

【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】令和2年8月20日(2020.8.20)

【公表番号】特表2019-521193(P2019-521193A)

【公表日】令和1年7月25日(2019.7.25)

【年通号数】公開・登録公報2019-030

【出願番号】特願2019-521185(P2019-521185)

【国際特許分類】

C 07 D	215/44	(2006.01)
A 61 K	31/4706	(2006.01)
A 61 P	35/00	(2006.01)
A 61 P	35/02	(2006.01)
A 61 P	13/10	(2006.01)
A 61 P	13/12	(2006.01)
A 61 P	13/08	(2006.01)
A 61 P	1/00	(2006.01)
A 61 P	11/00	(2006.01)
A 61 P	15/14	(2006.01)
A 61 P	7/00	(2006.01)
A 61 K	31/4709	(2006.01)
A 61 P	43/00	(2006.01)
A 61 K	31/496	(2006.01)
A 61 K	31/5377	(2006.01)
C 07 D	405/12	(2006.01)

【F I】

C 07 D	215/44	C S P
A 61 K	31/4706	
A 61 P	35/00	
A 61 P	35/02	
A 61 P	13/10	
A 61 P	13/12	
A 61 P	13/08	
A 61 P	1/00	
A 61 P	11/00	
A 61 P	15/14	
A 61 P	7/00	
A 61 K	31/4709	
A 61 P	43/00	1 1 1
A 61 P	43/00	1 2 1
A 61 K	31/496	
A 61 K	31/5377	
C 07 D	405/12	

【手続補正書】

【提出日】令和2年7月10日(2020.7.10)

【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

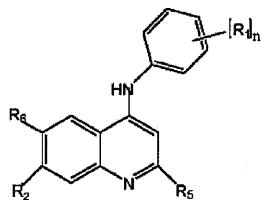
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

一般式(1)：

【化1】



[式中、

R₁は、H、アルキル、ハロ、OH、O-アルキル、NH₂、NH-アルキル、N-(アルキル)₂、S-アルキル、CF₃、OCF₃、OCF₂H、及びO(CH₂)_{n1}O(CH₂)_{n2}CH₃から選択され、

n₁は1から4であり、n₂は0から3であり、ハロは、Cl、F、Br、及びIから選択され；

nは1または2であり、

nが2である場合には、R₁は、フェニル基と一緒にメタ位及びパラ位でジオキソラン基もしくは1,4-ジオキサン基を形成することができ、

R₂は、ハロ、及びNR₃R₄から選択され、ハロは、既に定義した通りであり、

R₃はHであり、R₄は、OH、O-アルキル、及びハロから選択される1つまたは複数の置換基で任意に置換されたフェニルであり、あるいは、R₃及びR₄は一緒に(CH₂)₂O(CH₂)₂鎖を形成し、すなわちNR₃R₄がモルホリノ基：

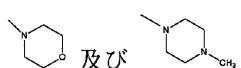
【化2】



を形成し、

R₅は、H、環式基、O-アルキル、O-(CH₂)_{n1}-（環式基）、(CH₂)_{n1}-（環式基）から選択され、n₁は既に定義した通りであり、前記環式基は、下式：

【化3】



より選択され、

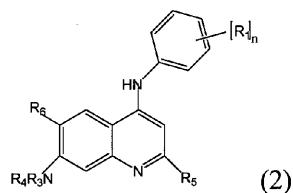
R₆は、H及びハロから選択され、

R₂がハロであるかまたはR₆がハロである場合には、R₅はHではないことを条件とする]の化合物、あるいはその薬学的に許容される塩及び/または光学異性体、互変異性体、溶媒和物、または同位体変種。

【請求項2】

一般式(2)：

【化4】

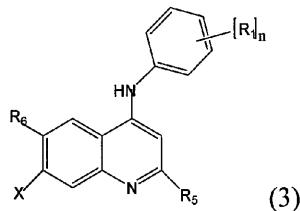


[式中、R₁、R₃、R₄、R₅、R₆、及びnは、請求項1に定義した通りである]の、請求項1に記載の化合物、あるいはその薬学的に許容される塩及び/または光学異性体、互変異性体、溶媒和物、または同位体変種。

【請求項3】

一般式(3)：

【化5】



[式中、R₁、R₅、R₆、及びnは、請求項1に定義した通りであり、Xは、Cl、F、Br、及びIから選択されるハロであり、R₅はHではないことを条件とする]

の、請求項1に記載の化合物、あるいはその薬学的に許容される塩及び/または光学異性体、互変異性体、溶媒和物、または同位体変種。

【請求項4】

R₁は、メチル(CH₃)、フルオロ(F)、クロロ(Cl)、ヒドロキシ(OH)、メトキシ(OCH₃)、CF₃、OCF₃、OCF₂H、及びO(CH₂)₂OCH₃から選択され、ここで、nが2である場合には、置換基R₁が同一または相違する、請求項1から3のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項5】

nが2である場合に、2つのR₁が、フェニル基と一緒にメタ位及びパラ位でジオキソラン基もしくは1,4-ジオキサン基を形成する、請求項1から3のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項6】

R₃がHであり、R₄が、OH、OCH₃、及びハロ、好ましくはクロロから選択される1つ、または同一もしくは相違する2つの基で置換された、または未置換のフェニルである、請求項1、2、及び4のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項7】

R₃及びR₄が、共に(CH₂)₂O(CH₂)₂鎖を形成し、すなわちNR₃R₄がモルホリノ基を形成する、請求項1、2、及び4のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項8】

- ・N-(3,5-ジフルオロフェニル)-7-モルホリノキノリン-4-アミン、
- ・N-(p-トリル)-7-モルホリノキノリン-4-アミン、
- ・N-(o-トリル)-7-モルホリノキノリン-4-アミン、
- ・N-(4-メトキシフェニル)-7-モルホリノキノリン-4-アミン、
- ・N-(3-メトキシフェニル)-7-モルホリノキノリン-4-アミン、
- ・N-(3-(トリフルオロメチル)フェニル)-7-モルホリノキノリン-4-アミン、
- ・N⁴, N⁷-ビス(4-メトキシフェニル)キノリン-4,7-ジアミン、
- ・N⁴, N⁷-ビス(3-メトキシフェニル)キノリン-4,7-ジアミン、
- ・N⁴-(3,5-ジフルオロフェニル)-N⁷-(4-メトキシフェニル)キノリン-4,7-ジアミン、
- ・N⁴-(3,5-ジフルオロフェニル)-N⁷-(3-クロロ-4-ヒドロキシフェニル)キノリン-4,7-ジアミン、
- ・N⁴-(p-トリル)-N⁷-(3-メトキシフェニル)キノリン-4,7-ジアミン、
- ・N⁴-(p-トリル)-N⁷-(4-メトキシフェニル)キノリン-4,7-ジアミン、
- ・N⁴-(3-(トリフルオロメチル)フェニル)-N⁷-(4-メトキシフェニル)キノリン-4,7-ジアミン、
- ・N⁴-(o-トリル)-N⁷-(3-メトキシフェニル)キノリン-4,7-ジアミン、
- ・N⁴-(4-メトキシフェニル)-N⁷-(3-メトキシフェニル)キノリン-4,7-ジアミン、

- ・N⁴-(3-メトキシフェニル)-N⁷-(4-メトキシフェニル)キノリン-4,7-ジアミン、
- ・N⁴-(3,5-ジフルオロフェニル)-N⁷-(3-メトキシフェニル)キノリン-4,7-ジアミン
- ・N-(4-メトキシフェニル)-7-クロロ-2-メトキシ-キノリン-4-アミン、
- ・N-(3,4-ジメトキシフェニル)-7-クロロ-2-モルホリノキノリン-4-アミン、
- ・N-(3,4-ジメトキシフェニル)-7-クロロ-2-(4-メチルピペラジン-1-イル)-キノリン-4-アミン、
- ・N-(4-メトキシフェニル)-7-クロロ-2-モルホリノキノリン-4-アミン、
- ・N-(4-メトキシフェニル)-7-クロロ-2-(4-メチルピペラジン-1-イル)-キノリン-4-アミン、
- ・N-(3,4-ジメトキシフェニル)-7-クロロ-2-(2-モルホリノエトキシ)キノリン-4-アミン及び
- ・N-(3,4-ジメトキシフェニル)-7-クロロ-2-メトキシ-キノリン-4-アミン

から選択される、請求項1に記載の化合物、あるいはその薬学的に許容される塩及び/または光学異性体、互変異性体、溶媒和物、または同位体変種。

【請求項9】

癌の治療に使用するための請求項1から8のいずれか1項に記載の化合物を含む医薬組成物。

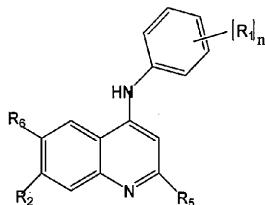
【請求項10】

前記癌が、黑色腫、膀胱癌、腎臓癌、前立腺癌、結腸癌、肺癌、乳癌、及び血液癌から選択される、請求項9に記載の医薬組成物。

【請求項11】

- ・一般式(I)：

【化6】



[式中、

R₁は、H、アルキル、ハロ、OH、O-アルキル、NH₂、NH-アルキル、N-(アルキル)₂、S-アルキル、CF₃、OCF₃、OCF₂H、及びO(CH₂)_{n1}O(CH₂)_{n2}CH₃から選択され、

n₁は1から4であり、n₂は0から3であり、ハロは、Cl、F、Br、及びIから選択され；

nは1または2であり、

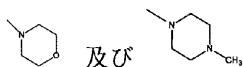
nが2である場合には、R₁は、フェニル基と共にメタ位及びパラ位でジオキソラン基もしくは1,4-ジオキサン基を形成することができ、

R₂は、H、ハロ、及びNR₃R₄から選択され、ハロは、既に定義した通りであり、

R₃はHであり、R₄は、OH、O-アルキル、及びハロから選択される1つまたは複数の置換基で任意に置換されたフェニルであり、あるいは、R₃及びR₄は共に(CH₂)₂O(CH₂)₂鎖を形成し、

R₅は、H、環式基、O-アルキル、O-(CH₂)_{n1}-（環式基）、(CH₂)_{n1}-（環式基）から選択され、n₁は既に定義した通りであり、前記環式基は、下式：

【化7】



より選択され、

R₆は、H及びハロから選択される]

の化合物、あるいは薬学的に許容される、その塩及び／または光学異性体、互変異性体、溶媒和物、または同位体変種、

・抗PD1抗体、抗CTLA4抗体、抗PD-L1抗体、及びこれらの2つ以上の混合物から選択される少なくとも1つの抗体、及び

・任意の、少なくとも1つの薬学的に許容される担体

を含む、癌の治療における同時、個別、または逐次の使用のための組合せ調剤としての医薬組成物。

【請求項 1 2】

- 化合物(1)が、
- ・N-(3,5-ジフルオロフェニル)-7-クロロキノリン-4-アミン、
 - ・N-(4-メチルフェニル)-7-クロロキノリン-4-アミン、
 - ・N-(3-トリフルオロメチルフェニル)-7-クロロキノリン-4-アミン、
 - ・N-(2-メチルフェニル)-7-クロロキノリン-4-アミン、
 - ・N-(4-メトキシフェニル)-7-クロロキノリン-4-アミン、
 - ・N-(3-メトキシフェニル)-7-クロロキノリン-4-アミン、
 - ・N-(4-ヒドロキシフェニル)-7-クロロキノリン-4-アミン、
 - ・N-(4-ヒドロキシ-3-クロロフェニル)-7-クロロキノリン-4-アミン、
 - ・N-(4-トリフルオロメチルフェニル)-7-クロロキノリン-4-アミン、
 - ・N-(3,5-ジフルオロフェニル)-7-モルホリノキノリン-4-アミン、
 - ・N-(4-(ジフルオロメトキシ)フェニル)-7-クロロ-キノリン-4-アミン、
 - ・N-(4-メトキシ-3-(2-メトキシエトキシ)フェニル)-7-クロロ-キノリン-4-アミン、
 - ・N-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-6-クロロキノリン-4-アミン、
 - ・N-(2,4-ジメトキシフェニル)-6-クロロキノリン-4-アミン、
 - ・N-(3,4-ジメトキシフェニル)-7-クロロキノリン-4-アミン、
 - ・N-(2,4-ジメトキシフェニル)-7-クロロキノリン-4-アミン、
 - ・N-(p-トリル)-7-モルホリノキノリン-4-アミン、
 - ・N-(o-トリル)-7-モルホリノキノリン-4-アミン、
 - ・N-(4-メトキシフェニル)-7-モルホリノキノリン-4-アミン、
 - ・N-(3-メトキシフェニル)-7-モルホリノキノリン-4-アミン、
 - ・N-(3-(トリフルオロメチル)フェニル)-7-モルホリノキノリン-4-アミン、
 - ・N⁴, N⁷-ビス(4-メトキシフェニル)キノリン-4,7-ジアミン、
 - ・N⁴, N⁷-ビス(3-メトキシフェニル)キノリン-4,7-ジアミン、
 - ・N⁴-(3,5-ジフルオロフェニル)-N⁷-(4-メトキシフェニル)キノリン-4,7-ジアミン、
 - ・N⁴-(3,5-ジフルオロフェニル)-N⁷-(3-クロロ-4-ヒドロキシフェニル)キノリン-4,7-ジアミン、
 - ・N⁴-(p-トリル)-N⁷-(3-メトキシフェニル)キノリン-4,7-ジアミン、
 - ・N⁴-(p-トリル)-N⁷-(4-メトキシフェニル)キノリン-4,7-ジアミン、
 - ・N⁴-(3-(トリフルオロメチル)フェニル)-N⁷-(4-メトキシフェニル)キノリン-4,7-ジアミン、
 - ・N⁴-(o-トリル)-N⁷-(3-メトキシフェニル)キノリン-4,7-ジアミン、
 - ・N⁴-(4-メトキシフェニル)-N⁷-(3-メトキシフェニル)キノリン-4,7-ジアミン、
 - ・N⁴-(3-メトキシフェニル)-N⁷-(4-メトキシフェニル)キノリン-4,7-ジアミン、
 - ・N⁴-(3,5-ジフルオロフェニル)-N⁷-(3-メトキシフェニル)キノリン-4,7-ジアミン、
 - ・N-(4-メトキシフェニル)-7-クロロ-2-メトキシ-キノリン-4-アミン、
 - ・N-(3,4-ジメトキシフェニル)-7-クロロ-2-モルホリノキノリン-4-アミン、
 - ・N-(3,4-ジメトキシフェニル)-7-クロロ-2-(4-メチルピペラジン-1-イル)-キノリン-4-アミン、
 - ・N-(4-メトキシフェニル)-7-クロロ-2-モルホリノキノリン-4-アミン、
 - ・N-(4-メトキシフェニル)-7-クロロ-2-(4-メチルピペラジン-1-イル)-キノリン-4-アミン、

- ・N-(3,4-ジメトキシフェニル)-7-クロロ-2-(2-モルホリノエトキシ)キノリン-4-アミン、
- ・N-(3,4-ジメトキシフェニル)-7-クロロ-2-メトキシ-キノリン-4-アミン、
- ・7-クロロ-N-(2,3-ジヒドロベンゾ[*b*][1,4]ジオキシン-6-イル)キノリン-4-アミン、及び
- ・7-クロロ-N-(ベンゾ[*d*][1,3]ジオキソール-5-イル)キノリン-4-アミン、
あるいは、薬学的に許容される、その塩及び/または光学異性体、互変異性体、溶媒和物、または同位体変種から選択される、請求項11に規定の使用のための医薬品組成物。

【請求項13】

請求項1から8のいずれか一項に記載の化合物及び薬学的に許容される担体を含む、医薬組成物。

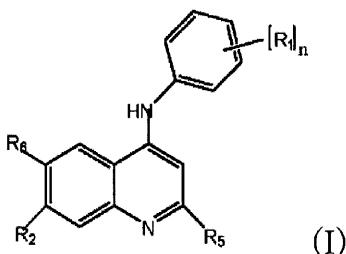
【請求項14】

前記癌が、黑色腫、膀胱癌、腎臓癌、前立腺癌、結腸癌、脾臓癌、肺癌、乳癌、及び血液癌から選択される、請求項11または12に規定の使用のための医薬組成物。

【請求項15】

癌の治療用の使用のための、一般式(I)：

【化8】



[式中、

R₁は、H、アルキル、ハロ、OH、O-アルキル、NH₂、NH-アルキル、N-(アルキル)₂、S-アルキル、CF₃、OCF₃、OCF₂H、及びO(CH₂)_{n1}O(CH₂)_{n2}CH₃から選択され、

n₁は1から4であり、n₂は0から3であり、ハロは、Cl、F、Br、及びIから選択され；

nは1または2であり、

nが2である場合には、R₁は、フェニル基と共にメタ位及びパラ位でジオキサン基もしくは1,4-ジオキサン基を形成することができ、

R₂は、H、ハロ、及びNR₃R₄から選択され、ハロは、既に定義した通りであり、

R₃はHであり、R₄は、OH、O-アルキル、及びハロから選択される1つまたは複数の置換基で任意に置換されたフェニルであり、あるいは、R₃及びR₄は共に(CH₂)₂O(CH₂)₂鎖を形成し、すなわちNR₃R₄がモルホリノ基：

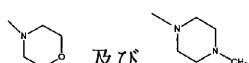
【化9】



を形成し、

R₅は、H、環式基、O-アルキル、O-(CH₂)_{n1}-（環式基）、(CH₂)_{n1}-（環式基）から選択され、n₁は既に定義した通りであり、前記環式基は、下式：

【化10】



より選択され、

R₆は、H及びハロから選択され、

R₂がFであり、R₅=R₆=Hである場合には、R₁は3-Cl；4-Cl；3-F；4-OCH₃；4-CH₃；3-Cl及

び4-F ; 3-Cl 及び4-Cl ; または4-Fではないことを条件とし、
 R_2 がClであり、 $R_5 = R_6 = H$ である場合には、 R_1 は4-OHでも4-Clでもないことを条件とする]の化合物、あるいはその薬学的に許容される塩及び／または光学異性体、互変異性体、溶媒和物、または同位体変種を含む、医薬組成物。

【請求項 1 6】

前記癌が、黒色腫、膀胱癌、腎臓癌、前立腺癌、結腸癌、脾臓癌、肺癌、乳癌、及び血液癌から選択される、請求項 1 5に規定の使用のための医薬組成物。

【請求項 1 7】

化合物が、

- ・N-(3,5-ジフルオロフェニル)-7-クロロキノリン-4-アミン、
- ・N-(4-メチルフェニル)-7-クロロキノリン-4-アミン、
- ・N-(3-トリフルオロメチルフェニル)-7-クロロキノリン-4-アミン、
- ・N-(2-メチルフェニル)-7-クロロキノリン-4-アミン、
- ・N-(4-メトキシフェニル)-7-クロロキノリン-4-アミン、
- ・N-(3-メトキシフェニル)-7-クロロキノリン-4-アミン、
- ・N-(4-トリフルオロメチルフェニル)-7-クロロキノリン-4-アミン、
- ・N-(3,5-ジフルオロフェニル)-7-モルホリノキノリン-4-アミン、
- ・N-(4-(ジフルオロメトキシ)フェニル)-7-クロロ-キノリン-4-アミン、
- ・N-(4-メトキシ-3-(2-メトキシエトキシ)フェニル)-7-クロロ-キノリン-4-アミン、
- ・N-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-6-クロロキノリン-4-アミン、
- ・N-(2,4-ジメトキシフェニル)-6-クロロキノリン-4-アミン、
- ・N-(3,4-ジメトキシフェニル)-7-クロロキノリン-4-アミン、
- ・N-(2,4-ジメトキシフェニル)-7-クロロキノリン-4-アミン、
- ・N-(p-トリル)-7-モルホリノキノリン-4-アミン、
- ・N-(o-トリル)-7-モルホリノキノリン-4-アミン、
- ・N-(4-メトキシフェニル)-7-モルホリノキノリン-4-アミン、
- ・N-(3-メトキシフェニル)-7-モルホリノキノリン-4-アミン、
- ・N-(3-(トリフルオロメチル)フェニル)-7-モルホリノキノリン-4-アミン、
- ・N⁴, N⁷-ビス(4-メトキシフェニル)キノリン-4,7-ジアミン、
- ・N⁴, N⁷-ビス(3-メトキシフェニル)キノリン-4,7-ジアミン、
- ・N⁴-(3,5-ジフルオロフェニル)-N⁷-(4-メトキシフェニル)キノリン-4,7-ジアミン、
- ・N⁴-(3,5-ジフルオロフェニル)-N⁷-(3-クロロ-4-ヒドロキシフェニル)キノリン-4,7-ジアミン、
- ・N⁴-(p-トリル)-N⁷-(3-メトキシフェニル)キノリン-4,7-ジアミン、
- ・N⁴-(p-トリル)-N⁷-(4-メトキシフェニル)キノリン-4,7-ジアミン、
- ・N⁴-(3-(トリフルオロメチル)フェニル)-N⁷-(4-メトキシフェニル)キノリン-4,7-ジアミン、
- ・N⁴-(o-トリル)-N⁷-(3-メトキシフェニル)キノリン-4,7-ジアミン、
- ・N⁴-(4-メトキシフェニル)-N⁷-(3-メトキシフェニル)キノリン-4,7-ジアミン、
- ・N⁴-(3-メトキシフェニル)-N⁷-(4-メトキシフェニル)キノリン-4,7-ジアミン、
- ・N⁴-(3,5-ジフルオロフェニル)-N⁷-(3-メトキシフェニル)キノリン-4,7-ジアミン、
- ・N-(4-メトキシフェニル)-7-クロロ-2-メトキシ-キノリン-4-アミン、
- ・N-(3,4-ジメトキシフェニル)-7-クロロ-2-モルホリノキノリン-4-アミン、
- ・N-(3,4-ジメトキシフェニル)-7-クロロ-2-(4-メチルピペラジン-1-イル)-キノリン-4-アミン、
- ・N-(4-メトキシフェニル)-7-クロロ-2-モルホリノキノリン-4-アミン、
- ・N-(4-メトキシフェニル)-7-クロロ-2-(4-メチルピペラジン-1-イル)-キノリン-4-アミン、
- ・N-(3,4-ジメトキシフェニル)-7-クロロ-2-(2-モルホリノエトキシ)キノリン-4-アミン

、

・N-(3,4-ジメトキシフェニル)-7-クロロ-2-メトキシ-キノリン-4-アミン、
 ・7-クロロ-N-(2,3-ジヒドロベンゾ[b][1,4]ジオキシン-6-イル)キノリン-4-アミン、及び
 ・7-クロロ-N-(ベンゾ[d][1,3]ジオキソール-5-イル)キノリン-4-アミン、
 あるいは、薬学的に許容される、その塩及び/または光学異性体、互変異性体、溶媒和物、または同位体変種から選択される、請求項15または16に規定の使用のための医薬品組成物。

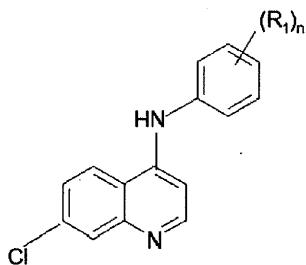
【請求項18】

抗PD1抗体、抗CTLA4抗体、抗PD-L1抗体、及びこれらの2つ以上の混合物から選択される抗体との併用投与のための、請求項15から17のいずれか一項に規定の使用のための医薬品組成物。

【請求項19】

下式：

【化11】



【式中】

R₁は、H、アルキル、ハロ、OH、O-アルキル、NH₂、NH-アルキル、N-(アルキル)₂、S-アルキル、CF₃、OCF₃、OCF₂H、及びO(CH₂)_n₁O(CH₂)_n₂CH₃から選択され、

n₁は1から4であり、n₂は0から3であり、ハロは、Cl、F、Br、及びIから選択され；

nは1または2であり、

R₁は4-OHでも4-Clでもないことを条件とする】

の化合物、あるいは、その薬学的に許容される塩及び/または光学異性体、互変異性体、溶媒和物、または同位体変種。

【請求項20】

R₁が、アルキル、ハロ、OH、O-アルキル、NH₂、NH-アルキル、N-(アルキル)₂、S-アルキル、CF₃、OCF₃、OCF₂H、及びO(CH₂)_n₁O(CH₂)_n₂CH₃から選択される、請求項19に記載の化合物。

【請求項21】

R₁が、OH、O-アルキル、及びO(CH₂)_n₁O(CH₂)_n₂CH₃から選択される、請求項19に記載の化合物。

【請求項22】

・N-(4-メトキシフェニル)-7-クロロキノリン-4-アミン、
 ・N-(3,4-ジメトキシフェニル)-7-クロロキノリン-4-アミン、
 ・N-(2,4-ジメトキシフェニル)-7-クロロキノリン-4-アミン、

あるいは、薬学的に許容される、その塩及び/または光学異性体、互変異性体、溶媒和物、または同位体変種から選択される、請求項19から21のいずれか一項に記載の化合物。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0040

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0040】

本発明の有利な実施態様によれば、上述の医薬組成物において使用される好ましい化合物は、一般式(1)のものであり、とりわけ下記のものである：

- ・N-(3,5-ジフルオロフェニル)-7-クロロキノリン-4-アミン(化合物1)、
- ・N-(4-メチルフェニル)-7-クロロキノリン-4-アミン(化合物2)、
- ・N-(3-トリフルオロメチルフェニル)-7-クロロキノリン-4-アミン(化合物3)、
- ・N-(2-メチルフェニル)-7-クロロキノリン-4-アミン(化合物4)、
- ・N-(4-メトキシフェニル)-7-クロロキノリン-4-アミン(化合物5)、
- ・N-(3-メトキシフェニル)-7-クロロキノリン-4-アミン(化合物6)、
- ・N-(4-ヒドロキシフェニル)-7-クロロキノリン-4-アミン(化合物7)、
- ・N-(4-ヒドロキシ-3-クロロフェニル)-7-クロロキノリン-4-アミン(化合物8)、
- ・N-(4-トリフルオロメチルフェニル)-7-クロロキノリン-4-アミン(化合物9)、
- ・N-(3,5-ジフルオロフェニル)-7-モルホリノキノリン-4-アミン(化合物10)、
- ・N-(4-(ジフルオロメトキシ)フェニル)-7-クロロ-キノリン-4-アミン(化合物34)、
- ・N-(4-メトキシ-3-(2-メトキシエトキシ)フェニル)-7-クロロ-キノリン-4-アミン(化合物35)、
- ・N-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-6-クロロキノリン-4-アミン(化合物36)、
- ・N-(2,4-ジメトキシフェニル)-6-クロロキノリン-4-アミン(化合物37)、
- ・N-(3,4-ジメトキシフェニル)-7-クロロキノリン-4-アミン(化合物38)、
- ・N-(2,4-ジメトキシフェニル)-7-クロロキノリン-4-アミン(化合物39)、
- ・N-(p-トリル)-7-モルホリノキノリン-4-アミン(化合物11)、
- ・N-(o-トリル)-7-モルホリノキノリン-4-アミン(化合物12)、
- ・N-(4-メトキシフェニル)-7-モルホリノキノリン-4-アミン(化合物13)、
- ・N-(3-メトキシフェニル)-7-モルホリノキノリン-4-アミン(化合物14)、
- ・N-(3-(トリフルオロメチル)フェニル)-7-モルホリノキノリン-4-アミン(化合物15)、
- ・N⁴, N⁷-ビス(4-メトキシフェニル)キノリン-4,7-ジアミン(化合物16)、
- ・N⁴, N⁷-ビス(3-メトキシフェニル)キノリン-4,7-ジアミン(化合物17)、
- ・N⁴-(3,5-ジフルオロフェニル)-N⁷-(4-メトキシフェニル)キノリン-4,7-ジアミン(化合物18)、
- ・N⁴-(3,5-ジフルオロフェニル)-N⁷-(3-クロロ-4-ヒドロキシフェニル)キノリン-4,7-ジアミン(化合物19)、
- ・N⁴-(p-トリル)-N⁷-(3-メトキシフェニル)キノリン-4,7-ジアミン(化合物20)、
- ・N⁴-(p-トリル)-N⁷-(4-メトキシフェニル)キノリン-4,7-ジアミン(化合物21)、
- ・N⁴-(3-(トリフルオロメチル)フェニル)-N⁷-(4-メトキシフェニル)キノリン-4,7-ジアミン(化合物22)、
- ・N⁴-(o-トリル)-N⁷-(3-メトキシフェニル)キノリン-4,7-ジアミン(化合物23)、
- ・N⁴-(4-メトキシフェニル)-N⁷-(3-メトキシフェニル)キノリン-4,7-ジアミン(化合物24)、
- ・N⁴-(3-メトキシフェニル)-N⁷-(4-メトキシフェニル)キノリン-4,7-ジアミン(化合物25)、及び
- ・N⁴-(3,5-ジフルオロフェニル)-N⁷-(3-メトキシフェニル)キノリン-4,7-ジアミン(化合物26)、
- ・N-(4-メトキシフェニル)-7-クロロ-2-メトキシ-キノリン-4-アミン(化合物27)、
- ・N-(3,4-ジメトキシフェニル)-7-クロロ-2-モルホリノキノリン-4-アミン(化合物28)、
- ・N-(3,4-ジメトキシフェニル)-7-クロロ-2-(4-メチルピペラジン-1-イル)-キノリン-4-アミン(化合物29)、
- ・N-(4-メトキシフェニル)-7-クロロ-2-モルホリノキノリン-4-アミン(化合物30)、
- ・N-(4-メトキシフェニル)-7-クロロ-2-(4-メチルピペラジン-1-イル)-キノリン-4-アミン(化合物31)、
- ・N-(3,4-ジメトキシフェニル)-7-クロロ-2-(2-モルホリノエトキシ)キノリン-4-アミン

(化合物32) 、

- ・ N-(3,4-ジメトキシフェニル)-7-クロロ-2-メトキシ-キノリン-4-アミン (化合物33) 、
- ・ 7-クロロ-N-(2,3-ジヒドロベンゾ[*b*][1,4]ジオキシン-6-イル)キノリン-4-アミン (40) 、
- ・ 7-クロロ-N-(ベンゾ[*d*][1,3]ジオキソール-5-イル)キノリン-4-アミン (41) 。