

【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22年7月29日(2010.7.29)

【公表番号】特表2006-505509(P2006-505509A)

【公表日】平成18年2月16日(2006.2.16)

【年通号数】公開・登録公報2006-007

【出願番号】特願2004-521770(P2004-521770)

【国際特許分類】

C 0 7 D 239/94 (2006.01)

A 6 1 K 31/517 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

A 6 1 K 31/5383 (2006.01)

A 6 1 K 31/553 (2006.01)

A 6 1 K 31/7064 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

C 0 7 D 401/12 (2006.01)

C 0 7 D 403/12 (2006.01)

C 0 7 D 405/12 (2006.01)

C 0 7 D 413/12 (2006.01)

C 0 7 D 413/14 (2006.01)

C 0 7 D 417/12 (2006.01)

C 0 7 D 417/14 (2006.01)

C 0 7 D 451/02 (2006.01)

C 0 7 D 451/04 (2006.01)

C 0 7 D 471/04 (2006.01)

C 0 7 D 487/04 (2006.01)

C 0 7 D 493/04 (2006.01)

C 0 7 D 493/14 (2006.01)

C 0 7 D 493/20 (2006.01)

C 0 7 D 495/04 (2006.01)

C 0 7 D 498/04 (2006.01)

C 0 7 D 513/04 (2006.01)

C 0 7 H 17/02 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 239/94 C S P

A 6 1 K 31/517

A 6 1 K 31/5377

A 6 1 K 31/5383

A 6 1 K 31/553

A 6 1 K 31/7064

A 6 1 P 35/00

C 0 7 D 401/12

C 0 7 D 403/12

C 0 7 D 405/12

C 0 7 D 413/12

C 0 7 D 413/14

C 0 7 D 417/12

C 0 7 D 417/14

C 0 7 D 451/02

C 0 7 D 451/04
 C 0 7 D 471/04 1 1 2 Z
 C 0 7 D 471/04 1 1 7 Z
 C 0 7 D 487/04 1 4 0
 C 0 7 D 493/04 1 0 1 C
 C 0 7 D 493/14
 C 0 7 D 493/20
 C 0 7 D 495/04 1 0 3
 C 0 7 D 498/04 1 1 1
 C 0 7 D 513/04 3 0 1
 C 0 7 H 17/02
 C 0 7 D 498/04 1 1 2 Q

【誤訳訂正書】

【提出日】平成22年6月9日(2010.6.9)

【誤訳訂正1】

【訂正対象書類名】特許請求の範囲

【訂正対象項目名】全文

【訂正方法】変更

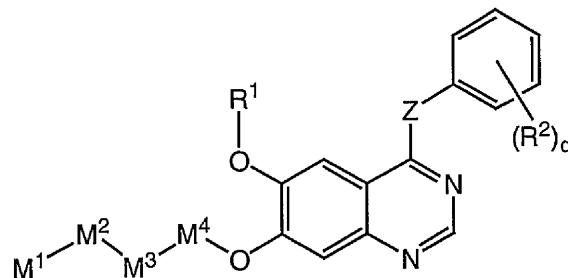
【訂正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

チロシンキナーゼ活性をモジュレーションするための次式 I の化合物：

化学式 I



I

またはその単一の幾何異性体、立体異性体、ラセミ体、鏡像異性体、もしくはジアステレオ異性体、および、場合によっては、製薬的に許容されるその塩又は水和物

[式中、

R^1 は、場合によっては1個～3個の R^{50} 置換基により置換されている $C_1 \sim C_3$ アルキルであり；

R^2 は、ハロゲン、トリハロメチル、 $-CN$ 、 $-NH_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-OR^3$ 、 $-N(R^3)R^4$ 、 $-S(O)_{0-2}R^4$ 、 $-SO_2N(R^3)R^4$ 、 $-CO_2R^3$ 、 $-C(=O)N(R^3)R^4$ 、 $-N(R^3)SO_2R^4$ 、 $-N(R^3)C(=O)R^3$ 、 $-N(R^3)CO_2R^4$ 、 $-C(=O)R^3$ 、置換されていてもよい低級アルキル、置換されていてもよい低級アルケニル、および置換されていてもよい低級アルキニルから選択され；

R^3 は、 $-H$ または R^4 であり；

R^4 は、置換されていてもよい低級アルキル、置換されていてもよいアリーール、置換されていてもよい低級アリーールアルキル、置換されていてもよいヘテロシクリル、および置換されていてもよい低級ヘテロシクリルアルキルから選択されるか；または

R^3 および R^4 は、これらの結合相手である共通の窒素と一緒に、置換されていてもよい五員～七員環ヘテロシクリルを形成し、前記の置換されていてもよい五員～七員

環ヘテロシクリルは、N、O、S、およびPから選択される少なくとも1個の追加のヘテロ原子を場合によって含んでおり；

q は、0、1、2、3、4、または5であり；

Z は、 $-OCH_2-$ 、 $-O-$ 、 $-S(O)_{0-2}-$ 、 $-N(R^5)CH_2-$ 、および $-NR^5-$ から選択され；

R^5 は、 $-H$ 、または置換されていてもよい低級アルキルであり；

R^{50} は、 $-H$ 、ハロ、トリハロメチル、 $-OR^3$ 、 $-N(R^3)R^4$ 、 $-S(O)_{0-2}R^4$ 、 $-SO_2N(R^3)R^4$ 、 $-CO_2R^3$ 、 $-C(=O)N(R^3)R^4$ 、 $-C(=NR^{25})N(R^3)R^4$ 、 $-C(=NR^{25})R^4$ 、 $-N(R^3)SO_2R^4$ 、 $-N(R^3)C(O)R^3$ 、 $-NCO_2R^3$ 、 $-C(=O)R^3$ 、置換されていてもよいアルコキシ、置換されていてもよい低級アルキル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよい低級アリールアルキル、置換されていてもよいヘテロシクリル、および置換されていてもよい低級ヘテロシクリルアルキルであるか；または

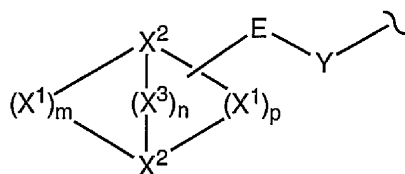
R^{50} のうちの2個が、同じ炭素上で一緒になって、オキソになるか；または

R^{50} のうちの2個が、これらの結合相手である共通の炭素と一緒に、置換されていてもよいは三員～七員環スピロシクリルを形成し、前記の置換されていてもよい三員～七員環スピロシクリルは、N、O、S、およびPから選択される少なくとも1個の追加のヘテロ原子を場合によって含んでおり；

R^{25} は、 $-H$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-OR^3$ 、 $-S(O)_{0-2}R^4$ 、 $-CO_2R^3$ 、置換されていてもよい低級アルキル、置換されていてもよい低級アルケニル、および置換されていてもよい低級アルキニルから選択されており；

M1 - M2 - M3 - M4 は一緒になって次式 I I となる：

化学式 I I



II

〔式中、

X^1 、 X^2 、および場合によっては X^3 は飽和架橋環系の原子を表し、前記架橋環系は X^1 、 X^2 および X^3 の何れかで表される3個以下の環状ヘテロ原子を含み；

各 X^1 は、 $-C(R^6)R^7-$ 、 $-O-$ 、 $-S(O)_{0-2}-$ 、および $-NR^8-$ からそれぞれ独立に選択され；

各 X^2 は、それぞれ独立に、 R^6 で置換されていてもよい架橋先端メチン、または架橋先端窒素であり；

各 X^3 は、 $-C(R^6)R^7-$ 、 $-O-$ 、 $-S(O)_{0-2}-$ 、および $-NR^8-$ からそれぞれ独立に選択され；

但し、 X^1 、 X^2 、および X^3 については、窒素-窒素の環状結合もなければ、ジェミナルな二窒素置換もなく；

E は、 $-NR^9-$ 、 $-O-$ 、および不在から選択され；

Y は、次のいずれかであり、すなわち、

I のキナゾリン環系の7位にある酸素とEとの間の、もしくは、Eが存在しないときには、 X^1 、 X^2 、または X^3 によって表される任意のヘテロ原子との間に少なくとも2個の炭素原子が存在する場合には； I のキナゾリン環系の7位にある酸素とEとの間の C_{1-3} アルキレンリンカーであるか、もしくは、Eが存在しないときには、 X^2 が架橋先端窒素であるときには X^2 以外の、飽和架橋環系の任意の原子とIのキナゾリン環系の7位にある酸素との間の C_{1-3} アルキレンリンカーであるか；または

Yは存在せず、Yが存在しないとき、Eも存在せず；前記の飽和架橋環系は、Iのキナ

ゾリン環系の7位にある酸素に前記飽和架橋環系の炭素原子を介して直接に結合しており；

mおよびpは、それぞれ独立に1から4であり；

nは、0から2であり、nが0であるとき、2個の架橋先端 X^2 間に直接的な一重結合が存在し；

R^6 および R^7 は、-H、ハロゲン、トリハロメチル、-CN、-NH₂、-NO₂、-OR³、-N(R³)R⁴、-S(O)₀₋₂R⁴、-SO₂N(R³)R⁴、-CO₂R³、-C(O)N(R³)R⁴、-N(R³)SO₂R⁴、-N(R³)C(O)R³、-NCO₂R³、-C(O)R³、置換されていてもよい低級アルキル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよい低級アリールアルキル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよい低級ヘテロシクリルアルキルからそれぞれ独立に選択されるか；または

R^6 および R^7 は、一緒になってオキソになるか；または

R^6 および R^7 は、これらの結合相手である共通の炭素原子と一緒に、置換されていてもよい三員～七員環スピロシクリルを形成し、前記の置換されていてもよい三員～七員環スピロシクリルは、N、O、S、およびPから選択された少なくとも1個の追加のヘテロ原子を含んでいてもよく；

R^8 は、 R^3 、-SO₂N(R³)R⁴、-CO₂R³、-C(O)N(R³)R⁴、-SO₂R⁴、および-C(O)R³から選択され；

R^9 は、-Hまたは置換されていてもよい低級アルキルであり；

但し、

YがC₁₋₃アルキレンリンカーであり、Eが存在せず、Zが-NH-または-N(C₁₋₃H₃)-であり、R¹が、C₁₋₃アルキルであり、R²が、-Hまたはハロゲンであり、n=0であり、

かつ：

飽和架橋環系の両方の架橋先端原子 X^2 と合わさって、飽和架橋環系の一本の架橋の原子 X^1 がピロリジン環またはペリリジン環を表し、前記ピロリジン環または前記ペリリジン環の任意の原子 X^1 または X^2 が、Yに結合しているならば、

前記飽和架橋環系の他の架橋は、-OC(O)CH₂-、-CH₂OC(O)-、-OC(O)CH₂CH₂-、-CH₂OC(O)CH₂-、-CH₂CH₂OC(O)-、-OC(O)CH₂NH-、-OC(O)CH₂N(C₁₋₄アルキル)-、および-OC(O)CH₂O-のうちの何れの1種にもなることはできないか；あるいは

飽和架橋環系の両方の架橋先端原子 X^2 と合わさって、飽和架橋環系の一本の架橋の原子 X^1 がピペラジン環または4-(C₁₋₄アルキル)-ピペラジン環を表し、前記ピペラジン環または前記4-(C₁₋₄アルキル)-ピペラジン環の任意の原子 X^1 または X^2 は、Yに結合しているならば、

前記飽和架橋環系の他の架橋は、前記ピペラジン環または前記4-(C₁₋₄アルキル)-ピペラジン環の2位および3位を介して結合するときに限り、-CH₂OC(O)CH₂-、-CH₂CH₂OC(O)-のうちの1種になることはできず、前述の2種の架橋はどちらも、1個または2個のC₁₋₂アルキル基で置換されてはならないか；あるいは

飽和架橋環系の両方の架橋先端原子 X^2 と合わさって、飽和架橋環系の一本の架橋の原子 X^1 がピペラジン環を表し、前記ピペラジン環の任意の原子 X^1 または X^2 は、Yに結合しているならば、

前記飽和架橋環系の他の架橋は、前記ピペラジン環の3位および4位を介して結合するとき(そして、-C(O)OCH₂CH₂-、-CH₂OC(O)CH₂-のどちらかが、その左側の末端を介して前記ピペラジン環の3位に結合するとき)に限り、-C(O)OCH₂CH₂-、-CH₂OC(O)CH₂-のうちの1種になることはできず、前述の2種の架橋はどちらも、1個または2個のC₁₋₂アルキル基で置換されてはならないか；あるいは

飽和架橋環系の両方の架橋先端原子 X^2 と合わさって、飽和架橋環系の一本の架橋の原子 X^1 が 2 - オキソモルホリン環を表し、前記 2 - オキソモルホリン環は、その 4 位を介して Y に結合しているならば、

前記飽和架橋環系の他の架橋は、前記 2 - オキソモルホリン環の 5 位および 6 位を介して結合するときに限り、 $-(CH_2)_g-$ 、 $-CH_2WCH_2-$ 、 $-CH_2WCH_2CH_2-$ 、および $-CH_2CH_2WCH_2-$ のうちの 1 種になることはできず、ここで、W は、 $-O-$ 、 $-S(O)_{0-2}-$ 、 $-NH-$ 、または $-N(C_{1-4} \text{アルキル})-$ であり、g は、2、3、または 4 である。]。]

【請求項 2】

Z が $-NR^5-$ である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

R^2 がハロゲン、トリハロメチル、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-OR^3$ 、および置換されていてもよい低級アルキルから選択される、請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 4】

R^1 が置換されていない C_{1-3} アルキルから選択される、請求項 3 に記載の化合物。

【請求項 5】

前記飽和架橋環系が、 $[4.4.0]$ 、 $[4.3.0]$ 、 $[4.2.0]$ 、 $[4.1.0]$ 、 $[3.3.0]$ 、 $[3.2.0]$ 、 $[3.1.0]$ 、 $[3.3.3]$ 、 $[3.3.2]$ 、 $[3.3.1]$ 、 $[3.2.2]$ 、 $[3.2.1]$ 、 $[2.2.2]$ 、および $[2.2.1]$ からなる群から選択された配置を有する、請求項 4 に記載の化合物。

【請求項 6】

Y が、 $-CH_2CH_2-$ 、 $-CH_2-$ 、および不在から選択される、請求項 5 に記載の化合物。

【請求項 7】

q が、1、2、または 3 である、請求項 6 に記載の化合物。

【請求項 8】

R^5 が $-H$ である、請求項 7 に記載の化合物。

【請求項 9】

R^1 がメチルである、請求項 8 に記載の化合物。

【請求項 10】

前記飽和架橋環系が、 $[4.4.0]$ 、 $[4.3.0]$ 、 $[4.2.0]$ 、 $[4.1.0]$ 、 $[3.3.0]$ 、 $[3.2.0]$ 、および $[3.1.0]$ からなる群から選択された配置を有する、請求項 9 に記載の化合物。

【請求項 11】

前記飽和架橋環系が、1 個または 2 個の環状窒素を含み、前記の 1 個または 2 個の環状窒素が、 X^1 のときには $-NR^8-$ から選択され、 X^2 のときには架橋先端窒素である、請求項 10 に記載の化合物。

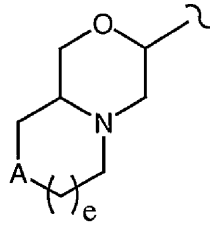
【請求項 12】

E が存在しない、請求項 11 に記載の化合物。

【請求項 13】

前記飽和架橋環系が、次式 I I I :

化学式 I I I



III

[式中、Aは、 $-O-$ 、 $-S(O)_{0-2}-$ 、 $-NR^8-$ 、および不在から選択され；eは、0または1である。]に従う、請求項12に記載の化合物。

【請求項14】

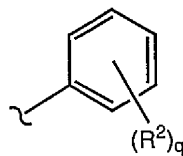
Yが $-CH_2-$ である、請求項13に記載の化合物。

【請求項15】

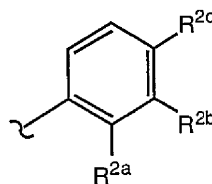
Aが $-NR^8-$ 、 $-O-$ 、および不在から選択され； R^8 が、 $-H$ 、置換されていてもよい低級アルキル、 $-CO_2R^3$ 、 $-C(O)N(R^3)R^4$ 、 $-SO_2R^4$ 、および $-C(O)R^3$ から選択される、請求項14に記載の化合物。

【請求項16】

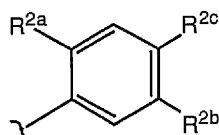
Iの



が



および



から選択され、

R^{2a} 、 R^{2b} 、および R^{2c} が、F、Cl、およびBrからそれぞれ独立に選択される、請求項15に記載の化合物。

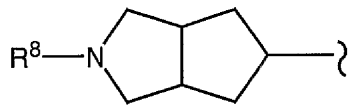
【請求項17】

R^{2a} がFであり、 R^{2b} がClであり、 R^{2c} がClまたはBrである、請求項16に記載の化合物。

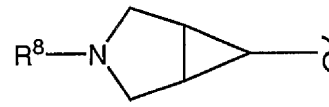
【請求項18】

前記飽和架橋環系が、次式VまたはVI：

化学式V 化学式VI



V



VI

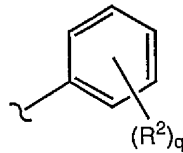
[式中、 R^8 は、 $-H$ 、置換されていてもよい低級アルキル、 $-CO_2R^3$ 、 $-C(O)N(R^3)R^4$ 、 $-SO_2R^4$ 、および $-C(O)R^3$ から選択される。] に従う、請求項 11 に記載の化合物。

【請求項 19】

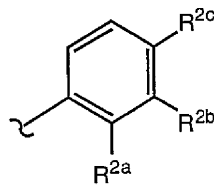
Y が $-CH_2-$ または不在である、請求項 18 に記載の化合物。

【請求項 20】

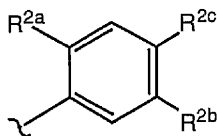
I の



が



および



から選択され、

R^{2a} 、 R^{2b} 、および R^{2c} が、 F 、 Cl 、および Br からそれぞれ独立に選択される、請求項 19 に記載の化合物。

【請求項 21】

R^{2a} が F であり、 R^{2b} が Cl であり、 R^{2c} が Cl または Br である、請求項 20 に記載の化合物。

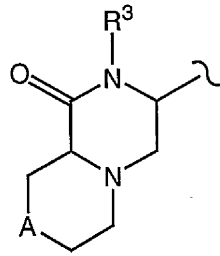
【請求項 22】

R^8 がメチルまたはエチルである、請求項 21 に記載の化合物。

【請求項 23】

前記飽和架橋環系が、次式 VII :

化学式 VII



VII

[式中、Aは、 $-O-$ 、 $-S(O)_{0-2}-$ 、 $-NR^8-$ 、 $-CR^6R^7-$ 、および不在から選択される。]に従う、請求項22に記載の化合物。

【請求項24】

R^3 が、 $-H$ および置換されていてもよいアルキルから選択される、請求項23に記載の化合物。

【請求項25】

Aが $-C(R^6)R^7-$ または不在である、請求項24に記載の化合物。

【請求項26】

Aが $-CH_2-$ または不在である、請求項25に記載の化合物。

【請求項27】

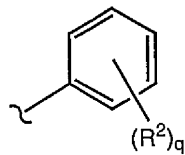
Yが $-CH_2-$ である、請求項26に記載の化合物。

【請求項28】

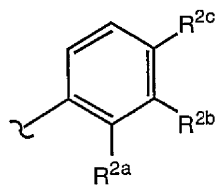
q = 3である、請求項27に記載の化合物。

【請求項29】

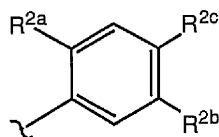
Iの



が



および



から選択され、

R^{2a} 、 R^{2b} 、および R^{2c} が、F、Cl、およびBrからそれぞれ独立に選択される、請求項28に記載の化合物。

【請求項30】

R^{2a} がFであり、 R^{2b} がClであり、 R^{2c} がClまたはBrである、請求項29

に記載の化合物。

【請求項 3 1】

前記飽和架橋環系が、[3 . 3 . 1]、[3 . 2 . 1]、および [2 . 2 . 1] からなる群から選択された配置を有する、請求項 9 に記載の化合物。

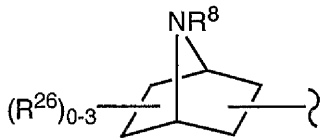
【請求項 3 2】

前記飽和架橋環系が 1 個または 2 個の環状窒素を含み、前記の 1 個または 2 個の環状窒素が、 X^1 のときには $-NR^8-$ から選択され、 X^2 のときには架橋先端窒素である、請求項 3 1 に記載の化合物。

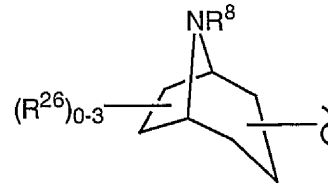
【請求項 3 3】

前記飽和架橋環系が、次式 V I I I または I X :

化学式 V I I I 化学式 I X



VIII



IX

[式中、 R^8 は、 $-H$ 、置換されていてもよい低級アルキル、 $-CO_2R^3$ 、 $-C(O)N(R^3)R^4$ 、 $-SO_2R^4$ 、および $-C(O)R^3$ から選択され； $R^{2,6}$ は、 $C_1 - C_3$ アルキルである。] に従う、請求項 3 2 に記載の化合物。

【請求項 3 4】

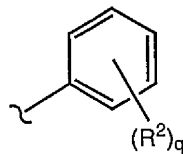
Y が $-CH_2CH_2-$ であり； E が不在または $-N(R^9)-$ である、請求項 3 3 に記載の化合物。

【請求項 3 5】

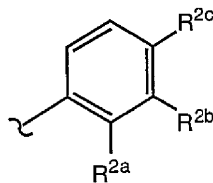
$q = 3$ である、請求項 3 4 に記載の化合物。

【請求項 3 6】

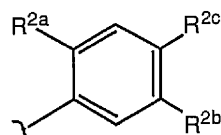
I の



が



および



から選択され、 R^{2a} 、 R^{2b} 、および R^{2c} が、F、Cl、およびBrからそれぞれ独立に選択される、請求項35に記載の化合物。

【請求項37】

R^{2a} がFであり、 R^{2b} がClであり、 R^{2c} がClまたはBrである、請求項36に記載の化合物。

【請求項38】

R^8 がメチルまたはエチルである、請求項37に記載の化合物。

【請求項39】

次の表：

N- (3, 4-ジクロロ-2-フルオロフェニル) -7- ([[(3 a R, 5 r, 6 a S) -2- (1-メチルエチル) オクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル] オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (4-ブロモ-3-クロロ-2-フルオロフェニル) -7- ([[(3 a R, 5 r, 6 a S) -2- (1-メチルエチル) オクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル] オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
7- ([[(3 a R, 5 r, 6 a S) -2-アセチルオクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル] オキシ) -N- (4-ブロモ-3-クロロ-2-フルオロフェニル) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (4-ブロモ-3-クロロ-2-フルオロフェニル) -6- (メチルオキシ) -7- ([[(3 a R, 5 r, 6 a S) -オクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イルメチル] オキシ] キナゾリン-4-アミン;
エチル (3 a R, 6 a S) -5- ([4- [(4-ブロモ-3-クロロ-2-フルオロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] オキシ] メチル) ヘキサヒドロシクロペンタ [c] ピロール-2 (1H) -カルボキシレート;
N- (4-ブロモ-3-クロロ-2-フルオロフェニル) -6- (メチルオキシ) -7- ([[(3 a R, 5 r, 6 a S) -2- (メチルスルフォニル) オクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル] オキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (3, 4-ジクロロ-2-フルオロフェニル) -7- ([[(3 a R, 5 r, 6 a S) -2-エチルオクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル] オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (3, 4-ジクロロ-2-フルオロフェニル) -6- (メチルオキシ) -7- ([[(3 a R, 5 r, 6 a S) -2- (2-メチルプロピル) オクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル] オキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (3, 4-ジクロロ-2-フルオロフェニル) -7- ([[(3 a R, 5 s, 6 a S) -2-メチルオクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル] オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (4-ブロモ-3-クロロ-2-フルオロフェニル) -7- ([[(3 a R, 5 s, 6 a S) -2-メチルオクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル] オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (3-クロロ-2, 4-ジフルオロフェニル) -7- ([[(3 a R, 5 s, 6 a S) -2-メチルオクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル] オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;

N- (4, 5-ジクロロ-2-フルオロフェニル) -7- ([(3 a R, 5 s, 6 a S) -2-メチルオクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル} オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (4-ブロモ-5-クロロ-2-フルオロフェニル) -7- ([(3 a R, 5 s, 6 a S) -2-メチルオクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル} オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (4-ブロモ-2, 3-ジクロロフェニル) -7- ([(3 a R, 5 s, 6 a S) -2-メチルオクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル} オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (3, 4-ジクロロフェニル) -7- ([(3 a R, 5 s, 6 a S) -2-メチルオクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル} オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (4-ブロモ-3-クロロ-2-フルオロフェニル) -7- ([(3 a R, 5 r, 6 a S) -2-エチルオクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル} オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (4-ブロモ-3-クロロ-2-フルオロフェニル) -6- (メチルオキシ) -7- ([(3 a R, 5 r, 6 a S) -2- (2-メチルプロピル) オクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル} オキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (4-ブロモ-2, 3-ジクロロフェニル) -7- {(3 R, 9 a S) -ヘキサヒドロ-1H- [1, 4] オキサジノ [3, 4-c] [1, 4] オキサジン-3-イルメチル} オキシ} -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (4, 5-ジクロロ-2-フルオロフェニル) -7- {(3 R, 9 a S) -ヘキサヒドロ-1H- [1, 4] オキサジノ [3, 4-c] [1, 4] オキサジン-3-イルメチル} オキシ} -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (4-ブロモ-5-クロロ-2-フルオロフェニル) -7- {(3 R, 9 a S) -ヘキサヒドロ-1H- [1, 4] オキサジノ [3, 4-c] [1, 4] オキサジン-3-イルメチル} オキシ} -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (3-クロロ-2, 4-ジフルオロフェニル) -7- {(3 R, 9 a S) -ヘキサヒドロ-1H- [1, 4] オキサジノ [3, 4-c] [1, 4] オキサジン-3-イルメチル} オキシ} -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (3, 4-ジクロロ-2-フルオロフェニル) -7- {(3 S, 9 a S) -ヘキサヒドロ-1H- [1, 4] オキサジノ [3, 4-c] [1, 4] オキサジン-3-イルメチル} オキシ} -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;

N-(4-ブromo-3-クロロ-2-フルオロフェニル)-7-[[[(3S, 9aS)-ヘキサヒドロ-1H-[1, 4]オキサジノ[3, 4-c][1, 4]オキサジン-3-イルメチル]オキシ]-6-(メチルオキシ)キナゾリン-4-アミン;
N-(3-クロロ-2, 4-ジフルオロフェニル)-7-[[[(3S, 9aS)-ヘキサヒドロ-1H-[1, 4]オキサジノ[3, 4-c][1, 4]オキサジン-3-イルメチル]オキシ]-6-(メチルオキシ)キナゾリン-4-アミン;
N-(3, 4-ジクロロフェニル)-7-[(ヘキサヒドロ-1H-[1, 4]オキサジノ[3, 4-c][1, 4]オキサジン-3-イルメチル)オキシ]-6-(メチルオキシ)キナゾリン-4-アミン;
N-(4, 5-ジクロロ-2-フルオロフェニル)-7-[[[(3S, 9aS)-ヘキサヒドロ-1H-[1, 4]オキサジノ[3, 4-c][1, 4]オキサジン-3-イルメチル]オキシ]-6-(メチルオキシ)キナゾリン-4-アミン;
N-(4-ブromo-2, 3-ジクロロフェニル)-7-[[[(3S, 9aS)-ヘキサヒドロ-1H-[1, 4]オキサジノ[3, 4-c][1, 4]オキサジン-3-イルメチル]オキシ]-6-(メチルオキシ)キナゾリン-4-アミン;
N-(4-ブromo-5-クロロ-2-フルオロフェニル)-7-[[[(3S, 9aS)-ヘキサヒドロ-1H-[1, 4]オキサジノ[3, 4-c][1, 4]オキサジン-3-イルメチル]オキシ]-6-(メチルオキシ)キナゾリン-4-アミン;
N-(3, 4-ジクロロ-2-フルオロフェニル)-7-[[[(3R, 9aS)-ヘキサヒドロ-1H-[1, 4]オキサジノ[3, 4-c][1, 4]オキサジン-3-イルメチル]オキシ]-6-(メチルオキシ)キナゾリン-4-アミン;
N-(4-ブromo-3-クロロ-2-フルオロフェニル)-7-[[[(3R, 9aS)-ヘキサヒドロ-1H-[1, 4]オキサジノ[3, 4-c][1, 4]オキサジン-3-イルメチル]オキシ]-6-(メチルオキシ)キナゾリン-4-アミン;
N-(3, 4-ジクロロフェニル)-7-[[[(3R, 8aR)-ヘキサヒドロ-1H-ピロロ[2, 1-c][1, 4]オキサジン-3-イルメチル]オキシ]-6-(メチルオキシ)キナゾリン-4-アミン;
N-(4-ブromo-5-クロロ-2-フルオロフェニル)-7-[[[(3S, 8aS)-ヘキサヒドロ-1H-ピロロ[2, 1-c][1, 4]オキサジン-3-イルメチル]オキシ]-6-(メチルオキシ)キナゾリン-4-アミン;
N-(3, 4-ジクロロフェニル)-7-[[[(3S, 8aR)-ヘキサヒドロ-1H-ピロロ[2, 1-c][1, 4]オキサジン-3-イルメチル]オキシ]-6-(メチルオキシ)キナゾリン-4-アミン;

N-(3, 4-ジクロロフェニル)-7- {[(3 S, 8 a S) -ヘキサヒドロ-1H-ピロロ [2, 1-c] [1, 4] オキサジン-3-イルメチル] オキシ} -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N-(3, 4-ジクロロフェニル)-7- {[(3 R, 8 a S) -ヘキサヒドロ-1H-ピロロ [2, 1-c] [1, 4] オキサジン-3-イルメチル] オキシ} -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N-(3, 4-ジクロロ-2-フルオロフェニル)-7- {[(3 S, 8 a S) -ヘキサヒドロ-1H-ピロロ [2, 1-c] [1, 4] オキサジン-3-イルメチル] オキシ} -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N-(4-ブromo-3-クロロ-2-フルオロフェニル)-7- {[(3 S, 8 a S) -ヘキサヒドロ-1H-ピロロ [2, 1-c] [1, 4] オキサジン-3-イルメチル] オキシ} -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N-(3-クロロ-2, 4-ジフルオロフェニル)-7- {[(3 S, 8 a S) -ヘキサヒドロ-1H-ピロロ [2, 1-c] [1, 4] オキサジン-3-イルメチル] オキシ} -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N-(4-ブromo-2, 3-ジクロロフェニル)-7- {[(3 S, 8 a S) -ヘキサヒドロ-1H-ピロロ [2, 1-c] [1, 4] オキサジン-3-イルメチル] オキシ} -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N-(4, 5-ジクロロ-2-フルオロフェニル)-7- {[(3 S, 8 a S) -ヘキサヒドロ-1H-ピロロ [2, 1-c] [1, 4] オキサジン-3-イルメチル] オキシ} -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
(3 S, 9 a S) -3- ([4- [(3, 4-ジクロロ-2-フルオロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] オキシ) メチル) ヘキサヒドロ-2H-ピリド [1, 2-a] ピラジン-1 (6H) -オン;
(3 S, 9 a R) -3- ([4- [(3, 4-ジクロロ-2-フルオロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] オキシ) メチル) ヘキサヒドロ-2H-ピリド [1, 2-a] ピラジン-1 (6H) -オン;
(3 S, 8 a S) -3- ([4- [(3, 4-ジクロロ-2-フルオロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] オキシ) メチル) ヘキサヒドロピロロ [1, 2-a] ピラジン-1 (2H) -オン;
(3 S, 8 a R) -3- ([4- [(3, 4-ジクロロ-2-フルオロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] オキシ) メチル) ヘキサヒドロピロロ [1, 2-a] ピラジン-1 (2H) -オン;

(3 S, 8 a S) - 3 - ({[4 - [(4-ブロモ-3-クロロ-2-フルオロフェニル) アミノ] - 6 - (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] オキシ} メチル) ヘキサヒドロピロロ [1, 2-a] ピラジン-1 (2 H) -オン;
(3 S, 8 a S) - 3 - ({[4 - [(3, 4-ジクロロ-2-フルオロフェニル) アミノ] - 6 - (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] オキシ} メチル) - 2 - メチルヘキサヒドロピロロ [1, 2-a] ピラジン-1 (2 H) -オン;
N - (3, 4-ジクロロフェニル) - 7 - ({2 - [(8-メチル8-アザビシクロ [3. 2. 1] オクト-3-イル) アミノ] エチル} オキシ) - 6 - (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N - (3, 4-ジクロロフェニル) - 6 - (メチルオキシ) - 7 - {[(8 a R) -テトラヒドロ-1 H- [1, 3] チアゾロ [4, 3-c] [1, 4] オキサジン-6-イルメチル] オキシ} キナゾリン-4-アミン;
N - (3, 4-ジクロロフェニル) - 7 - {[2 - (8-メチル8-アザビシクロ [3. 2. 1] オクト-3-イル) エチル] オキシ} - 6 - (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N - (3, 4-ジクロロフェニル) - 7 - {[(8-メチル8-アザビシクロ [3. 2. 1] オクト-3-イル) メチル] オキシ} - 6 - (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N - (3, 4-ジクロロフェニル) - 7 - {[(3 a R, 6 a S) - 2 - メチルオクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] オキシ} - 6 - (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N - (3, 4-ジクロロフェニル) - 7 - [(8-メチル8-アザビシクロ [3. 2. 1] オクト-3-イル) オキシ] - 6 - (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N - (3, 4-ジクロロ-2-フルオロフェニル) - 6 - (メチルオキシ) - 7 - [(オクタヒドロ-2 H-キノリジン-3-イルメチル) オキシ] キナゾリン-4-アミン;
N - (3, 4-ジクロロ-2-フルオロフェニル) - 7 - ({[(3 a R, 6 a S) - 2 - (1-メチルエチル) オクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル} オキシ) - 6 - (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N - (4-ブロモ-3-クロロ-2-フルオロフェニル) - 7 - ({[(3 a R, 6 a S) - 2 - (1-メチルエチル) オクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル} オキシ) - 6 - (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
7 - ({[(3 a R, 6 a S) - 2 - アセチルオクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル} オキシ) - N - (4-ブロモ-3-クロロ-2-フルオロフェニル) - 6 - (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;

N- (4-ブromo-3-クロロ-2-フルオロフェニル) -6- (メチルオキシ) -7- {[(3 a R, 6 a S) -オクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イルメチル] オキシ} キナゾリン-4-アミン;
エチル (3 a R, 5 r, 6 a S) -5- [(4- [(4-ブromo-3-クロロ-2-フルオロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] オキシ) メチル] ヘキサヒドロシクロペンタ [c] ピロール-2 (1 H) -カルボキシレート;
N- (4-ブromo-3-クロロ-2-フルオロフェニル) -6- (メチルオキシ) -7- ([(3 a R, 6 a S) -2- (メチルスルフォニル) オクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル] オキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (3, 4-ジクロロ-2-フルオロフェニル) -7- ([(3 a R, 6 a S) -2- エチルオクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル] オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (3, 4-ジクロロ-2-フルオロフェニル) -6- (メチルオキシ) -7- ([(3 a R, 6 a S) -2- (2-メチルプロピル) オクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール -5-イル] メチル] オキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (3, 4-ジクロロ-2-フルオロフェニル) -7- ([(3 a R, 6 a S) -2- メチルオクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル] オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (3, 4-ジクロロ-2-フルオロフェニル) -7- ([(3 a R, 5 r, 6 a S) -2-メチルオクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル] オキシ) - 6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (4-ブromo-3-クロロ-2-フルオロフェニル) -7- ([(3 a R, 6 a S) -2-メチルオクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル] オキシ) - 6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (4-ブromo-3-クロロ-2-フルオロフェニル) -7- ([(3 a R, 5 r, 6 a S) -2-メチルオクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル] オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (3-クロロ-2, 4-ジフルオロフェニル) -7- ([(3 a R, 6 a S) -2- メチルオクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル] オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (3-クロロ-2, 4-ジフルオロフェニル) -7- ([(3 a R, 5 r, 6 a S) -2-メチルオクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル] オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;

N- (4, 5-ジクロロ-2-フルオロフェニル) -7- ([(3 a R, 6 a S) -2-メチルオクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル} オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (4, 5-ジクロロ-2-フルオロフェニル) -7- ([(3 a R, 5 r, 6 a S) -2-メチルオクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル} オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (4-ブロモ-5-クロロ-2-フルオロフェニル) -7- ([(3 a R, 6 a S) -2-メチルオクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル} オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (4-ブロモ-5-クロロ-2-フルオロフェニル) -7- ([(3 a R, 5 r, 6 a S) -2-メチルオクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル} オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (4-ブロモ-2, 3-ジクロロフェニル) -7- ([(3 a R, 6 a S) -2-メチルオクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル} オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (4-ブロモ-2, 3-ジクロロフェニル) -7- ([(3 a R, 5 r, 6 a S) -2-メチルオクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル} オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (3, 4-ジクロロフェニル) -7- ([(3 a R, 6 a S) -2-メチルオクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル} オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (3, 4-ジクロロフェニル) -7- ([(3 a R, 5 r, 6 a S) -2-メチルオクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル} オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (4-ブロモ-3-クロロ-2-フルオロフェニル) -7- ([(3 a R, 6 a S) -2-エチルオクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル} オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (4-ブロモ-3-クロロ-2-フルオロフェニル) -6- (メチルオキシ) -7- ([(3 a R, 6 a S) -2- (2-メチルプロピル) オクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル} オキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (3, 4-ジクロロフェニル) -7- [(2- {(3-エンド) -8-メチル-8-アザビシクロ [3. 2. 1] オクト-3-イル} アミノ} エチル) オキシ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;

N- (3, 4-ジクロロフェニル) -7- ({2- [(3-エンド) -8-メチル-8-アザビシクロ [3. 2. 1] オクト-3-イル] エチル} オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (3, 4-ジクロロフェニル) -7- ({[(3-エンド) -8-メチル-8-アザビシクロ [3. 2. 1] オクト-3-イル] メチル} オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (3, 4-ジクロロフェニル) -7- {[(3-エキソ) -8-メチル-8-アザビシクロ [3. 2. 1] オクト-3-イル] オキシ} -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
1, 1-ジメチルエチル (3 a R, 6 a S) -5- ({ [4- [(4-ブromo-3-クロロ-2-フルオロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] オキシ} メチル) ヘキサヒドシクロペンタ [c] ピロール-2 (1H) -カルボキシレート;
1, 1-ジメチルエチル (3 a R, 6 a S) -5- ({ [4- [(4-ブromo-5-クロロ-2-フルオロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] オキシ} メチル) ヘキサヒドシクロペンタ- [c] ピロール-2 (1H) -カルボキシレート;
N- (4-ブromo-5-クロロ-2-フルオロフェニル) -6- (メチルオキシ) -7- { [(3 a R, 5 r, 6 a S) -オクタヒドロシクロペンタ- [c] ピロール-5-イルメチル] オキシ} キナゾリン-4-アミン;
1, 1-ジメチルエチル (3 a R, 6 a S) -5- ({ [4- [(3-クロロ-2, 4-ジフルオロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] オキシ} メチル) ヘキサヒドシクロペンタ- [c] ピロール-2 (1H) -カルボキシレート;
N- (3-クロロ-2, 4-ジフルオロフェニル) -7- ({ [(3 a R, 5 r, 6 a S) -オクタヒドロシクロペンタ- [c] ピロール-5-イル] メチル} オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
1, 1-ジメチルエチル (3 a R, 6 a S) -5- ({ [4- [(3, 4-ジクロロ-2-フルオロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] オキシ} メチル) ヘキサヒドシクロペンタ- [c] ピロール-2 (1H) -カルボキシレート;
N- (3, 4-ジクロロ-2-フルオロフェニル) -6- (メチルオキシ) -7- { [[(3 a R, 5 r, 6 a S) -オクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル] オキシ} キナゾリン-4-アミン;
1, 1-ジメチルエチル (3 a R, 6 a S) -5- ({ [4- [(4, 5-ジクロロ-2-フルオロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] オキシ} メチル) ヘキサヒドシクロペンタ- [c] ピロール-2 (1H) -カルボキシレート;

N- (4, 5-ジクロロ-2-フルオロフェニル) -7- ([(3 a R, 5 r, 6 a S) -オクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル} オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
1, 1-ジメチルエチル (3 a R, 6 a S) -5- ([4- [(4-ブromo-2, 3-ジクロロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] オキシ} メチル) ヘキサヒドロシクロペンタ- [c] ピロール-2 (1H) -カルボキシレート;
N- (4-ブromo-2, 3-ジクロロフェニル) -7- ([(3 a R, 5 r, 6 a S) -オクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル} オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
1, 1-ジメチルエチル (3 a R, 6 a S) -5- ([4- [(3, 4-ジクロロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] オキシ} メチル) ヘキサヒドロシクロペンタ- [c] ピロール-2 (1H) -カルボキシレート;
N- (3, 4-ジクロロフェニル) -7- ([(3 a R, 5 r, 6 a S) -オクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル} オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
7- [(3-エンド) -8-アザビシクロ [3. 2. 1] オクト-3-イルメチル} オキシ) -N- (3, 4-ジクロロフェニル) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
1, 1-ジメチルエチル (3-エンド) -3- (2- [(4- [(3, 4-ジクロロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] オキシ} エチル) -8-アザビシクロ [3. 2. 1] オクタン-8-カルボキシレート;
7- (2- [(3-エンド) -8-アザビシクロ [3. 2. 1] オクト-3-イル] エチル} オキシ) -N- (3, 4-ジクロロフェニル) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン

から選択される、請求項1に記載の化合物、および、その単一の幾何異性体、立体異性体、ラセミ体、鏡像異性体あるいはジアステレオ異性体、および、場合によっては、製薬的に許容されるその塩または水和物。

【請求項40】

次の表：

N- (3, 4-ジクロロ-2-フルオロフェニル) -7- ([(3 a R, 5 r, 6 a S) -2- (1-メチルエチル) オクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル} オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (4-ブromo-3-クロロ-2-フルオロフェニル) -7- ([(3 a R, 5 r, 6 a S) -2- (1-メチルエチル) オクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル} オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
7- ([(3 a R, 5 r, 6 a S) -2-アセチルオクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル} オキシ) -N- (4-ブromo-3-クロロ-2-フルオロフェニル) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (4-ブromo-3-クロロ-2-フルオロフェニル) -6- (メチルオキシ) -7- ([(3 a R, 5 r, 6 a S) -オクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イルメチル} オキシ] キナゾリン-4-アミン;
エチル (3 a R, 6 a S) -5- ([(4- [(4-ブromo-3-クロロ-2-フルオロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] オキシ} メチル) ヘキサヒドロシクロペンタ [c] ピロール-2 (1H) -カルボキシレート;
N- (4-ブromo-3-クロロ-2-フルオロフェニル) -6- (メチルオキシ) -7- ([(3 a R, 5 r, 6 a S) -2- (メチルスルフォニル) オクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル} オキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (3, 4-ジクロロ-2-フルオロフェニル) -7- ([(3 a R, 5 r, 6 a S) -2-エチルオクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル} オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (3, 4-ジクロロ-2-フルオロフェニル) -6- (メチルオキシ) -7- ([(3 a R, 5 r, 6 a S) -2- (2-メチルプロピル) オクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル} オキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (3, 4-ジクロロ-2-フルオロフェニル) -7- ([(3 a R, 5 s, 6 a S) -2-メチルオクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル} オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (4-ブromo-3-クロロ-2-フルオロフェニル) -7- ([(3 a R, 5 s, 6 a S) -2-メチルオクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル} オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (3-クロロ-2, 4-ジフルオロフェニル) -7- ([(3 a R, 5 s, 6 a S) -2-メチルオクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル} オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;

N- (4, 5-ジクロロ-2-フルオロフェニル) -7- ([(3 a R, 5 s, 6 a S) -2-メチルオクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル} オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (4-ブロモ-5-クロロ-2-フルオロフェニル) -7- ([(3 a R, 5 s, 6 a S) -2-メチルオクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル} オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (4-ブロモ-2, 3-ジクロロフェニル) -7- ([(3 a R, 5 s, 6 a S) -2-メチルオクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル} オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (3, 4-ジクロロフェニル) -7- ([(3 a R, 5 s, 6 a S) -2-メチルオクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル} オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (4-ブロモ-3-クロロ-2-フルオロフェニル) -7- ([(3 a R, 5 r, 6 a S) -2-エチルオクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル} オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (4-ブロモ-3-クロロ-2-フルオロフェニル) -6- (メチルオキシ) -7- ([(3 a R, 5 r, 6 a S) -2- (2-メチルプロピル) オクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル} オキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (4-ブロモ-2, 3-ジクロロフェニル) -7- [(3 R, 9 a S) -ヘキサヒドロ-1H- [1, 4] オキサジノ [3, 4-c] [1, 4] オキサジン-3-イルメチル} オキシ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (4, 5-ジクロロ-2-フルオロフェニル) -7- [(3 R, 9 a S) -ヘキサヒドロ-1H- [1, 4] オキサジノ [3, 4-c] [1, 4] オキサジン-3-イルメチル} オキシ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (4-ブロモ-5-クロロ-2-フルオロフェニル) -7- [(3 R, 9 a S) -ヘキサヒドロ-1H- [1, 4] オキサジノ [3, 4-c] [1, 4] オキサジン-3-イルメチル} オキシ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (3-クロロ-2, 4-ジフルオロフェニル) -7- [(3 R, 9 a S) -ヘキサヒドロ-1H- [1, 4] オキサジノ [3, 4-c] [1, 4] オキサジン-3-イルメチル} オキシ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (3, 4-ジクロロ-2-フルオロフェニル) -7- [(3 S, 9 a S) -ヘキサヒドロ-1H- [1, 4] オキサジノ [3, 4-c] [1, 4] オキサジン-3-イルメチル} オキシ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;

N- (4-ブロモ-3-クロロ-2-フルオロフェニル) -7- {[(3 S, 9 a S) -ヘキサヒドロ-1H- [1, 4] オキサジノ [3, 4-c] [1, 4] オキサジン-3-イルメチル] オキシ} -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (3-クロロ-2, 4-ジフルオロフェニル) -7- {[(3 S, 9 a S) -ヘキサヒドロ-1H- [1, 4] オキサジノ [3, 4-c] [1, 4] オキサジン-3-イルメチル] オキシ} -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (3, 4-ジクロロフェニル) -7- [(ヘキサヒドロ-1H- [1, 4] オキサジノ [3, 4-c] [1, 4] オキサジン-3-イルメチル) オキシ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (4, 5-ジクロロ-2-フルオロフェニル) -7- {[(3 S, 9 a S) -ヘキサヒドロ-1H- [1, 4] オキサジノ [3, 4-c] [1, 4] オキサジン-3-イルメチル] オキシ} -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (4-ブロモ-2, 3-ジクロロフェニル) -7- {[(3 S, 9 a S) -ヘキサヒドロ-1H- [1, 4] オキサジノ [3, 4-c] [1, 4] オキサジン-3-イルメチル] オキシ} -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (4-ブロモ-5-クロロ-2-フルオロフェニル) -7- {[(3 S, 9 a S) -ヘキサヒドロ-1H- [1, 4] オキサジノ [3, 4-c] [1, 4] オキサジン-3-イルメチル] オキシ} -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (3, 4-ジクロロ-2-フルオロフェニル) -7- {[(3 R, 9 a S) -ヘキサヒドロ-1H- [1, 4] オキサジノ [3, 4-c] [1, 4] オキサジン-3-イルメチル] オキシ} -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (4-ブロモ-3-クロロ-2-フルオロフェニル) -7- {[(3 R, 9 a S) -ヘキサヒドロ-1H- [1, 4] オキサジノ [3, 4-c] [1, 4] オキサジン-3-イルメチル] オキシ} -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (3, 4-ジクロロフェニル) -7- {[(3 R, 8 a R) -ヘキサヒドロ-1H-ピロロ [2, 1-c] [1, 4] オキサジン-3-イルメチル] オキシ} -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (4-ブロモ-5-クロロ-2-フルオロフェニル) -7- {[(3 S, 8 a S) -ヘキサヒドロ-1H-ピロロ [2, 1-c] [1, 4] オキサジン-3-イルメチル] オキシ} -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (3, 4-ジクロロフェニル) -7- {[(3 S, 8 a R) -ヘキサヒドロ-1H-ピロロ [2, 1-c] [1, 4] オキサジン-3-イルメチル] オキシ} -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;

N- (3, 4-ジクロロフェニル) -7- {[(3 S, 8 a S) -ヘキサヒドロ-1H-ピロロ [2, 1-c] [1, 4] オキサジン-3-イルメチル] オキシ} -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (3, 4-ジクロロフェニル) -7- {[(3 R, 8 a S) -ヘキサヒドロ-1H-ピロロ [2, 1-c] [1, 4] オキサジン-3-イルメチル] オキシ} -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (3, 4-ジクロロ-2-フルオロフェニル) -7- {[(3 S, 8 a S) -ヘキサヒドロ-1H-ピロロ [2, 1-c] [1, 4] オキサジン-3-イルメチル] オキシ} -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (4-ブロモ-3-クロロ-2-フルオロフェニル) -7- {[(3 S, 8 a S) -ヘキサヒドロ-1H-ピロロ [2, 1-c] [1, 4] オキサジン-3-イルメチル] オキシ} -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (3-クロロ-2, 4-ジフルオロフェニル) -7- {[(3 S, 8 a S) -ヘキサヒドロ-1H-ピロロ [2, 1-c] [1, 4] オキサジン-3-イルメチル] オキシ} -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (4-ブロモ-2, 3-ジクロロフェニル) -7- {[(3 S, 8 a S) -ヘキサヒドロ-1H-ピロロ [2, 1-c] [1, 4] オキサジン-3-イルメチル] オキシ} -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (4, 5-ジクロロ-2-フルオロフェニル) -7- {[(3 S, 8 a S) -ヘキサヒドロ-1H-ピロロ [2, 1-c] [1, 4] オキサジン-3-イルメチル] オキシ} -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
(3 S, 9 a S) -3- ([4- [(3, 4-ジクロロ-2-フルオロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] オキシ) メチル) ヘキサヒドロ-2H-ピリド [1, 2-a] ピラジン-1 (6H) -オン;
(3 S, 9 a R) -3- ([4- [(3, 4-ジクロロ-2-フルオロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] オキシ) メチル) ヘキサヒドロ-2H-ピリド [1, 2-a] ピラジン-1 (6H) -オン;
(3 S, 8 a S) -3- ([4- [(3, 4-ジクロロ-2-フルオロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] オキシ) メチル) ヘキサヒドロピロロ [1, 2-a] ピラジン-1 (2H) -オン;
(3 S, 8 a R) -3- ([4- [(3, 4-ジクロロ-2-フルオロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] オキシ) メチル) ヘキサヒドロピロロ [1, 2-a] ピラジン-1 (2H) -オン;

(3 S, 8 a S) - 3 - ({[4 - [(4-ブromo-3-クロロ-2-フルオロフェニル) アミノ] - 6 - (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] オキシ} メチル) ヘキサヒドロピロロ [1, 2-a] ピラジン-1 (2 H) -オン;
(3 S, 8 a S) - 3 - ({[4 - [(3, 4-ジクロロ-2-フルオロフェニル) アミノ] - 6 - (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] オキシ} メチル) - 2-メチルヘキサヒドロピロロ [1, 2-a] ピラジン-1 (2 H) -オン;
N - (3, 4-ジクロロフェニル) - 7 - ({2 - [(8-メチル8-アザビシクロ [3. 2. 1] オクト-3-イル) アミノ] エチル} オキシ) - 6 - (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N - (3, 4-ジクロロフェニル) - 6 - (メチルオキシ) - 7 - {[(8 a R) -テトラヒドロ-1H- [1, 3] チアゾロ [4, 3-c] [1, 4] オキサジン-6-イルメチル] オキシ} キナゾリン-4-アミン;
N - (3, 4-ジクロロフェニル) - 7 - {[2 - (8-メチル8-アザビシクロ [3. 2. 1] オクト-3-イル) エチル] オキシ} - 6 - (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N - (3, 4-ジクロロフェニル) - 7 - {[(8-メチル8-アザビシクロ [3. 2. 1] オクト-3-イル) メチル] オキシ} - 6 - (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N - (3, 4-ジクロロフェニル) - 7 - {[(3 a R, 6 a S) - 2-メチルオクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] オキシ} - 6 - (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N - (3, 4-ジクロロフェニル) - 7 - {[8-メチル8-アザビシクロ [3. 2. 1] オクト-3-イル] オキシ} - 6 - (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N - (3, 4-ジクロロ-2-フルオロフェニル) - 6 - (メチルオキシ) - 7 - [(オクタヒドロ-2H-キノリジン-3-イルメチル) オキシ] キナゾリン-4-アミン;
エチル (3 a R, 5 r, 6 a S) - 5 - ([4 - [(4-ブromo-3-クロロ-2-フルオロフェニル) アミノ] - 6 - (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] オキシ) メチル] ヘキサヒドロシクロペンタ [c] ピロール-2 (1 H) -カルボキシレート;
N - (3, 4-ジクロロ-2-フルオロフェニル) - 7 - ([(3 a R, 5 r, 6 a S) - 2-メチルオクタヒドロシクロペンタ - [c] ピロール-5-イル] メチル] オキシ) - 6 - (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N - (4-ブromo-3-クロロ-2-フルオロフェニル) - 7 - ([(3 a R, 5 r, 6 a S) - 2-メチルオクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル] オキシ) - 6 - (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;

N- (3-クロロ-2, 4-ジフルオロフェニル) -7- ([(3 a R, 5 r, 6 a S) -2-メチルオクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル} オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (4, 5-ジクロロ-2-フルオロフェニル) -7- ([(3 a R, 5 r, 6 a S) -2-メチルオクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル} オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (4-ブromo-5-クロロ-2-フルオロフェニル) -7- ([(3 a R, 5 r, 6 a S) -2-メチルオクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル} オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (4-ブromo-2, 3-ジクロロフェニル) -7- ([(3 a R, 5 r, 6 a S) -2-メチルオクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル} オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (3, 4-ジクロロフェニル) -7- ([(3 a R, 5 r, 6 a S) -2-メチルオクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル} オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (3, 4-ジクロロフェニル) -7- [(2- [(3-エンド) -8-メチル8-アザビシクロ [3. 2. 1] オクト-3-イル] アミノ} エチル) オキシ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (3, 4-ジクロロフェニル) -7- ({2- [(3-エンド) -8-メチル8-アザビシクロ [3. 2. 1] オクト-3-イル] エチル} オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (3, 4-ジクロロフェニル) -7- ([(3-エンド) -8-メチル8-アザビシクロ [3. 2. 1] オクト-3-イル] メチル} オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (3, 4-ジクロロフェニル) -7- [(3-エキソ) -8-メチル8-アザビシクロ [3. 2. 1] オクト-3-イル] オキシ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
1, 1-ジメチルエチル (3 a R, 6 a S) -5- ([4- [(4-ブromo-3-クロロ-2-フルオロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] オキシ} メチル) ヘキサヒドロシクロペンタ [c] ピロール-2 (1H) -カルボキシレート;
1, 1-ジメチルエチル (3 a R, 6 a S) -5- ([4- [(4-ブromo-5-クロロ-2-フルオロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] オキシ} メチル) ヘキサヒドロシクロペンタ [c] ピロール-2 (1H) -カルボキシレート;

N- (4-ブromo-5-クロロ-2-フルオロフェニル) -6- (メチルオキシ) -7- {[(3 a R, 5 r, 6 a S) -オクタヒドロシクロペンタ- [c] ピロール-5-イルメチル] オキシ} キナゾリン-4-アミン;
1, 1-ジメチルエチル (3 a R, 6 a S) -5- ({[4- [(3-クロロ-2, 4-ジフルオロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] オキシ} メチル) ヘキサヒドロシクロペンタ- [c] ピロール-2 (1H) -カルボキシレート;
N- (3-クロロ-2, 4-ジフルオロフェニル) -7- ({[(3 a R, 5 r, 6 a S) -オクタヒドロシクロペンタ- [c] ピロール-5-イル] メチル} オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
1, 1-ジメチルエチル (3 a R, 6 a S) -5- ({[4- [(3, 4-ジクロロ-2-フルオロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] オキシ} メチル) ヘキサヒドロシクロペンタ- [c] ピロール-2 (1H) -カルボキシレート;
N- (3, 4-ジクロロ-2-フルオロフェニル) -6- (メチルオキシ) -7- {[(3 a R, 5 r, 6 a S) -オクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル} オキシ} キナゾリン-4-アミン;
1, 1-ジメチルエチル (3 a R, 6 a S) -5- ({[4- [(4, 5-ジクロロ-2-フルオロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] オキシ} メチル) ヘキサヒドロシクロペンタ- [c] ピロール-2 (1H) -カルボキシレート;
N- (4, 5-ジクロロ-2-フルオロフェニル) -7- ({[(3 a R, 5 r, 6 a S) -オクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル} オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
1, 1-ジメチルエチル (3 a R, 6 a S) -5- ({[4- [(4-ブromo-2, 3-ジクロロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] オキシ} メチル) ヘキサヒドロシクロペンタ- [c] ピロール-2 (1H) -カルボキシレート;
N- (4-ブromo-2, 3-ジクロロフェニル) -7- ({[(3 a R, 5 r, 6 a S) -オクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル} オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
1, 1-ジメチルエチル (3 a R, 6 a S) -5- ({[4- [(3, 4-ジクロロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] オキシ} メチル) ヘキサヒドロシクロペンタ- [c] ピロール-2 (1H) -カルボキシレート;
N- (3, 4-ジクロロフェニル) -7- ({[(3 a R, 5 r, 6 a S) -オクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル} オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;

7- {[(3-エンド) -8-アザビシクロ [3. 2. 1] オクト-3-イルメチル] オキシ} -N- (3, 4-ジクロロフェニル) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;

1, 1-ジメチルエチル (3-エンド) -3- (2- {[4- [(3, 4-ジクロロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] オキシ} エチル) -8-アザビシクロ [3. 2. 1] オクタン-8-カルボキシレート;

7- ({2- [(3-エンド) -8-アザビシクロ [3. 2. 1] オクト-3-イル] エチル} オキシ) -N- (3, 4-ジクロロフェニル) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン

から選択される、請求項1に記載の化合物、および、その単一の幾何異性体、立体異性体、ラセミ体、鏡像異性体あるいはジアステレオ異性体、および、場合によっては、製薬的に許容されるその塩または水和物。

【請求項41】

次の表：

N- (3, 4-ジクロロ-2-フルオロフェニル) -7- ([(3 a R, 5 r, 6 a S) -2- (1-メチルエチル) オクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル} オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (4-ブromo-3-クロロ-2-フルオロフェニル) -7- ([(3 a R, 5 r, 6 a S) -2- (1-メチルエチル) オクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル} オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
7- ([(3 a R, 5 r, 6 a S) -2-アセチルオクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル} オキシ) -N- (4-ブromo-3-クロロ-2-フルオロフェニル) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (4-ブromo-3-クロロ-2-フルオロフェニル) -6- (メチルオキシ) -7- ([(3 a R, 5 r, 6 a S) -オクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イルメチル} オキシ] キナゾリン-4-アミン;
エチル (3 a R, 6 a S) -5- ([(4- [(4-ブromo-3-クロロ-2-フルオロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] オキシ) メチル) ヘキサヒドロシクロペンタ [c] ピロール-2 (1H) -カルボキシレート;
N- (4-ブromo-3-クロロ-2-フルオロフェニル) -6- (メチルオキシ) -7- ([(3 a R, 5 r, 6 a S) -2- (メチルスルフォニル) オクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル} オキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (3, 4-ジクロロ-2-フルオロフェニル) -7- ([(3 a R, 5 r, 6 a S) -2-エチルオクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル} オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (3, 4-ジクロロ-2-フルオロフェニル) -6- (メチルオキシ) -7- ([(3 a R, 5 r, 6 a S) -2- (2-メチルプロピル) オクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル} オキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (3, 4-ジクロロ-2-フルオロフェニル) -7- ([(3 a R, 5 s, 6 a S) -2-メチルオクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル} オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (4-ブromo-3-クロロ-2-フルオロフェニル) -7- ([(3 a R, 5 r, 6 a S) -2-エチルオクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル} オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (4-ブromo-3-クロロ-2-フルオロフェニル) -6- (メチルオキシ) -7- ([(3 a R, 5 r, 6 a S) -2- (2-メチルプロピル) オクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル} オキシ) キナゾリン-4-アミン;

N- (4-ブロモ-2, 3-ジクロロフェニル) -7- {[(3R, 9a S) -ヘキサヒドロ-1H- [1, 4] オキサジノ [3, 4-c] [1, 4] オキサジン-3-イルメチル] オキシ} -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (4, 5-ジクロロ-2-フルオロフェニル) -7- {[(3R, 9a S) -ヘキサヒドロ-1H- [1, 4] オキサジノ [3, 4-c] [1, 4] オキサジン-3-イルメチル] オキシ} -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (4-ブロモ-5-クロロ-2-フルオロフェニル) -7- {[(3R, 9a S) -ヘキサヒドロ-1H- [1, 4] オキサジノ [3, 4-c] [1, 4] オキサジン-3-イルメチル] オキシ} -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (3-クロロ-2, 4-ジフルオロフェニル) -7- {[(3R, 9a S) -ヘキサヒドロ-1H- [1, 4] オキサジノ [3, 4-c] [1, 4] オキサジン-3-イルメチル] オキシ} -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (3, 4-ジクロロ-2-フルオロフェニル) -7- {[(3S, 9a S) -ヘキサヒドロ-1H- [1, 4] オキサジノ [3, 4-c] [1, 4] オキサジン-3-イルメチル] オキシ} -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (4-ブロモ-3-クロロ-2-フルオロフェニル) -7- {[(3S, 9a S) -ヘキサヒドロ-1H- [1, 4] オキサジノ [3, 4-c] [1, 4] オキサジン-3-イルメチル] オキシ} -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (3-クロロ-2, 4-ジフルオロフェニル) -7- {[(3S, 9a S) -ヘキサヒドロ-1H- [1, 4] オキサジノ [3, 4-c] [1, 4] オキサジン-3-イルメチル] オキシ} -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (3, 4-ジクロロフェニル) -7- [(ヘキサヒドロ-1H- [1, 4] オキサジノ [3, 4-c] [1, 4] オキサジン-3-イルメチル) オキシ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (4, 5-ジクロロ-2-フルオロフェニル) -7- {[(3S, 9a S) -ヘキサヒドロ-1H- [1, 4] オキサジノ [3, 4-c] [1, 4] オキサジン-3-イルメチル] オキシ} -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (4-ブロモ-2, 3-ジクロロフェニル) -7- {[(3S, 9a S) -ヘキサヒドロ-1H- [1, 4] オキサジノ [3, 4-c] [1, 4] オキサジン-3-イルメチル] オキシ} -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (4-ブロモ-5-クロロ-2-フルオロフェニル) -7- {[(3S, 9a S) -ヘキサヒドロ-1H- [1, 4] オキサジノ [3, 4-c] [1, 4] オキサジン-3-イルメチル] オキシ} -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;

N- (3, 4-ジクロロ-2-フルオロフェニル) -7- {[(3R, 9a S) -ヘキサヒドロ-1H- [1, 4] オキサジノ [3, 4-c] [1, 4] オキサジン-3-イルメチル] オキシ} -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (4-ブロモ-3-クロロ-2-フルオロフェニル) -7- {[(3R, 9a S) -ヘキサヒドロ-1H- [1, 4] オキサジノ [3, 4-c] [1, 4] オキサジン-3-イルメチル] オキシ} -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (3, 4-ジクロロフェニル) -7- {[(3R, 8a R) -ヘキサヒドロ-1H-ピロロ [2, 1-c] [1, 4] オキサジン-3-イルメチル] オキシ} -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (4-ブロモ-5-クロロ-2-フルオロフェニル) -7- {[(3S, 8a S) -ヘキサヒドロ-1H-ピロロ [2, 1-c] [1, 4] オキサジン-3-イルメチル] オキシ} -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (3, 4-ジクロロフェニル) -7- {[(3S, 8a R) -ヘキサヒドロ-1H-ピロロ [2, 1-c] [1, 4] オキサジン-3-イルメチル] オキシ} -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (3, 4-ジクロロフェニル) -7- {[(3S, 8a S) -ヘキサヒドロ-1H-ピロロ [2, 1-c] [1, 4] オキサジン-3-イルメチル] オキシ} -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (3, 4-ジクロロフェニル) -7- {[(3R, 8a S) -ヘキサヒドロ-1H-ピロロ [2, 1-c] [1, 4] オキサジン-3-イルメチル] オキシ} -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (3, 4-ジクロロ-2-フルオロフェニル) -7- {[(3S, 8a S) -ヘキサヒドロ-1H-ピロロ [2, 1-c] [1, 4] オキサジン-3-イルメチル] オキシ} -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (4-ブロモ-3-クロロ-2-フルオロフェニル) -7- {[(3S, 8a S) -ヘキサヒドロ-1H-ピロロ [2, 1-c] [1, 4] オキサジン-3-イルメチル] オキシ} -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (3-クロロ-2, 4-ジフルオロフェニル) -7- {[(3S, 8a S) -ヘキサヒドロ-1H-ピロロ [2, 1-c] [1, 4] オキサジン-3-イルメチル] オキシ} -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (4-ブロモ-2, 3-ジクロロフェニル) -7- {[(3S, 8a S) -ヘキサヒドロ-1H-ピロロ [2, 1-c] [1, 4] オキサジン-3-イルメチル] オキシ} -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;

N-(4,5-ジクロロ-2-フルオロフェニル)-7-([(3S,8aS)-ヘキサヒドロ-1H-ピロロ[2,1-c][1,4]オキサジン-3-イルメチル]オキシ)-6-(メチルオキシ)キナゾリン-4-アミン;
(3S,9aS)-3-([(4-[(3,4-ジクロロ-2-フルオロフェニル)アミノ]-6-(メチルオキシ)キナゾリン-7-イル]オキシ)メチル)ヘキサヒドロ-2H-ピリド[1,2-a]ピラジン-1(6H)-オン;
(3S,9aR)-3-([(4-[(3,4-ジクロロ-2-フルオロフェニル)アミノ]-6-(メチルオキシ)キナゾリン-7-イル]オキシ)メチル)ヘキサヒドロ-2H-ピリド[1,2-a]ピラジン-1(6H)-オン;
(3S,8aS)-3-([(4-[(3,4-ジクロロ-2-フルオロフェニル)アミノ]-6-(メチルオキシ)キナゾリン-7-イル]オキシ)メチル)ヘキサヒドロピロロ[1,2-a]ピラジン-1(2H)-オン;
(3S,8aR)-3-([(4-[(3,4-ジクロロ-2-フルオロフェニル)アミノ]-6-(メチルオキシ)キナゾリン-7-イル]オキシ)メチル)ヘキサヒドロピロロ[1,2-a]ピラジン-1(2H)-オン;
(3S,8aS)-3-([(4-[(4-ブromo-3-クロロ-2-フルオロフェニル)アミノ]-6-(メチルオキシ)キナゾリン-7-イル]オキシ)メチル)ヘキサヒドロピロロ[1,2-a]ピラジン-1(2H)-オン;
(3S,8aS)-3-([(4-[(3,4-ジクロロ-2-フルオロフェニル)アミノ]-6-(メチルオキシ)キナゾリン-7-イル]オキシ)メチル)-2-メチルヘキサヒドロピロロ[1,2-a]ピラジン-1(2H)-オン;
N-(3,4-ジクロロフェニル)-7-({2-[(8-メチル8-アザビシクロ[3.2.1]オクト-3-イル)アミノ]エチル}オキシ)-6-(メチルオキシ)キナゾリン-4-アミン;
N-(3,4-ジクロロフェニル)-6-(メチルオキシ)-7-([(8aR)-テトラヒドロ-1H-[1,3]チアゾロ[4,3-c][1,4]オキサジン-6-イルメチル]オキシ)キナゾリン-4-アミン;
N-(3,4-ジクロロフェニル)-7-([2-(8-メチル8-アザビシクロ[3.2.1]オクト-3-イル)エチル]オキシ)-6-(メチルオキシ)キナゾリン-4-アミン;
N-(3,4-ジクロロフェニル)-7-([(8-メチル8-アザビシクロ[3.2.1]オクト-3-イル)メチル]オキシ)-6-(メチルオキシ)キナゾリン-4-アミン;
N-(3,4-ジクロロフェニル)-7-([8-メチル8-アザビシクロ[3.2.1]オクト-3-イル]オキシ)-6-(メチルオキシ)キナゾリン-4-アミン;

N- (3, 4-ジクロロ-2-フルオロフェニル) -6- (メチルオキシ) -7- [(オクタヒドロ-2H-キノリジン-3-イルメチル) オキシ] キナゾリン-4-アミン;
エチル (3 a R, 5 r, 6 a S) -5- [(4- [(4-ブromo-3-クロロ-2-フルオロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル) オキシ] メチル] ヘキサヒドロシクロペンタ [c] ピロール-2 (1H) -カルボキシレート;
N- (3, 4-ジクロロ-2-フルオロフェニル) -7- ([[(3 a R, 5 r, 6 a S) -2-メチルオクタヒドロシクロペンタ- [c] ピロール-5-イル] メチル] オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (4-ブromo-3-クロロ-2-フルオロフェニル) -7- ([[(3 a R, 5 r, 6 a S) -2-メチルオクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル] オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (3-クロロ-2, 4-ジフルオロフェニル) -7- ([[(3 a R, 5 r, 6 a S) -2-メチルオクタヒドロシクロペンタ- [c] ピロール-5-イル] メチル] オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (4, 5-ジクロロ-2-フルオロフェニル) -7- ([[(3 a R, 5 r, 6 a S) -2-メチルオクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル] オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (4-ブromo-5-クロロ-2-フルオロフェニル) -7- ([[(3 a R, 5 r, 6 a S) -2-メチルオクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル] オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (4-ブromo-2, 3-ジクロロフェニル) -7- ([[(3 a R, 5 r, 6 a S) -2-メチルオクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル] オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (3, 4-ジクロロフェニル) -7- ([[(3 a R, 5 r, 6 a S) -2-メチルオクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル] オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (3, 4-ジクロロフェニル) -7- [(2- [(3-エンド) -8-メチル8-アザビシクロ [3. 2. 1] オクト-3-イル] アミノ] エチル) オキシ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (3, 4-ジクロロフェニル) -7- ({2- [(3-エンド) -8-メチル8-アザビシクロ [3. 2. 1] オクト-3-イル] エチル} オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (3, 4-ジクロロフェニル) -7- ([[(3-エンド) -8-メチル8-アザビシクロ [3. 2. 1] オクト-3-イル] メチル] オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;

N- (3, 4-ジクロロフェニル) -7- {[(3-エキソ) -8-メチル8-アザビシクロ [3. 2. 1] オクト-3-イル] オキシ} -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
1, 1-ジメチルエチル (3 a R, 6 a S) -5- ([4- [(4-ブromo-3-クロロ-2-フルオロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] オキシ} メチル) ヘキサヒドロシクロペンタ [c] ピロール-2 (1 H) -カルボキシレート;
1, 1-ジメチルエチル (3 a R, 6 a S) -5- ([4- [(4-ブromo-5-クロロ-2-フルオロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] オキシ} メチル) ヘキサヒドロシクロペンタ- [c] ピロール-2 (1 H) -カルボキシレート;
N- (4-ブromo-5-クロロ-2-フルオロフェニル) -6- (メチルオキシ) -7- {[(3 a R, 5 r, 6 a S) -オクタヒドロシクロペンタ- [c] ピロール-5-イルメチル] オキシ} キナゾリン-4-アミン;
1, 1-ジメチルエチル (3 a R, 6 a S) -5- ([4- [(3-クロロ-2, 4-ジフルオロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] オキシ} メチル) ヘキサヒドロシクロペンタ- [c] ピロール-2 (1 H) -カルボキシレート;
N- (3-クロロ-2, 4-ジフルオロフェニル) -7- ([(3 a R, 5 r, 6 a S) -オクタヒドロシクロペンタ- [c] ピロール-5-イル] メチル) オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
1, 1-ジメチルエチル (3 a R, 6 a S) -5- ([4- [(3, 4-ジクロロ-2-フルオロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] オキシ} メチル) ヘキサヒドロシクロペンタ- [c] ピロール-2 (1 H) -カルボキシレート;
N- (3, 4-ジクロロ-2-フルオロフェニル) -6- (メチルオキシ) -7- {[(3 a R, 5 r, 6 a S) -オクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル] オキシ} キナゾリン-4-アミン;
1, 1-ジメチルエチル (3 a R, 6 a S) -5- ([4- [(4, 5-ジクロロ-2-フルオロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] オキシ} メチル) ヘキサヒドロシクロペンタ- [c] ピロール-2 (1 H) -カルボキシレート;
N- (4, 5-ジクロロ-2-フルオロフェニル) -7- ([(3 a R, 5 r, 6 a S) -オクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル) オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
1, 1-ジメチルエチル (3 a R, 6 a S) -5- ([4- [(4-ブromo-2, 3-ジクロロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] オキシ} メチル) ヘキサヒドロシクロペンタ- [c] ピロール-2 (1 H) -カルボキシレート;

N-(4-ブromo-2,3-ジクロロフェニル)-7-([(3aR,5r,6aS)-オクタヒドロシクロペンタ[c]ピロール-5-イル]メチル)オキシ)-6-(メチルオキシ)キナゾリン-4-アミン;
1,1-ジメチルエチル(3aR,6aS)-5-([4-[(3,4-ジクロロフェニル)アミノ]-6-(メチルオキシ)キナゾリン-7-イル]オキシ)メチル)ヘキサヒドロシクロペンタ[c]ピロール-2(1H)-カルボキシレート;
N-(3,4-ジクロロフェニル)-7-([(3aR,5r,6aS)-オクタヒドロシクロペンタ[c]ピロール-5-イル]メチル)オキシ)-6-(メチルオキシ)キナゾリン-4-アミン;
7-([(3-エンド)-8-アザビシクロ[3.2.1]オクト-3-イルメチル]オキシ)-N-(3,4-ジクロロフェニル)-6-(メチルオキシ)キナゾリン-4-アミン;
1,1-ジメチルエチル(3-エンド)-3-(2-([4-[(3,4-ジクロロフェニル)アミノ]-6-(メチルオキシ)キナゾリン-7-イル]オキシ)エチル)-8-アザビシクロ[3.2.1]オクタン-8-カルボキシレート;
7-([2-[(3-エンド)-8-アザビシクロ[3.2.1]オクト-3-イル]エチル]オキシ)-N-(3,4-ジクロロフェニル)-6-(メチルオキシ)キナゾリン-4-アミン

から選択される、請求項1に記載の化合物、および、その単一の幾何異性体、立体異性体、ラセミ体、鏡像異性体あるいはジアステレオ異性体、および、場合によっては、製薬的に許容されるその塩または水和物。

【請求項42】

次の表：

N- (3, 4-ジクロロ-2-フルオロフェニル) -7- ([(3 a R, 5 r, 6 a S) -2- (1-メチルエチル) オクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル] オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (4-ブromo-3-クロロ-2-フルオロフェニル) -7- ([(3 a R, 5 r, 6 a S) -2- (1-メチルエチル) オクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル] オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
7- ([(3 a R, 5 r, 6 a S) -2-アセチルオクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル] オキシ) -N- (4-ブromo-3-クロロ-2-フルオロフェニル) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (4-ブromo-3-クロロ-2-フルオロフェニル) -6- (メチルオキシ) -7- [(3 a R, 5 r, 6 a S) -オクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イルメチル] オキシ] キナゾリン-4-アミン;
エチル (3 a R, 6 a S) -5- ([4- [(4-ブromo-3-クロロ-2-フルオロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] オキシ] メチル) ヘキサヒドロシクロペンタ [c] ピロール-2 (1H) -カルボキシレート;
N- (4-ブromo-3-クロロ-2-フルオロフェニル) -6- (メチルオキシ) -7- ([(3 a R, 5 r, 6 a S) -2- (メチルスルフォニル) オクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル] オキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (3, 4-ジクロロ-2-フルオロフェニル) -7- ([(3 a R, 5 r, 6 a S) -2-エチルオクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル] オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (3, 4-ジクロロ-2-フルオロフェニル) -6- (メチルオキシ) -7- ([(3 a R, 5 r, 6 a S) -2- (2-メチルプロピル) オクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル] オキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (3, 4-ジクロロ-2-フルオロフェニル) -7- ([(3 a R, 5 s, 6 a S) -2-メチルオクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル] オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (4-ブromo-3-クロロ-2-フルオロフェニル) -7- ([(3 a R, 5 r, 6 a S) -2-エチルオクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル] オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (4-ブromo-3-クロロ-2-フルオロフェニル) -6- (メチルオキシ) -7- ([(3 a R, 5 r, 6 a S) -2- (2-メチルプロピル) オクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル] オキシ) キナゾリン-4-アミン;

N- (3, 4-ジクロロフェニル) -7- ([(3 a R, 6 a S) -2-メチルオクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
エチル (3 a R, 5 r, 6 a S) -5- ([4- [(4-ブromo-3-クロロ-2-フルオロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] オキシ) メチル] ヘキサヒドロシクロペンタ [c] ピロール-2 (1 H) -カルボキシレート;
N- (3, 4-ジクロロ-2-フルオロフェニル) -7- ([(3 a R, 5 r, 6 a S) -2-メチルオクタヒドロシクロペンタ- [c] ピロール-5-イル] メチル] オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (4-ブromo-3-クロロ-2-フルオロフェニル) -7- ([(3 a R, 5 r, 6 a S) -2-メチルオクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル] オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (3-クロロ-2, 4-ジフルオロフェニル) -7- ([(3 a R, 5 r, 6 a S) -2-メチルオクタヒドロシクロペンタ- [c] ピロール-5-イル] メチル] オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (4, 5-ジクロロ-2-フルオロフェニル) -7- ([(3 a R, 5 r, 6 a S) -2-メチルオクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル] オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (4-ブromo-5-クロロ-2-フルオロフェニル) -7- ([(3 a R, 5 r, 6 a S) -2-メチルオクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル] オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (4-ブromo-2, 3-ジクロロフェニル) -7- ([(3 a R, 5 r, 6 a S) -2-メチルオクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル] オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
N- (3, 4-ジクロロフェニル) -7- ([(3 a R, 5 r, 6 a S) -2-メチルオクタヒドロシクロペンタ [c] ピロール-5-イル] メチル] オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
1, 1-ジメチルエチル (3 a R, 6 a S) -5- ([4- [(4-ブromo-3-クロロ-2-フルオロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] オキシ) メチル] ヘキサヒドロシクロペンタ [c] ピロール-2 (1 H) -カルボキシレート;
1, 1-ジメチルエチル (3 a R, 6 a S) -5- ([4- [(4-ブromo-5-クロロ-2-フルオロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] オキシ) メチル] ヘキサヒドロシクロペンタ- [c] ピロール-2 (1 H) -カルボキシレート;

N-(4-ブロモ-5-クロロ-2-フルオロフェニル)-6-(メチルオキシ)-7-{{[(3 a R, 5 r, 6 a S)-オクタヒドロシクロペンタ-[c]ピロール-5-イルメチル]オキシ}キナゾリン-4-アミン};
1, 1-ジメチルエチル (3 a R, 6 a S)-5-({[4-[(3-クロロ-2, 4-ジフルオロフェニル)アミノ]-6-(メチルオキシ)キナゾリン-7-イル]オキシ}メチル)ヘキサヒドロシクロペンタ-[c]ピロール-2(1H)-カルボキシレート;
N-(3-クロロ-2, 4-ジフルオロフェニル)-7-({[(3 a R, 5 r, 6 a S)-オクタヒドロシクロペンタ-[c]ピロール-5-イル]メチル}オキシ)-6-(メチルオキシ)キナゾリン-4-アミン;
1, 1-ジメチルエチル (3 a R, 6 a S)-5-({[4-[(3, 4-ジクロロ-2-フルオロフェニル)アミノ]-6-(メチルオキシ)キナゾリン-7-イル]オキシ}メチル)ヘキサヒドロシクロペンタ-[c]ピロール-2(1H)-カルボキシレート;
N-(3, 4-ジクロロ-2-フルオロフェニル)-6-(メチルオキシ)-7-{{[(3 a R, 5 r, 6 a S)-オクタヒドロシクロペンタ-[c]ピロール-5-イル]メチル}オキシ}キナゾリン-4-アミン};
1, 1-ジメチルエチル (3 a R, 6 a S)-5-({[4-[(4, 5-ジクロロ-2-フルオロフェニル)アミノ]-6-(メチルオキシ)キナゾリン-7-イル]オキシ}メチル)ヘキサヒドロシクロペンタ-[c]ピロール-2(1H)-カルボキシレート;
N-(4, 5-ジクロロ-2-フルオロフェニル)-7-({[(3 a R, 5 r, 6 a S)-オクタヒドロシクロペンタ-[c]ピロール-5-イル]メチル}オキシ)-6-(メチルオキシ)キナゾリン-4-アミン;
1, 1-ジメチルエチル (3 a R, 6 a S)-5-({[4-[(4-ブロモ-2, 3-ジクロロフェニル)アミノ]-6-(メチルオキシ)キナゾリン-7-イル]オキシ}メチル)ヘキサヒドロシクロペンタ-[c]ピロール-2(1H)-カルボキシレート;
N-(4-ブロモ-2, 3-ジクロロフェニル)-7-({[(3 a R, 5 r, 6 a S)-オクタヒドロシクロペンタ-[c]ピロール-5-イル]メチル}オキシ)-6-(メチルオキシ)キナゾリン-4-アミン;
1, 1-ジメチルエチル (3 a R, 6 a S)-5-({[4-[(3, 4-ジクロロフェニル)アミノ]-6-(メチルオキシ)キナゾリン-7-イル]オキシ}メチル)ヘキサヒドロシクロペンタ-[c]ピロール-2(1H)-カルボキシレート;
N-(3, 4-ジクロロフェニル)-7-({[(3 a R, 5 r, 6 a S)-オクタヒドロシクロペンタ-[c]ピロール-5-イル]メチル}オキシ)-6-(メチルオキシ)キナゾリン-4-アミン

から選択される、請求項1に記載の化合物、および、その単一の幾何異性体、立体異性体、ラセミ体、鏡像異性体あるいはジアステレオ異性体、および、場合によっては、製薬的に許容されるその塩または水和物。

【請求項43】

次の表：

N-(4-ブromo-2,3-ジクロロフェニル)-7- {[(3R, 9aS) -ヘキサヒドロ-1H-[1,4]オキサジノ [3,4-c] [1,4]オキサジン-3-イルメチル]オキシ} -6-(メチルオキシ)キナゾリン-4-アミン;
N-(4,5-ジクロロ-2-フルオロフェニル)-7- {[(3R, 9aS) -ヘキサヒドロ-1H-[1,4]オキサジノ [3,4-c] [1,4]オキサジン-3-イルメチル]オキシ} -6-(メチルオキシ)キナゾリン-4-アミン;
N-(4-ブromo-5-クロロ-2-フルオロフェニル)-7- {[(3R, 9aS) -ヘキサヒドロ-1H-[1,4]オキサジノ [3,4-c] [1,4]オキサジン-3-イルメチル]オキシ} -6-(メチルオキシ)キナゾリン-4-アミン;
N-(3-クロロ-2,4-ジフルオロフェニル)-7- {[(3R, 9aS) -ヘキサヒドロ-1H-[1,4]オキサジノ [3,4-c] [1,4]オキサジン-3-イルメチル]オキシ} -6-(メチルオキシ)キナゾリン-4-アミン;
N-(3,4-ジクロロ-2-フルオロフェニル)-7- {[(3S, 9aS) -ヘキサヒドロ-1H-[1,4]オキサジノ [3,4-c] [1,4]オキサジン-3-イルメチル]オキシ} -6-(メチルオキシ)キナゾリン-4-アミン;
N-(4-ブromo-3-クロロ-2-フルオロフェニル)-7- {[(3S, 9aS) -ヘキサヒドロ-1H-[1,4]オキサジノ [3,4-c] [1,4]オキサジン-3-イルメチル]オキシ} -6-(メチルオキシ)キナゾリン-4-アミン;
N-(3-クロロ-2,4-ジフルオロフェニル)-7- {[(3S, 9aS) -ヘキサヒドロ-1H-[1,4]オキサジノ [3,4-c] [1,4]オキサジン-3-イルメチル]オキシ} -6-(メチルオキシ)キナゾリン-4-アミン;
N-(3,4-ジクロロフェニル)-7- [(ヘキサヒドロ-1H-[1,4]オキサジノ [3,4-c] [1,4]オキサジン-3-イルメチル)オキシ] -6-(メチルオキシ)キナゾリン-4-アミン;
N-(4,5-ジクロロ-2-フルオロフェニル)-7- {[(3S, 9aS) -ヘキサヒドロ-1H-[1,4]オキサジノ [3,4-c] [1,4]オキサジン-3-イルメチル]オキシ} -6-(メチルオキシ)キナゾリン-4-アミン;
N-(4-ブromo-2,3-ジクロロフェニル)-7- {[(3S, 9aS) -ヘキサヒドロ-1H-[1,4]オキサジノ [3,4-c] [1,4]オキサジン-3-イルメチル]オキシ} -6-(メチルオキシ)キナゾリン-4-アミン;
N-(4-ブromo-5-クロロ-2-フルオロフェニル)-7- {[(3S, 9aS) -ヘキサヒドロ-1H-[1,4]オキサジノ [3,4-c] [1,4]オキサジン-3-イルメチル]オキシ} -6-(メチルオキシ)キナゾリン-4-アミン;

N-(3,4-ジクロロ-2-フルオロフェニル)-7-([(3R,9aS)-ヘキサヒドロ-1H-[1,4]オキサジノ[3,4-c][1,4]オキサジン-3-イルメチル]オキシ)-6-(メチルオキシ)キナゾリン-4-アミン;

N-(4-ブロモ-3-クロロ-2-フルオロフェニル)-7-([(3R,9aS)-ヘキサヒドロ-1H-[1,4]オキサジノ[3,4-c][1,4]オキサジン-3-イルメチル]オキシ)-6-(メチルオキシ)キナゾリン-4-アミン

から選択される、請求項1に記載の化合物、および、その単一の幾何異性体、立体異性体、ラセミ体、鏡像異性体あるいはジアステレオ異性体、および、場合によっては、製薬的に許容されるその塩または水和物。

【請求項44】

次の表：

N-(3, 4-ジクロロフェニル)-7-[[[(3R, 8aR)-ヘキサヒドロ-1H-ピロロ[2, 1-c][1, 4]オキサジン-3-イルメチル]オキシ]-6-(メチルオキシ)キナゾリン-4-アミン;
N-(4-ブロモ-5-クロロ-2-フルオロフェニル)-7-[[[(3S, 8aS)-ヘキサヒドロ-1H-ピロロ[2, 1-c][1, 4]オキサジン-3-イルメチル]オキシ]-6-(メチルオキシ)キナゾリン-4-アミン;
N-(3, 4-ジクロロフェニル)-7-[[[(3S, 8aR)-ヘキサヒドロ-1H-ピロロ[2, 1-c][1, 4]オキサジン-3-イルメチル]オキシ]-6-(メチルオキシ)キナゾリン-4-アミン;
N-(3, 4-ジクロロフェニル)-7-[[[(3S, 8aS)-ヘキサヒドロ-1H-ピロロ[2, 1-c][1, 4]オキサジン-3-イルメチル]オキシ]-6-(メチルオキシ)キナゾリン-4-アミン;
N-(3, 4-ジクロロフェニル)-7-[[[(3R, 8aS)-ヘキサヒドロ-1H-ピロロ[2, 1-c][1, 4]オキサジン-3-イルメチル]オキシ]-6-(メチルオキシ)キナゾリン-4-アミン;
N-(3, 4-ジクロロ-2-フルオロフェニル)-7-[[[(3S, 8aS)-ヘキサヒドロ-1H-ピロロ[2, 1-c][1, 4]オキサジン-3-イルメチル]オキシ]-6-(メチルオキシ)キナゾリン-4-アミン;
N-(4-ブロモ-3-クロロ-2-フルオロフェニル)-7-[[[(3S, 8aS)-ヘキサヒドロ-1H-ピロロ[2, 1-c][1, 4]オキサジン-3-イルメチル]オキシ]-6-(メチルオキシ)キナゾリン-4-アミン;
N-(3-クロロ-2, 4-ジフルオロフェニル)-7-[[[(3S, 8aS)-ヘキサヒドロ-1H-ピロロ[2, 1-c][1, 4]オキサジン-3-イルメチル]オキシ]-6-(メチルオキシ)キナゾリン-4-アミン;
N-(4-ブロモ-2, 3-ジクロロフェニル)-7-[[[(3S, 8aS)-ヘキサヒドロ-1H-ピロロ[2, 1-c][1, 4]オキサジン-3-イルメチル]オキシ]-6-(メチルオキシ)キナゾリン-4-アミン;
N-(4, 5-ジクロロ-2-フルオロフェニル)-7-[[[(3S, 8aS)-ヘキサヒドロ-1H-ピロロ[2, 1-c][1, 4]オキサジン-3-イルメチル]オキシ]-6-(メチルオキシ)キナゾリン-4-アミン; aNd

から選択される、請求項1に記載の化合物、および、その単一の幾何異性体、立体異性体、ラセミ体、鏡像異性体あるいはジアステレオ異性体、および、場合によっては、製薬的に許容されるその塩または水和物。

【請求項45】

次の表：

(3S, 9aS) - 3 - ([4 - [(3, 4-ジクロロ-2-フルオロフェニル) アミノ] - 6 - (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] オキシ} メチル) ヘキサヒドロ-2H-ピリド [1, 2-a] ピラジン-1 (6H) -オン;
(3S, 9aR) - 3 - ([4 - [(3, 4-ジクロロ-2-フルオロフェニル) アミノ] - 6 - (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] オキシ} メチル) ヘキサヒドロ-2H-ピリド [1, 2-a] ピラジン-1 (6H) -オン;
(3S, 8aS) - 3 - ([4 - [(3, 4-ジクロロ-2-フルオロフェニル) アミノ] - 6 - (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] オキシ} メチル) ヘキサヒドロピロロ [1, 2-a] ピラジン-1 (2H) -オン;
(3S, 8aR) - 3 - ([4 - [(3, 4-ジクロロ-2-フルオロフェニル) アミノ] - 6 - (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] オキシ} メチル) ヘキサヒドロピロロ [1, 2-a] ピラジン-1 (2H) -オン;
(3S, 8aS) - 3 - ([4 - [(4-ブromo-3-クロロ-2-フルオロフェニル) アミノ] - 6 - (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] オキシ} メチル) ヘキサヒドロピロロ [1, 2-a] ピラジン-1 (2H) -オン;
(3S, 8aS) - 3 - ([4 - [(3, 4-ジクロロ-2-フルオロフェニル) アミノ] - 6 - (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] オキシ} メチル) -2-メチルヘキサヒドロピロロ [1, 2-a] ピラジン-1 (2H) -オン

から選択される、請求項1に記載の化合物、および、その単一の幾何異性体、立体異性体、ラセミ体、鏡像異性体あるいはジアステレオ異性体、および、場合によっては、製薬的に許容されるその塩または水和物。

【請求項46】

次の表：

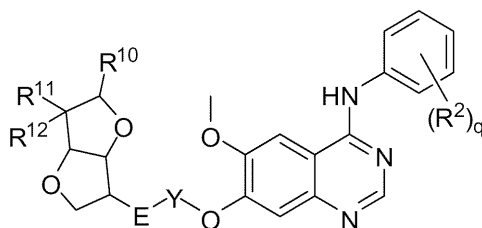
<i>N</i> - (3, 4-ジクロロフェニル) -7- [(2- [(3-エンド) -8-メチル8-アザビシクロ [3. 2. 1] オクト-3-イル] アミノ) エチル) オキシ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
<i>N</i> - (3, 4-ジクロロフェニル) -7- ({2- [(3-エンド) -8-メチル8-アザビシクロ [3. 2. 1] オクト-3-イル] エチル} オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
<i>N</i> - (3, 4-ジクロロフェニル) -7- ({[(3-エンド) -8-メチル8-アザビシクロ [3. 2. 1] オクト-3-イル] メチル} オキシ) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
<i>N</i> - (3, 4-ジクロロフェニル) -7- {[(3-エンド) -8-メチル8-アザビシクロ [3. 2. 1] オクト-3-イル] オキシ} -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
7- {[(3-エンド) -8-アザビシクロ [3. 2. 1] オクト-3-イルメチル] オキシ} - <i>N</i> - (3, 4-ジクロロフェニル) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
1, 1-ジメチルエチル (3-エンド) -3- (2- {[4- [(3, 4-ジクロロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] オキシ} エチル) -8-アザビシクロ [3. 2. 1] オクタン-8-カルボキシレート;
7- ({2- [(3-エンド) -8-アザビシクロ [3. 2. 1] オクト-3-イル] エチル} オキシ) - <i>N</i> - (3, 4-ジクロロフェニル) -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
<i>N</i> - (3, 4-ジクロロフェニル) -6- (メチルオキシ) -7- {[(8 a R) -テトラヒドロ-1H- [1, 3] チアゾロ [4, 3-c] [1, 4] オキサジン-6-イルメチル] オキシ} キナゾリン-4-アミン;
<i>N</i> - (3, 4-ジクロロ-2-フルオロフェニル) -6- (メチルオキシ) -7- [(オクタヒドロ-2H-キノリジン-3-イルメチル) オキシ] キナゾリン-4-アミン

から選択される、請求項1に記載の化合物、および、その単一の幾何異性体、立体異性体、ラセミ体、鏡像異性体あるいはジアステレオ異性体、および、場合によっては、製薬的に許容されるその塩または水和物。

【請求項47】

チロシンキナーゼ活性をモジュレーションするための次式 I a の化合物：

化学式 I a



I a

またはその単一の幾何異性体、立体異性体、ラセミ体、鏡像異性体、もしくはジアステレオ異性体、および、場合によっては、製薬的に許容されるその塩又は水和物

[式中、

q は 1、2、または 3 であり；

R^2 は、-H、ハロゲン、トリハロメチル、-CN、-NO₂、-OR³、および、置換されていてもよい低級アルキルから選択され；

Y は、-CH₂CH₂-、-CH₂-、および不在から選択され；

E は、-NR⁹-、-O-、および不在からから選択され；

R^3 は、-H または R^4 であり；

R^4 は、置換されていてもよい低級アルキル、置換されていてもよいアリーール、置換されていてもよい低級アリーールアルキル、置換されていてもよいヘテロシクリル、および置換されていてもよい低級ヘテロシクリルアルキルから選択されるか；または

R^3 および R^4 は、これらの結合相手である共通の窒素と一緒に、置換されていてもよい五員～七員環ヘテロシクリルを形成し、前記の置換されていてもよい五員～七員環ヘテロシクリルは、N、O、S、および P から選択される少なくとも 1 個の追加のヘテロ原子を含んでいてもよく；

R^9 は、-H、または置換されていてもよい低級アルキルであり；

R^{10} は、-H、置換されていてもよいアルキル、および -OR¹³ から選択され、 R^{11} および R^{12} は、-H、-CF₃、-F、-N(R^3) R^4 、-N(C=O) R^3 、-N(R^3)SO₂ R^3 、-S(O)₀₋₂ R^{13} 、-OR¹³、-OS(O)₀₋₂ R^{13a} 、-NH₂、およびアルコキシで置換されたアルキルからそれぞれ独立に選択されるか；あるいは

R^{10} は、-H および -OR¹³ から選択され、 R^{11} および R^{12} は、一緒になって、オキソ、exo-アルケニルとなるか、またはこれらの結合相手である炭素と一緒に、三員～七員環スピロシクリルを形成し、前記三員～七員環スピロシクリルは、アルキルで置換されていてもよく、また、1 個または 2 個の酸素原子を含んでいてもよく；

R^{13} は、-H、-C(=O) R^4 、置換されていてもよい低級アルキニル、置換されていてもよい低級アリーールアルキニル、置換されていてもよい低級ヘテロシクリルアルキニル、置換されていてもよい低級アルケニル、置換されていてもよい低級アリーールアルケニル、置換されていてもよい低級ヘテロシクリルアルケニル、置換されていてもよい低級アルキル、置換されていてもよい低級アリーールアルキル、置換されていてもよいアリーール、置換されていてもよい低級ヘテロシクリルアルキル、および置換されていてもよいヘテロシクリルから選択されるか；または

2 個の R^{13} が、一緒になって、1) R^{11} および R^{12} が共に -OR¹³ であるとき、 R^{11} 、 R^{12} 、およびこれらの結合相手である炭素から、対応するスピロ環式ケタールを形成し、または 2) R^{10} が -OR¹³ であり、 R^{11} および R^{12} の少なくとも一方も -OR¹³ であるとき、 R^{10} と、 R^{11} および R^{12} の一方と、これらの結合相手である対応する炭素とから、対応する環状ケタールを形成し、前記環状ケタールはアルキルで置換されていてもよく；そして、

R^{13a} はアルキルである。]

【請求項 48】

q が 1、2、または 3 であり；

R^2 が、ハロゲン、トリハロメチル、-CN、-NO₂、-OR³、および、置換されていてもよい低級アルキルから選択され；

Y が、-CH₂CH₂-、-CH₂-、および不在から選択され；

E が、-NR⁹-、-O-、および不在からから選択され；

R^3 が、-H または R^4 であり；

R^4 は、置換されていてもよい低級アルキル、置換されていてもよいアリーール、置換されていてもよい低級アリーールアルキル、置換されていてもよいヘテロシクリル、および置換されていてもよい低級ヘテロシクリルアルキルから選択されるか；または

R^3 および R^4 は、これらの結合相手である共通の窒素と一緒にあって、置換されていてもよい五員～七員環ヘテロシクリルを形成し、前記の置換されていてもよい五員～七員環ヘテロシクリルは、N、O、S、およびPから選択される少なくとも1個の追加のヘテロ原子を含んでいてもよく；

R^9 は、-H、または置換されていてもよい低級アルキルであり；

R^{10} は、-H、置換されていてもよいアルキル、および $-OR^{13}$ から選択され、 R^{11} および R^{12} は、-H、 $-CF_3$ 、 $-F$ 、 $-N(R^3)R^4$ 、 $-N(C=O)R^3$ 、 $-N(R^3)SO_2R^3$ 、 $-S(O)_{0-2}R^{13}$ 、および $-OR^{13}$ からそれぞれ独立に選択されるか；あるいは

R^{10} は、-H および $-OR^{13}$ から選択され、 R^{11} および R^{12} は、一緒になって、オキソ、exo-アルケニルとなるか、またはこれらの結合相手である炭素と一緒にあって、三員～七員環スピロシクリルを形成し；

R^{13} は、-H、 $-C(=O)R^4$ 、置換されていてもよい低級アルキニル、置換されていてもよい低級アリールアルキニル、置換されていてもよい低級ヘテロシクリルアルキニル、置換されていてもよい低級アルケニル、置換されていてもよい低級アリールアルケニル、置換されていてもよい低級ヘテロシクリルアルケニル、置換されていてもよい低級アルキル、置換されていてもよい低級アリールアルキル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよい低級ヘテロシクリルアルキル、および置換されていてもよいヘテロシクリルから選択されるか；または

2個の R^{13} が、一緒になって、1) R^{11} および R^{12} が共に $-OR^{13}$ であるとき、 R^{11} 、 R^{12} 、およびこれらの結合相手である炭素から、対応するスピロ環式ケタールを形成し、または2) R^{10} が $-OR^{13}$ であり、 R^{11} および R^{12} の少なくとも一方も $-OR^{13}$ であるとき、 R^{10} と、 R^{11} および R^{12} の一方と、これらの結合相手である対応する炭素とから、対応する環状ケタールを形成し、前記環状ケタールはアルキルで置換されていてもよい、請求項47に記載の化合物。

【請求項49】

Yが $-CH_2$ - または不在である、請求項48に記載の化合物。

【請求項50】

R^{11} および R^{12} の一方が $-OR^{13}$ であり、 R^{13} は -H、 $-C(O)R^4$ 、および置換されていてもよい低級アルキルから選択され、 R^{10} と、 R^{11} および R^{12} のもう一方とが共に -H である、請求項49に記載の化合物。

【請求項51】

R^{11} および R^{12} の一方が $-F$ であり、 R^{10} と、 R^{11} および R^{12} のもう一方とが共に -H である、請求項49に記載の化合物。

【請求項52】

R^{13} が、少なくとも1つのフッ素置換を含むアルキル基である、請求項49に記載の化合物。

【請求項53】

qが2または3である、請求項49に記載の化合物。

【請求項54】

R^2 が、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-CF_3$ 、 $-CH_3$ 、および $-OR^{25}$ から独立して選択され、 R^{25} が、それぞれ1から3のハロゲンで置換されていてもよいメチルまたはアリールである、請求項53に記載の化合物。

【請求項55】

次の表：

1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-5- ([4- [(4-ブロモ-5-クロロ-2-フルオロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] オキシ) メチル) -5-デオキシ-2-O-メチル-D-キシロ-ヘキシトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-5-デオキシ-5- ([4- [(3, 4-ジクロロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] オキシ) メチル) -2-O-メチル-D-グルシトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-5-デオキシ-5- ([4- [(3, 4-ジクロロ-2-フルオロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] オキシ) メチル) -2-O-メチル-D-キシロ-ヘキシトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-5- ([4- [(4-ブロモ-3-クロロ-2-フルオロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] オキシ) メチル) -5-デオキシ-2-O-メチル-D-キシロ-ヘキシトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-5- ([4- [(3-クロロ-2, 4-ジフルオロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] オキシ) メチル) -5-デオキシ-2-O-メチル-D-キシロ-ヘキシトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-5- ([4- [(4-ブロモ-2, 3-ジクロロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] オキシ) メチル) -5-デオキシ-2-O-メチル-D-グルシトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-2-デオキシ-2- ([4- [(3, 4-ジクロロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] オキシ) メチル) -5-O-メチル-D-トレオ-ヘキシトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-5-デオキシ-5- ([4- [(4, 5-ジクロロ-2-フルオロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] オキシ) メチル) -2-O-メチル-D-グルシトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-2-O- [4- [(4-ブロモ-5-クロロ-2-フルオロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -5-O-メチル-L-イジトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-2-O- [4- [(3, 4-ジクロロ-2-フルオロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -5-O-メチル-L-イジトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-2-O- [4- [(4-ブロモ-3-クロロ-2-フルオロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -5-O-メチル-L-イジトール ;

1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-2-0-メチル-5-0- {6- (メチルオキシ) -4- [(2, 3, 4-トリクロロフェニル) アミノ] キナゾリン-7-イル} -L-イジトール;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-5-0- [4- [(3, 4-ジクロロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -2-0-メチル-D-キシロ-ヘキシトール;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-2-0- [4- [(4-ブロモ-2, 3-ジクロロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -5-0-メチル-L-イジトール;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-5-0- [4- [(4-ブロモ-3-クロロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -L-ソルボース エチレン グリコール アセタール;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-2-0- [4- [(3-クロロ-2, 4-ジフルオロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -5-0-メチル-L-イジトール;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-2-0- [4- [(4, 5-ジクロロ-2-フルオロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -5-0-メチル-L-イジトール;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-2-0- [4- [(4-ブロモ-3-クロロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -5-0- (ジフルオロメチル) -L-イジトール;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-2-0- [4- [(3-クロロ-2-フルオロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -5-0-メチル-L-イジトール;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-2-0- [4- [(3, 4-ジクロロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -5-0-メチル-L-イジトール;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-2-0- [4- [(4-ブロモ-3-クロロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -5-0-メチル-L-イジトール;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-2-0- [4- [(4-ブロモ-3-クロロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -5-0-エチル-L-イジトール;

1, 4 : 3, 6-ジアニドロ-2-O- [4- [(3-ブロモ-2-メチルフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -5-O-メチル-L-イジトール;
1, 4 : 3, 6-ジアニドロ-2-O- [4- [(3-クロロ-2-メチルフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -5-O-メチル-L-イジトール;
1, 4 : 3, 6-ジアニドロ-2-O- [4- [(4-ブロモ-3-クロロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -5-デオキシ-D-キシロ-ヘキシトール;
1, 4 : 3, 6-ジアニドロ-2-O- [4- [(4-ブロモ-3-クロロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -5-O-メチル-D-グルシトール;
メチル 3, 6-アニドロ-5-O- [4- [(4-ブロモ-3-クロロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -2-O-メチル-アルファー-L-イドフラノシド;
3, 6-アニドロ-5-O- [4- [(4-ブロモ-3-クロロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -1, 2-O- (1-メチルエチリデン) -ベーター-L-キシロ-ヘキソフラノース;
1, 4 : 3, 6-ジアニドロ-2-O- [4- [(4-ブロモ-3-クロロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -5-デオキシ-5-メチリデン-D-キシロ-ヘキシトール;
メチル 3, 6-アニドロ-5-O- [4- [(4-ブロモ-3-クロロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -2-O-メチル-ベーター-L-イドフラノシド;
1, 4 : 3, 6-ジアニドロ-2-デオキシ-2-フルオロ-5-O- {6- (メチルオキシ) -4- [(2, 3, 4-トリフルオロフェニル) アミノ] キナゾリン-7-イル} -D-イジトール;
1, 4 : 3, 6-ジアニドロ-5-O- [4- [(2-クロロ-4-フルオロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -2-デオキシ-2-フルオロ-D-イジトール;
1, 4 : 3, 6-ジアニドロ-5-O- [4- [(2-ブロモ-4-フルオロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -2-デオキシ-2-フルオロ-D-イジトール;

1, 4 : 3, 6-ジアニヒドロ-2-デオキシ-5-O- [4- [(2, 6-ジフルオロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -2-フルオロ-D-イジトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアニヒドロ-5-O- [4- [(3-クロロ-2-フルオロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -2-デオキシ-2-フルオロ-D-イジトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアニヒドロ-2-デオキシ-2-フルオロ-5-O- [4- {[4-フルオロ-3- (トリフルオロメチル) フェニル] アミノ} -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -D-イジトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアニヒドロ-2-デオキシ-5-O- [4- [(2, 4-ジフルオロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -2-フルオロ-D-イジトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアニヒドロ-2-デオキシ-5-O- [4- [(2, 5-ジフルオロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -2-フルオロ-D-イジトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアニヒドロ-2-デオキシ-5-O- [4- [(2, 3-ジフルオロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -2-フルオロ-D-イジトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアニヒドロ-5-O- [4- [(5-クロロ-2-フルオロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -2-デオキシ-2-フルオロ-D-イジトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアニヒドロ-2-デオキシ-5-O- [4- [(3, 5-ジフルオロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -2-フルオロ-D-イジトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアニヒドロ-5-O- [4- [(3-クロロ-4-フルオロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -2-デオキシ-2-フルオロ-D-イジトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアニヒドロ-5-O- [4- [(4-ブロモ-2-クロロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -2-デオキシ-2-フルオロ-D-イジトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアニヒドロ-2-デオキシ-5-O- [4- [(3, 4-ジクロロ-2-フルオロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -2-フルオロ-D-イジトール ;

1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-5-O-[4-[(4-ブロモ-5-クロロ-2-フルオロフェニル) アミノ] -6-(メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -2-デオキシ-2-フルオロ-D-イジトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-2-デオキシ-2-フルオロ-5-O-{6-(メチルオキシ) -4-[(2, 4, 5-トリフルオロフェニル) アミノ] キナゾリン-7-イル} -D-イジトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-2-デオキシ-2-フルオロ-5-O-{6-(メチルオキシ) -4-[(2, 4, 6-トリフルオロフェニル) アミノ] キナゾリン-7-イル} -D-イジトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-5-O-[4-({4-[(4-クロロフェニル) オキシ] -3, 5-ジフルオロフェニル} アミノ) -6-(メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -2-デオキシ-2-フルオロ-D-イジトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-5-O-[4-[(4-ブロモ-3-クロロ-2-フルオロフェニル) アミノ] -6-(メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -2-デオキシ-2-フルオロ-D-イジトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-5-O-[4-[(4-ブロモ-2, 3-ジクロロフェニル) アミノ] -6-(メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -2-デオキシ-2-フルオロ-D-イジトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-5-O-[4-[(4-ブロモ-3-クロロ-5-フルオロフェニル) アミノ] -6-(メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -2-デオキシ-2-フルオロ-D-イジトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-2-デオキシ-5-O-[4-[(4, 5-ジクロロ-2-フルオロフェニル) アミノ] -6-(メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -2-フルオロ-D-イジトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-2-デオキシ-2-フルオロ-5-O-{6-(メチルオキシ) -4-[(2, 3, 4-トリクロロフェニル) アミノ] キナゾリン-7-イル} -D-イジトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-2-デオキシ-2-フルオロ-5-O-{6-(メチルオキシ) -4-[(3, 4, 5-トリクロロフェニル) アミノ] キナゾリン-7-イル} -D-イジトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-5-O-[4-[(4-ブロモ-2-フルオロフェニル) アミノ] -6-(メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -2-デオキシ-2-フルオロ-D-イジトール ;

1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-5-O-[4-[(4-クロロ-2-フルオロフェニル)アミノ]-6-(メチルオキシ)キナゾリン-7-イル]-2-デオキシ-2-フルオロ-D-イジトール;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-5-O-[4-[(3-クロロ-2-メチルフェニル)アミノ]-6-(メチルオキシ)キナゾリン-7-イル]-2-デオキシ-2-フルオロ-D-イジトール;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-2-デオキシ-5-O-[4-[(3, 4-ジフルオロフェニル)アミノ]-6-(メチルオキシ)キナゾリン-7-イル]-2-フルオロ-D-イジトール;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-5-O-[4-[(2-クロロフェニル)アミノ]-6-(メチルオキシ)キナゾリン-7-イル]-2-デオキシ-2-フルオロ-D-イジトール;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-2-デオキシ-2-フルオロ-5-O-[4-[(2-フルオロフェニル)アミノ]-6-(メチルオキシ)キナゾリン-7-イル]-D-イジトール;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-5-O-[4-[(3-クロロフェニル)アミノ]-6-(メチルオキシ)キナゾリン-7-イル]-2-デオキシ-2-フルオロ-D-イジトール;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-2-デオキシ-2-フルオロ-5-O-[4-[(4-フルオロフェニル)アミノ]-6-(メチルオキシ)キナゾリン-7-イル]-D-イジトール;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-5-O-[4-[(4-クロロフェニル)アミノ]-6-(メチルオキシ)キナゾリン-7-イル]-2-デオキシ-2-フルオロ-D-イジトール;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-2-デオキシ-5-O-[4-[(2, 4-ジクロロフェニル)アミノ]-6-(メチルオキシ)キナゾリン-7-イル]-2-フルオロ-D-イジトール;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-2-デオキシ-5-O-[4-[(2, 5-ジクロロフェニル)アミノ]-6-(メチルオキシ)キナゾリン-7-イル]-2-フルオロ-D-イジトール;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-2-デオキシ-5-O-[4-[(3, 4-ジクロロフェニル)アミノ]-6-(メチルオキシ)キナゾリン-7-イル]-2-フルオロ-D-イジトール;

1, 4 : 3, 6-ジアニヒドロ-5-O- [4- [(2-ブromo-4, 6-ジフルオロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -2-デオキシ-2-フルオロ-D-イジトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアニヒドロ-5-O- [4- [[4-クロロ-3- (トリフルオロメチル) フェニル] アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -2-デオキシ-2-フルオロ-D-イジトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアニヒドロ-5-O- [4- [[2-クロロ-5- (トリフルオロメチル) フェニル] アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -2-デオキシ-2-フルオロ-D-イジトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアニヒドロ-2-デオキシ-2-フルオロ-5-O- [4- [[2-フルオロ-3- (トリフルオロメチル) フェニル] アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -D-イジトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアニヒドロ-5-O- [4- [[2-ブromo-5- (トリフルオロメチル) フェニル] アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -2-デオキシ-2-フルオロ-D-イジトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアニヒドロ-5-O- [4- [[2-ブromo-4- (トリフルオロメチル) フェニル] アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -2-デオキシ-2-フルオロ-D-イジトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアニヒドロ-2-デオキシ-2-フルオロ-5-O- [4- [[4-フルオロ-2- (トリフルオロメチル) フェニル] アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -D-イジトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアニヒドロ-5-O- [4- [[3-ブromo-5- (トリフルオロメチル) フェニル] アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -2-デオキシ-2-フルオロ-D-イジトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアニヒドロ-5-O- [4- [(2-ブromoフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -2-デオキシ-2-フルオロ-D-イジトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアニヒドロ-5-O- [4- [(3-ブromoフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -2-デオキシ-2-フルオロ-D-イジトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアニヒドロ-5-O- [4- [(4-ブromoフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -2-デオキシ-2-フルオロ-D-イジトール ;

1, 4 : 3, 6-ジアニドロ-5-O-[4-[(3-ブロモ-4-メチルフェニル) アミノ]-6-(メチルオキシ) キナゾリン-7-イル]-2-デオキシ-2-フルオロ-D-イジトール;
1, 4 : 3, 6-ジアニドロ-5-O-[4-[(5-クロロ-2-メチルフェニル) アミノ]-6-(メチルオキシ) キナゾリン-7-イル]-2-デオキシ-2-フルオロ-D-イジトール;
1, 4 : 3, 6-ジアニドロ-2-デオキシ-5-O-[4-[(3, 5-ジメチルフェニル) アミノ]-6-(メチルオキシ) キナゾリン-7-イル]-2-フルオロ-D-イジトール;
1, 4 : 3, 6-ジアニドロ-5-O-[4-[[2, 5-ビス(メチルオキシ) フェニル] アミノ]-6-(メチルオキシ) キナゾリン-7-イル]-2-デオキシ-2-フルオロ-D-イジトール;
1, 4 : 3, 6-ジアニドロ-5-O-[4-[[5-クロロ-2, 4-ビス(メチルオキシ) フェニル] アミノ]-6-(メチルオキシ) キナゾリン-7-イル]-2-デオキシ-2-フルオロ-D-イジトール;
1, 4 : 3, 6-ジアニドロ-5-O-[4-[[4-クロロ-2, 5-ビス(メチルオキシ) フェニル] アミノ]-6-(メチルオキシ) キナゾリン-7-イル]-2-デオキシ-2-フルオロ-D-イジトール;
1, 4 : 3, 6-ジアニドロ-5-O-[4-[(3-クロロ-2, 4-ジフルオロフェニル) アミノ]-6-(メチルオキシ) キナゾリン-7-イル]-2-デオキシ-2-フルオロ-D-イジトール;
N-(4-ブロモ-3-クロロフェニル)-7-[[[(3a'S, 4R, 6'S, 6a'R)-2, 2-ジメチルテトラヒドロスピロ[1, 3-ジオキサラン-4, 3'-フロ[3, 2-b]フラン]-6'-イル] オキシ]-6-(メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン;
1, 4 : 3, 6-ジアニドロ-2-O-[4-[(4-ブロモ-3-クロロフェニル) アミノ]-6-(メチルオキシ) キナゾリン-7-イル]-5-O-メチル-5-C-[(メチルオキシ) メチル]-L-グルシトール;
1, 4 : 3, 6-ジアニドロ-2-O-[4-[(4-ブロモ-3-クロロフェニル) アミノ]-6-(メチルオキシ) キナゾリン-7-イル]-5-O-(メチルスルフォニル)-L-グルシトール;
1, 4 : 3, 6-ジアニドロ-2-O-[4-[(4-ブロモ-3-クロロフェニル) アミノ]-6-(メチルオキシ) キナゾリン-7-イル]-L-グルシトール;

1, 4 : 3, 6-ジアニヒドロ-2-O- [4- [(4-ブロモ-3-クロロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -5-S-メチル-5-チオ-D-イジトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアニヒドロ-5-O- [4- [(4-ブロモ-3-クロロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -2-デオキシ-2-モルフォリン-4-イル-D-イジトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアニヒドロ-5-O- [4- [(4-ブロモ-3-クロロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -2-デオキシ-2- (4-メチルピペラジン-1-イル) -D-イジトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアニヒドロ-5-O- [4- [(4-ブロモ-3-クロロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -2-デオキシ-2-ピロリジン-1-イル-D-イジトール ;
2-O-アセチル-1, 4 : 3, 6-ジアニヒドロ-5-O- [4- [(4-ブロモ-3-クロロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -D-イジトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアニヒドロ-2-O- [4- [(4-ブロモ-3-クロロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -D-イジトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアニヒドロ-5-O- [4- [(4-ブロモ-3-クロロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -2-デオキシ-2- (メチルスルフォニル) -D-イジトール ;
2-アミノ-1, 4 : 3, 6-ジアニヒドロ-5-O- [4- [(4-ブロモ-3-クロロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -2-デオキシ-D-イジトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアニヒドロ-5-O- [4- [(4-ブロモ-3-クロロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -2-デオキシ-2- (ジメチルアミノ) -D-イジトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアニヒドロ-5-O- [4- [(4-ブロモ-3-クロロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -2-デオキシ-2- (ジエチルアミノ) -D-イジトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアニヒドロ-5-O- [4- [(4-ブロモ-3-クロロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -2-デオキシ-2-ピペラジン-1-イル-D-イジトール ;

2-(アセチルアミノ)-1, 4:3, 6-ジアンヒドロ-5-O-[4-[(4-ブロモ-3-クロロフェニル)アミノ]-6-(メチルオキシ)キナゾリン-7-イル]-2-デオキシ-D-イジトール;
1, 4:3, 6-ジアンヒドロ-2-O-[4-[(4-ブロモ-3-クロロフェニル)アミノ]-6-(メチルオキシ)キナゾリン-7-イル]-5-O-メチル-5-C-(トリフルオロメチル)-L-グルシトール;
1, 4:3, 6-ジアンヒドロ-5-O-[4-[(4-ブロモ-3-クロロフェニル)アミノ]-6-(メチルオキシ)キナゾリン-7-イル]-2-デオキシ-2-[(メチルスルフォニル)アミノ]-D-イジトール;
1, 4:3, 6-ジアンヒドロ-2-デオキシ-2-フルオロ-5-O-(6-(メチルオキシ)-4-[[4-(4-メチルピペラジン-1-イル)フェニル]アミノ]キナゾリン-7-イル)-D-イジトール;
1, 4:3, 6-ジアンヒドロ-2-デオキシ-2-フルオロ-5-O-[4-[[3-フルオロ-4-(4-メチルピペラジン-1-イル)フェニル]アミノ]-6-(メチルオキシ)キナゾリン-7-イル]-D-イジトール;
1, 4:3, 6-ジアンヒドロ-2-デオキシ-5-O-[4-[[2, 3-ジクロロ-4-(4-メチルピペラジン-1-イル)フェニル]アミノ]-6-(メチルオキシ)キナゾリン-7-イル]-2-フルオロ-D-イジトール;
1, 4:3, 6-ジアンヒドロ-2-デオキシ-5-O-[4-[[3, 4-ジクロロ-2-(4-メチルピペラジン-1-イル)フェニル]アミノ]-6-(メチルオキシ)キナゾリン-7-イル]-2-フルオロ-D-イジトール;
1, 4:3, 6-ジアンヒドロ-2-O-[4-[(4-ブロモ-3-クロロフェニル)アミノ]-6-(メチルオキシ)キナゾリン-7-イル]-5-C-(トリフルオロメチル)-D-グルシトール;
1, 4:3, 6-ジアンヒドロ-5-O-[4-[(3, 4-ジクロロフェニル)アミノ]-6-(メチルオキシ)キナゾリン-7-イル]-2-O-メチル-D-グルシトール;
1, 4:3, 6-ジアンヒドロ-2-O-[4-[(4-ブロモ-3-クロロフェニル)アミノ]-6-(メチルオキシ)キナゾリン-7-イル]-5-O-メチル-D-グルシトール;
3, 6-アンヒドロ-5-O-[4-[(4-ブロモ-3-クロロフェニル)アミノ]-6-(メチルオキシ)キナゾリン-7-イル]-1, 2-O-(1-メチルエチリデン)-ベータ-D-イドフラノース;

1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-5-O- [4- [(3-クロロ-2-フルオロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -2-デオキシ-2-フルオロ- L-イジトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-2-O- [4- [(4-ブロモ-3-クロロフェニル) ア ミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -5-O-メチル-5-C- [(メ チルオキシ) メチル] -D-グルシトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-5-O- [4- [(4-ブロモ-3-クロロフェニル) ア ミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -2-O-メチル-2-C- [(メチ ルオキシ) メチル] -L-イジトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-5-O- [4- [(4-ブロモ-3-クロロフェニル) ア ミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -2-O-メチル-2-C- [(メチ ルオキシ) メチル] -D-イジトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-2-O- [4- [(4-ブロモ-3-クロロフェニル) ア ミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -5-O- (メチルスルフォニル) -D-グルシトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-2-O- [4- [(4-ブロモ-3-クロロフェニル) ア ミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -D-グルシトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-2-O- [4- [(4-ブロモ-3-クロロフェニル) ア ミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -5-S-メチル-5-チオ-L -イジトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-5-O- [4- [(4-ブロモ-3-クロロフェニル) ア ミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -2-デオキシ-2-モルフォリ ン-4-イル-L-イジトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-5-O- [4- [(4-ブロモ-3-クロロフェニル) ア ミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -2-デオキシ-2- (4-メチ ルピペラジン-1-イル) -L-イジトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-5-O- [4- [(4-ブロモ-3-クロロフェニル) ア ミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -2-デオキシ-2-ピロリジン -1-イル-L-イジトール ;
2-O-アセチル-1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-5-O- [4- [(4-ブロモ-3- クロロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -L-イジト ール ;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-2-O- [4- [(4-ブロモ-3-クロロフェニル) ア ミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -L-イジトール ;

1, 4 : 3, 6-ジアニヒドロ-5-O-[4-[(4-ブロモ-3-クロロフェニル) アミノ]-6-(メチルオキシ) キナゾリン-7-イル]-2-デオキシ-2-(メチルスルフォニル)-L-イジトール;
2-アミノ-1, 4 : 3, 6-ジアニヒドロ-5-O-[4-[(4-ブロモ-3-クロロフェニル) アミノ]-6-(メチルオキシ) キナゾリン-7-イル]-2-デオキシ-L-イジトール;
1, 4 : 3, 6-ジアニヒドロ-5-O-[4-[(4-ブロモ-3-クロロフェニル) アミノ]-6-(メチルオキシ) キナゾリン-7-イル]-2-デオキシ-2-(ジメチルアミノ)-L-イジトール;
1, 4 : 3, 6-ジアニヒドロ-5-O-[4-[(4-ブロモ-3-クロロフェニル) アミノ]-6-(メチルオキシ) キナゾリン-7-イル]-2-デオキシ-2-(ジエチルアミノ)-L-イジトール;
1, 4 : 3, 6-ジアニヒドロ-5-O-[4-[(4-ブロモ-3-クロロフェニル) アミノ]-6-(メチルオキシ) キナゾリン-7-イル]-2-デオキシ-2-ピペラジン-1-イル-L-イジトール;
2-(アセチルアミノ)-1, 4 : 3, 6-ジアニヒドロ-5-O-[4-[(4-ブロモ-3-クロロフェニル) アミノ]-6-(メチルオキシ) キナゾリン-7-イル]-2-デオキシ-L-イジトール;
1, 4 : 3, 6-ジアニヒドロ-2-O-[4-[(4-ブロモ-3-クロロフェニル) アミノ]-6-(メチルオキシ) キナゾリン-7-イル]-5-O-メチル-5-C-(トリフルオロメチル)-D-グルシトール;
1, 4 : 3, 6-ジアニヒドロ-5-O-[4-[(4-ブロモ-3-クロロフェニル) アミノ]-6-(メチルオキシ) キナゾリン-7-イル]-2-デオキシ-2-[(メチルスルフォニル) アミノ]-L-イジトール;
1, 4 : 3, 6-ジアニヒドロ-2-デオキシ-2-フルオロ-5-O-(6-(メチルオキシ)-4-[[4-(4-メチルピペラジン-1-イル) フェニル] アミノ] キナゾリン-7-イル)-L-イジトール;
1, 4 : 3, 6-ジアニヒドロ-2-デオキシ-2-フルオロ-5-O-[4-[[3-フルオロ-4-(4-メチルピペラジン-1-イル) フェニル] アミノ]-6-(メチルオキシ) キナゾリン-7-イル]-L-イジトール;
1, 4 : 3, 6-ジアニヒドロ-2-デオキシ-5-O-[4-[[2, 3-ジクロロ-4-(4-メチルピペラジン-1-イル) フェニル] アミノ]-6-(メチルオキシ) キナゾリン-7-イル]-2-フルオロ-L-イジトール;

1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-2-デオキシ-5-O- [4- {[3, 4-ジクロロ-2-
-(4-メチルピペラジン-1-イル) フェニル] アミノ} -6-(メチルオキシ) キナ
ゾリン-7-イル] -2-フルオロ-L-イジトール

から選択される、請求項47に記載の化合物。

【請求項56】

次の表：

1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-5- ([4- [(4-ブロモ-5-クロロ-2-フルオロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] オキシ) メチル) -5-デオキシ-2-O-メチル-D-キシロ-ヘキシトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-5-デオキシ-5- ([4- [(3, 4-ジクロロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] オキシ) メチル) -2-O-メチル-D-グルシトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-5-デオキシ-5- ([4- [(3, 4-ジクロロ-2-フルオロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] オキシ) メチル) -2-O-メチル-D-キシロ-ヘキシトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-5- ([4- [(4-ブロモ-3-クロロ-2-フルオロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] オキシ) メチル) -5-デオキシ-2-O-メチル-D-キシロ-ヘキシトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-5- ([4- [(3-クロロ-2, 4-ジフルオロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] オキシ) メチル) -5-デオキシ-2-O-メチル-D-キシロ-ヘキシトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-5- ([4- [(4-ブロモ-2, 3-ジクロロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] オキシ) メチル) -5-デオキシ-2-O-メチル-D-グルシトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-2-デオキシ-2- ([4- [(3, 4-ジクロロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] オキシ) メチル) -5-O-メチル-D-トレオ-ヘキシトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-5-デオキシ-5- ([4- [(4, 5-ジクロロ-2-フルオロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] オキシ) メチル) -2-O-メチル-D-グルシトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-2-O- [4- [(4-ブロモ-5-クロロ-2-フルオロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -5-O-メチル-L-イジトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-2-O- [4- [(3, 4-ジクロロ-2-フルオロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -5-O-メチル-L-イジトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-2-O- [4- [(4-ブロモ-3-クロロ-2-フルオロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -5-O-メチル-L-イジトール ;

1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-2-0-メチル-5-0- {6- (メチルオキシ) -4- [(2, 3, 4-トリクロロフェニル) アミノ] キナゾリン-7-イル} -L-イジトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-2-0- [4- [(4-ブロモ-2, 3-ジクロロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -5-0-メチル-L-イジトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-5-0- [4- [(4-ブロモ-3-クロロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -L-ソルボース エチレン グリコール アセタール ;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-2-0- [4- [(3-クロロ-2, 4-ジフルオロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -5-0-メチル-L-イジトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-2-0- [4- [(4, 5-ジクロロ-2-フルオロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -5-0-メチル-L-イジトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-2-0- [4- [(4-ブロモ-3-クロロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -5-0- (ジフルオロメチル) -L-イジトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-2-0- [4- [(3-クロロ-2-フルオロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -5-0-メチル-L-イジトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-2-0- [4- [(3, 4-ジクロロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -5-0-メチル-L-イジトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-2-0- [4- [(4-ブロモ-3-クロロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -5-0-メチル-L-イジトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-2-0- [4- [(4-ブロモ-3-クロロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -5-0-エチル-L-イジトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-2-0- [4- [(3-ブロモ-2-メチルフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -5-0-メチル-L-イジトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-2-0- [4- [(3-クロロ-2-メチルフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -5-0-メチル-L-イジトール ;

1, 4 : 3, 6-ジアニドロ-2-O- [4- [(4-ブロモ-3-クロロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -5-デオキシ-D-キシロ-ヘキシトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアニドロ-2-O- [4- [(4-ブロモ-3-クロロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -5-O-メチル-D-グルシトール ;
メチル 3, 6-アニドロ-5-O- [4- [(4-ブロモ-3-クロロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -2-O-メチル-アルファ-レイドフラノシド ;
1, 4 : 3, 6-ジアニドロ-2-O- [4- [(4-ブロモ-3-クロロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -5-デオキシ-5-メチリデン-D-キシロ-ヘキシトール ;
メチル 3, 6-アニドロ-5-O- [4- [(4-ブロモ-3-クロロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -2-O-メチル-ベータ-レイドフラノシド ;
N- (4-ブロモ-3-クロロフェニル) -7- {[(3a' S, 4R, 6' S, 6a' R) -2, 2-ジメチルテトラヒドロスピロ [1, 3-ジオキサラン-4, 3'-フロ [3, 2-b] フラン] -6'-イル] オキシ} -6- (メチルオキシ) キナゾリン-4-アミン ;
1, 4 : 3, 6-ジアニドロ-2-O- [4- [(4-ブロモ-3-クロロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -5-C- (トリフルオロメチル) -D-グルシトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアニドロ-5-O- [4- [(3, 4-ジクロロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -2-O-メチル-D-グルシトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアニドロ-2-O- [4- [(4-ブロモ-3-クロロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -5-O-メチル-D-グルシトール ;
3, 6-アニドロ-5-O- [4- [(4-ブロモ-3-クロロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル] -1, 2-O- (1-メチルエチリデン) -D-イドフラノース ;
1, 4 : 3, 6-ジアニドロ-5-O- {4- [(3-クロロ-2-フルオロフェニル) アミノ] -6- (メチルオキシ) キナゾリン-7-イル} -2-デオキシ-2-フルオロ-L-イジトール ;

1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-2-O-[4-[(4-ブロモ-3-クロロフェニル) アミノ]-6-(メチルオキシ)キナゾリン-7-イル]-5-O-(メチルスルフォニル)-D-グルシトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-2-O-[4-[(4-ブロモ-3-クロロフェニル) アミノ]-6-(メチルオキシ)キナゾリン-7-イル]-D-グルシトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-2-O-[4-[(4-ブロモ-3-クロロフェニル) アミノ]-6-(メチルオキシ)キナゾリン-7-イル]-5-S-メチル-5-チオール-イジトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-5-O-[4-[(4-ブロモ-3-クロロフェニル) アミノ]-6-(メチルオキシ)キナゾリン-7-イル]-2-デオキシ-2-モルフォリン-4-イル-L-イジトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-5-O-[4-[(4-ブロモ-3-クロロフェニル) アミノ]-6-(メチルオキシ)キナゾリン-7-イル]-2-デオキシ-2-(4-メチルピペラジン-1-イル)-L-イジトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-5-O-[4-[(4-ブロモ-3-クロロフェニル) アミノ]-6-(メチルオキシ)キナゾリン-7-イル]-2-デオキシ-2-ピロリジン-1-イル-L-イジトール ;
2-O-アセチル-1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-5-O-[4-[(4-ブロモ-3-クロロフェニル) アミノ]-6-(メチルオキシ)キナゾリン-7-イル]-L-イジトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-2-O-[4-[(4-ブロモ-3-クロロフェニル) アミノ]-6-(メチルオキシ)キナゾリン-7-イル]-L-イジトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-5-O-[4-[(4-ブロモ-3-クロロフェニル) アミノ]-6-(メチルオキシ)キナゾリン-7-イル]-2-デオキシ-2-(メチルスルフォニル)-L-イジトール ;
2-アミノ-1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-5-O-[4-[(4-ブロモ-3-クロロフェニル) アミノ]-6-(メチルオキシ)キナゾリン-7-イル]-2-デオキシ-L-イジトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-5-O-[4-[(4-ブロモ-3-クロロフェニル) アミノ]-6-(メチルオキシ)キナゾリン-7-イル]-2-デオキシ-2-(ジメチルアミノ)-L-イジトール ;
1, 4 : 3, 6-ジアンヒドロ-5-O-[4-[(4-ブロモ-3-クロロフェニル) アミノ]-6-(メチルオキシ)キナゾリン-7-イル]-2-デオキシ-2-(ジエチルアミノ)-L-イジトール ;

1, 4 : 3, 6-ジアニヒドロ-5-O-[4-[(4-ブromo-3-クロロフェニル) アミノ]-6-(メチルオキシ) キナゾリン-7-イル]-2-デオキシ-2-ピペラジン-1-イル-L-イジトール;
2-(アセチルアミノ)-1, 4 : 3, 6-ジアニヒドロ-5-O-[4-[(4-ブromo-3-クロロフェニル) アミノ]-6-(メチルオキシ) キナゾリン-7-イル]-2-デオキシ-L-イジトール;
1, 4 : 3, 6-ジアニヒドロ-2-O-[4-[(4-ブromo-3-クロロフェニル) アミノ]-6-(メチルオキシ) キナゾリン-7-イル]-5-O-メチル-5-C-(トリフルオロメチル)-D-グルシトール;
1, 4 : 3, 6-ジアニヒドロ-5-O-[4-[(4-ブromo-3-クロロフェニル) アミノ]-6-(メチルオキシ) キナゾリン-7-イル]-2-デオキシ-2-[(メチルスルフォニル) アミノ]-L-イジトール;
1, 4 : 3, 6-ジアニヒドロ-2-デオキシ-2-フルオロ-5-O-(6-(メチルオキシ)-4-[[4-(4-メチルピペラジン-1-イル) フェニル] アミノ] キナゾリン-7-イル)-L-イジトール;
1, 4 : 3, 6-ジアニヒドロ-2-デオキシ-2-フルオロ-5-O-[4-[[3-フルオロ-4-(4-メチルピペラジン-1-イル) フェニル] アミノ]-6-(メチルオキシ) キナゾリン-7-イル]-L-イジトール;
1, 4 : 3, 6-ジアニヒドロ-2-デオキシ-5-O-[4-[[2, 3-ジクロロ-4-(4-メチルピペラジン-1-イル) フェニル] アミノ]-6-(メチルオキシ) キナゾリン-7-イル]-2-フルオロ-L-イジトール;
1, 4 : 3, 6-ジアニヒドロ-2-デオキシ-5-O-[4-[[3, 4-ジクロロ-2-(4-メチルピペラジン-1-イル) フェニル] アミノ]-6-(メチルオキシ) キナゾリン-7-イル]-2-フルオロ-L-イジトール

から選択される、請求項 47 に記載の化合物。

【請求項 57】

化学式 I または I a の化合物および製薬的に許容される担体を含む医薬組成物。

【請求項 58】

エフリンおよび EGF R から選択されるキナーゼのインビボ活性をモジュレーションするための薬剤であって、

場合によっては製薬的に許容される担体と共に、化学式 I または I a の化合物の治療的な有効量を含む薬剤。

【請求項 59】

異常な細胞活動と関連した疾患あるいは障害を治療するための医薬であって、

場合によっては製薬的に許容される担体と共に、化学式 I または I a の化合物の治療的な有効量を含む医薬。

【請求項 60】

前記疾患が癌である請求項 59 に記載の医薬。

【請求項 61】

前記癌が、エフリン、KDR、Flt-1、EGFRおよびErbB2から選択される1または複数のキナーゼによりモジュレートされる、請求項60に記載の医薬。

【請求項62】

前記癌が、非小細胞肺癌、神経膠芽腫、膵臓癌、神経系の癌、大腸癌、多発性骨髄腫、未分化小細胞気管支原性肺癌、消化器系癌、食道癌、悪性黒色腫、神経芽細胞腫、骨肉腫、卵巣癌、子宮体癌、子宮頸癌、膀胱癌、尿道癌、および前立腺癌から選択される、請求項60に記載の医薬。

【請求項63】

前記癌が、非小細胞肺癌、神経膠芽腫、膵臓癌、神経系の癌、大腸癌、神経芽細胞腫、および消化器系の癌から選択される、請求項60に記載の医薬。

【請求項64】

前記癌が、卵巣癌、子宮頸癌、膀胱癌、食道癌、悪性黒色腫、および前立腺癌から選択される、請求項60に記載の医薬。

【請求項65】

前記癌が非小細胞肺癌である、請求項60に記載の医薬。

【請求項66】

前記癌が神経膠芽腫である、請求項60に記載の医薬。

【請求項67】

前記消化器系癌が胃癌である、請求項62に記載の医薬。

【請求項68】

前記疾患が、虚血性冠動脈疾患、糖尿病性網膜症、乾癬、および関節リウマチから選択される、請求項59に記載の医薬。

【誤訳訂正2】

【訂正対象書類名】明細書

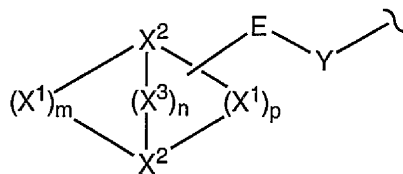
【訂正対象項目名】0035

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0035】

別の例では、化合物は、 $M^1 - M^2 - M^3 - M^4 -$ が、全体として次式II
化学式II



II

[式中、 X^1 、 X^2 、および場合によって X^3 は、飽和架橋環系の原子を表し、前記の飽和架橋環系は、 X^1 、 X^2 、および X^3 のいずれかによって表される最高で3個の環状ヘテロ原子を含み；

各 X^1 は、 $-C(R^6)R^7-$ 、 $-O-$ 、 $-S(O)_{0-2}-$ 、および $-NR^8-$ からそれぞれ独立に選択され；

各 X^2 は、それぞれ独立に、 R^6 で場合によって置換されている架橋先端メチン、または架橋先端窒素であり；

各 X^3 は、 $-C(R^6)R^7-$ 、 $-O-$ 、 $-S(O)_{0-2}-$ 、および $-NR^8-$ からそれぞれ独立に選択され；

但し、 X^1 、 X^2 、および X^3 については、窒素-窒素の環状結合もなければ、ジェミナルな二窒素置換もなく；

Eは、 $-NR^9-$ 、 $-O-$ 、および不在から選択され；

Yは、次のいずれかであり、すなわち、

I のキナゾリン環系の 7 位にある酸素と E との間の、もしくは、E が存在しないときには、 X^1 、 X^2 、または X^3 によって表される任意のヘテロ原子との間に少なくとも 2 個の炭素原子が存在する場合には； I のキナゾリン環系の 7 位にある酸素と E との間の C_{1-3} アルキレンリンカーであるか、もしくは、E が存在しないときには、 X^2 が架橋先端窒素であるときには X^2 以外の、飽和架橋環系の任意の原子と I のキナゾリン環系の 7 位にある酸素との間の C_{1-3} アルキレンリンカーであるか；または

Y は不在であり、Y が不在であるとき、E も不在であり、前記の飽和架橋環系は、I のキナゾリン環系の 7 位にある酸素に前記飽和架橋環系の炭素原子を介して直接に結合しており；

m および p は、それぞれ独立に 1 ~ 4 であり；

n は、0 ~ 2 であり、n が 0 であるとき、2 個の架橋先端 X^2 間に直接単結合が存在し；

R^6 および R^7 は、-H、ハロゲン、トリハロメチル、-CN、-NH₂、-NO₂、-OR³、-N(R³)R⁴、-S(O)₀₋₂R⁴、-SO₂N(R³)R⁴、-CO₂R³、-C(O)N(R³)R⁴、-N(R³)SO₂R⁴、-N(R³)C(O)R³、-NCO₂R³、-C(O)R³、場合によって置換されている低級アルキル、場合によって置換されているアリール、場合によって置換されている低級アリールアルキル、場合によって置換されているヘテロシクリル、場合によって置換されている低級ヘテロシクリルアルキルからそれぞれ独立に選択されるか；または

R^6 および R^7 は、一緒になってオキソになるか；または

R^6 および R^7 は、これらの結合相手である共通の炭素原子と一緒に、場合によって置換されている 3 員 ~ 7 員スピロシクリルを形成し、前記の場合によって置換されている 3 員 ~ 7 員スピロシクリルは、N、O、S、および P から選択された少なくとも 1 個の追加のヘテロ原子を場合によって含んでおり；

R^8 は、 R^3 、-SO₂N(R³)R⁴、-CO₂R³、-C(O)N(R³)R⁴、-SO₂R⁴、および -C(O)R³ から選択され、

但し、

Y が C_{1-3} アルキレンリンカーであり、E が存在せず、Z が -NH- または -N(CH₃)- であり、 R^1 が、 C_{1-3} アルキルであり、 R^2 が、-H またはハロゲンであり、n = 0 であり、

かつ；

飽和架橋環系の両方の架橋先端原子 X^2 と合わさって、飽和架橋環系の一本の架橋の原子 X^1 がピロリジン環またはピペリジン環を表し、前記ピロリジン環または前記ピペリジン環の任意の原子 X^1 または X^2 が、Y に結合しているならば、

前記飽和架橋環系の他の架橋は、-OC(O)CH₂-、-CH₂OC(O)-、-OC(O)CH₂CH₂-、-CH₂OC(O)CH₂-、-CH₂CH₂OC(O)-、-OC(O)CH₂NH-、-OC(O)CH₂N(C₁₋₄アルキル)-、および -OC(O)CH₂O- のうちの何れの 1 種にもなることはできないか；あるいは

飽和架橋環系の両方の架橋先端原子 X^2 と合わさって、飽和架橋環系の一本の架橋の原子 X^1 がピペラジン環または 4-(C₁₋₄アルキル)-ピペラジン環を表し、前記ピペラジン環または前記 4-(C₁₋₄アルキル)-ピペラジン環の任意の原子 X^1 または X^2 は、Y に結合しているならば、

前記飽和架橋環系の他の架橋は、前記ピペラジン環または前記 4-(C₁₋₄アルキル)-ピペラジン環の 2 位および 3 位を介して結合するときに限り、-CH₂OC(O)CH₂-、-CH₂CH₂OC(O)- のうちの 1 種になることはできず、前述の 2 種の架橋はどちらも、1 個または 2 個の C₁₋₂ アルキル基で置換されてはならないか；あるいは

飽和架橋環系の両方の架橋先端原子 X^2 と合わさって、飽和架橋環系の一本の架橋の原子 X^1 がピペラジン環を表し、前記ピペラジン環の任意の原子 X^1 または X^2 は、Y に結合しているならば、

前記飽和架橋環系の他の架橋は、前記ピペラジン環の3位および4位を介して結合するとき（そして、 $-C(O)OCH_2CH_2-$ 、 $-CH_2OC(O)CH_2-$ のどちらかが、その左側の末端を介して前記ピペラジン環の3位に結合するとき）に限り、 $-C(O)OCH_2CH_2-$ 、 $-CH_2OC(O)CH_2-$ のうち1種になることはできず、前述の2種の架橋はどちらも、1個または2個の C_{1-2} アルキル基で置換されているはならないか；あるいは

飽和架橋環系の両方の架橋先端原子 X^2 と合わさって、飽和架橋環系の一本の架橋の原子 X^1 が2-オキソモルホリン環を表し、前記2-オキソモルホリン環は、その4位を介してYに結合しているならば、

前記飽和架橋環系の他の架橋は、前記2-オキソモルホリン環の5位および6位を介して結合するときに限り、 $-(CH_2)_g-$ 、 $-CH_2WCH_2-$ 、 $-CH_2WCH_2CH_2-$ 、および $-CH_2CH_2WCH_2-$ のうち1種になることはできず、ここで、Wは、 $-O-$ 、 $-S(O)_{0-2}-$ 、 $-NH-$ 、または $-N(C_{1-4}アルキル)-$ であり、gは、2、3、または4である。]に従う、パラグラフ[0024]に記載のものである。