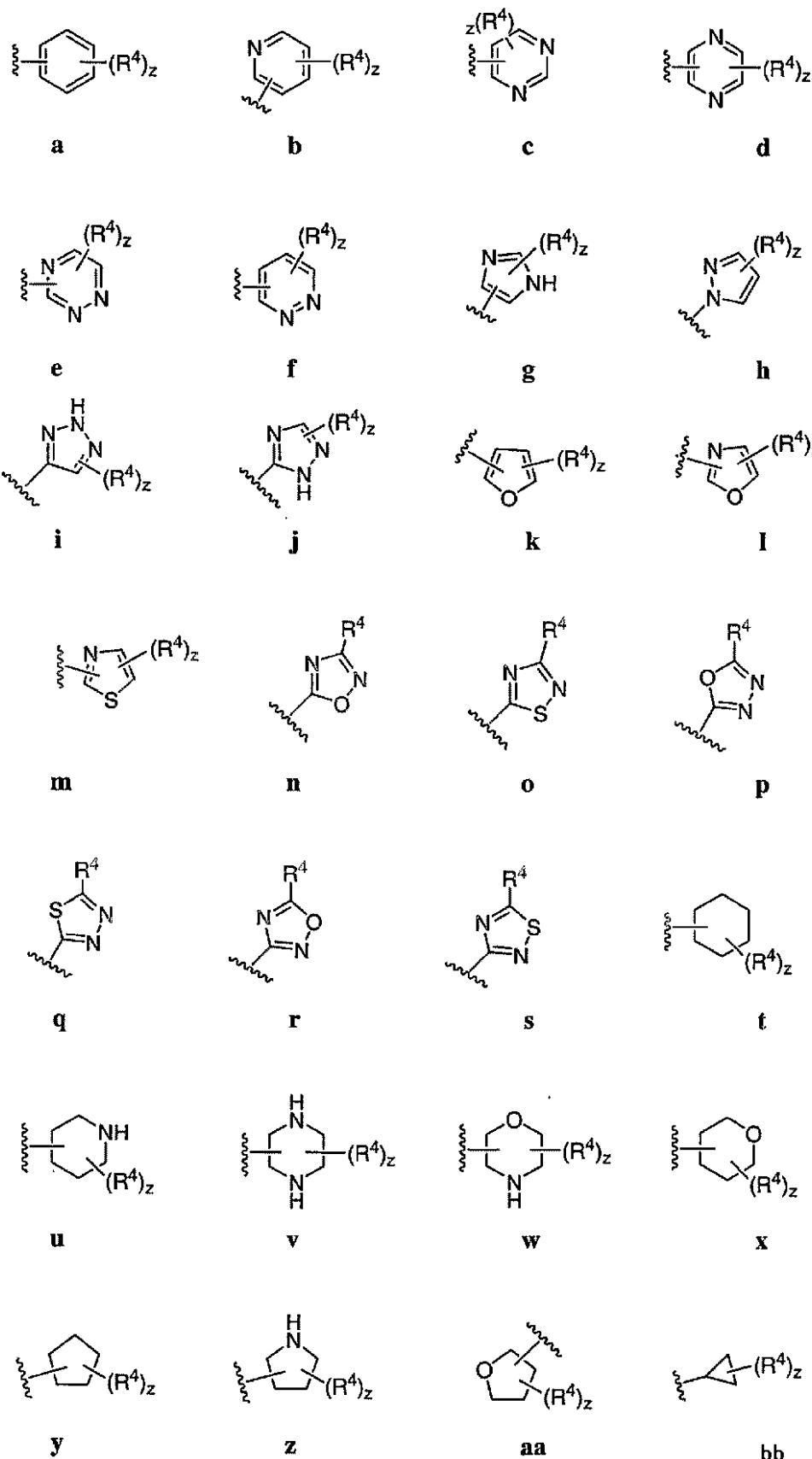


である、
化合物。

【請求項106】

請求項103に記載の化合物であって、ここで、R¹が、水素または必要に応じて置換されたC₁～C₄脂肪族基であり、そして、R²が、-CH_R-Cy¹であり、ここで、Rが、水素またはC₁～C₄アルキルであり、そしてCy¹が、以下：

【化23】



である、

化合物。

【請求項107】

請求項103に記載の化合物であって、ここで、 R^1 基および R^2 基が、各々独立して

、必要に応じて置換されたC₁～C₄脂肪族基であり、そして、各々独立して、必要に応じて置換されたメチル、エチル、シクロプロピル、n-プロピル、プロペニル、シクロブチル、(CO)OCH₂CH₃、(CH₂)₂OCH₃、CH₂CO)OCH₂CH₃、CH₂(CO)OCH₃、CH(CH₃)CH₂CH₃、またはn-ブチルより選択される、化合物。

【請求項108】

請求項103に記載の化合物であって、ここで、zが0～5であり、そしてR⁴基が、存在する場合、各々独立して、ハロゲン、CN、NO₂、-N(R')₂、-CH₂N(R')₂、-OR'、-CH₂OR'、-SR'、-CH₂SR'、-COOR'、-NRCOR'、-CON(R')₂、-OCON(R')₂、COR'、-NHCOOR'、-SO₂R'、-SO₂N(R')₂、または、C₁～C₆脂肪族、アリール、ヘテロアリール、シクロ脂肪族、ヘテロシクロ脂肪族、アリールC₁～C₆アルキル、ヘテロアリールC₁～C₆アルキル、シクロ脂肪族C₁～C₆アルキル、もしくはヘテロシクロ脂肪族C₁～C₆アルキルより選択される、必要に応じて置換された基である、化合物。

【請求項109】

請求項103に記載の化合物であって、ここで、zが0～5であり、そしてR⁴基が、各々独立して、Cl、Br、F、CF₃、CH₃、-CH₂CH₃、CN、-COOH、-N(CH₃)₂、-N(Et)₂、-N(ipr)₂、-O(CH₂)₂OCH₃、-CONH₂、-COOCH₃、-OH、-CH₂OH、-NHCOCH₃、-SO₂NH₂、-SO₂(CH₂)₃CH₃、-SO₂CH(CH₃)₂、-SO₂N(CH₃)₂、-SO₂CH₂CH₃、-C(O)OCH₂CH(CH₃)₂、-C(O)NHCH₂CH(CH₃)₂、-NHCOOCH₃、-C(O)C(CH₃)₃、-COO(CH₂)₂CH₃、-C(O)NHCH(CH₃)₂、-C(O)CH₂CH₃、または、-ピペリジニル(piperidinyl)、ピペリジニル(piperizinyl)、モルホリノ、C₁～C₄アルコキシ、フェニル、フェニルオキシ、ベンジル、ベンジルオキシ、-CH₂シクロヘキシル、ピリジル、-CH₂ピリジル、もしくは-CH₂チアゾリルより選択される、必要に応じて置換された基である、化合物。

【請求項110】

請求項103に記載の化合物であって、R³が、ハロゲン、CN、NO₂、-NR'₂、-CH₂N(R')₂、-OR'、-CH₂OR'、-SR'、-CH₂SR'、-COOR'、-NRCOR'、-CON(R')₂、-OCON(R')₂、COR'、-NHCOOR'、-SO₂R'、-SO₂N(R')₂、または、必要に応じて置換された基であって、該基が、C₁～C₆脂肪族、アリール、ヘテロアリール、シクロ脂肪族、ヘテロシクロ脂肪族、アリールC₁～C₆アルキル、ヘテロアリールC₁～C₆アルキル、シクロ脂肪族C₁～C₆アルキル、もしくはヘテロシクロ脂肪族C₁～C₆アルキルより選択される基である、

化合物。

【請求項111】

請求項105に記載の化合物であって、ここで、R³が、Cl、Br、F、CF₃、-OCF₃、Me、Et、CN、-COOH、-NH₂、-N(CH₃)₂、-N(Et)₂、-N(ipr)₂、-O(CH₂)₂OCH₃、-CONH₂、-COOCH₃、-OH、-OCH₃、-OCH₂CH₃、-CH₂OH、-NHCOCH₃、-NHCOCH₂CH₃、または、必要に応じて置換された基であって、該基が、-ピペリジニル(piperidinyl)、ピペリジニル(piperizinyl)、モルホリノ、フェニル、フェニルオキシ、ベンジル、もしくはベンジルオキシより選択される基である、

化合物。

【請求項 112】

請求項 10_3 に記載の化合物であって、ここで、R³ が、ハロゲン、CN、必要に応じて置換されたC₁ ~ C₆ アルキル、OR'、N(R')₂、CON(R')₂、またはNRCOR' である、

化合物。

【請求項 113】

請求項 10_3 に記載の化合物であって、ここで、R³ が、-Cl、-CH₃、-CH₂CH₃、-F、-CF₃、-OCF₃、-CONHCH₃、-CONHCH₂CH₃、-CONH(シクロプロピル)、-OCH₃、-NH₂、-OCH₂CH₃、または-CN である、

化合物。

【請求項 114】

請求項 10_3 に記載の化合物であって、ここで、R³ が、前記キナゾリン環の6位に存在し、そして、-Cl、-CH₃、-CH₂CH₃、-F、-CF₃、-OCF₃、-CONHCH₃、-CONHCH₂CH₃、-CONH(シクロプロピル)、-OCH₃、-NH₂、-OCH₂CH₃、または-CN である、

化合物。

【請求項 115】

請求項 10_3 に記載の化合物であって、R³ が、前記キナゾリン環の7位に存在し、そして、-Cl、-CH₃、-CH₂CH₃、-F、-CF₃、-OCF₃、-CONHCH₃、-CONHCH₂CH₃、-CONH(シクロプロピル)、-OCH₃、-NH₂、-OCH₂CH₃、または-CN である、

化合物。

【請求項 116】

請求項 10_3 に記載の化合物であって、ここで、R³ が、前記キナゾリン環の6位に存在し、そして、-Cl、-CH₃、-CH₂CH₃、-F、-CF₃、-OCF₃、-OCH₃、または-OCH₂CH₃ である、

化合物。

【請求項 117】

請求項 10_3 に記載の化合物であって、ここで、R³ が、前記キナゾリン環の7位に存在し、そして、-Cl、-CH₃、-CH₂CH₃、-F、-CF₃、-OCF₃、-OCH₃、または-OCH₂CH₃ である、

化合物。

【請求項 118】

請求項 10_3 に記載の化合物であって、ここで、R³ が、前記キナゾリン環の6位に存在し、そして、-CON(R')₂ またはNRCOR' である、

化合物。

【請求項 119】

請求項 10_3 に記載の化合物であって、ここで、R³ が、前記キナゾリン環の7位に存在し、そして、-CON(R')₂ またはNRCOR' である、

化合物。

【請求項 120】

請求項 10_3 に記載の化合物であって、ここで、y が0 ~ 5 であり、q が0 ~ 2 であり、そしてR⁵ 基およびR^{5a} 基が、存在する場合、各々独立して、ハロゲン、CN、NO₂、-N(R')₂、-CH₂N(R')₂、-OR'、-CH₂OR'、-SR'、-CH₂SR'、-NRCOR'、-CON(R')₂、-S(O)₂N(R')₂、-OCOR'、-COR'、-CO₂R'、-OCON(R')₂、-NR'SO₂R'、-OP(O)(OR')₂、-P(O)(OR')₂、-OP(O)₂OR'、-P(O)₂OR'、-PO(R')₂、-OPPO(R')₂、または、必要に応じて置換された基

であって、該基が、C₁～C₆脂肪族、アリール、ヘテロアリール、シクロ脂肪族、ヘテロシクロ脂肪族、アリールC₁～C₆アルキル、ヘテロアリールC₁～C₆アルキル、シクロ脂肪族C₁～C₆アルキル、もしくはヘテロシクロ脂肪族C₁～C₆アルキルより選択される基である、

化合物。

【請求項 1 2 1】

請求項10_3に記載の化合物であって、ここで、yが0～5であり、そしてqが1または2であり、そしてR^{5a}の各存在が、独立して、C1、Br、F、CF₃、Me、Et、CN、-COOH、-NH₂、-N(CH₃)₂、-N(Et)₂、-N(iPr)₂、-O(CH₂)₂OCH₃、-CONH₂、-COOCH₃、-OH、-OCH₃、-OCH₂CH₃、-CH₂OH、-NHCOCH₃、-SO₂NH₂、-SO₂NHC(CH₃)₂、-OCOC(CH₃)₃、-OCOCH₂C(CH₃)₃、-O(CH₂)₂N(CH₃)₂、4-CH₃-ピペラジン-1-イル、OCOCH(CH₃)₂、OCO(シクロペンチル)、-COCH₃、必要に応じて置換されたフェノキシ、または必要に応じて置換されたベンジルオキシである、

化合物。

【請求項 1 2 2】

請求項10_3に記載の化合物であって、ここで：

yが0であり、そしてR^{5a}がFであるか；

yが0であり、qが1であり、そしてR^{5a}がOR'であるか；

yが0であり、qが1であり、そしてR^{5a}がOHであるか；

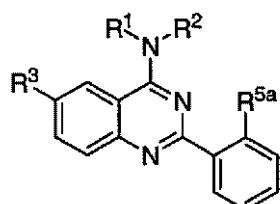
yが1であり、R^{5a}がOR'であり、そしてR⁵がFであり、ここで、OR'が前記フェニル環の2位において置換され、そしてFが該フェニル環の6位において置換されるか；または

yが1であり、R^{5a}がOHであり、そしてR⁵がFであり、ここで、OHが、該フェニル環の2位において置換され、そしてFが該フェニル環の6位において置換される、化合物。

【請求項 1 2 3】

請求項10_3に記載の化合物であって、ここで、R³が、前記キナゾリン環の6位において置換され、qが1であり、そしてyが0であり、そして化合物が式III：

【化 2 4】



III

を有する、化合物。

【請求項 1 2 4】

請求項12_3に記載の化合物であって、ここで：

a) ここで、R¹およびR²が、各々独立して、C₁～₆脂肪族、Cy¹であり、ここで、Cy¹は、窒素、酸素、もしくは硫黄より独立して選択される0個～3個のヘテロ原子を有する、5員～7員の单環式アリール環もしくは8員～10員の二環式アリール環であるか、または、窒素、酸素、もしくは硫黄より独立して選択される0個～3個のヘテロ原子を有する、3員～12員の飽和または部分的に不飽和な单環式環であって、ここで、Cy¹は、前記窒素原子に直接的に結合されるか、または、必要に応じて置換されたC₁～₄脂肪族基を通して結合されるかであり、ここで、該C₁～₄脂肪族基における1以上のメチレン単位が、-NR-、-O-、-COO-、-OCO-、-NRCO-、-CON

R^- 、 $-SO_2NR^-$ 、もしくは $-NRSO_2^-$ で必要に応じて置換され；ここで、 R^1 および R^2 が、必要に応じてかつ独立して、1個以上の置換可能な炭素原子、窒素原子、もしくは硫黄原子において、 $-R^4$ のz個の独立した存在で置換され、ここで、zが0～5であり；

b) ここで、zが0～5であり、そして R^4 基が、各々独立して、Cl、Br、F、CF₃、CH₃、-CH₂CH₃、CN、-COOH、-N(CH₃)₂、-N(Et)₂、-N(ipr)₂、-O(CH₂)₂OCH₃、-CONH₂、-COOCH₃、-OH、-CH₂OH、-NHCOCH₃、-SO₂NH₂、-SO₂(CH₂)₃CH₃、-SO₂CH(CH₃)₂、-SO₂N(CH₃)₂、-SO₂CH₂CH₃、-C(O)OCH₂CH(CH₃)₂、-C(O)NHCH₂CH(CH₃)₂、-NHCOOC_H₃、-C(O)C(CH₃)₃、-COO(CH₂)₂CH₃、-C(O)NHC_H(CH₃)₂、-C(O)CH₂CH₃、または、必要に応じて置換された基であって、該基が、-ピペリジニル(piperidinyl)、ピペリジニル(piperiziny1)、モルホリノ、C₁～₄アルコキシ、フェニル、フェニルオキシ、ベンジル、ベンジルオキシ、-CH₂シクロヘキシル、ピリジル、-CH₂ピリジル、もしくは-CH₂チアゾリルより選択される基であり；

c) R³が、Cl、Br、F、CF₃、-OCF₃、Me、Et、CN、-COOH、-NH₂、-N(CH₃)₂、-N(Et)₂、-N(ipr)₂、-O(CH₂)₂OCH₃、-CONH₂、-COOCH₃、-OH、-OCH₃、-OCH₂CH₃、-CH₂OH、-NHCOCH₃、-NHCOCH(CH₃)₂、-SO₂NH₂、-CONH(シクロプロピル)、-CONHCH₃、-C(O)NHC_HCH₃、または、必要に応じて置換された基であって、該基が、-ピペリジニル(piperidinyl)、ピペリジニル(piperiziny1)、モルホリノ、フェニル、フェニルオキシ、ベンジル、ベンジルオキシより選択され；そして

d) R⁵^aが、Cl、F、CF₃、Me、Et、-OH、-OCH₃、-OCH₂CH₃、-CH₂OH、-SO₂NH₂、-SO₂NHC(CH₃)₂、-OCOC(CH₃)₃、-OCOCH₂C(CH₃)₃、-O(CH₂)₂N(CH₃)₂、4-CH₃-ピペラジン-1-イル、OCOCH(CH₃)₂、OCO(シクロペンチル)、または-COCH₃である、

化合物。

【請求項125】

請求項123に記載の化合物であって、ここで、R³が、-Cl、-CH₃、-CH₂CH₃、-F、-CF₃、-OCF₃、-CONHCH₃、-CONHCH₂CH₃、-CONH(シクロプロピル)、-OCH₃、-NH₂、-OCH₂CH₃、または-CNである、

化合物。

【請求項126】

請求項123に記載の化合物であって、ここで、R³が、-Cl、-CH₃、-CH₂CH₃、-F、-CF₃、-OCF₃、-OCH₃、または-OCH₂CH₃である、化合物。

【請求項127】

請求項123に記載の化合物であって、ここで、R³が、-CON(R')₂またはNRCOR'である、

化合物。

【請求項128】

請求項123に記載の化合物であって、ここで、R⁵^aが、Cl、F、CF₃、Me、Et、-OH、-OCH₃、-OCH₂CH₃である、

化合物。

【請求項129】

請求項123に記載の化合物であって、ここで：

R^5^a が F であるか ;
 R^5^a が OR' であるか ; または
 R^5^a が OH である、

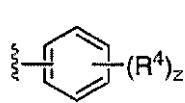
化合物。

【請求項 1 3 0】

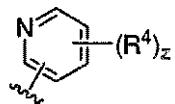
請求項 1 2 3 に記載の化合物であって、ここで：

a) Cy¹ が、以下：

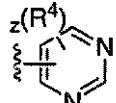
【化 2 5】



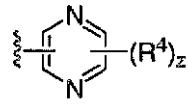
a



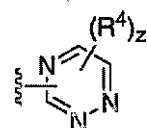
b



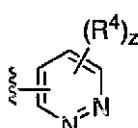
c



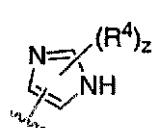
d



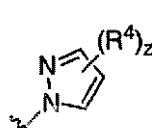
e



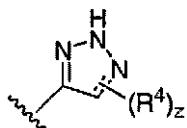
f



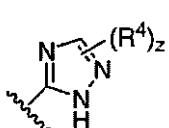
g



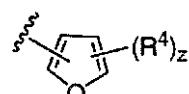
h



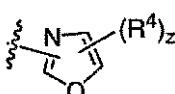
i



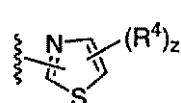
j



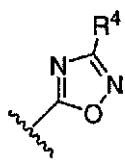
k



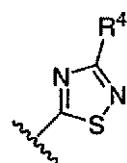
l



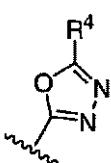
m



n

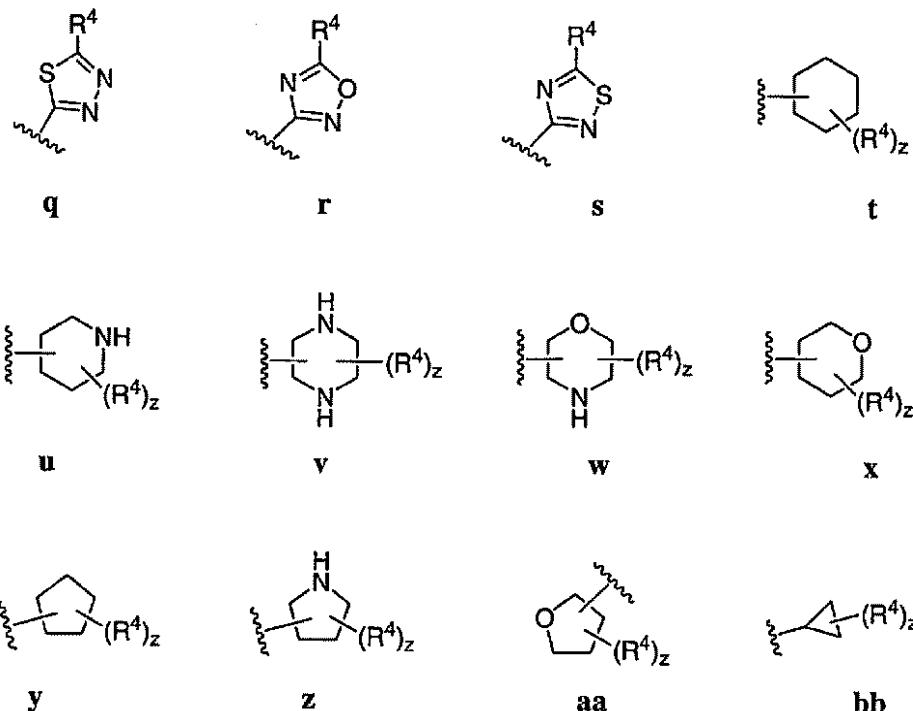


o



p

【化26】



であるか、または、 R^1 および R^2 が、各々独立して、必要に応じて置換された $C_{1 \sim 4}$ 脂肪族基であり、そして各々独立して、必要に応じて置換されたメチル、エチル、シクロプロピル、 n -プロピル、プロペニル、シクロプロチル、 $(CO)OCH_2CH_3$ 、 $(CH_2)_2OCH_3$ 、 $CH_2CO)OCH_2CH_3$ 、 $CH_2(CO)OCH_3$ 、 $CH(CCH_3)CH_2CH_3$ 、もしくは n -ブチルであり；

b) z が $0 \sim 5$ であり、そして R^4 基が、各々独立して、Cl、Br、F、CF₃、CH₃、-CH₂CH₃、CN、-COOH、-N(CH₃)₂、-N(Et)₂、-N(ipr)₂、-O(CH₂)₂OCH₃、-CONH₂、-COOCH₃、-OH、-CH₂OH、-NHCOCH₃、-SO₂NH₂、-SO₂(CH₂)₃CH₃、-SO₂CH(CH₃)₂、-SO₂N(CH₃)₂、-SO₂CH₂CH₃、-C(O)OCH₂CH(CH₃)₂、-C(O)NHCH₂CH(CH₃)₂、-NHCOOCH₃、-C(O)C(CH₃)₃、-COO(CH₂)₂CH₃、-C(O)NHCH(CH₃)₂、-C(O)CH₂CH₃、または、必要に応じて置換された基であって、該基が、-ピペリジニル(piperidinyl)、ピペリジニル(piperizinyl)、モルホリノ、 $C_{1 \sim 4}$ アルコキシ、フェニル、フェニルオキシ、ベンジル、ベンジルオキシ、-CH₂シクロヘキシリル、ピリジル、-CH₂ピリジル、もしくは-CH₂チアゾリルより選択され；

c) R^3 が、Cl、Br、F、CF₃、-OCF₃、Me、Et、CN、-COOH、-NH₂、-N(CH₃)₂、-N(Et)₂、-N(ipr)₂、-O(CH₂)₂OCH₃、-CONH₂、-COOCH₃、-OH、-OCH₃、-OCH₂CH₃、-CH₂OH、-NHCOCH₃、-NHCOCH(CH₃)₂、-SO₂NH₂、-CONH(シクロプロピル)、-CONHCH₃、-CONHCH₂CH₃、または、必要に応じて置換された基であって、該基が、-ピペリジニル(piperidinyl)、ピペリジニル(piperizinyl)、モルホリノ、フェニル、フェニルオキシ、ベンジル、もしくはベンジルオキシより選択され；そして

d) R^5 ^a が、Cl、F、CF₃、Me、Et、-OH、-OCH₃、-OCH₂CH₃、-CH₂OH、-SO₂NH₂、-SO₂NHC(CH₃)₂、-OCOC(CH₃)₃、-OCOCH₂C(CH₃)₃、-O(CH₂)₂N(CH₃)₂、4-CH₃-ピペラジン-1-イル、OCOCH(CH₃)₂、OCO(シクロペンチル)、または-

COCH_3 である、
化合物。

【請求項 1 3 1】

請求項 1 2 3 に記載の化合物であって、ここで、 R^3 が、 - Cl、 - CH_3 、 - CH_2 CH_3 、 - F、 - CF_3 、 - OCF_3 、 - CONHCH_3 、 - $\text{CONHCH}_2\text{CH}_3$ 、 - CONH (シクロプロピル)、 - OCH_3 、 - NH_2 、 - OCH_2CH_3 、または - CN である、

化合物。

【請求項 1 3 2】

請求項 1 2 3 に記載の化合物であって、ここで、 R^3 が、 - Cl、 - CH_3 、 - CH_2 CH_3 、 - F、 - CF_3 、 - OCF_3 、 - OCH_3 、または - OCH_2CH_3 である、
化合物。

【請求項 1 3 3】

請求項 1 2 3 に記載の化合物であって、ここで、 R^3 が、 - $\text{CON}(R')$ ₂、または NRCOR' である、
化合物。

【請求項 1 3 4】

請求項 1 2 3 に記載の化合物であって、ここで、 R^{5a} が、 Cl、 F、 CF_3 、 Me、 Et、 - OH、 - OCH_3 、 - OCH_2CH_3 である、
化合物。

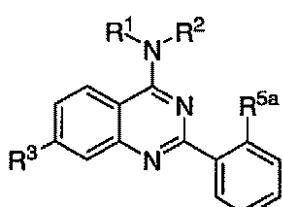
【請求項 1 3 5】

請求項 1 2 3 に記載の化合物であって、ここで、
 R^{5a} が F であるか；
 R^{5a} が OR' であるか；または
 R^{5a} が OH である、
化合物。

【請求項 1 3 6】

請求項 1 0 3 に記載の化合物であって、ここで、 R^3 が、前記キナゾリン環の 7 位において置換され、q が 1 であり、そして y が 0 であり、そして化合物が、式 IV：

【化 2 7】



IV

を有する、
化合物。

【請求項 1 3 7】

請求項 1 3 6 に記載の化合物であって、ここで：
a) ここで、 R^1 および R^2 が、各々独立して、C₁ ~ 6 脂肪族、C_y¹ より選択される、必要に応じて置換される基であり、ここで、C_y¹ は、窒素、酸素、もしくは硫黄より独立して選択される 0 個 ~ 3 個のヘテロ原子を有する、5 員 ~ 7 員の单環式アリール環もしくは 8 員 ~ 10 員の二環式アリール環であるか、または、窒素、酸素、もしくは硫黄より独立して選択される 0 個 ~ 3 個のヘテロ原子を有する、3 員 ~ 12 員の飽和または部分的に不飽和な单環式環であって、ここで、C_y¹ は、前記窒素原子に直接的に結合されるか、または、必要に応じて置換された C₁ ~ 4 脂肪族基を通して結合されるかであり、ここで、該 C₁ ~ 4 脂肪族基における 1 以上のメチレン単位が、 - NR - 、 - O - 、 - C

O_2 、 $-\text{OCO}-$ 、 $-\text{NRCO}-$ 、 $-\text{CONR}-$ 、 $-\text{SO}_2\text{NR}-$ 、もしくは $-\text{NRSO}_2$ で必要に応じて置換され；ここで、 R^1 および R^2 が、各々必要に応じてかつ独立して、1個以上の置換可能な炭素原子、窒素原子、もしくは硫黄原子において、 $-\text{R}^4$ の z 個の独立した存在で置換され、ここで、 z が0～5であり；

b) z が0～5であり、そして R^4 基が、各々独立して、Cl、Br、F、CF₃、CH₃、-CH₂CH₃、CN、-COOH、-N(CH₃)₂、-N(Et)₂、-N(iPr)₂、-O(CH₂)₂OCH₃、-CONH₂、-COOCH₃、-OH、-CH₂OH、-NHCOCH₃、-SO₂NH₂、-SO₂(CH₂)₃CH₃、-SO₂CH(CH₃)₂、-SO₂N(CH₃)₂、-SO₂CH₂CH₃、-C(O)OCH₂CH(CH₃)₂、-C(O)NHCH₂CH(CH₃)₂、-NHCOOCH₃、-C(O)C(CH₃)₃、-COO(CH₂)₂CH₃、-C(O)NHC(H₃)₂、-C(O)CH₂CH₃、または、必要に応じて置換された基であって、該基が、-ピペリジニル(piperidinyl)、ピペリジニル(piperizinyl)、モルホリノ、C₁～₄アルコキシ、フェニル、フェニルオキシ、ベンジル、ベンジルオキシ、-CH₂シクロヘキシリル、ピリジル、-CH₂ピリジル、もしくは-CH₂チアゾリルより選択され；

c) R³が、Cl、Br、F、CF₃、-OCF₃、Me、Et、CN、-COOH、-NH₂、-N(CH₃)₂、-N(Et)₂、-N(iPr)₂、-O(CH₂)₂OCH₃、-CONH₂、-COOCH₃、-OH、-OCH₃、-OCH₂CH₃、-CH₂OH、-NHCOCH₃、-NHCOCH(CH₃)₂、-SO₂NH₂、-CONH(シクロプロピル)、-CONHC(H₃)₂、-CONHCH₂CH₃、または、必要に応じて置換された基であって、該基が、-ピペリジニル(piperidinyl)、ピペリジニル(piperizinyl)、モルホリノ、フェニル、フェニルオキシ、ベンジル、もしくはベンジルオキシより選択され；そして、

d) R⁵^aが、Cl、F、CF₃、Me、Et、-OH、-OCH₃、-OCH₂CH₃、-CH₂OH、-SO₂NH₂、-SO₂NHC(H₃)₂、-OCOC(CH₃)₃、-OCOCH₂C(CH₃)₃、-O(CH₂)₂N(CH₃)₂、4-CH₃-ピペラジン-1-イル、OCOCH(CH₃)₂、OCO(シクロペンチル)、または-OCCH₃である、

化合物。

【請求項138】

請求項13_6に記載の化合物であって、ここで、R³が、-Cl、-CH₃、-CH₂CH₃、-F、-CF₃、-OCF₃、-CONHCH₃、-CONHCH₂CH₃、-CONH(シクロプロピル)、-OCH₃、-NH₂、-OCH₂CH₃、または-CNである、

化合物。

【請求項139】

請求項13_6に記載の化合物であって、ここで、R³が、-Cl、-CH₃、-CH₂CH₃、-F、-CF₃、-OCF₃、-OCH₃、または-OCH₂CH₃である、

化合物。

【請求項140】

請求項13_6に記載の化合物であって、ここで、R³が、-CON(R')₂またはNRCOR'である、

化合物。

【請求項141】

請求項13_6に記載の化合物であって、ここで、R⁵^aが、Cl、F、CF₃、Me、Et、-OH、-OCH₃、-OCH₂CH₃である、

化合物。

【請求項142】

請求項13_6に記載の化合物であって、ここで：

R^5^a が F であるか ;
 R^5^a が O R' であるか ; または
 R^5^a が OH である、

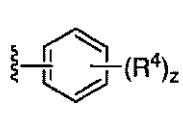
化合物。

【請求項 1 4 3】

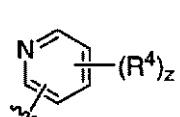
請求項 1 3 6 に記載の化合物であって、ここで：

a) Cy¹ が、以下：

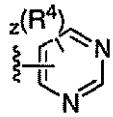
【化 2 8】



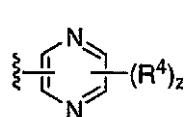
a



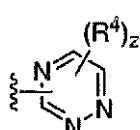
b



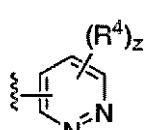
c



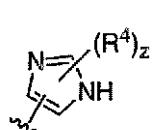
d



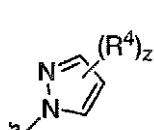
e



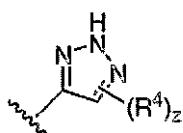
f



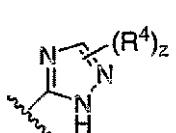
g



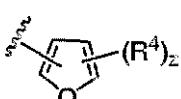
h



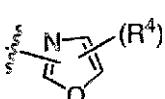
i



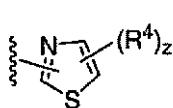
j



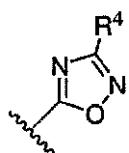
k



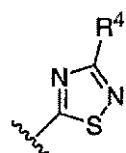
l



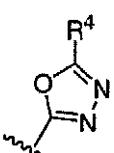
m



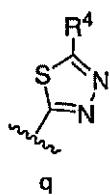
n



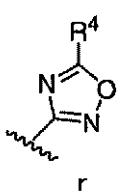
o



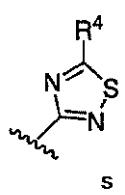
p



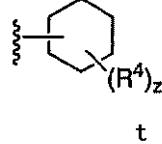
q



r

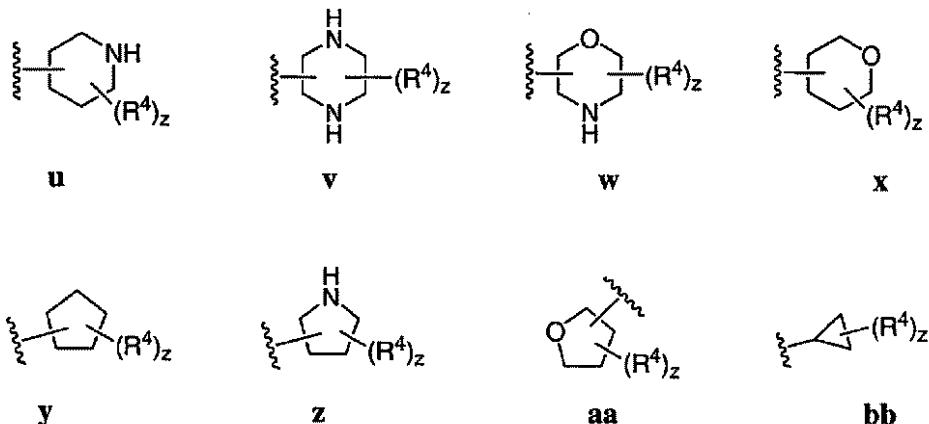


s



t

【化29】



であるか、または、 R^1 および R^2 は、各々独立して、必要に応じて置換された $C_1 \sim 4$ 脂肪族基であり、そして必要に応じて置換されたメチル、エチル、シクロプロピル、 n -プロピル、プロペニル、シクロブチル、 $(CO)OCH_2CH_3$ 、 $(CH_2)_2OCH_3$ 、 $CH_2CO)OCH_2CH_3$ 、 $CH_2(CO)OCH_3$ 、 $CH(CH_3)CH_2CH_3$ 、もしくは n -ブチルより各々独立して選択され；

b) z が $0 \sim 5$ であり、そして R^4 基が、各々独立して、Cl、Br、F、 CF_3 、 CH_3 、 $-CH_2CH_3$ 、CN、 $-COOH$ 、 $-N(CH_3)_2$ 、 $-N(Et)_2$ 、 $-N(ipr)_2$ 、 $-O(CH_2)_2OCH_3$ 、 $-CONH_2$ 、 $-COOCH_3$ 、 $-OH$ 、 $-CH_2OH$ 、 $-NHCOCH_3$ 、 $-SO_2NH_2$ 、 $-SO_2(CH_2)_3CH_3$ 、 $-SO_2CH(CH_3)_2$ 、 $-SO_2N(CH_3)_2$ 、 $-SO_2CH_2CH_3$ 、 $-C(O)OCH_2CH(CH_3)_2$ 、 $-C(O)NHCH_2CH(CH_3)_2$ 、 $-NHCOOCH_3$ 、 $-C(O)C(CH_3)_3$ 、 $-COO(CH_2)_2CH_3$ 、 $-C(O)NHCH(CH_3)_2$ 、 $-C(O)CH_2CH_3$ 、または、-ピペリジニル(piperidinyl)、ピペリジニル(piperizinyl)、モルホリノ、 $C_1 \sim 4$ アルコキシ、フェニル、フェニルオキシ、ベンジル、ベンジルオキシ、 $-CH_2$ シクロヘキシリル、ピリジル、 $-CH_2$ ピリジル、もしくは $-CH_2$ チアゾリルより選択される、必要に応じて置換された基であり；

c) R^3 が、Cl、Br、F、 CF_3 、 Me 、Et、CN、 $-COOH$ 、 $-NH_2$ 、 $-N(CH_3)_2$ 、 $-N(Et)_2$ 、 $-N(ipr)_2$ 、 $-O(CH_2)_2OCH_3$ 、 $-CONH_2$ 、 $-COOCH_3$ 、 $-OH$ 、 $-OCH_3$ 、 $-OCH_2CH_3$ 、 $-CH_2OH$ 、 $-NHCOCH_3$ 、 $-NHCOCH(CH_3)_2$ 、 $-SO_2NH_2$ 、 $-CONH$ (シクロプロピル)、 $-CONHCH_3$ 、 $-CONHCH_2CH_3$ 、または、必要に応じて置換された基であり、該基が、-ピペリジニル(piperidinyl)、ピペリジニル(piperizinyl)、モルホリノ、フェニル、フェニルオキシ、ベンジル、もしくはベンジルオキシより選択され；そして

d) R^5 ^a が、Cl、F、 CF_3 、 Me 、Et、 $-OH$ 、 $-OCH_3$ 、 $-OCH_2CH_3$ 、 $-CH_2OH$ 、 $-SO_2NH_2$ 、 $-SO_2NHC(CH_3)_2$ 、 $-OCOC(CH_3)_3$ 、 $-OCOCH_2C(CH_3)_3$ 、 $-O(CH_2)_2N(CH_3)_2$ 、 $4-CH_3$ -ピペラジン-1-イル、 $OCOCH(CH_3)_2$ 、 OCO (シクロペンチル)、または $-COCH_3$ である、

化合物。

【請求項144】

請求項136に記載の化合物であって、ここで、 R^3 が、 $-Cl$ 、 $-CH_3$ 、 $-CH_2CH_3$ 、 $-F$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-CONHCH_3$ 、 $-CONHCH_2CH_3$ 、 $-$

C O N H (シクロプロピル)、-O C H₃、-N H₂、-O C H₂ C H₃、または-C Nである、化合物。

【請求項 1 4 5】

請求項 1 3 6に記載の化合物であって、ここで、R³が、-C l、-C H₃、-C H₂ C H₃、-F、-C F₃、-O C F₃、-O C H₃、または-O C H₂ C H₃である、化合物。

【請求項 1 4 6】

請求項 1 3 6に記載の化合物であって、ここで、R³が、-C O N (R')₂、またはN R C O R'である、化合物。

【請求項 1 4 7】

請求項 1 3 6に記載の化合物であって、ここで、R^{5a}が、C l、F、C F₃、M e、E t、-O H、-O C H₃、-O C H₂ C H₃である、化合物。

【請求項 1 4 8】

請求項 1 3 6に記載の化合物であって、ここで：

R^{5a}がFであるか；

R^{5a}がO R'であるか；または

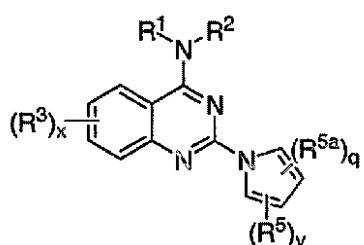
R^{5a}がO Hである、

化合物。

【請求項 1 4 9】

式Vの化合物：

【化 3 0】



V

であって、ここで、R¹およびR²が、各々独立して、C₁~₆脂肪族、C y¹より選択される、必要に応じて置換される基であり、ここで、C y¹は、窒素、酸素、もしくは硫黄より独立して選択される0個~3個のヘテロ原子を有する、5員~7員の単環式アリール環もしくは8員~10員の二環式アリール環であるか、または、窒素、酸素、もしくは硫黄より独立して選択される0個~3個のヘテロ原子を有する、3員~12員の飽和または部分的に不飽和な単環式環であって、ここで、C y¹は、該窒素原子に直接的に結合されるか、または、必要に応じて置換されたC₁~₄脂肪族基を通して結合されるかであり、ここで、該C₁~₄脂肪族基における1以上のメチレン単位が、-N R-、-O-、-C O O、-O C O-、-N R C O-、-C O N R-、-S O₂ N R-、もしくは-N R S O₂-で必要に応じて置換されるか；または、R¹およびR²が、これらが結合する該窒素原子と一緒にになって、必要に応じて置換された3員~12員の単環式または二環式の飽和または部分的に不飽和な環を形成し、該環は、窒素、硫黄、または酸素より独立して選択される0個~3個のさらなるヘテロ原子を有し；ここで、R₁およびR₂、または、一緒にになったR₁およびR₂により形成される該環、1個以上の置換可能な炭素原子、窒素原子、または硫黄原子において、-R⁴のz個の独立した存在で各々必要に応じてかつ独立して置換され、ここで、zは0~5であり；

xは0~4であり；

y は 0 ~ 2 であり；

R^3 、 R^4 、および R^5 の各存在は、独立して $Q - R^X$ であり；ここで、 Q は、結合であるか、または $C_1 \sim C_6$ アルキリデン鎖であり、ここで、 Q の 2 までの非隣接メチレン単位は、必要に応じてかつ独立して、-NR-、-S-、-O-、-CS-、-CO₂-、-OCO-、-CO-、-COCO-、-CONR-、-NRCO-、-NR₂CO-、-SO₂NR-、-NRSO₂-、-CONRNR-、-NRCONR-、-OCO NR-、-NRNR-、-NRSO₂NR-、-SO-、-SO₂-、-PO-、-PO₂-、-OP(O)(OR)-、または-POR-により置換され；そして R^X の各存在は、-R'、=O、=NR'、ハロゲン、-NO₂、-CN、-OR'、-SR'、-N(R')₂、-NR'COR'、-NR'CON(R')₂、-NR'CO₂R'、-COR'、-CO₂R'、-OCOR'、-CON(R')₂、-OCON(R')₂、-SOR'、-SO₂R'、-SO₂N(R')₂、-NR'SO₂R'、-NR'SO₂N(R')₂、-COCOR'、-COCH₂COR'、-OP(O)(OR')₂、-P(O)(OR')₂、-OP(O)₂OR'、-P(O)₂OR'、-PO(R')₂、または-OPO(R')₂ より独立して選択され；

R^5 ^a は、必要に応じて置換された $C_1 \sim C_6$ 脂肪族基、ハロゲン、-OR'、-SR'、-N(R')₂、-NR'COR'、-NR'CON(R')₂、-NR'CO₂R'、-COR'、-CO₂R'、-OCOR'、-CON(R')₂、-OCON(R')₂、-SOR'、-SO₂R'、-SO₂N(R')₂、-NR'SO₂R'、-NR'SO₂N(R')₂、-COCOR'、-COCH₂COR'、-OP(O)(OR')₂、-P(O)(OR')₂、-OP(O)₂OR'、-P(O)₂OR'、-PO(R')₂、または-OPO(R')₂ であり；そして

R の各存在は、独立して、水素または必要に応じて置換された $C_1 \sim C_6$ 脂肪族基であり；そして R' の各存在は、独立して、水素、または必要に応じて置換された $C_1 \sim C_6$ 脂肪族基、3員～8員の飽和、部分的に不飽和、もしくは完全に不飽和な单環式環であって、該環は、窒素、酸素もしくは硫黄より独立して選択される 0 個～3 個のヘテロ原子を有するか、または、窒素、酸素、もしくは硫黄より独立して選択される 0 個～5 個のヘテロ原子を有する 8 員～12 員の飽和、部分的に不飽和、または完全に不飽和な二環式系であり；または、 R および R' 、2つの R の存在、もしくは 2 つの R' の存在は、これらが結合する該原子と一緒にになって、必要に応じて置換された 3 員～12 員の飽和、部分的に不飽和、または十分に不飽和な单環式環または二環式環を形成し、該環は、窒素、酸素、もしくは硫黄より独立して選択される 0 個～4 個のヘテロ原子を有し；ただし、 X が 1 であり、そして R^3 が 6-OME であり、 R^1 が水素であり、そして y および q が両方 0 である場合、 R^2 は、-CH₂CH₂OCH₂CH₂OH でも、モノメタンスルホン酸塩でもない、化合物。

【請求項 150】

請求項 149 に記載の化合物であって、ここで、

a) R^1 または R^2 の一つが水素であり、 R^1 および R^2 のもう一方が、以下：

i) Cy¹ であって、ここで、Cy¹ は、前記窒素原子に直接的に結合されるか、もしくは、必要に応じて置換された $C_1 \sim C_4$ 脂肪族基を通じて結合され、ここで、該 $C_1 \sim C_4$ 脂肪族基における 1 以上のメチレン単位は、-NR-、-O-、-COO-、-OCO-、-NRCO-、-CONR-、-SO₂NR-、もしくは-NRSO₂-で必要に応じて置換される、Cy¹；または

ii) 必要に応じて置換された $C_1 \sim C_4$ 脂肪族基であって、ここで、該 $C_1 \sim C_4$ 脂肪族基における 1 以上のメチレン単位が、必要に応じて-NR-、-O-、-COO-、-OCO-、-NRCO-、-CONR-、-SO₂NR-、もしくは-NRSO₂-で置換される、 $C_1 \sim C_4$ 脂肪族基より選択されるか；あるいは、

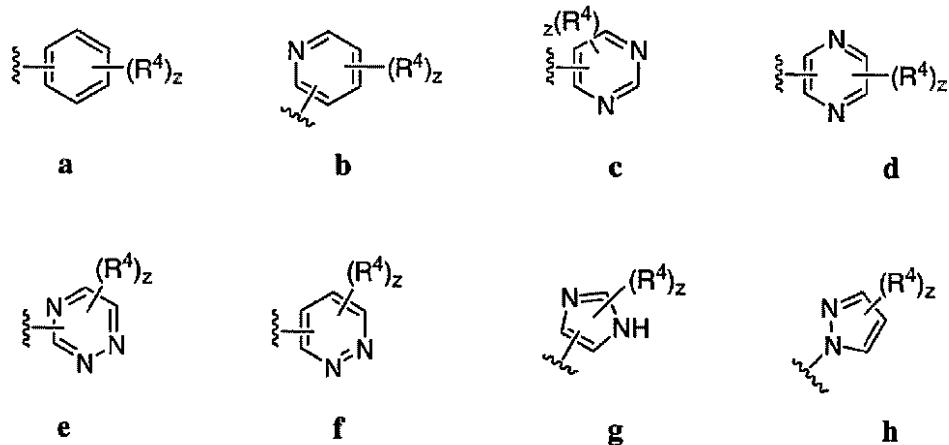
b) R^1 および R^2 は、各々独立して、Cy¹ より選択され、ここで、Cy¹ は、該窒素原子に直接的に結合されるか、または必要に応じて置換された $C_1 \sim C_4$ 脂肪族基を通して結合され、ここで、該 $C_1 \sim C_4$ 脂肪族基における 1 以上のメチレン単位は、必要に応じ

て、-NR-、-O-、-COO-、-OCO-、-NRCO-、-CONR-、-SO₂NR-、もしくは-NRSO₂-で置換されるか；または、必要に応じて置換されたC₁～₄脂肪族基で置換され、ここで、該C₁～₄脂肪族基における1以上のメチレン単位は、必要に応じて、-NR-、-O-、-COO-、-OCO-、-NRCO-、-CONR-、-SO₂NR-、または-NRSO₂により置換される、化合物。

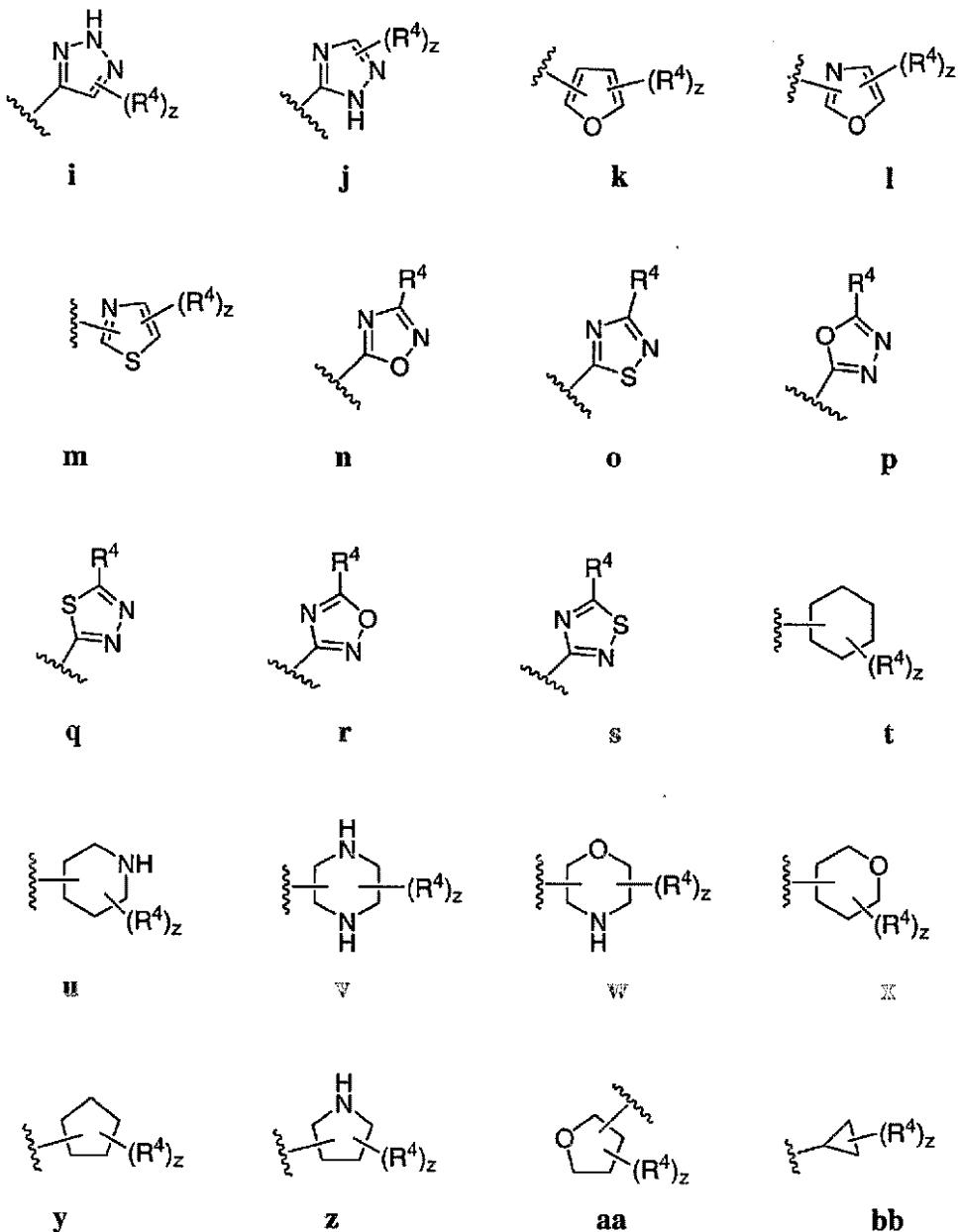
【請求項151】

請求項149に記載の化合物であって、ここで、Cy¹は、以下：

【化31】



【化32】

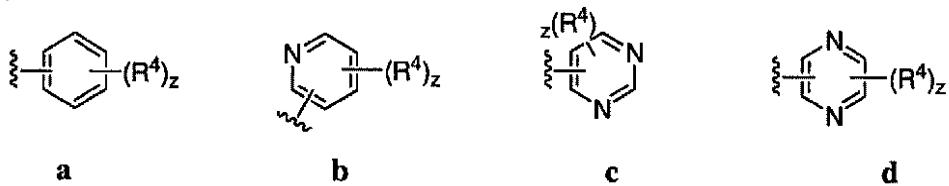


である、化合物。

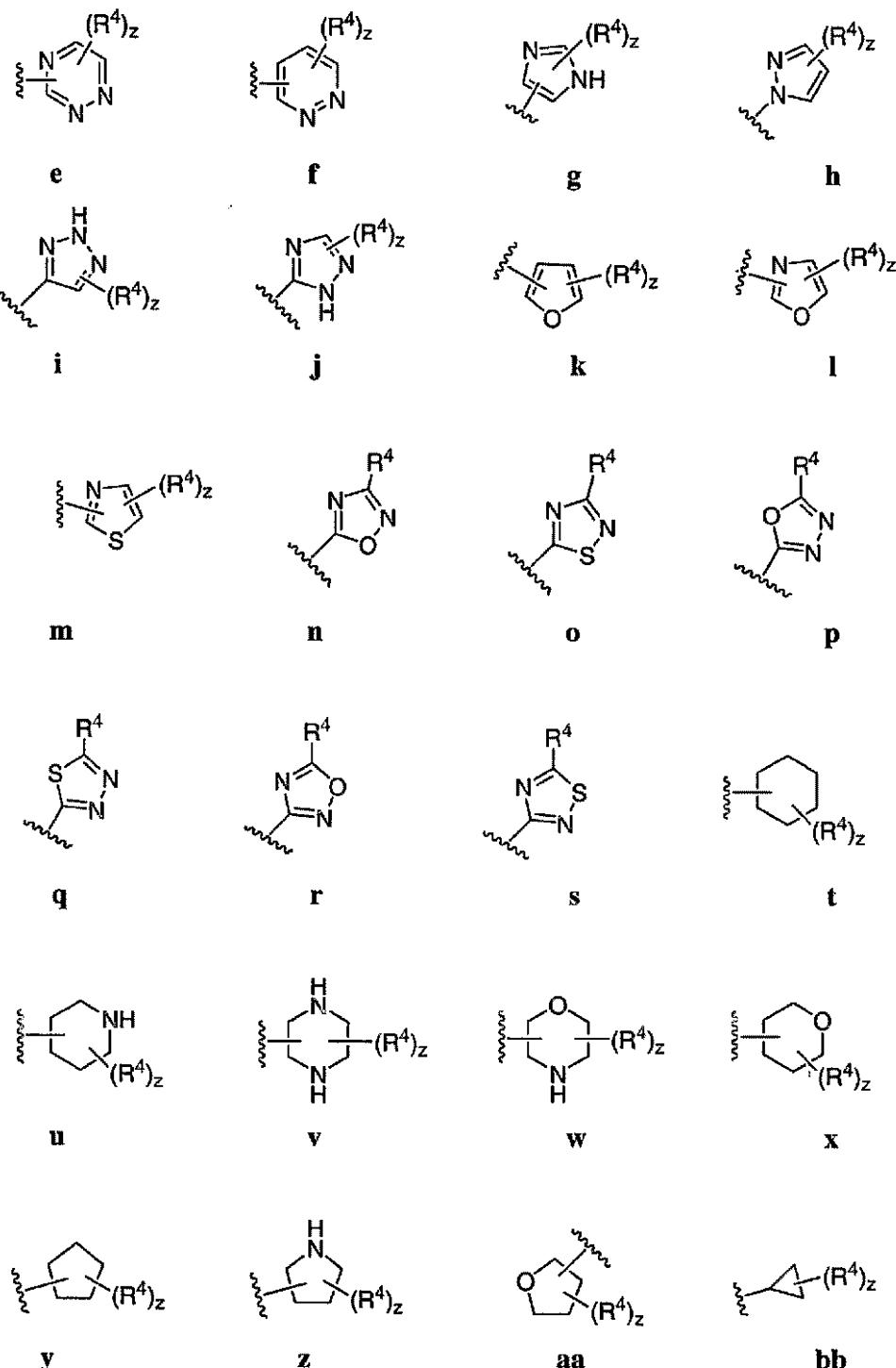
【請求項152】

請求項149に記載の化合物であって、ここで、 R^1 は、水素または必要に応じて置換されたC₁～C₄脂肪族基であり、そして R^2 は、-CH₂R-Cy¹であり、ここで、Rは、水素またはC₁～C₄アルキルであり、かつ、Cy¹は以下：

【化33】



【化34】



である、化合物。

【請求項153】

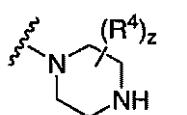
請求項149に記載の化合物であって、ここで、R¹基およびR²基は、各々独立して、必要に応じて置換されたC₁~₄脂肪族基であり、そして、各々独立して、必要に応じて置換されたメチル、エチル、シクロプロピル、n-プロピル、プロペニル、シクロブチル、(CO)OCH₂CH₃、(CH₂)₂OCH₃、CH₂CO)OCH₂CH₃、CH₂(CO)OCH₃、CH(CH₃)CH₂CH₃、またはn-ブチルより選択される化合物。

【請求項154】

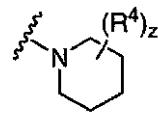
請求項149に記載の化合物であって、ここで、R¹およびR²は、これらが結合する

前記窒素原子と一緒にになって、必要に応じて置換された3員～12員のヘテロシクリル環を形成し、該環が、窒素または酸素より独立して選択された1個～3個のヘテロ原子を有し、そして、以下：

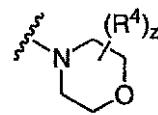
【化35】



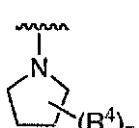
cc



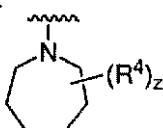
dd



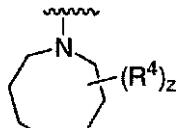
ee



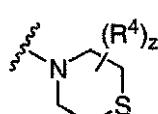
ff



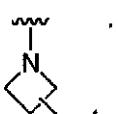
gg



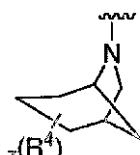
hh



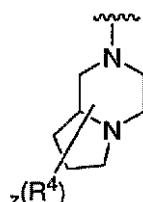
ii



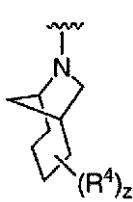
jj



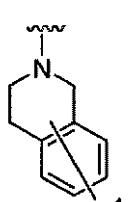
kk



ll



mm



nn



oo

より選択される3員～12員のヘテロシクリル基を形成し、ここで、一緒にになったR¹およびR²により形成される該環は、一個以上の適切な炭素原子、窒素原子、または硫黄原子において、-R⁴のz個の独立した存在で必要に応じて置換され、かつ、zが0～5である、化合物。

【請求項155】

請求項149に記載の化合物であって、ここで、一緒にになったR¹およびR²が、ピロリジン-1-イル(f f)、ピペリジン-1-イル(d d)、ピペラジン-1-イル(c c)、またはモルホリン-4-イル(e e)より選択される必要に応じて置換された環である、化合物。

【請求項156】

請求項149に記載の化合物であって、ここで、一緒にになったR¹およびR²が、ピロリジン-1-イル(f f)、ピペリジン-1-イル(d d)、またはピペラジン-1-イル(c c)より選択される必要に応じて置換された環である、化合物。

【請求項157】

請求項149に記載の化合物であって、ここで、zが0～5であり、そしてR⁴基が、存在する場合、各々独立して、ハロゲン、CN、NO₂、-N(R')₂、-CH₂N(R')₂、-OR'、-CH₂OR'、-SR'、-CH₂SR'、-COOR'、-NRCOR'、-CON(R')₂、-OCON(R')₂、COR'、-NHCOOR'、-SO₂R'、-SO₂N(R')₂、または、C₁～C₆脂肪族、アリール、ヘテロ

アリール、シクロ脂肪族、ヘテロシクロ脂肪族、アリールC₁～C₆アルキル、ヘテロアリールC₁～C₆アルキル、シクロ脂肪族C₁～C₆アルキル、もしくはヘテロシクロ脂肪族C₁～C₆アルキルより選択される必要に応じて置換された基である、化合物。

【請求項158】

請求項14_9に記載の化合物であって、ここで、zが0～5であり、そしてR⁴基が、各々独立して、C1、Br、F、CF₃、CH₃、-CH₂CH₃、CN、-COOH、-N(CH₃)₂、-N(Et)₂、-N(iPr)₂、-O(CH₂)₂OCH₃、-CONH₂、-COOCH₃、-OH、-CH₂OH、-NHCOCH₃、-SO₂NH₂、-SO₂(CH₂)₃CH₃、-SO₂CH(CH₃)₂、-SO₂N(CH₃)₂、-SO₂CH₂CH₃、-C(O)OCH₂CH(CH₃)₂、-C(O)NHCH₂CH(CH₃)₂、-NHCOOCH₃、-C(O)C(CH₃)₃、-COO(CH₂)₂CH₃、-C(O)NHCH(CH₃)₂、-C(O)CH₂CH₃、または、必要に応じて置換された基であって、該基が、-ピペリジニル(piperidinyl)、ピペリジニル(piperazineyl)、モルホリノ、C₁～₄アルコキシ、フェニル、フェニルオキシ、ベンジル、ベンジルオキシ、-CH₂シクロヘキシリル、ピリジル、-CH₂ピリジル、もしくは-CH₂チアゾリルより選択される、化合物。

【請求項159】

請求項14_9に記載の化合物であって、ここで、xが0～4であり、そして、R³基が、存在する場合、各々独立して、ハロゲン、CN、NO₂、-N(R')₂、-CH₂N(R')₂、-OR'、-CH₂OR'、-SR'、-CH₂SR'、-COOR'、-NRCOR'、-CON(R')₂、-OCON(R')₂、COR'、-NHCOOR'、-SO₂R'、-SO₂N(R')₂、または、C₁～C₆脂肪族、アリール、ヘテロアリール、シクロ脂肪族、ヘテロシクロ脂肪族、アリールC₁～C₆アルキル、ヘテロアリールC₁～C₆アルキル、シクロ脂肪族C₁～C₆アルキル、もしくはヘテロシクロ脂肪族C₁～C₆アルキルより選択される必要に応じて置換された基である、化合物。

【請求項160】

請求項14_9に記載の化合物であって、ここで、R¹およびR²が、一緒になって、以下：

a) zが1もしくは2であり、そして少なくとも1個のR⁴の存在が、-NRSO₂R'、-NRCOO'R'、または-NRCOR'である、必要に応じて置換されたアゼチジン-1-イル(jj)；

b) zが1であり、そしてR⁴が、-NRSO₂R'である、必要に応じて置換されたアゼチジン-1-イル(jj)；

c) zが1であり、そしてR⁴が、-NRCOO'R'である、必要に応じて置換されたアゼチジン-1-イル(jj)；

d) zが1であり、そしてR⁴が、-NRCOR'である、必要に応じて置換されたアゼチジン-1-イル(jj)；

e) zが1もしくは2であり、そしてR⁴が、C1、Br、F、CF₃、CH₃、-CH₂CH₃、-OR'もしくは-CH₂OR'である、必要に応じて置換されたピロリジン-1-イル(ff)；

f) zが1または2であり、そして少なくとも1個のR₄の存在が、C1、Br、F、CF₃、CH₃、-CH₂CH₃、-OR'、もしくは-CH₂OR'、-NRSO₂R'、-NRCOO'R'、または-OCON(R')₂である、必要に応じて置換されたピペリジン-1-イル(dd)；

g) zが1であり、そしてR₄がF、CF₃、CH₃、-CH₂CH₃、-OR'もしくは-CH₂OR'である、必要に応じて置換されたピペリジン-1-イル(dd)；

h) zが1であり、そしてR₄が、-NRSO₂R'である、必要に応じて置換されたピペリジン-1-イル(dd)；

i) zが1であり、そしてR₄が、-NRCOO'R'である、必要に応じて置換されたピペリジン-1-イル(dd)；

j) z が 1 または 2 であり、そして少なくとも 1 個の R⁴ の存在が、-S O R'、-C O N(R')₂、-S O₂ N(R')₂、-C O R'、もしくは-C O O R' である、必要に応じて置換されるピペラジン-1-イル(c c)；

k) z が 1 であり、そして R⁴ が、-S O R' である、必要に応じて置換されるピペラジン-1-イル(c c)；

l) z が 1 であり、そして R⁴ が、-C O O R' である、必要に応じて置換されるピペラジン-1-イル(c c)；

m) z が 1 であり、そして R⁴ が、-C O N(R')₂ である、必要に応じて置換されるピペラジン-1-イル(c c)；

n) z が 1 であり、そして R⁴ が、-S O₂ N(R')₂ である、必要に応じて置換されるピペラジン-1-イル(c c)；あるいは、

o) z が 1 であり、そして R⁴ が、-C O R' である、必要に応じて置換されるピペラジン-1-イル(c c)、

より選択される、化合物。

【請求項 161】

請求項 14_9 に記載の化合物であって、ここで、x は 1 または 2 であり、そして、R³ の各存在は、独立して、C l、B r、F、C F₃、-O C F₃、M e、E t、C N、-C O O H、-N H₂、-N(C H₃)₂、-N(E t)₂、-N(i P r)₂、-O(C H₂)₂O C H₃、-C O N H₂、-C O O C H₃、-O H、-O C H₃、-O C H₂C H₃、-C H₂O H、-N H C O C H₃、-N H C O C H(C H₃)₂、-S O₂N H₂、-C O N H(シクロプロピル)、-C O N H C H₃、-C O N H C H₂C H₃、または、-ピペリジニル(p i p e r i d i n y l)、ピペリジニル(p i p e r i z i n y l)、モルホリノ、フェニル、フェニルオキシ、ベンジル、もしくはベンジルオキシより選択される必要に応じて置換された基である、化合物。

【請求項 162】

請求項 14_9 に記載の化合物であって、ここで、x は 1 または 2 であり、そして各 R³ 基は、独立して、ハロゲン、C N、必要に応じて置換されたC₁ ~ C₆ アルキル、O R'、N(R')₂、C O N(R')₂、またはN R C O R' である、化合物。

【請求項 163】

請求項 14_9 に記載の化合物であって、ここで、x は 1 または 2 であり、そして各 R³ 基は、-C l、-C H₃、-C H₂C H₃、-F、-C F₃、-O C F₃、-C O N H C H₃、-C O N H C H₂C H₃、-C O N H(シクロプロピル)、-O C H₃、-N H₂、-O C H₂C H₃、または-C N である、化合物。

【請求項 164】

請求項 14_9 に記載の化合物であって、ここで、x は 1 であり、そして、R³ は、前記キナゾリン環の 6 位に存在し、そして、-C l、-C H₃、-C H₂C H₃、-F、-C F₃、-O C F₃、-C O N H C H₃、-C O N H C H₂C H₃、-C O N H(シクロプロピル)、-O C H₃、-N H₂、-O C H₂C H₃、または-C N である、化合物。

【請求項 165】

請求項 14_9 に記載の化合物であって、ここで、x は 1 であり、そして、R³ は、前記キナゾリン環の 7 位に存在し、そして、-C l、-C H₃、-C H₂C H₃、-F、-C F₃、-O C F₃、-C O N H C H₃、-C O N H C H₂C H₃、-C O N H(シクロプロピル)、-O C H₃、-N H₂、-O C H₂C H₃、または-C N である、化合物。

【請求項 166】

請求項 14_9 に記載の化合物であって、ここで、x は 1 であり、そして、R³ は、前記キナゾリン環の 6 位に存在し、そして、-C l、-C H₃、-C H₂C H₃、-F、-C F₃、-O C F₃、-O C H₃、または-O C H₂C H₃ である、化合物。

【請求項 167】

請求項 14_9 に記載の化合物であって、ここで、x は 1 であり、そして、R³ は、前記キナゾリン環の 7 位に存在し、そして、-C l、-C H₃、-C H₂C H₃、-F、-C

F_3 、 $-OCF_3$ 、 $-OCH_3$ 、または $-OCH_2CH_3$ である、化合物。

【請求項 168】

請求項 149に記載の化合物であって、ここで、 x は1であり、そして、 R^3 は、前記キナゾリン環の6位に存在し、そして、 $-CON(R')2$ または $NRCOR'$ である、化合物。

【請求項 169】

請求項 149に記載の化合物であって、ここで、 x は1であり、そして、 R^3 は、前記キナゾリン環の7位に存在し、そして、 $-CON(R')2$ または $NRCOR'$ である、化合物。

【請求項 170】

請求項 149に記載の化合物であって、ここで、 y は0～2であり、 q は0～2であり、そして R^5 基および R^{5a} 基が、存在する場合、各々独立して、ハロゲン、CN、NO₂、 $-N(R')2$ 、 $-CH_2N(R')2$ 、 $-OR'$ 、 $-CH_2OR'$ 、 $-SR'$ 、 $-CH_2SR'$ 、 $-NRCOR'$ 、 $-CON(R')2$ 、 $-S(O)_2N(R')2$ 、 $-OCOR'$ 、 $-COR'$ 、 $-CO_2R'$ 、 $-OCON(R')2$ 、 $-NR'SO_2R'$ 、 $-OP(O)(OR')2$ 、 $-P(O)(OR')2$ 、 $-OP(O)OR'$ 、 $-P(O)OR'$ 、 $-PO(R')2$ 、 $-OPo(R')2$ 、または、必要に応じて置換された基であって、該基が、C₁～C₆脂肪族、アリール、ヘテロアリール、シクロ脂肪族、ヘテロシクロ脂肪族、アリールC₁～C₆アルキル、ヘテロアリールC₁～C₆アルキル、シクロ脂肪族C₁～C₆アルキル、もしくはヘテロシクロ脂肪族C₁～C₆アルキルより選択される基である、化合物。

【請求項 171】

請求項 149に記載の化合物であって、ここで、 y は0～2であり、そして q は1または2であり、そして R^{5a} の各存在が、独立して、Cl、Br、F、CF₃、Me、Et、CN、 $-COOH$ 、 $-NH_2$ 、 $-N(CH_3)_2$ 、 $-N(Et)_2$ 、 $-N(ipr)_2$ 、 $-O(CH_2)_2OCH_3$ 、 $-CONH_2$ 、 $-COOCH_3$ 、 $-OH$ 、 $-OCH_3$ 、 $-OCH_2CH_3$ 、 $-CH_2OH$ 、 $-NHCOCH_3$ 、 $-SO_2NH_2$ 、 $-SO_2NHCO(CH_3)_2$ 、 $-OCOCC(CH_3)_3$ 、 $-OCOCH_2C(CH_3)_3$ 、 $-O(CH_2)_2N(CH_3)_2$ 、4-CH₃-ピペラジン-1-イル、OCOCH(CH₃)₂、OCO(シクロペンチル)、 $-COCH_3$ 、必要に応じて置換されたフェノキシ、または必要に応じて置換されたベンジルオキシである、化合物。

【請求項 172】

請求項 149に記載の化合物であって、ここで：

- a . y が0であり、そして q が1であり、かつ R^{5a} がFであるか；
- b . y が0であり、 q が1であり、そして R^{5a} がOR'であるか；
- c . y が0であり、 q が1であり、そして R^{5a} がOHであるか；
- d . y が0であり、 q が2であり、そして R^{5a} の一方の存在がOR'であり、そして R^{5a} のもう一方の存在がFであるか；または、
- e . y が0であり、 q が2であり、そして R^{5a} の一方の存在がOHであり、そして R^{5a} のもう一方の存在がFである、化合物。

【請求項 173】

請求項 149に記載の化合物であって、ここで：

a) 一緒にになった R^1 および R^2 は、アゼチジン-1-イル(jj)、ピロリジン-1-イル(ff)、ピペリジン-1-イル(dd)、またはピペラジン-1-イル(cc)より選択される、必要に応じて置換された環； R^1 または R^2 の一方が水素であり、 R^1 および R^2 のもう一方が、前記窒素原子に直接的に結合されたCy¹、または必要に応じて置換されたC₁～₄脂肪族基を通して結合されたCy¹より選択され、ここで、該C₁～₄脂肪族基における1以上のメチレン単位は、必要に応じて、 $-NR-$ 、 $-O-$ 、 $-COO-$ 、 $-OCO-$ 、 $-NRCO-$ 、 $-CONR-$ 、 $-SO_2NR-$ 、もしくは $-NRSO_2$ により置換されるか、または、必要に応じて置換されたC₁～₄脂肪族基であり、ここ

で、該 C_{1-4} 脂肪族基における 1 以上のメチレン単位は、必要に応じて、-NR-、-O-、-COO-、-OCO-、-NRCO-、-CONR-、-SO₂NR-、もしくは-NRSO₂-で置換されるか；あるいは、R¹ および R² は、各々独立して、必要に応じて置換された C_{1-4} 脂肪族基であって、ここで、該 C_{1-4} 脂肪族基における 1 以上のメチレン単位は、必要に応じて、-NR-、-O-、-COO-、-OCO-、-NRCO-、-CONR-、-SO₂NR-、もしくは-NRSO₂-で置換された、必要に応じて置換された C_{1-4} 脂肪族基、または、Cy¹ であって、ここで、Cy¹ は該窒素原子に直接的に結合されるか、もしくは必要に応じて置換された C_{1-4} 脂肪族基を通して結合され、ここで、該 C_{1-4} 脂肪族基における 1 以上のメチレン単位は、必要に応じて、-NR-、-O-、-COO-、-OCO-、-NRCO-、-CONR-、-SO₂NR-、もしくは-NRSO₂-で置換された Cy¹ より選択され；

b) ここで、z は 0 ~ 5 であり、そして R⁴ 基は、各々独立して、Cl、Br、F、CF₃、CH₃、-CH₂CH₃、CN、-COOH、-N(CH₃)₂、-N(Et)₂、-N(iPr)₂、-O(CH₂)₂OCH₃、-CONH₂、-COOCH₃、-OH、-CH₂OH、-NHCOCH₃、-SO₂NH₂、-SO₂(CH₂)₃CH₃、-SO₂CH(CH₃)₂、-SO₂N(CH₃)₂、-SO₂CH₂CH₃、-C(O)OCH₂CH(CH₃)₂、-C(O)NHCH₂CH(CH₃)₂、-NHCOOC_H₃、-C(O)C(CH₃)₃、-COO(CH₂)₂CH₃、-C(O)NHCH(CH₃)₂、-C(O)CH₂CH₃、または、必要に応じて置換された基であって、該基が、-ピペリジニル(piperidinyl)、ピペリジニル(piperiziny1)、モルホリノ、C₁₋₄ アルコキシ、フェニル、フェニルオキシ、ベンジル、ベンジルオキシ、-CH₂シクロヘキシル、ピリジル、-CH₂ピリジル、もしくは-CH₂チアゾリルより選択される基であり；

c) x は 0、1 または 2 であり、そして R³ の各存在は、独立して、Cl、Br、F、CF₃、-OCF₃、Me、Et、CN、-COOH、-NH₂、-N(CH₃)₂、-N(Et)₂、-N(iPr)₂、-O(CH₂)₂OCH₃、-CONH₂、-COOCH₃、-OH、-OCH₃、-OCH₂CH₃、-CH₂OH、-NHCOCH₃、-NHCOCH(CH₃)₂、-SO₂NH₂、-CONH(シクロプロピル)、-CONHC_H₃、-CONHCH₂CH₃、または、必要に応じて置換された基であって、該基が、-ピペリジニル(piperidinyl)、ピペリジニル(piperiziny1)、モルホリノ、フェニル、フェニルオキシ、ベンジル、もしくはベンジルオキシより選択される基であり；

d) ここで、y は 0 ~ 2 であり、そして R⁵ 基は、存在する場合、各々独立して、Cl、Br、F、CF₃、Me、Et、CN、-COOH、-NH₂、-N(CH₃)₂、-N(Et)₂、-N(iPr)₂、-O(CH₂)₂OCH₃、-CONH₂、-COOCH₃、-OH、-OCH₃、-OCH₂CH₃、-CH₂OH、-NHCOCH₃、-SO₂NH₂、-SO₂NHC(CH₃)₂、-OCOC(CH₃)₃、-OCOCH₂C(CH₃)₃、-O(CH₂)₂N(CH₃)₂、4-CH₃-ピペラジン-1-イル、OCOCH(CH₃)₂、OCO(シクロペンチル)、-COCH₃、必要に応じて置換されたフェノキシ、または必要に応じて置換されたベンジルオキシであり；そして

e) R^{5a} は、Cl、F、CF₃、Me、Et、-OH、-OCH₃、-OCH₂CH₃、-CH₂OH、-SO₂NH₂、-SO₂NHC(CH₃)₂、-OCOC(CH₃)₃、-OCOCH₂C(CH₃)₃、-O(CH₂)₂N(CH₃)₂、4-CH₃-ピペラジン-1-イル、OCOCH(CH₃)₂、OCO(シクロペンチル)、または-COCH₃ である。

化合物。

【請求項 174】

請求項 173 に記載の化合物であって、ここで、x は 1 であり、そして、R³ は、前記キナゾリン環の 6 位に存在し、そして、-Cl、-CH₃、-CH₂CH₃、-F、-CF₃、-OCF₃、-CONHCH₃、-CONHCH₂CH₃、-CONH(シクロブ

ロピル)、-OCH₃、-NH₂、-OCH₂CH₃、または-CNである、化合物。

【請求項 175】

請求項173に記載の化合物であって、ここで、xは1であり、そして、R³は、前記キナゾリン環の7位に存在し、そして、-Cl、-CH₃、-CH₂CH₃、-F、-CF₃、-OCF₃、-CONHCH₃、-CONHCH₂CH₃、-CONH(シクロプロピル)、-OCH₃、-NH₂、-OCH₂CH₃、または-CNである、化合物。

【請求項 176】

請求項173に記載の化合物であって、ここで、xは1であり、そして、R³は、前記キナゾリン環の6位に存在し、そして、-Cl、-CH₃、-CH₂CH₃、-F、-CF₃、-OCF₃、-OCH₃、または-OCH₂CH₃である、化合物。

【請求項 177】

請求項173に記載の化合物であって、ここで、xは1であり、そして、R³は、前記キナゾリン環の7位に存在し、そして、-Cl、-CH₃、-CH₂CH₃、-F、-CF₃、-OCF₃、-OCH₃、または-OCH₂CH₃である、化合物。

【請求項 178】

請求項173に記載の化合物であって、ここで、xは1であり、そして、R³は、前記キナゾリン環の6位に存在し、そして、-CON(R')₂またはNRCOR'である、化合物。

【請求項 179】

請求項173に記載の化合物であって、ここで、xは1であり、そして、R³は、前記キナゾリン環の7位に存在し、かつ、-CON(R')₂またはNRCOR'である、化合物。

【請求項 180】

請求項173に記載の化合物であって、R^{5a}が、Cl、F、CF₃、Me、Et、-OH、-OCH₃、-OCH₂CH₃である、化合物。

【請求項 181】

請求項173に記載の化合物であって、ここで：

- a . yが0であり、そしてqが1であり、そしてR^{5a}がFであるか；
- b . yが0であり、qが1であり、そしてR^{5a}がOR'であるか；
- c . yが0であり、qが1であり、そしてR^{5a}がOHであるか；
- d . yが0であり、qが2であり、そしてR^{5a}の一方の存在がOR'であり、そしてR^{5a}のもう一方の存在がFであるか；または、
- e . yが0であり、qが2であり、そしてR^{5a}の一方の存在がOHであり、そしてR^{5a}のもう一方の存在がFである、

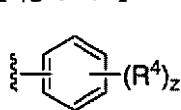
化合物。

【請求項 182】

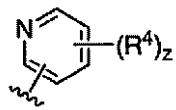
請求項173に記載の化合物であって、ここで：

- a) Cy¹は、以下：

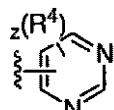
【化36】



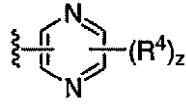
a



b

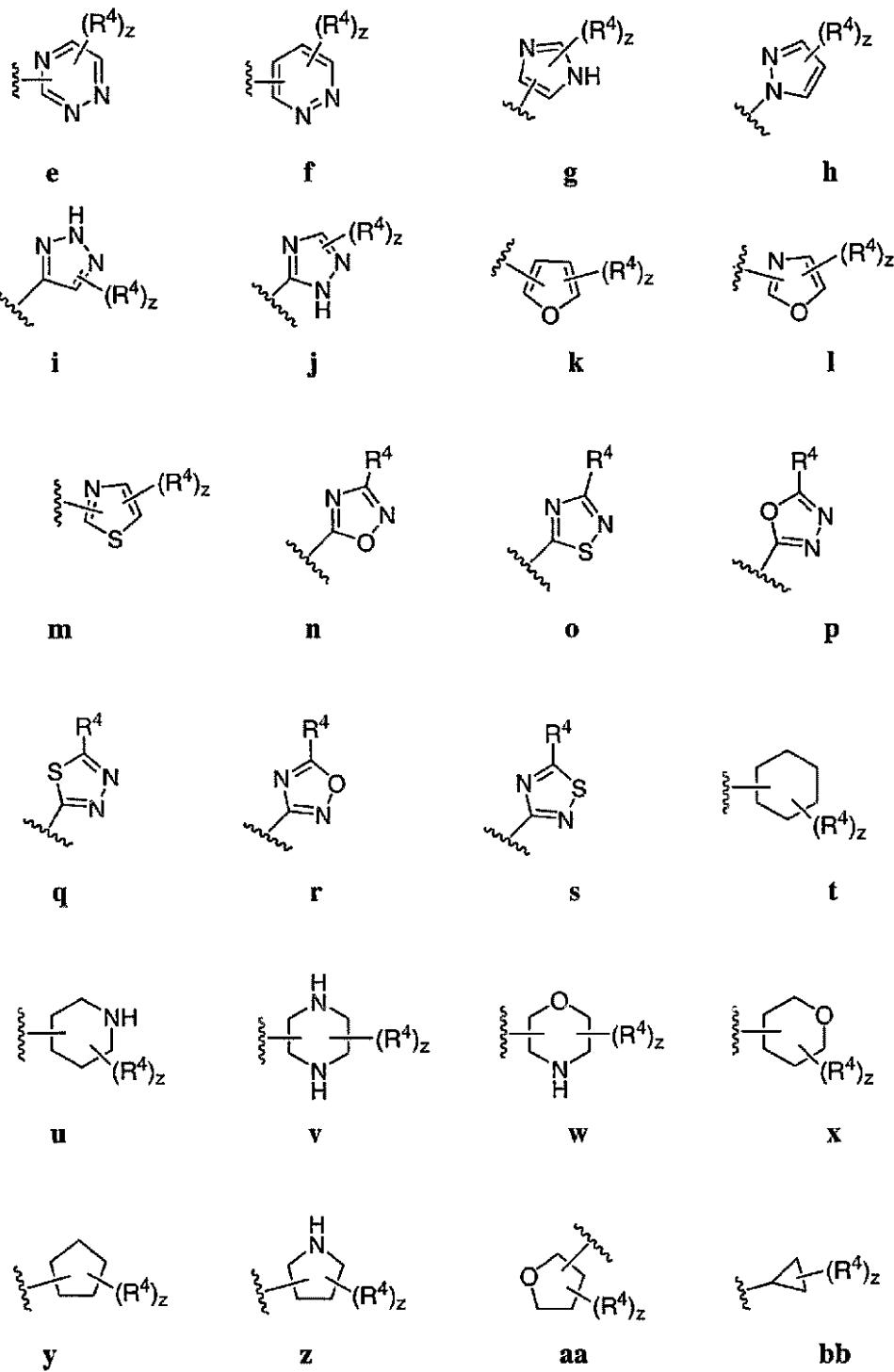


c



d

【化37】



であるか、または、R¹ および R² は、各々独立して、必要に応じて置換された C₁ ~ C₄ 脂肪族基であり、そして各々独立して、必要に応じて置換されたメチル、エチル、シクロプロピル、n-プロピル、プロペニル、シクロブチル、(CO)OCH₂CH₃、(CH₂)₂OCH₃、CH₂CO)OCH₂CH₃、CH₂(CO)OCH₃、CH(C₂H₅)CH₂CH₃、もしくはn-ブチルより選択され；

b) z は 0 ~ 5 であり、そして R⁴ 基は、各々独立して、Cl、Br、F、CF₃、CH₃、-CH₂CH₃、CN、-COOH、-N(CH₃)₂、-N(Et)₂、-N(iPr)₂、-O(CH₂)₂OCH₃、-CONH₂、-COOCH₃、-OH、-CH₂OH、-NHCOCH₃、-SO₂NH₂、-SO₂(CH₂)₃CH₃、-SO₂CH(C₂H₅)₂、-SO₂N(CH₃)₂、-SO₂CH₂CH₃、-C(O)OCH₂CH(C₂H₅)₂、-NHCOOCH₃、-

$\text{C}(\text{O})\text{C}(\text{CH}_3)_3$ 、 $-\text{COO}(\text{CH}_2)_2\text{CH}_3$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NHCH}(\text{CH}_3)_2$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{CH}_2\text{CH}_3$ 、または、必要に応じて置換された基であって、該基が、-ピペリジニル(piperidinyl)、ピペリジニル(piperizinyl)、モルホリノ、 C_{1-4} アルコキシ、フェニル、フェニルオキシ、ベンジル、ベンジルオキシ、 $-\text{CH}_2$ シクロヘキシリ、ピリジル、 $-\text{CH}_2$ ピリジル、もしくは $-\text{CH}_2$ チアゾリルより選択される基であり；

c) x は0、1または2であり、そして R^3 の各存在は、独立して、Cl、Br、F、 CF_3 、 $-\text{OCF}_3$ 、Me、Et、CN、 $-\text{COOH}$ 、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{N}(\text{CH}_3)_2$ 、 $-\text{N}(\text{Et})_2$ 、 $-\text{N}(\text{iPr})_2$ 、 $-\text{O}(\text{CH}_2)_2\text{OCH}_3$ 、 $-\text{CONH}_2$ 、 $-\text{COOCH}_3$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{OCH}_3$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CH}_3$ 、 $-\text{CH}_2\text{OH}$ 、 $-\text{NHCOCOCH}_3$ 、 $-\text{NHCOCOCH}(\text{CH}_3)_2$ 、 $-\text{SO}_2\text{NH}_2$ 、 $-\text{CONH}$ (シクロプロピル)、 $-\text{CONHCCH}_2\text{CH}_3$ 、または、必要に応じて置換された基であって、該基が、-ピペリジニル(piperidinyl)、ピペリジニル(piperizinyl)、モルホリノ、フェニル、フェニルオキシ、ベンジル、もしくはベンジルオキシより選択される基であり；

d) ここで、 y は0～5であり、そして R^5 基が、存在する場合、各々独立して、Cl、Br、F、 CF_3 、Me、Et、CN、 $-\text{COOH}$ 、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{N}(\text{CH}_3)_2$ 、 $-\text{N}(\text{Et})_2$ 、 $-\text{N}(\text{iPr})_2$ 、 $-\text{O}(\text{CH}_2)_2\text{OCH}_3$ 、 $-\text{CONH}_2$ 、 $-\text{COOCH}_3$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{OCH}_3$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CH}_3$ 、 $-\text{CH}_2\text{OH}$ 、 $-\text{NHCOCOCH}_3$ 、 $-\text{SO}_2\text{NH}_2$ 、 $-\text{SO}_2\text{NHC}(\text{CH}_3)_2$ 、 $-\text{OCOC}(\text{CH}_3)_3$ 、 $-\text{OCOCH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_3$ 、 $-\text{O}(\text{CH}_2)_2\text{N}(\text{CH}_3)_2$ 、 $4-\text{CH}_3$ -ピペラジン-1-イル、 $\text{OCOCH}(\text{CH}_3)_2$ 、 OCO (シクロペンチル)、 $-\text{COCH}_3$ 、必要に応じて置換されたフェノキシ、または必要に応じて置換されたベンジルオキシであり；そして

e) R^{5a} は、Cl、F、 CF_3 、Me、Et、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{OCH}_3$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CH}_3$ 、 $-\text{CH}_2\text{OH}$ 、 $-\text{SO}_2\text{NH}_2$ 、 $-\text{SO}_2\text{NHC}(\text{CH}_3)_2$ 、 $-\text{OCOC}(\text{CH}_3)_3$ 、 $-\text{OCOCH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_3$ 、 $-\text{O}(\text{CH}_2)_2\text{N}(\text{CH}_3)_2$ 、 $4-\text{CH}_3$ -ピペラジン-1-イル、 $\text{OCOCH}(\text{CH}_3)_2$ 、 OCO (シクロペンチル)、または $-\text{COCH}_3$ である、化合物。

【請求項183】

請求項173に記載の化合物であって、ここで、 x は1であり、そして、 R^3 は、前記キナゾリン環の6位に存在し、そして、 $-\text{Cl}$ 、 $-\text{CH}_3$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_3$ 、 $-\text{F}$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{CONHCH}_3$ 、 $-\text{CONHCCH}_2\text{CH}_3$ 、 $-\text{CONH}$ (シクロプロピル)、 $-\text{OCH}_3$ 、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CH}_3$ 、または $-\text{CN}$ である、化合物。

【請求項184】

請求項173に記載の化合物であって、ここで、 x は1であり、そして、 R^3 は、前記キナゾリン環の7位に存在し、そして、 $-\text{Cl}$ 、 $-\text{CH}_3$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_3$ 、 $-\text{F}$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{CONHCH}_3$ 、 $-\text{CONHCCH}_2\text{CH}_3$ 、 $-\text{CONH}$ (シクロプロピル)、 $-\text{OCH}_3$ 、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CH}_3$ 、または $-\text{CN}$ である、化合物。

【請求項185】

請求項173に記載の化合物であって、ここで、 x は1であり、そして、 R^3 は、前記キナゾリン環の6位に存在し、そして、 $-\text{Cl}$ 、 $-\text{CH}_3$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_3$ 、 $-\text{F}$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OCH}_3$ 、または $-\text{OCH}_2\text{CH}_3$ である、化合物。

【請求項186】

請求項173に記載の化合物であって、ここで、 x は1であり、そして、 R^3 は、前記キナゾリン環の7位に存在し、そして、 $-\text{Cl}$ 、 $-\text{CH}_3$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_3$ 、 $-\text{F}$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OCH}_3$ 、または $-\text{OCH}_2\text{CH}_3$ である、化合物。

【請求項187】

請求項173に記載の化合物であって、ここで、 x は1であり、そして、 R^3 は、前記キナゾリン環の6位に存在し、そして、 $-\text{CON}(\text{R}')_2$ または NRCOR' である、

化合物。

【請求項 1 8 8】

請求項 1 7 3 に記載の化合物であって、ここで、 x は1であり、そして、 R^3 は、前記キナゾリン環の7位に存在し、そして、 $-CON(R')_2$ または $NRCOR'$ である、化合物。

【請求項 1 8 9】

請求項 1 7 3 に記載の化合物であって、ここで、 R^{5a} は、Cl、F、CF₃、Me、Et、-OH、-OCH₃、-OCH₂CH₃である、化合物。

【請求項 1 9 0】

請求項 1 7 3 に記載の化合物であって、ここで、 R^{5a} は、OR'である、化合物。

【請求項 1 9 1】

請求項 1 7 3 に記載の化合物であって、ここで、 R^{5a} は、OHである、化合物。

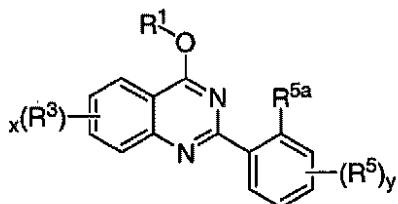
【請求項 1 9 2】

請求項 1 7 3 に記載の化合物であって、ここで、 R^{5a} は、Fである、化合物。

【請求項 1 9 3】

式 I - B - i の化合物：

【化 3 8】



I-B-i

またはその薬学的に受容可能な塩であって、

ここで、 R^1 は、C₁ ~ C₆脂肪族、C_y¹より選択され、ここで、C_y¹は、窒素、酸素もしくは硫黄から独立して選択される0個~3個のヘテロ原子を有する、5員~7員の単環式アリール環もしくは8員~10員の二環式アリール環であるか、または、窒素、酸素もしくは硫黄から独立して選択される0個~3個のヘテロ原子を有する3員~12員の飽和または部分的に不飽和な単環式環であり、ここで、C_y¹は、前記窒素原子に直接に結合されるか、または、必要に応じて置換されたC₁ ~ C₄脂肪族基を通して結合され、ここで、該C₁ ~ C₄脂肪族基における1個以上のメチレン単位は、-NR-、-O-、-COO-、-OCO-、-NRCO-、-CONR-、-SO₂NR-、または-NRSO₂-で必要に応じて置換され；ここで、 R^1 は、1個以上の置換可能な炭素原子、窒素原子、または硫黄原子において、-R⁴のz個の独立した存在で置換され、ここで、zは0~5であり；

x は、0~4であり；

y は、0~4であり；

R^3 、 R^4 、および R^5 の各存在は、独立してQ-R^Xであり；ここで、Qは、結合であるか、または、C₁ ~ C₆アルキデン鎖であり、ここで、Qの2個までの非隣接メチレン単位が、-NR-、-S-、-O-、-CS-、-CO₂-、-OCO-、-CO-、-COCO-、-CONR-、-NRCO-、-NRCO₂-、-SO₂NR-、-NRSO₂-、-CONRNR-、-NRCONR-、-OCONR-、-NRNR-、-NRSO₂NR-、-SO-、-SO₂-、-PO-、-PO₂-、-OP(O)(OR)-、もしくは-POR-により、必要に応じてかつ独立して置換され；そして、 R^X の各存在が、-R'、=O、=NR'、ハロゲン、-NO₂、-CN、-OR'、-SR'、-N(R')₂、-NR'COR'、-NR'CON(R')₂、-NR'CO₂R'、-COR'、-CO₂R'、-OCOR'、-CON(R')₂、-OCON(R')₂、-SOR'、-SO₂R'、-SO₂N(R')₂、-NR'SO₂R'、-NR'S

$O_2N(R')$ ₂、-COCOR'、-COCH₂COR'、-OP(O)(OR')₂、-P(O)(OR')₂、-OP(O)₂OR'、-P(O)₂OR'、-PO(R')₂、または-OPO(R')₂から独立して選択され；

R^{5a} の各存在は、独立して、必要に応じて置換されたC₁～C₆脂肪族基、ハロゲン、-OR'、-SR'、-N(R')₂、-NR'COR'、-NR'CON(R')₂、-NR'CO₂R'、-COR'、-CO₂R'、-OCOR'、-CON(R')₂、-OCON(R')₂、-SOR'、-SO₂R'、-SO₂N(R')₂、-NR'SO₂N(R')₂、-COCOR'、-COCH₂COR'、-OP(O)(OR')₂、-P(O)(OR')₂、-OP(O)₂OR'、-P(O)₂OR'、-PO(R')₂、または-OPO(R')₂であり；そして

R の各存在が、独立して、水素、または必要に応じて置換されたC₁～C₆脂肪族基であり； R' の各存在は、水素、または必要に応じて置換されたC₁～C₆脂肪族基、窒素、酸素、もしくは硫黄から独立して選択される0個から3個のヘテロ原子を有する3員～8員の飽和、部分的に不飽和、もしくは完全に不飽和な単環式環、または、窒素、酸素、もしくは硫黄から独立して選択される0個～5個のヘテロ原子を有する8員～12員の飽和、部分的に不飽和、もしくは完全に不飽和な二環式環系であるか；あるいは、 R および R' 、 R の2個の存在、または R' の2個の存在が、これらが結合する該原子と一緒に、必要に応じて置換された3員～12員の飽和、部分的に不飽和、もしくは完全に不飽和な単環式または二環式環を形成し、該環が、窒素、酸素または硫黄から独立して選択される0個～4個のヘテロ原子を有し、但し；以下：

- a) R^{5a} が、Me、Cl、またはOMeであり、かつ、 x が0である場合、 R^1 は、EtでもMeでもなく；
- b) R^{5a} が、Clであり、 x が3であり、かつ、 R^3 の3個の存在が、6-Me、7-COOEt、および8-Meである場合、 R^1 は、-(CH₂)₂ピペリジン-1-イルではなく；
- c) R^{5a} がMeであり、 x が1であり、かつ、 R^3 がNO₂またはNH₂である場合、 R^1 は、Etではなく；
- d) R^{5a} がOH、NHMe、またはN(NO)Meであり、かつ、 x が0である場合、 R^1 は、Etでも、Meでも、-CH₂CH=CH₂でもなく；
- e) R^{5a} がNH₂であり、かつ、 x が0である場合、 R^1 は、-COCH₃ではなく；
- f) R^{5a} がClまたはMeであり、そして y が0または1である場合、および y が1であり、 R^5 が4-Clであり、そして x が0である場合、 R^1 は、4-CN-フェニルでも、4-Me-フェニルでも、4-OMe-フェニルでも、4-Cl-フェニルでも、4-NO₂-フェニルでも、-CH₂CH₂NHMeでも、Etでも、Meでも、4-COOEt-フェニルでも、-CH₂Phでも、iPrでも、2-Me-フェニルでも、4-フェニル-フェニルでも、-CH₂CH=CH₂でもない、化合物またはその薬学的に受容可能な塩。

【請求項194】

請求項193に記載の化合物であって、ここで

- a) R^1 が、以下：

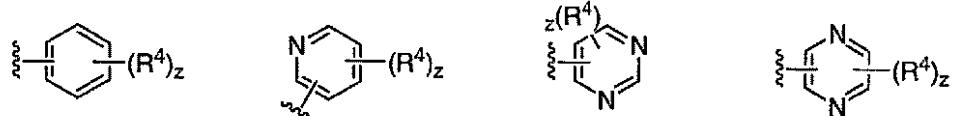
i) 前記窒素原子に直接的に結合されるか、または、必要に応じて置換されたC₁～C₄脂肪族基を通して結合されるCy¹であって、ここで、該C₁～C₄脂肪族基の1個以上のメチレン単位が、-NR-、-O-、-COO-、-OCO-、-NRCO-、-CONR-、-SO₂NR-、もしくは-NRSO₂-で必要に応じて置換された置換された、Cy¹；または、

ii) 必要に応じて置換されたC₁～C₄脂肪族基であって、ここで、該C₁～C₄基の1以上のメチレン単位が、必要に応じて、-NR-、-O-、-COO-、-OCO-、-NRCO-、-CONR-、-SO₂NR-、もしくは-NRSO₂-で置換される、C₁～C₄脂肪族基である、化合物。

【請求項195】

請求項 1 9 3に記載の化合物であって、ここで、 C_y^1 が、以下：

【化 3 9】



a

b

c

d



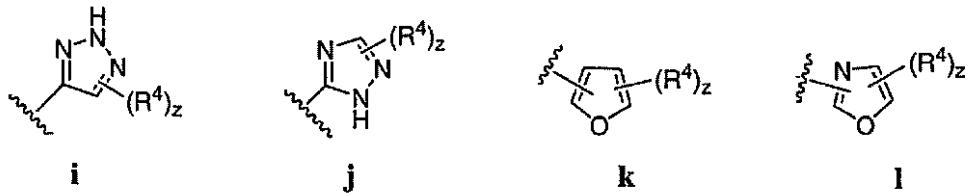
e

f

g

h

【化 4 0】



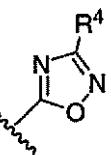
i

j

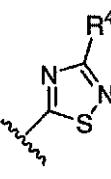
k

l

m



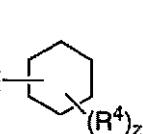
n



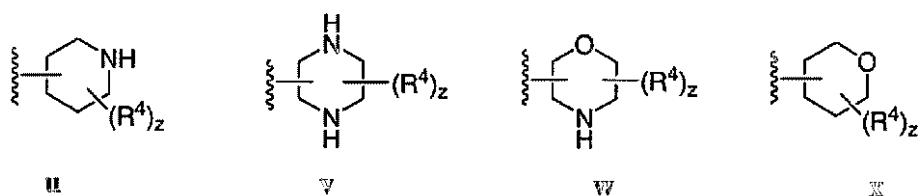
q

r

s



t

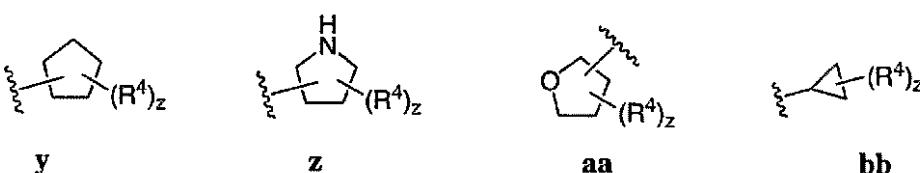


u

v

w

x



y

z

aa

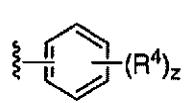
bb

である、化合物。

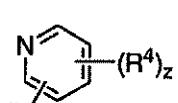
【請求項 1 9 6】

請求項 1 9 3 に記載の化合物であつて、ここで、 R^1 が、 $-CH_2-$ Cy^1 であり、ここで、 R が、水素または $C_1 \sim C_4$ アルキルであり、そして、 Cy^1 が、以下：

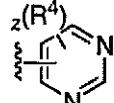
【化 4 1】



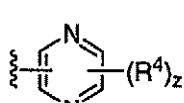
a



b

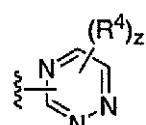


c

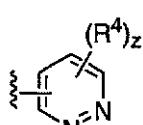


d

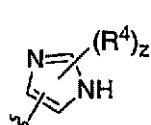
【化 4 2】



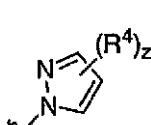
e



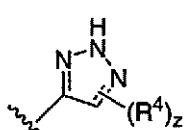
f



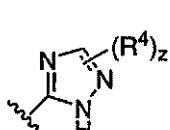
g



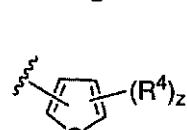
h



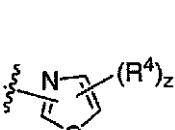
i



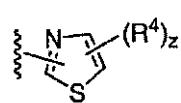
j



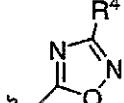
k



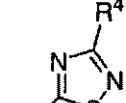
l



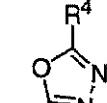
m



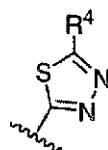
n



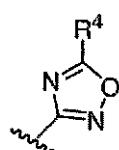
o



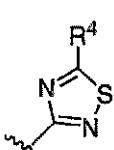
p



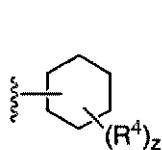
q



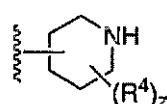
r



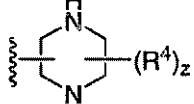
s



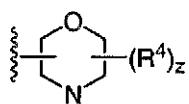
t



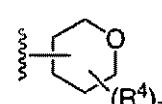
u



v



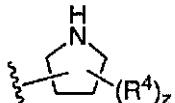
w



x



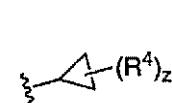
y



z



aa



bb

である、化合物。

【請求項 197】

請求項 193に記載の化合物であって、ここで、R¹が、必要に応じて置換されたC₁～C₄脂肪族基であり、そして各々独立して、必要に応じて置換されたメチル、エチル、シクロプロピル、n-プロピル、プロペニル、シクロブチル、(CO)OCH₂CH₃、(CH₂)₂OCH₃、CH₂CO)OCH₂CH₃、CH₂(CO)OCH₃、CH(C_H₃)CH₂CH₃、またはn-ブチルより選択される、化合物。

【請求項 198】

請求項 193に記載の化合物であって、ここで、zが0～5であり、そしてR⁴基が、存在する場合、各々独立して、ハロゲン、CN、NO₂、-N(R')₂、-CH₂N(R')₂、-OR'、-CH₂OR'、-SR'、-CH₂SR'、-COOR'、-NRCOR'、-CON(R')₂、-OCON(R')₂、COR'、-NHCOOR'、-SO₂R'、-SO₂N(R')₂、または、必要に応じて置換された基であって、該基が、C₁～C₆脂肪族、アリール、ヘテロアリール、シクロ脂肪族、ヘテロシクロ脂肪族、アリールC₁～C₆アルキル、ヘテロアリールC₁～C₆アルキル、シクロ脂肪族C₁～C₆アルキル、もしくはヘテロシクロ脂肪族C₁～C₆アルキルより選択される基である、化合物。

【請求項 199】

請求項 193に記載の化合物であって、ここで、zが0～5であり、そしてR⁴基が、各々独立して、Cl、Br、F、CF₃、CH₃、-CH₂CH₃、CN、-COOH、-N(CH₃)₂、-N(Et)₂、-N(iPr)₂、-O(CH₂)₂OCH₃、-CONH₂、-COOCH₃、-OH、-CH₂OH、-NHCOCH₃、-SO₂NH₂、-SO₂(CH₂)₃CH₃、-SO₂CH(CH₃)₂、-SO₂N(CH₃)₂、-SO₂CH₂CH₃、-C(O)OCH₂CH(CH₃)₂、-C(O)NHCH₂CH(CH₃)₂、-NHCOOCH₃、-C(O)C(CH₃)₃、-COO(CH₂)₂CH₃、-C(O)NHCH(CH₃)₂、-C(O)CH₂CH₃、または、-ピペリジニル(piperidinyl)、ピペリジニル(piperizinyl)、モルホリノ、C₁～₄アルコキシ、フェニル、フェニルオキシ、ベンジル、ベンジルオキシ、-CH₂シクロヘキシリ、ピリジル、-CH₂ピリジル、もしくは-CH₂チアゾリルより選択される、必要に応じて置換された基である、化合物。

【請求項 200】

請求項 193に記載の化合物であって、R³が、ハロゲン、CN、NO₂、-N(R')₂、-CH₂N(R')₂、-OR'、-CH₂OR'、-SR'、-CH₂SR'、-COOR'、-NRCOR'、-CON(R')₂、-OCON(R')₂、COR'、-NHCOOR'、-SO₂R'、-SO₂N(R')₂、または、必要に応じて置換された基であって、該基が、C₁～C₆脂肪族、アリール、ヘテロアリール、シクロ脂肪族、ヘテロシクロ脂肪族、アリールC₁～C₆アルキル、ヘテロアリールC₁～C₆アルキル、シクロ脂肪族C₁～C₆アルキル、もしくはヘテロシクロ脂肪族C₁～C₆アルキルより選択される、化合物。

【請求項 201】

請求項 193に記載の化合物であって、ここで、R³が、Cl、Br、F、CF₃、-OCF₃、Me、Et、CN、-COOH、-NH₂、-N(CH₃)₂、-N(Et)₂、-N(iPr)₂、-O(CH₂)₂OCH₃、-CONH₂、-COOCH₃、-OH、-OCH₃、-OCH₂CH₃、-CH₂OH、-NHCOCH₃、-NHCOCH(CH₃)₂、-SO₂NH₂、-CONH(シクロプロピル)、-CONHCH₃、-CONHCH₂CH₃、または、必要に応じて置換された基であって、該基が、-ピペリジニル(piperidinyl)、ピペリジニル(piperizinyl)、モルホリノ、フェニル、フェニルオキシ、ベンジル、もしくはベンジルオキシより選択される、化合物。

【請求項 202】

請求項 19_3に記載の化合物であって、ここで、R³が、ハロゲン、CN、必要に応じて置換されたC₁～C₆アルキル、OR'、N(R')₂、CON(R')₂、またはNRCOR'である、化合物。

【請求項 203】

請求項 19_3に記載の化合物であって、ここで、R³が、-Cl、-CH₃、-CH₂CH₃、-F、-CF₃、-OCF₃、-CONHCH₃、-CONHCH₂CH₃、-CONH(シクロプロピル)、-OCH₃、-NH₂、-OCH₂CH₃、または-CNである、化合物。

【請求項 204】

請求項 19_3に記載の化合物であって、ここで、R³が、前記キナゾリン環の6位に存在し、そして、-Cl、-CH₃、-CH₂CH₃、-F、-CF₃、-OCF₃、-CONHCH₃、-CONHCH₂CH₃、-CONH(シクロプロピル)、-OCH₃、-NH₂、-OCH₂CH₃、または-CNである、化合物。

【請求項 205】

請求項 19_3に記載の化合物であって、R³が、前記キナゾリン環の7位に存在し、そして、-Cl、-CH₃、-CH₂CH₃、-F、-CF₃、-OCF₃、-CONHCH₃、-CONHCH₂CH₃、-CONH(シクロプロピル)、-OCH₃、-NH₂、-OCH₂CH₃、または-CNである、化合物。

【請求項 206】

請求項 19_3に記載の化合物であって、ここで、R³が、前記キナゾリン環の6位に存在し、そして、-Cl、-CH₃、-CH₂CH₃、-F、-CF₃、-OCF₃、-OCH₃、または-OCH₂CH₃である、化合物。

【請求項 207】

請求項 19_3に記載の化合物であって、ここで、R³が、前記キナゾリン環の7位に存在し、そして、-Cl、-CH₃、-CH₂CH₃、-F、-CF₃、-OCF₃、-OCH₃、または-OCH₂CH₃である、化合物。

【請求項 208】

請求項 19_3に記載の化合物であって、ここで、R³が、前記キナゾリン環の6位に存在し、そして、-CON(R')₂またはNRCOR'である、化合物。

【請求項 209】

請求項 19_3に記載の化合物であって、ここで、R³が、前記キナゾリン環の7位に存在し、そして、-CON(R')₂またはNRCOR'である、化合物。

【請求項 210】

請求項 19_3に記載の化合物であって、ここで、yが0～5であり、qが0～2であり、そしてR⁵基およびR^{5a}基が、存在する場合、各々独立して、ハロゲン、CN、NO₂、-N(R')₂、-CH₂N(R')₂、-OR'、-CH₂OR'、-SR'、-CH₂SR'、-NRCOR'、-CON(R')₂、-S(O)₂N(R')₂、-OCOR'、-COR'、-CO₂R'、-OCON(R')₂、-NR'SO₂R'、-OP(O)(OR')₂、-P(O)(OR')₂、-OP(O)₂OR'、-P(O)₂OR'、-PO(R')₂、-OPO(R')₂、または、必要に応じて置換された基であって、該基が、C₁～C₆脂肪族、アリール、ヘテロアリール、シクロ脂肪族、ヘテロシクロ脂肪族、アリールC₁～C₆アルキル、ヘテロアリールC₁～C₆アルキル、シクロ脂肪族C₁～C₆アルキル、もしくはヘテロシクロ脂肪族C₁～C₆アルキルより選択される、化合物。

【請求項 211】

請求項 19_3に記載の化合物であって、ここで、yが0～5であり、そしてqが1または2であり、そしてR^{5a}の各存在が、独立して、Cl、Br、F、CF₃、Me、Et、CN、-COOH、-NH₂、-N(CH₃)₂、-N(Et)₂、-N(ipr)₂、-O(CH₂)₂OCH₃、-CONH₂、-COOCH₃、-OH、-OCH₃、-OCH₂CH₃、-CH₂OH、-NHCOCH₃、-SO₂NH₂、-SO₂NHC(

$\text{C H}_3)_2$ 、 $-\text{O C O C}(\text{C H}_3)_3$ 、 $-\text{O C O C H}_2\text{C}(\text{C H}_3)_3$ 、 $-\text{O}(\text{C H}_2)_2\text{N}(\text{C H}_3)_2$ 、 $4-\text{C H}_3$ -ピペラジン-1-イル、 $\text{O C O C H}(\text{C H}_3)_2$ 、 O C O (シクロペンチル)、 $-\text{C O C H}_3$ 、必要に応じて置換されたフェノキシ、または必要に応じて置換されたベンジルオキシである、化合物。

【請求項 2 1 2】

請求項 1 9 3 に記載の化合物であって、ここで：

- a) y が 0 であり、 q が 1 であり、そして R^{5a} が F であるか；
- b) y が 0 であり、 q が 1 であり、そして R^{5a} が OR' であるか；
- c) y が 0 であり、 q が 1 であり、そして R^{5a} が OH であるか；
- d) y が 1 であり、 R^{5a} が OR' であり、そして R^5 が F であり、ここで、OR' が前記フェニル環の 2 位において置換され、そして F が該フェニル環の 6 位において置換されるか；または
- e) y が 1 であり、 R^{5a} が OH であり、そして R^5 が F であり、ここで、OH が、該フェニル環の 2 位において置換され、そして F が該フェニル環の 6 位において置換された、化合物。

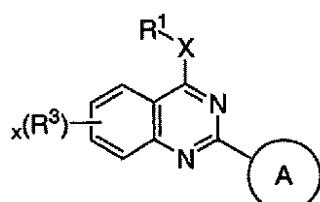
【請求項 2 1 3】

請求項 1 ~ 請求項 2 1 2 のいずれか 1 項に記載の化合物を包含する組成物であって；かつ、薬学的に受容可能なキャリア、ビヒクル、または希釈剤である、組成物。

【請求項 2 1 4】

急性の疼痛、慢性の疼痛、神経障害性の疼痛、または炎症性の疼痛、関節炎、片頭痛、群発性頭痛、三叉神経痛、疱疹性神経痛、全体神経痛、癲癇もしくは癲癇の状態、神経変性障害、不安症および抑うつ症などの精神医学的障害、筋緊張症、不整脈、運動障害、神経内分泌障害、運動失調、多発性硬化症、過敏症腸症候群、失禁、内臓痛、変形性関節症の疼痛、帯状疱疹後神経痛、糖尿病性神経障害、歯根痛、坐骨神経痛、背中の疼痛、頭痛もしくは頸痛、激痛もしくは難治性疼痛、侵害受容性疼痛、抑えきれない痛み、手術後の疼痛、または癌の疼痛、より選択される疾患、障害または状態を処置するか、またはその重篤度を減らすための組成物であって、該組成物は、有効量の式 I :

【化 4 3】



I

の化合物もしくはその薬学的に受容可能な塩を含有し、ここで：

X が O または N R^2 であり；

R^1 および R^2 が、各々独立して、必要に応じて置換された基であって、該基が、水素、 $\text{C}_{1~6}$ 脂肪族、または C y^1 より選択され、ここで、 C y^1 は、窒素、酸素もしくは硫黄より独立して選択される 0 個 ~ 3 個のヘテロ原子を有する、5 員 ~ 7 員の単環式アリール環もしくは 8 員 ~ 10 員の二環式アリール環であるか、または、窒素、酸素もしくは硫黄より独立して選択される 0 個 ~ 3 個のヘテロ原子を有する 3 員 ~ 12 員の飽和もしくは部分的に不飽和な単環式環もしくは二環式環であり、ここで、 C y^1 は、前記窒素原子に直接に結合されるか、または、必要に応じて置換された $\text{C}_{1~4}$ 脂肪族基を通して結合され、ここで、該 $\text{C}_{1~4}$ 脂肪族基における 1 以上のメチレン単位は、 $-\text{N R}-$ 、 $-\text{O}-$ 、 $-\text{C O O}$ 、 $-\text{O C O}-$ 、 $-\text{N R C O}-$ 、 $-\text{C O N R}-$ 、 $-\text{S O}_2\text{N R}-$ 、または $-\text{N R S O}_2-$ で必要に応じて置換されるか；あるいは、 R^1 および R^2 は、これらが結合される窒素原子と一緒にになって、窒素、硫黄、もしくは酸素より独立して選択される 0 個 ~ 3 個のヘテロ原子を有する、必要に応じて置換された 3 員 ~ 12 員の単環式もしくは二環式

の飽和、部分的に不飽和、もしくは完全に不飽和な環を形成し；ここで、 R^1 および R^2 、もしくは一緒になった R^1 および R^2 より形成される該環が、各々必要に応じてかつ独立して、1個以上の置換可能な炭素原子、窒素原子もしくは硫黄原子において、- R^4 の z 個の独立した存在で置換され、ここで、 z は 0 ~ 5 であり；

環 A は、窒素、酸素、もしくは硫黄より独立して選択される 0 個 ~ 3 個のヘテロ原子を有する、5員 ~ 7 員の単環式アリール環もしくは 8 員 ~ 10 員の二環式アリール環、または、窒素、酸素もしくは硫黄より独立して選択される 0 個 ~ 3 個のヘテロ原子を有する、3 員 ~ 12 員の単環式もしくは二環式の飽和もしくは部分的に不飽和な単環式環であり、ここで、環 A は、必要に応じて、- R^5 の y 個の独立した存在で置換され、ここで、 y が 0 ~ 5 であり、そしてさらに必要に応じて、- R^{5a} の q 個の独立した存在で置換され、ここで、 q は 0 ~ 2 であり；

x は 0 ~ 4 であり；

R^3 、 R^4 、および R^5 の各存在は、独立して $Q - R^x$ であり；ここで、 Q は、結合であるか、または C_1 ~ C_6 アルキリデン鎖であり、ここで、 Q の 2 までの非隣接メチレン単位が、必要に応じてかつ独立して、- NR - 、- S - 、- O - 、- CS - 、- CO_2 - 、- OCO - 、- CO - 、- $COCO$ - 、- $CONR$ - 、- $NRCO$ - 、- $NRCO_2$ - 、- SO_2NR - 、- $NRSO_2$ - 、- $CONRNR$ - 、- $NRCO NR$ - 、- $OCONR$ - 、- $NRNR$ - 、- $NRSO_2NR$ - 、- SO - 、- SO_2 - 、- PO - 、- PO_2 - 、- $OP(O)(OR)$ - 、または - POR - により置換され；そして R^x の各存在は、独立して、- R' 、= O 、= NR' 、ハロゲン、- NO_2 、- CN 、- OR' 、- SR' 、- $N(R')_2$ 、- $NR'COR'$ 、- $NR'CON(R')_2$ 、- $NR'CO_2R'$ 、- COR' 、- CO_2R' 、- $OCOR'$ 、- $CON(R')_2$ 、- $OCON(R')_2$ 、- SOR' 、- SO_2R' 、- $SO_2N(R')_2$ 、- $NR'SO_2R'$ 、- $NR'SO_2N(R')_2$ 、- $COCOR'$ 、- $COCH_2COR'$ 、- $OP(O)(OR')_2$ 、- $P(O)(OR')_2$ 、- $OP(O)_2OR'$ 、- $P(O)_2OR'$ 、- $PO(R')_2$ 、または - $OPO(R')_2$ より選択され；

R^{5a} の各存在は、独立して、必要に応じて置換された C_1 ~ C_6 脂肪族基、ハロゲン、- OR' 、- SR' 、- $N(R')_2$ 、- $NR'COR'$ 、- $NR'CON(R')_2$ 、- $NR'CO_2R'$ 、- COR' 、- CO_2R' 、- $OCOR'$ 、- $CON(R')_2$ 、- $OCON(R')_2$ 、- SOR' 、- SO_2R' 、- $SO_2N(R')_2$ 、- $NR'SO_2R'$ 、- $NR'SO_2N(R')_2$ 、- $COCOR'$ 、- $COCH_2COR'$ 、- $OP(O)(OR')_2$ 、- $P(O)(OR')_2$ 、- $OP(O)_2OR'$ 、- $P(O)_2OR'$ 、- $PO(R')_2$ 、または - $OPO(R')_2$ であり；そして

R の各存在は、独立して、水素または必要に応じて置換された C_1 ~ C_6 脂肪族基であり；そして R' の各存在は、独立して、水素もしくは必要に応じて置換された C_1 ~ C_6 脂肪族基、3 員 ~ 8 員の飽和、部分的に不飽和、もしくは完全に不飽和な単環式環であって、該環は、窒素、酸素もしくは硫黄より独立して選択される 0 個 ~ 3 個のヘテロ原子を有する単環式環、または、窒素、酸素、もしくは硫黄より独立して選択される 0 個 ~ 5 個のヘテロ原子を有する 8 員 ~ 12 員の飽和、部分的に不飽和、または完全に不飽和な二環式系であるか；または、 R および R' 、2 つの R の存在、もしくは 2 つの R' の存在は、これらが結合する原子と一緒にになって、必要に応じて置換された 3 員 ~ 12 員の飽和、部分的に不飽和、または完全に不飽和な単環式または二環式環であって、該環は、窒素、酸素、もしくは硫黄より独立して選択される 0 個 ~ 4 個のヘテロ原子を有する単環式または二環式環を形成し、ただし：

i) x が 1 であり、そして R^3 が必要に応じて置換された 6 - フェニルまたは 6 - ピリジルであり、そして R^1 が水素である場合、 R^2 は、 Cy^1 ではなく；そして

ii) ピペラジン、1 - (4 - アミノ - 6 , 7 - ジメトキシ - 2 - キナゾリニル) - 4 (2 - フラニルカルボニル) - モノヒドロクロリドおよびピペラジン、1 - (4 - アミノ - 6 , 7 - ジメトキシ - 2 - キナゾリニル) - 4 [(2 , 3 - ジヒドロ - 1 , 4 - ベンゾジオキシン - 2 - イル)カルボニル] - が除外される、

組成物。

【請求項 215】

請求項 214に記載の組成物であって、ここで、前記疾患、状態または障害が、電位依存性ナトリウムチャネルの過活性化に関与している、組成物。

【請求項 216】

請求項 214に記載の組成物であって、ここで、前記疾患、状態または障害が、電位依存性カルシウムチャネルの過活性化に関与している、組成物。

【請求項 217】

請求項 214に記載の組成物であって、ここで、前記疾患、状態または障害が、急性の疼痛、慢性の疼痛、神経障害性の疼痛、または炎症性の疼痛である、組成物。

【請求項 218】

請求項 214に記載の組成物であって、ここで、前記疾患、状態または障害が、歯根痛、坐骨神経痛、背中の疼痛、頭痛、または頸痛である、組成物。

【請求項 219】

請求項 214に記載の組成物であって、ここで、前記疾患、状態または障害が、重篤な疼痛もしくは難治性疼痛、手術後の疼痛、背中の疼痛、または癌の疼痛である、組成物。

【請求項 220】

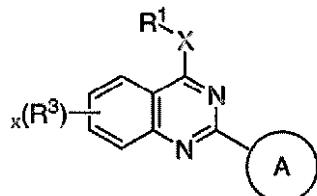
以下：

(a) 患者；または

(b) 生物学的サンプル；

における、NaV1.1、NaV1.2、NaV1.3、NaV1.4、NaV1.5、NaV1.6、NaV1.7、NaV1.8、NaV1.9、またはCaV2.2の活性のうちの1以上を阻害するための組成物であって、該組成物は、該患者への式Iの化合物：

【化44】



I

または、これらの薬学的に受容可能な塩の投与、あるいは該生物学的サンプルを該化合物またはこれらの薬学的に受容可能な塩と接触させるのに適しており、ここで：

XがOまたはNR²であり；

ここで、R¹およびR²が、各々独立して、必要に応じて置換された基であり、該基が、水素、C₁~₆脂肪族、もしくはC_y¹より選択され、ここで、C_y¹が、窒素、酸素、もしくは硫黄より独立して選択される0個~3個のヘテロ原子を有する、5員~7員の单環式アリール環もしくは8員~10員の二環式アリール環であるか、または、窒素、酸素もしくは硫黄より独立して選択される0個~3個のヘテロ原子を有する、3員~12員の飽和または部分的に不飽和な单環式環または二環式環であり、ここで、C_y¹が、該窒素原子に直接的に結合されるか、または必要に応じて置換されたC₁~₄脂肪族基を通して結合され、ここで、該C₁~₄脂肪族基における1以上のメチレン単位が、必要に応じて、-NR-、-O-、-COO-、-OCO-、-NRCO-、-CONR-、-SO₂NR-、もしくは-NRSO₂-で置換された；あるいは、R¹およびR²が、これらが結合する窒素原子と一緒にになって、必要に応じて置換された、3員~12員の单環式または二環式の、飽和、部分的に不飽和、または完全に不飽和な環を形成し、該環が、窒素、硫黄、もしくは酸素より独立して選択される0個~3個のさらなるヘテロ原子を有し；ここで、R₁およびR₂、または、一緒にになったR₁およびR₂により形成される該環が、

各々必要に応じてかつ独立して、1個以上の置換可能な炭素原子、窒素原子、または硫黄原子において、 $-R^4$ の z 個の独立した存在で置換され、ここで、 z が $0 \sim 5$ であり；

環 A が、窒素、酸素、もしくは硫黄より独立して選択される 0 個～3 個のヘテロ原子を有する、5 員～7 員の単環式アリール環または 8 員～10 員の二環式アリール環であるか、または窒素、酸素もしくは硫黄より独立して選択される 0 個～3 個のヘテロ原子を有する、3 員～12 員の単環式もしくは二環式の飽和もしくは部分的に不飽和の単環式環であり、ここで、環 A が、必要に応じて、 $-R^5$ の y 個の独立した存在で置換され、ここで、 y が、 $0 \sim 5$ であり、そして、さらに、必要に応じて、 R^{5a} の q 個の独立した存在で置換され、ここで、 q は、 $0 \sim 2$ であり；

x が、 $0 \sim 4$ であり：

R^3 、 R^4 、および R^5 の各存在が、独立して $Q - R^x$ であり；ここで、 Q が、結合であるか、または $C_1 \sim C_6$ アルキリデン鎖であり、ここで、 Q の 2 までの非隣接メチレン単位が、必要に応じてかつ独立して、 $-NR-$ 、 $-S-$ 、 $-O-$ 、 $-CS-$ 、 $-CO_2-$ 、 $-OCO-$ 、 $-CO-$ 、 $-COCO-$ 、 $-CONR-$ 、 $-NRCO-$ 、 $-NRCO_2-$ 、 $-SO_2NR-$ 、 $-NRSO_2-$ 、 $-CONRNR-$ 、 $-NRCONR-$ 、 $-OCONR-$ 、 $-NRNR-$ 、 $-NRSO_2NR-$ 、 $-SO-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-PO-$ 、 $-PO_2-$ 、 $-OP(O)(OR)-$ 、または $-POR-$ により置換され；そして R^x の各存在が、 $-R'$ 、 $=O$ 、 $=NR'$ 、ハロゲン、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-OR'$ 、 $-SR'$ 、 $-N(R')_2$ 、 $-NR'COR'$ 、 $-NR'CON(R')_2$ 、 $-NR'CO_2R'$ 、 $-COR'$ 、 $-CO_2R'$ 、 $-OCOR'$ 、 $-CON(R')_2$ 、 $-OCON(R')_2$ 、 $-SOR'$ 、 $-SO_2R'$ 、 $-SO_2N(R')_2$ 、 $-NR'SO_2R'$ 、 $-NR'SO_2N(R')_2$ 、 $-COCOR'$ 、 $-COCH_2COR'$ 、 $-OP(O)(OR')_2$ 、 $-P(O)(OR')_2$ 、 $-PO(R')_2$ 、または $-OPO(R')_2$ より独立して選択され；

R^{5a} の各存在が、独立して、必要に応じて置換された $C_1 \sim C_6$ 脂肪族基、ハロゲン、 $-OR'$ 、 $-SR'$ 、 $-N(R')_2$ 、 $-NR'COR'$ 、 $-NR'CON(R')_2$ 、 $-NR'CO_2R'$ 、 $-COR'$ 、 $-CO_2R'$ 、 $-OCOR'$ 、 $-CON(R')_2$ 、 $-OCON(R')_2$ 、 $-SOR'$ 、 $-SO_2R'$ 、 $-SO_2N(R')_2$ 、 $-NR'SO_2R'$ 、 $-NR'SO_2N(R')_2$ 、 $-COCOR'$ 、 $-COCH_2COR'$ 、 $-OP(O)(OR')_2$ 、 $-P(O)(OR')_2$ 、 $-OP(O)_2OR'$ 、 $-P(O)_2OR'$ 、 $-PO(R')_2$ 、または $-OPO(R')_2$ であり；そして

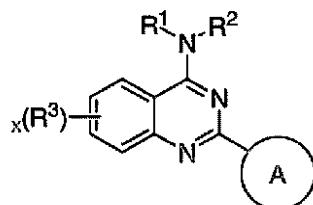
R の各存在が、独立して、水素または必要に応じて置換された $C_1 \sim C_6$ 脂肪族基であり；そして R' の各存在が、独立して、水素もしくは必要に応じて置換された $C_1 \sim C_6$ 脂肪族基、3 員～8 員の飽和、部分的に不飽和、もしくは完全に不飽和な単環式環であって、該環が、窒素、酸素もしくは硫黄より独立して選択される 0 個～3 個のヘテロ原子を有するか、または、窒素、酸素、もしくは硫黄より独立して選択される 0 個～5 個のヘテロ原子を有する 8 員～12 員の飽和、部分的に不飽和、または完全に不飽和な二環式環系である；あるいは、 R および R' 、2 個の R の存在、または 2 個の R' の存在が、これらが結合する原子と一緒にになって、必要に応じて置換された 3 員～12 員の飽和、部分的に不飽和、または完全に不飽和な単環式または二環式環を形成し、該環が、窒素、酸素、もしくは硫黄より独立して選択される 0 個～4 個のヘテロ原子を有する、

組成物。

【請求項 221】

請求項 214 または請求項 220 に記載の組成物であって、ここで、 X が NR^2 であり、そして、化合物が、式 I-A :

【化45】

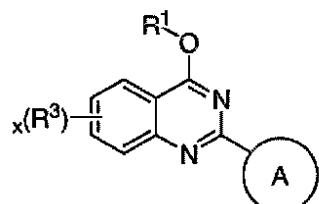


の構造を有する、組成物。

【請求項222】

請求項214または請求項220に記載の組成物であって、ここで、XがOであり、そして、化合物が、式I-B：

【化46】



I-B

の構造を有する、組成物。

【請求項223】

請求項214または請求項220に記載の組成物であって、ここで、

a) R¹またはR²の一つが水素であり、R¹およびR²のもう一方が、以下：

i) C_{1~4}脂肪族基における1以上のメチレン単位が、必要に応じて、-NR-、-O-、-COO-、-OCO-、-NRCO-、-CONR-、-SO₂NR-、もしくは-NRSO₂-で置換された、必要に応じて置換された該C_{1~4}脂肪族基であるか；または、Cy¹が、窒素、酸素もしくは硫黄より独立して選択される0個～3個のヘテロ原子を有する、5員～7員の单環式アリール環もしくは8員～10員の二環式アリール環であるか、または、窒素、酸素もしくは硫黄より独立して選択される0個～3個のヘテロ原子を有する、3員～12員の飽和もしくは部分的に不飽和な单環式環もしくは二環式環であって、ここで、Cy¹が、前記窒素原子に直接的に結合されるか、もしくは、必要に応じて置換されたC_{1~4}脂肪族基を通じて結合され、ここで、該C_{1~4}脂肪族基における1以上のメチレン単位が、-NR-、-O-、-COO-、-OCO-、-NRCO-、-CONR-、-SO₂NR-、もしくは-NRSO₂-により置換された、Cy¹である；あるいは、

ii) 必要に応じて置換されたC_{1~4}脂肪族基であって、ここで、該C_{1~4}脂肪族基における1以上のメチレン単位が、必要に応じて、-NR-、-O-、-COO-、-OCO-、-NRCO-、-CONR-、-SO₂NR-、もしくは-NRSO₂-で置換されたか；あるいは

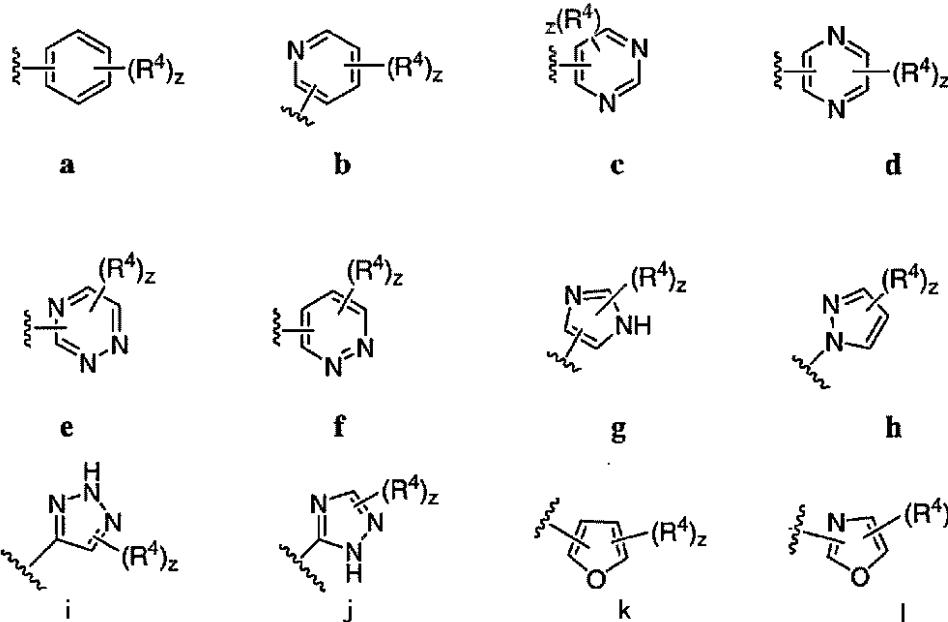
b) R¹およびR²が、各々独立して、Cy¹または必要に応じて置換されたC_{1~4}脂肪族基より選択され、ここで、該C_{1~4}脂肪族基における1以上のメチレン単位が、必要に応じて、-NR-、-O-、-COO-、-OCO-、-NRCO-、-CONR-、-SO₂NR-、もしくは-NRSO₂-で置換され、Cy¹が、窒素、酸素、もしくは硫黄より独立して選択される0個～3個のヘテロ原子を有する、5員～7員の单環式アリール環もしくは8員～10員の二環式アリール環であるか、または、窒素、酸素、もしくは硫黄より独立して選択される0個～3個のヘテロ原子を有する、3員～12員の飽

和もしくは部分的に不飽和な、単環式環もしくは二環式環であり、ここで、 C_y^1 が、前記窒素原子に直接的に結合されるか、または必要に応じて置換された $C_{1\sim 4}$ 脂肪族基を通して結合され、ここで、該 $C_{1\sim 4}$ 脂肪族基における 1 以上のメチレン単位が、必要に応じて、-NR-、-O-、-COO-、-OCO-、-NRCO-、-CONR-、-SO₂NR-、もしくは-NRSO₂-で置換される、

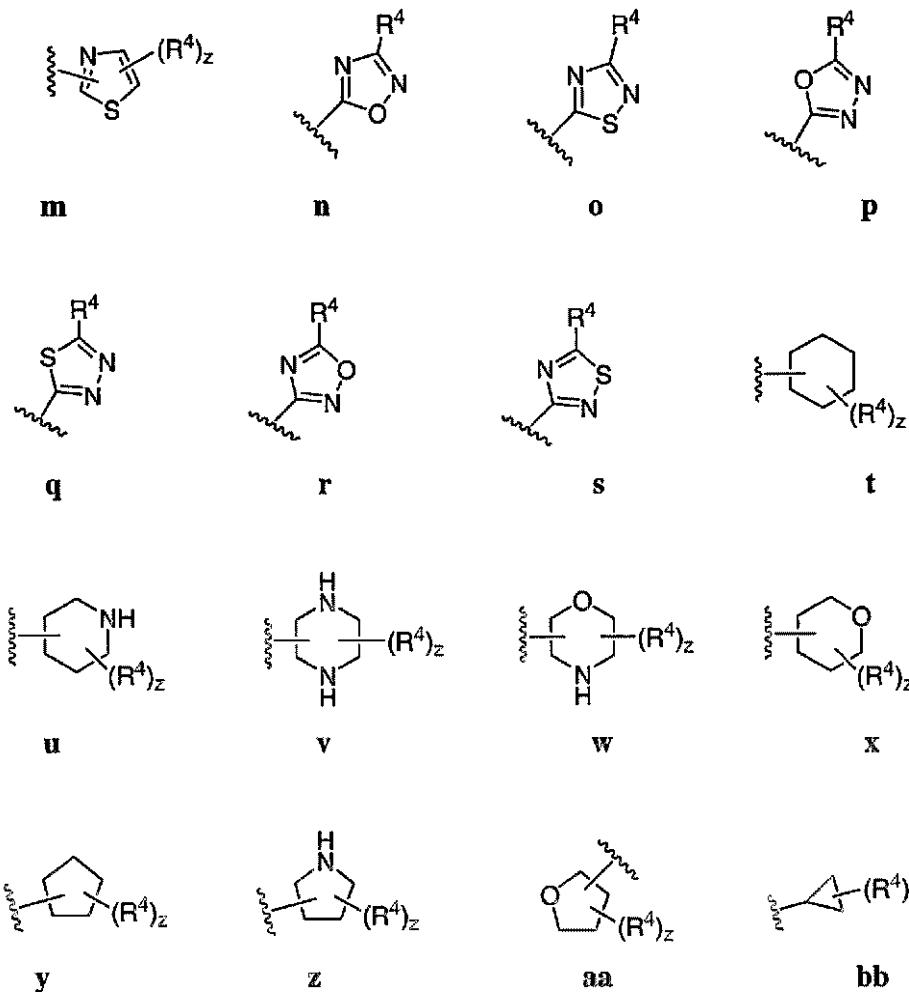
より選択される、組成物。

【請求項 224】

請求項 214 または請求項 220 に記載の組成物であって、ここで、 C_y^1 が、以下：
【化 47】



【化48】

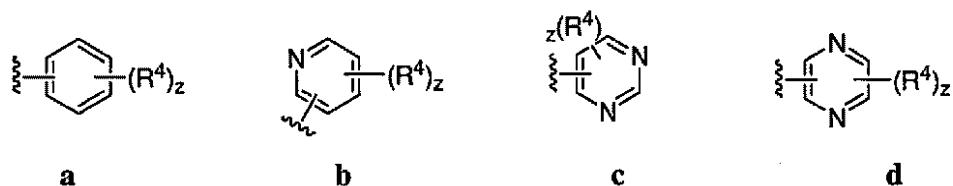


である、組成物。

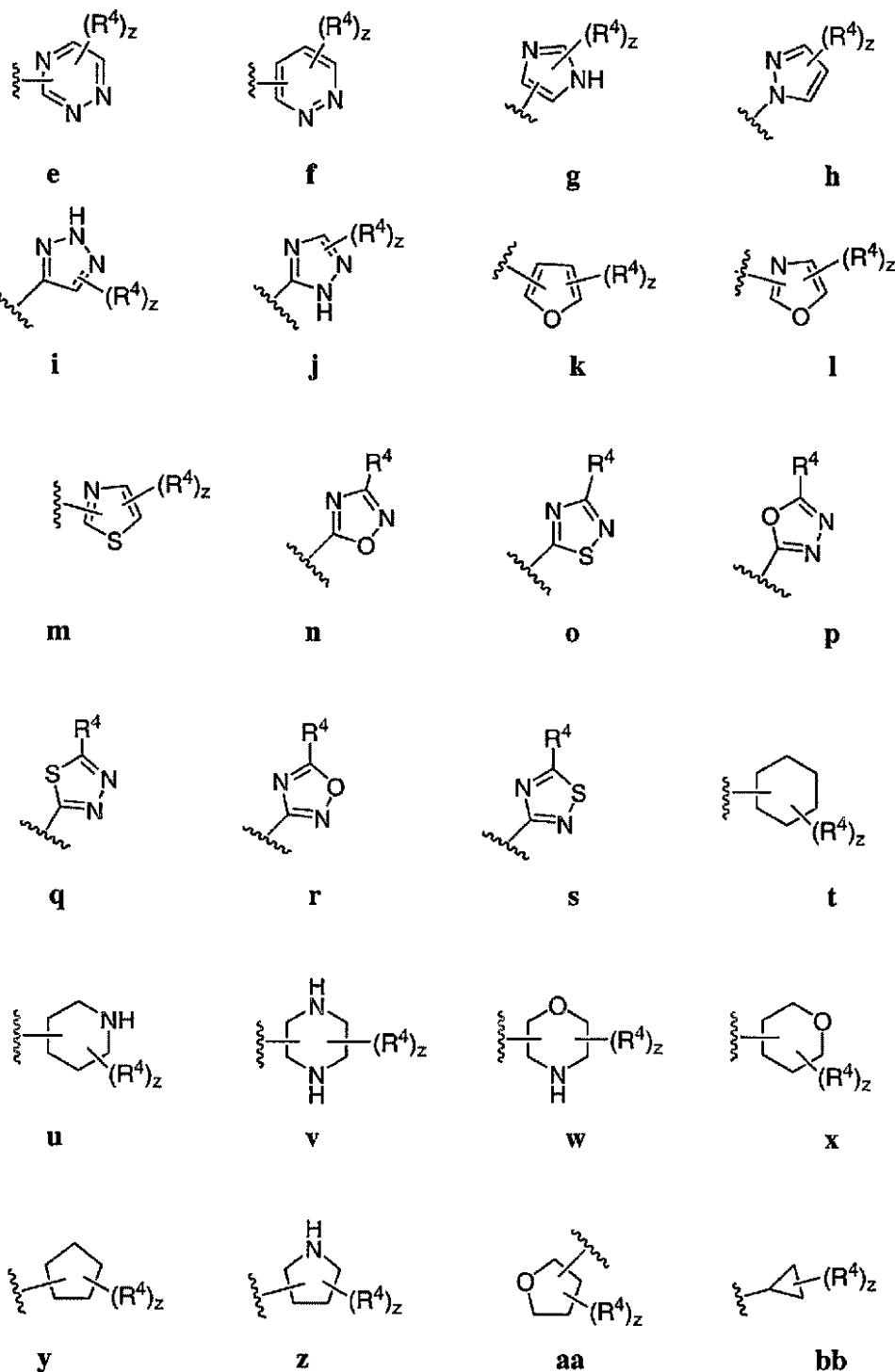
【請求項225】

請求項214または請求項220に記載の組成物であって、ここで、 R^1 が、水素または必要に応じて置換された $C_1 \sim C_4$ 脂肪族基であり、そして R^2 が、 $-CH_2-$ Cy^1 であり、ここで、 Cy^1 が、以下：

【化49】



【化50】



である、組成物。

【請求項226】

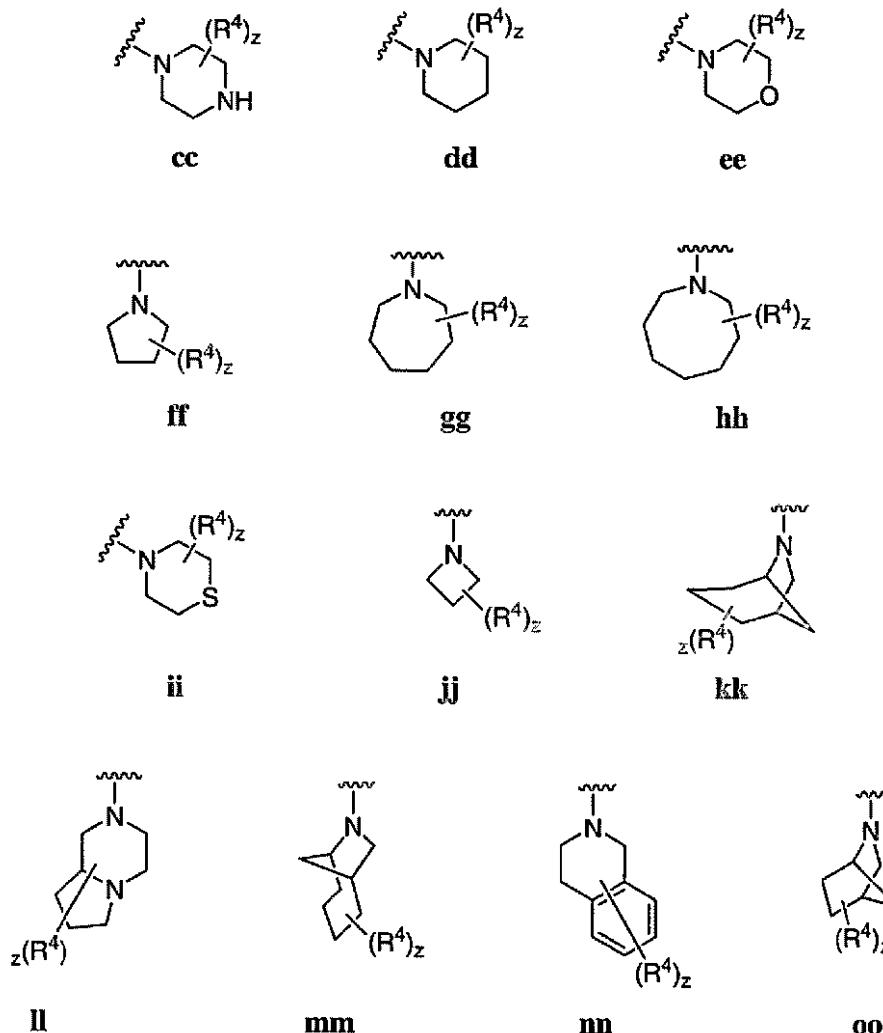
請求項214または請求項220に記載の組成物であって、ここで、R¹基およびR²基が、各々独立して、必要に応じて置換されたC₁~₄脂肪族基であり、そして、各々独立して、必要に応じて置換されたメチル、エチル、シクロプロピル、n-プロピル、プロペニル、シクロブチル、(CO)OCH₂CH₃、(CH₂)₂OCH₃、CH₂CO)OCH₂CH₃、CH₂(CO)OCH₃、CH(CH₃)CH₂CH₃、またはn-ブチルより選択される、組成物。

【請求項227】

請求項214または請求項220に記載の組成物であって、ここで、R¹およびR²は

、これらが結合する窒素原子と一緒にになって、必要に応じて置換された3員～12員の複素環を形成し、該環が、窒素または酸素より独立して選択される1個～3個のヘテロ原子を有し、そして、以下：

【化51】



より選択される3員～12員の複素環基を形成し、ここで、一緒にになったR¹およびR²より形成される該環が、1個以上の置換可能な炭素原子、窒素原子、もしくは硫黄原子において、-R⁴のz個の独立した存在で必要に応じて置換され、そして、zが0～5である、組成物。

【請求項228】

請求項214または請求項220に記載の組成物であって、ここで、一緒にになったR¹およびR²が、アゼチジン-1-イル(jj)、ピロリジン-1-イル(ff)、ピペリジン-1-イル(dd)、ピペラジン-1-イル(cc)、またはモルホリン-4-イル(ee)より選択される、必要に応じて置換された環である、組成物。

【請求項229】

請求項214または請求項220に記載の組成物であって、ここで、一緒にになったR¹およびR²が、アゼチジン-1-イル(jj)、ピロリジン-1-イル(ff)、ピペリジン-1-イル(dd)、またはピペラジン-1-イル(cc)より選択される、必要に応じて置換された環である、組成物。

【請求項230】

請求項214または請求項220に記載の組成物であって、ここで、zが0～5であり、そして、R⁴が存在する場合、各々独立して、ハロゲン、CN、NO₂、-N(R')₂、-CH₂N(R')₂、-OR'、-CH₂OR'、-SR'、-CH₂SR'、-

COOR' 、 $-\text{NRCOR}'$ 、 $-\text{CON}(\text{R}')_2$ 、 $-\text{OCON}(\text{R}')_2$ 、 COR' 、 $-\text{NHCOOR}'$ 、 $-\text{SO}_2\text{R}'$ 、 $-\text{SO}_2\text{N}(\text{R}')_2$ 、または、必要に応じて置換された基であって、該基が、C₁～C₆脂肪族、アリール、ヘテロアリール、シクロ脂肪族、ヘテロシクロ脂肪族、アリールC₁～C₆アルキル、ヘテロアリールC₁～C₆アルキル、シクロ脂肪族C₁～C₆アルキル、もしくはヘテロシクロ脂肪族C₁～C₆アルキルより選択される、組成物。

【請求項 231】

請求項 214または請求項 220に記載の組成物であって、ここで、z が 0～5 であり、そして、R⁴ 基は、各々独立して、Cl、Br、F、CF₃、CH₃、-CH₂CH₃、CN、-COOH、-N(CH₃)₂、-N(Et)₂、-N(iPr)₂、-O(CH₂)₂OCH₃、-CONH₂、-COOCH₃、-OH、-CH₂OH、-NHCOCH₃、-SO₂NH₂、-SO₂(CH₂)₃CH₃、-SO₂CH(CH₃)₂、-SO₂N(CH₃)₂、-SO₂CH₂CH₃、-C(O)OCH₂CH(CH₃)₂、-C(O)NHC₂CH(CH₃)₂、-NHCOOCH₃、-C(O)C(CH₃)₃、-COO(CH₂)₂CH₃、-C(O)NHC₂CH(CH₃)₂、-C(O)CH₂CH₃、または、必要に応じて置換された基であって、該基が、-ピペリジニル(piperidinyl)、ピペリジニル(piperazine)、モルホリノ、C₁～₄アルコキシ、フェニル、フェニルオキシ、ベンジル、ベンジルオキシ、-CH₂シクロヘキシル、ピリジル、-CH₂ピリジル、もしくは-CH₂チアゾリルより選択される、組成物。

【請求項 232】

請求項 214または請求項 220に記載の組成物であって、ここで、一緒になった R¹ および R² が、以下：

- a) z が 1 もしくは 2 であり、そして少なくとも 1 個の R⁴ の存在が、-NRSO₂R'、-NRCOOR'、もしくは-NRCOR' である、必要に応じて置換されたアゼチジン-1-イル(jj)；
- b) z が 1 であり、そして R⁴ が、-NRSO₂R' である、必要に応じて置換されたアゼチジン-1-イル(jj)；
- c) z が 1 であり、そして R⁴ が、-NRCOOR' である、必要に応じて置換されたアゼチジン-1-イル(jj)；
- d) z が 1 であり、そして R⁴ が、-NRCOR' である、必要に応じて置換されたアゼチジン-1-イル(jj)；
- e) z が 1 もしくは 2 であり、そして R⁴ が、Cl、Br、F、CF₃、CH₃、-CH₂CH₃、-OR'、もしくは-CH₂OR' である、必要に応じて置換されたピロリジン-1-イル(ff)；
- f) z が 1 または 2 であり、そして少なくとも 1 個の R⁴ の存在が、Cl、Br、F、CF₃、CH₃、-CH₂CH₃、-OR'、もしくは-CH₂OR'、-NRSO₂R'、-NRCOOR'、または-OCON(R')₂ である、必要に応じて置換されたピペリジン-1-イル(dd)；
- g) z が 1 であり、そして R⁴ が F、CF₃、CH₃、-CH₂CH₃、-OR'、もしくは-CH₂OR' である、必要に応じて置換されたピペリジン-1-イル(dd)；
- h) z が 1 であり、そして R⁴ が、-NRSO₂R' である、必要に応じて置換されたピペリジン-1-イル(dd)；
- i) z が 1 であり、そして R⁴ が、-NRCOOR' である、必要に応じて置換されたピペリジン-1-イル(dd)；
- j) z が 1 または 2 であり、そして少なくとも 1 個の R⁴ の存在が、-SOR'、-CON(R')₂、-SO₂N(R')₂、-COR'、もしくは-COOR' である、必要に応じて置換されたピペラジン-1-イル(cc)；
- k) z が 1 であり、そして R⁴ が、-SOR' である、必要に応じて置換されたピペラ

ジン - 1 - イル (c c) ;

l) z が 1 であり、そして R⁴ が、 - COOR' である、必要に応じて置換されたピペラジン - 1 - イル (c c) ;

m) z が 1 であり、そして R⁴ が、 - CON(R')₂ である、必要に応じて置換されたピペラジン - 1 - イル (c c) ;

n) z が 1 であり、そして R⁴ が、 - SO₂N(R')₂ である、必要に応じて置換されたピペラジン - 1 - イル (c c) ; あるいは、

o) z が 1 であり、そして R⁴ が、 - COR' である、必要に応じて置換されたピペラジン - 1 - イル (c c) ;

より選択される、組成物。

【請求項 233】

請求項 214 または請求項 220 に記載の組成物であって、ここで、x が 0 ~ 4 であり、そして R³ 基が、存在する場合、各々独立して、ハロゲン、CN、NO₂、-N(R')₂、-CH₂N(R')₂、-OR'、-CH₂OR'、-SR'、-CH₂SR'、-COOR'、-NRCOR'、-CON(R')₂、-OCON(R')₂、COR'、-NHCOOR'、-SO₂R'、-SO₂N(R')₂、または、必要に応じて選択された基であって、該基が、C₁ ~ C₆ 脂肪族、アリール、ヘテロアリール、シクロ脂肪族、ヘテロシクロ脂肪族、アリール C₁ ~ C₆ アルキル、ヘテロアリール C₁ ~ C₆ アルキル、シクロ脂肪族 C₁ ~ C₆ アルキル、もしくはヘテロシクロ脂肪族 C₁ ~ C₆ アルキルより選択される基である、組成物。

【請求項 234】

請求項 214 または請求項 220 に記載の組成物であって、ここで、x が 1 または 2 であり、そして R³ の各存在が、独立して、Cl、Br、F、CF₃、-OCF₃、Me、Et、CN、-COOH、-NH₂、-N(CH₃)₂、-N(Et)₂、-N(iPr)₂、-O(CH₂)₂OCH₃、-CONH₂、-COOCH₃、-OH、-OCH₃、-OCH₂CH₃、-CH₂OH、-NHCOCH₃、-NHCOCH(CH₃)₂、-SO₂NH₂、-CONH(シクロプロピル)、-CONHCH₃、-C(O)NHC₂CH₃、または、必要に応じて置換された基であって、該基が、-ピペリジニル(piperidinyl)、ピペリジニル(piperizinyl)、モルホリノ、フェニル、フェニルオキシ、ベンジル、もしくはベンジルオキシより選択される、組成物。

【請求項 235】

請求項 214 または請求項 220 に記載の組成物であって、ここで、x が 1 または 2 であり、そして、各 R³ 基が、独立して、ハロゲン、CN、必要に応じて置換された C₁ ~ C₆ アルキル、OR'、N(R')₂、CON(R')₂、または NRCOR' である、組成物。

【請求項 236】

請求項 214 または請求項 220 に記載の組成物であって、ここで、x が 1 または 2 であり、そして、各 R³ 基が、-Cl、-CH₃、-CH₂CH₃、-F、-CF₃、-OC
F₃、-CONHCH₃、-CONHCH₂CH₃、-CONH(シクロプロピル)、-OCH₃、-NH₂、-OCH₂CH₃、または-CN である、組成物。

【請求項 237】

請求項 214 または請求項 220 に記載の組成物であって、ここで、x が 1 であり、そして、R³ が、前記キナゾリン環の 6 位に存在し、-Cl、-CH₃、-CH₂CH₃、-F、-CF₃、-OCF₃、-CONHCH₃、-CONHCH₂CH₃、-CONH(シクロプロピル)、-OCH₃、-NH₂、-OCH₂CH₃、または-CN である、組成物。

【請求項 238】

請求項 214 または請求項 220 に記載の組成物であって、ここで、x が 1 であり、そして、R³ が、前記キナゾリン環の 7 位に存在し、-Cl、-CH₃、-CH₂CH₃、

- F、- CF₃、- OC₂F₃、- CONHCH₃、- CONHCH₂CH₃、- CONH
(シクロプロピル)、- OCH₃、- NH₂、- OCH₂CH₃、または- CNである、組成物。

【請求項 239】

請求項 214または請求項 220に記載の組成物であって、ここで、xが1であり、そして、R³が、前記キナゾリン環の6位に存在し、- C1、- CH₃、- CH₂CH₃、- F、- CF₃、- OC₂F₃、- OCH₃、または- OCH₂CH₃である、組成物。

【請求項 240】

請求項 214または請求項 220に記載の組成物であって、ここで、xが1であり、そして、R³が、前記キナゾリン環の7位に存在し、- C1、- CH₃、- CH₂CH₃、- F、- CF₃、- OC₂F₃、- OCH₃、または- OCH₂CH₃である、組成物。

【請求項 241】

請求項 214または請求項 220に記載の組成物であって、ここで、xが1であり、そして、R³が、前記キナゾリン環の6位に存在し、そして- CON(R')₂またはNR COR'である、組成物。

【請求項 242】

請求項 214または請求項 220に記載の組成物であって、ここで、xが1であり、そして、R³が、前記キナゾリン環の7位に存在し、そして- CON(R')₂またはNR COR'である、組成物。

【請求項 243】

請求項 214または請求項 220に記載の組成物であって、ここで、yが0～5であり、そしてqが0～2であり、そしてR⁵基およびR^{5a}基が、存在する場合、各々独立して、ハロゲン、CN、NO₂、- N(R')₂、- CH₂N(R')₂、- OR'、- CH₂OR'、- SR'、- CH₂SR'、- NR COR'、- CON(R')₂、- S(O)₂N(R')₂、- OCOR'、- COR'、- CO₂R'、- OCON(R')₂、- NR'SO₂R'、- OP(O)(OR')₂、- P(O)(OR')₂、- OP(O)₂OR'、- P(O)₂OR'、- PO(R')₂、- OPO(R')₂、または、必要に応じて選択される基であって、該基が、C₁～C₆脂肪族、アリール、ヘテロアリール、シクロ脂肪族、ヘテロシクロ脂肪族、アリールC₁～C₆アルキル、ヘテロアリールC₁～C₆アルキル、シクロ脂肪族C₁～C₆アルキル、もしくはヘテロシクロ脂肪族C

C₁～C₆アルキルより選択される基である、組成物。

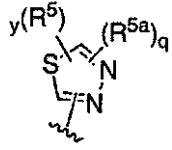
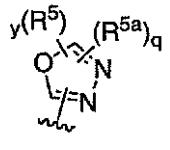
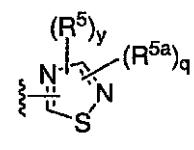
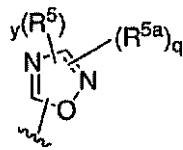
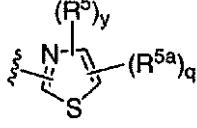
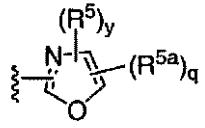
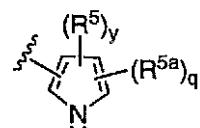
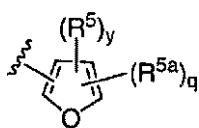
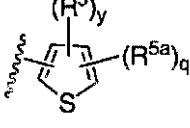
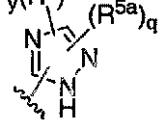
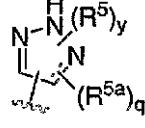
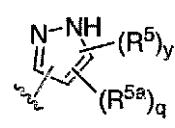
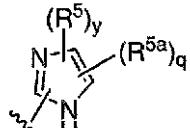
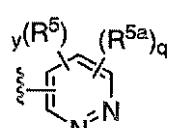
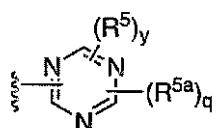
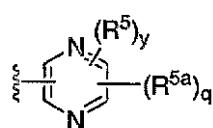
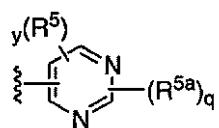
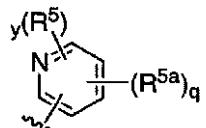
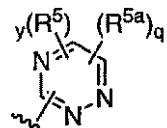
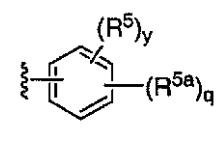
【請求項 244】

請求項 214または請求項 220の組成物であって、ここで、qが1であり、そしてyが0または1であり、そしてR^{5a}がF、OR'、またはOHである、組成物。

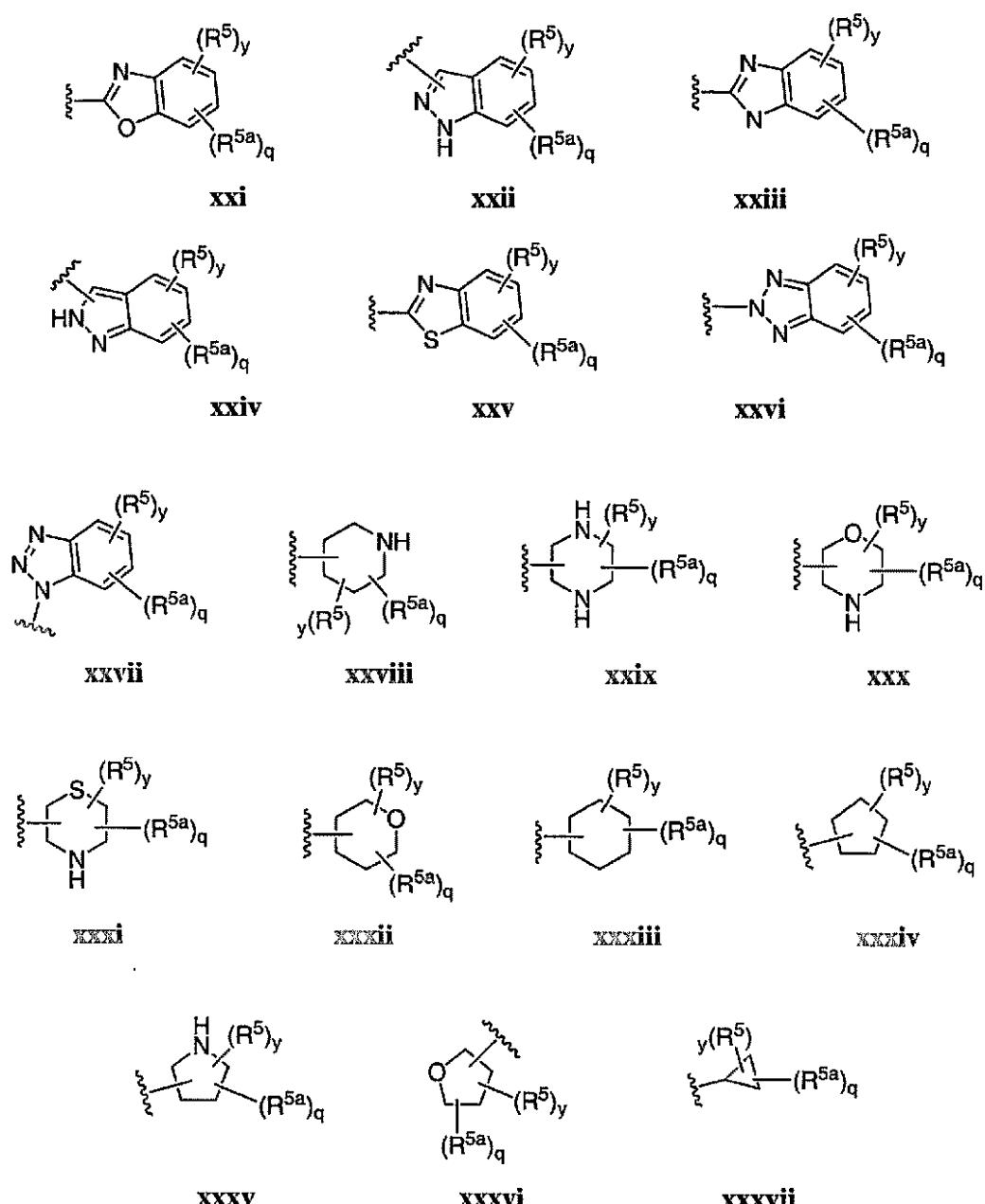
【請求項 245】

請求項 214または請求項 220に記載の組成物であって、ここで、環Aが、以下：

【化 5 2】



【化53】



より選択される、組成物。

【請求項246】

請求項214または請求項220に記載の組成物であって、ここで、環Aが、必要に応じて置換されたフェニル、2-ピリジル、3-ピリジル、もしくは4-ピリジル、またはピロール-1-イルより選択される、組成物。

【請求項247】

請求項214または請求項220に記載の組成物であって、請求項1～請求項211のいずれか1項に記載の化合物を含有する、組成物。

【請求項248】

請求項220または請求項247に記載の組成物であって、NaV1.3またはNaV1.8の活性を阻害するのに適している、組成物。

【請求項249】

請求項220または請求項247に記載の組成物であって、CaV2.2の活性を阻害するのに適している、組成物。

【請求項 250】

請求項220または請求項247に記載の組成物であって、Navy1.8およびCav2.2の活性を阻害するのに適している、組成物。

【請求項 251】

請求項220または請求項247に記載の組成物であって、Navy1.8の活性を阻害するのに適している、組成物。