

【公報種別】特許法第17条の2の規定による補正の掲載

【部門区分】第3部門第2区分

【発行日】平成19年9月27日(2007.9.27)

【公表番号】特表2007-511491(P2007-511491A)

【公表日】平成19年5月10日(2007.5.10)

【年通号数】公開・登録公報2007-017

【出願番号】特願2006-538946(P2006-538946)

【国際特許分類】

C 0 7 D 239/94	(2006.01)
C 0 7 D 401/12	(2006.01)
C 0 7 D 403/12	(2006.01)
C 0 7 D 417/12	(2006.01)
C 0 7 D 413/12	(2006.01)
C 0 7 D 405/14	(2006.01)
C 0 7 D 401/14	(2006.01)
A 6 1 K 31/517	(2006.01)
A 6 1 K 31/5377	(2006.01)
A 6 1 P 43/00	(2006.01)
A 6 1 P 35/00	(2006.01)
A 6 1 P 17/06	(2006.01)
A 6 1 P 13/08	(2006.01)
A 6 1 P 9/10	(2006.01)
A 6 1 P 9/08	(2006.01)
A 6 1 P 35/02	(2006.01)
A 6 1 P 19/00	(2006.01)
A 6 1 P 15/00	(2006.01)
A 6 1 P 1/00	(2006.01)
A 6 1 P 21/00	(2006.01)
A 6 1 P 13/00	(2006.01)

【F I】

C 0 7 D 239/94	
C 0 7 D 401/12	C S P
C 0 7 D 403/12	
C 0 7 D 417/12	
C 0 7 D 413/12	
C 0 7 D 405/14	
C 0 7 D 401/14	
A 6 1 K 31/517	
A 6 1 K 31/5377	
A 6 1 P 43/00	1 1 1
A 6 1 P 35/00	
A 6 1 P 17/06	
A 6 1 P 13/08	
A 6 1 P 9/10	
A 6 1 P 9/08	
A 6 1 P 35/02	
A 6 1 P 19/00	
A 6 1 P 15/00	
A 6 1 P 1/00	

A 6 1 P 21/00

A 6 1 P 13/00

## 【手続補正書】

【提出日】平成19年8月13日(2007.8.13)

## 【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

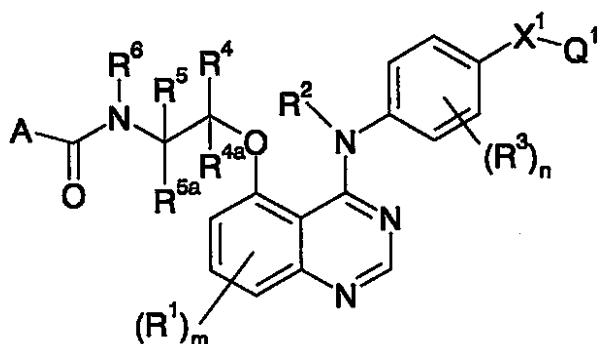
## 【補正の内容】

【特許請求の範囲】

## 【請求項1】

以下の式I:

## 【化1】



I

## [式中:

mは、0、1又は2であり;

同一又は異なることができるそれぞれのR<sup>1</sup>は、ヒドロキシ、(1-6C)アルコキシ、(3-7C)シクロアルキル-オキシ及び(3-7C)シクロアルキル-(1-6C)アルコキシから選択され、そしてここにおいて、R<sup>1</sup>置換基内のいずれものCH<sub>2</sub>又はCH<sub>3</sub>基は、それぞれの前記CH<sub>2</sub>又はCH<sub>3</sub>基において、一つ若しくはそれより多いハロゲノ又は(1-6C)アルキル置換基を、或いはヒドロキシ及び(1-6C)アルコキシから選択される置換基を所望により保有していてもよく;R<sup>2</sup>は、水素又は(1-4C)アルキルであり;

nは、0、1、2、3又は4であり;

同一又は異なることができるそれぞれのR<sup>3</sup>は、シアノ、ハロゲノ、(1-4C)アルキル、トリフルオロメチル、(1-4C)アルコキシ、(2-4C)アルケニル及び(2-4C)アルキニルから選択され、X<sup>1</sup>は、O、S、SO、SO<sub>2</sub>、N(R<sup>7</sup>)、CH(OR<sup>7</sup>)、CON(R<sup>7</sup>)、N(R<sup>7</sup>)CO、SO<sub>2</sub>N(R<sup>7</sup>)、N(R<sup>7</sup>)SO<sub>2</sub>、OC(R<sup>7</sup>)<sub>2</sub>、C(R<sup>7</sup>)<sub>2</sub>O、SC(R<sup>7</sup>)<sub>2</sub>、C(R<sup>7</sup>)<sub>2</sub>S、CO、C(R<sup>7</sup>)<sub>2</sub>N(R<sup>7</sup>)及びN(R<sup>7</sup>)C(R<sup>7</sup>)<sub>2</sub>から選択され、ここにおいて同一又は異なることができるそれぞれのR<sup>7</sup>は、水素又は(1-6C)アルキルであり;Q<sup>1</sup>は、アリール又はヘテロアリールであり、そしてここにおいて、Q<sup>1</sup>は、ハロゲノ、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、アミノ、カルボキシ、カルバモイル、スルファモイル、ホルミル、メルカプト、(1-6C)アルキル、(2-8C)アルケニル、(2-8C)アルキニル、(1-6C)アルコキシ、(2-6C)アルケニルオキシ、(2-6C)アルキニルオキシ、(1-6C)アルキルチオ、

(1 - 6 C) アルキルスルフィニル、(1 - 6 C) アルキルスルホニル、(1 - 6 C) アルキルアミノ、ジ - [(1 - 6 C) アルキル] アミノ、(1 - 6 C) アルコキシカルボニル、N - (1 - 6 C) アルキルカルバモイル、N, N - ジ - [(1 - 6 C) アルキル] カルバモイル、(2 - 6 C) アルカノイル、(3 - 6 C) アルケノイル、(3 - 6 C) アルキノイル、(2 - 6 C) アルカノイルオキシ、(2 - 6 C) アルカノイルアミノ、N - (1 - 6 C) アルキル - (2 - 6 C) アルカノイルアミノ、(3 - 6 C) アルケノイルアミノ、N - (1 - 6 C) アルキル - (3 - 6 C) アルケノイルアミノ、(3 - 6 C) アルキノイルアミノ、N - (1 - 6 C) アルキル - (3 - 6 C) アルキノイルアミノ、N - (1 - 6 C) アルキルスルファモイル、N, N - ジ - [(1 - 6 C) アルキル] スルファモイル、(1 - 6 C) アルカンスルホニルアミノ、N - (1 - 6 C) アルキル - (1 - 6 C) アルカンスルホニルアミノ、及び以下の式：

- X<sup>2</sup> - R<sup>8</sup>

の基から選択される、同一又は異なっていることができる一つ若しくはそれより多い置換基を所望により保有していてもよく、

式中、X<sup>2</sup> は、直接結合であるか、又はO、CO及びN (R<sup>9</sup>) から選択され、ここにおいてR<sup>9</sup> は、水素又は(1 - 6 C) アルキルであり、そしてR<sup>8</sup> は、ハロゲノ - (1 - 6 C) アルキル、ヒドロキシ - (1 - 6 C) アルキル、カルボキシ - (1 - 6 C) アルキル、(1 - 6 C) アルコキシ - (1 - 6 C) アルキル、シアノ - (1 - 6 C) アルキル、アミノ - (1 - 6 C) アルキル、N - (1 - 6 C) アルキルアミノ - (1 - 6 C) アルキル、N, N - ジ - [(1 - 6 C) アルキル] アミノ - (1 - 6 C) アルキル、(2 - 6 C) アルカノイルアミノ - (1 - 6 C) アルキル、N - (1 - 6 C) アルキル - (2 - 6 C) アルカノイルアミノ - (1 - 6 C) アルキル、(1 - 6 C) アルコキシカルボニルアミノ - (1 - 6 C) アルキル、カルバモイル - (1 - 6 C) アルキル、N - (1 - 6 C) アルキルカルバモイル - (1 - 6 C) アルキル、N, N - ジ - [(1 - 6 C) アルキル] カルバモイル - (1 - 6 C) アルキル、(1 - 6 C) アルキルチオ - (1 - 6 C) アルキル、(1 - 6 C) アルキルスルフィニル - (1 - 6 C) アルキル、(1 - 6 C) アルキルスルホニル - (1 - 6 C) アルキルスルファモイル (1 - 6 C) アルキル、N, N - ジ - (1 - 6 C) アルキルスルファモイル (1 - 6 C) アルキル、(2 - 6 C) アルカノイル - (1 - 6 C) アルキル、(2 - 6 C) アルカノイルオキシ - (1 - 6 C) アルキル又は(1 - 6 C) アルコキシカルボニル - (1 - 6 C) アルキルであり、

そしてここにおいて、- X<sup>1</sup> - Q<sup>1</sup> 内のいずれものCH<sub>2</sub> 又はCH<sub>3</sub> 基は、それぞれの前記CH<sub>2</sub> 又はCH<sub>3</sub> 基において、一つ若しくはそれより多いハロゲノ又は(1 - 6 C) アルキル置換基を、或いはヒドロキシ、シアノ、アミノ、(1 - 4 C) アルコキシ、(1 - 4 C) アルキルアミノ及びジ - [(1 - 4 C) アルキルアミノ] から選択される置換基を所望により保有していてもよく；

同一又は異なっていることができるR<sup>4</sup>、R<sup>4 a</sup>、R<sup>5</sup> 及びR<sup>5 a</sup> は、水素及び(1 - 6 C) アルキルから選択されるか、或いは

R<sup>4</sup> 及びR<sup>4 a</sup> は、これらが接続している炭素原子といっしょに、(3 - 7 C) シクロアルキル環を形成し、或いは

R<sup>5</sup> 及びR<sup>5 a</sup> は、これらが接続している炭素原子といっしょに、(3 - 7 C) シクロアルキル環を形成し、

そしてここにおいて、いずれものR<sup>4</sup>、R<sup>4 a</sup>、R<sup>5</sup> 及びR<sup>5 a</sup> 内のいずれものCH<sub>2</sub> 又はCH<sub>3</sub> 基は、それぞれの前記CH<sub>2</sub> 又はCH<sub>3</sub> 基において、一つ又はそれより多いハロゲノ置換基を、或いはヒドロキシ、シアノ、(1 - 6 C) アルコキシ、アミノ、(2 - 6 C) アルカノイル、(1 - 6 C) アルキルアミノ及びジ - [(1 - 6 C) アルキルアミノ] から選択される置換基を所望により保有していてもよく；

R<sup>6</sup> は、水素、(1 - 6 C) アルキル、(2 - 6 C) アルケニル、(2 - 6 C) アルキニル、(3 - 7 C) シクロアルキル、(3 - 7 C) シクロアルキル - (1 - 6 C) アルキル、(3 - 7 C) シクロアルケニル、(3 - 7 C) シクロアルケニル - (1 - 6 C) アル

キル、ヘテロシクリル及びヘテロシクリル- (1 - 6 C) アルキルから選択され、

そしてここにおいて、R<sup>6</sup> 置換基内のいずれものヘテロシクリル基は、ハロゲノ、トリフルオロメチル、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、アミノ、ホルミル、メルカプト、(1 - 6 C) アルキル、(2 - 6 C) アルケニル、(2 - 6 C) アルキニル、(1 - 6 C) アルコキシ、(1 - 6 C) アルキルチオ、(1 - 6 C) アルキルスルフィニル、(1 - 6 C) アルキルスルホニル、(1 - 6 C) アルキルアミノ、ジ- [(1 - 6 C) アルキル] アミノ、(2 - 6 C) アルカノイル、(2 - 6 C) アルカノイルオキシから、及び以下の式：  

$$- X^3 - R^{10}$$

の基から選択される同一又は異なっていることができる、一つ若しくはそれより多い置換基を所望により保有していてもよく、

式中、X<sup>3</sup> は、直接結合であるか、又はO、CO、SO<sub>2</sub> 及びN (R<sup>11</sup>) から選択され、ここにおいてR<sup>11</sup> は、水素又は(1 - 4 C) アルキルであり、そしてR<sup>10</sup> は、ハロゲノ- (1 - 4 C) アルキル、ヒドロキシ- (1 - 4 C) アルキル、(1 - 4 C) アルコキシ- (1 - 4 C) アルキル、シアノ- (1 - 4 C) アルキル、アミノ- (1 - 4 C) アルキル、N- (1 - 4 C) アルキルアミノ- (1 - 4 C) アルキル及びN, N-ジ- [(1 - 4 C) アルキル] アミノ- (1 - 4 C) アルキルであり、

そしてここにおいて、R<sup>6</sup> 置換基内のいずれものヘテロシクリル基は、1 又は2 個のオキソ或いはチオキソ置換基を所望により保有していてもよく；

そしてここにおいて、R<sup>6</sup> 置換基内の、ヘテロシクリル基内のCH<sub>2</sub> 基以外のいずれものCH<sub>2</sub> 又はCH<sub>3</sub> 基は、それぞれの前記CH<sub>2</sub> 又はCH<sub>3</sub> 基において、一つ若しくはそれより多いハロゲノ又は(1 - 6 C) アルキル置換基を、或いはヒドロキシ、シアノ、アミノ、カルボキシ、カルバモイル、スルファモイル、(2 - 6 C) アルケニル、(2 - 6 C) アルキニル、(1 - 6 C) アルコキシ、(1 - 6 C) アルキルチオ、(1 - 6 C) アルキルスルフィニル、(1 - 6 C) アルキルスルホニル、(1 - 6 C) アルキルアミノ、ジ- [(1 - 6 C) アルキル] アミノ、N- (1 - 6 C) アルキルカルバモイル、N, N-ジ- [(1 - 6 C) アルキル] カルバモイル、(2 - 6 C) アルカノイル、(2 - 6 C) アルカノイルオキシ、(2 - 6 C) アルカノイルアミノ、N- (1 - 6 C) アルキルスルファモイル、N, N-ジ- [(1 - 6 C) アルキル] スルファモイル、(1 - 6 C) アルカンスルホニルアミノ及びN- (1 - 6 C) アルキル- (1 - 6 C) アルカンスルホニルアミノから選択される置換基を所望により保有していてもよく；

A は、水素、式Z- (CR<sup>12</sup> R<sup>13</sup>)<sub>p</sub> - の基及びR<sup>14</sup> から選択され、

ここにおいてp は、1、2、3、又は4 であり、

同一又は異なっていることができるそれぞれのR<sup>12</sup> 及びR<sup>13</sup> は、水素、(1 - 6 C) アルキル、(2 - 6 C) アルケニル及び(2 - 6 C) アルキニルから選択され、

或いは同一の炭素原子に接続しているR<sup>12</sup> 及びR<sup>13</sup> 基は、(3 - 7 C) シクロアルキル又は(3 - 7 C) シクロアルケニル環を形成し、

そしてここにおいて、いずれものR<sup>12</sup> 及びR<sup>13</sup> 内のいずれものCH<sub>2</sub> 又はCH<sub>3</sub> 基は、それぞれの前記CH<sub>2</sub> 又はCH<sub>3</sub> 基において、一つ若しくはそれより多いハロゲノ又は(1 - 6 C) アルキル置換基を、或いはヒドロキシ、シアノ、(1 - 6 C) アルキル、(1 - 6 C) アルコキシ、アミノ、(2 - 6 C) アルカノイル、(1 - 6 C) アルキルアミノ及びジ- [(1 - 6 C) アルキル] アミノから選択される置換基を所望により保有していてもよく、

Z は、水素、OR<sup>15</sup>、NR<sup>16</sup> R<sup>17</sup>、(1 - 6 C) アルキルスルホニル、(1 - 6 C) アルカンスルホニルアミノ及びN- (1 - 6 C) アルキル- (1 - 6 C) アルカンスルホニルアミノから選択され、ここにおいて同一又は異なっていることができるそれぞれのR<sup>15</sup>、R<sup>16</sup> 及びR<sup>17</sup> は、水素、(1 - 6 C) アルキル、(2 - 6 C) アルケニル、(2 - 6 C) アルキニル及び(1 - 6 C) アルコキシカルボニルから選択され、

或いはZ は、以下の式：

Q<sup>2</sup> - X<sup>4</sup> -

の基であり、

式中、 $X^4$  は、O、N( $R^{1-8}$ )、 $SO_2$  及び  $SO_2N(R^{1-8})$  から選択され、ここにおいて  $R^{1-8}$  は、水素又は(1-6C)アルキルであり、そして  $Q^2$  は、(3-7C)シクロアルキル、(3-7C)シクロアルケニル又はヘテロシクリルであり、

$R^{1-4}$  は、水素、 $OR^{1-9}$  及び  $NR^{1-6}R^{1-7}$  から選択され、ここにおいて  $R^{1-9}$  は、(1-6C)アルキル、(2-6C)アルケニル及び(2-6C)アルキニルから選択され、そしてここにおいて、 $R^{1-6}$  及び  $R^{1-7}$  は、先に定義したとおりであり、

或いは  $R^{1-4}$  は、以下の式：

$$Q^3 - X^5 -$$

の基であり、

式中、 $X^5$  は、O 及び N( $R^{2-0}$ ) から選択され、ここにおいて  $R^{2-0}$  は、水素又は(1-6C)アルキルであり、そして  $Q^3$  は、(3-7C)シクロアルキル、(3-7C)シクロアルキル - (1-6C)アルキル、(3-7C)シクロアルケニル、(3-7C)シクロアルケニル - (1-6C)アルキル、ヘテロシクリル及びヘテロシクリル - (1-6C)アルキルであり、

或いは  $R^{1-4}$  は、 $Q^4$  であり、ここにおいて  $Q^4$  は、(3-7C)シクロアルキル、(3-7C)シクロアルキル - (1-6C)アルキル、(3-7C)シクロアルケニル、(3-7C)シクロアルケニル - (1-6C)アルキル、ヘテロシクリル又はヘテロシクリル - (1-6C)アルキルであり、

そしてここにおいて、Z 又は  $R^{1-4}$  置換基内にいすれもの(2-6C)アルキレン鎖中の隣接する炭素原子は、O、S、 $SO$ 、 $SO_2$ 、N( $R^{2-1}$ )、CO、-C=C- 及び-C-C-から選択される基の、鎖への挿入によって所望により分離されていてもよく、ここにおいて  $R^{2-1}$  は、水素又は(1-6C)アルキルであり、

そしてここにおいて、Z 又は  $R^{1-4}$  置換基内にいすれものヘテロシクリル基は、ハロゲノ、トリフルオロメチル、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、アミノ、ホルミル、メルカプト、(1-6C)アルキル、(2-6C)アルケニル、(2-6C)アルキニル、(1-6C)アルコキシ、(1-6C)アルキルチオ、(1-6C)アルキルスルフィニル、(1-6C)アルキルスルホニル、(1-6C)アルキルアミノ、ジ-[ (1-6C)アルキル]アミノ、(2-6C)アルカノイル、(2-6C)アルカノイルオキシから、及び以下の式：

$$-X^6 - R^{2-2}$$

の基から選択される同一又は異なることができる、一つ若しくはそれより多い置換基を所望により保有していてもよく、

式中、 $X^6$  は、直接結合であるか、又はO、CO、 $SO_2$  及び N( $R^{2-3}$ ) から選択され、ここにおいて  $R^{2-3}$  は、水素又は(1-4C)アルキルであり、そして  $R^{2-2}$  は、ハロゲノ - (1-4C)アルキル、ヒドロキシ - (1-4C)アルキル、(1-4C)アルコキシ - (1-4C)アルキル、シアノ - (1-4C)アルキル、アミノ - (1-4C)アルキル、N - (1-4C)アルキルアミノ - (1-4C)アルキル及びN, N-ジ-[ (1-4C)アルキル]アミノ - (1-4C)アルキルであり、

そしてここにおいて、Z 又は  $R^{1-4}$  置換基内にいすれものヘテロシクリル基は、1若しくは2個のオキソ又はチオキソ置換基を所望により保有していてもよく、

そしてここにおいて、Z 又は  $R^{1-4}$  基内に、ヘテロシクリル環内の  $CH_2$  基以外のいすれもの  $CH_2$  又は  $CH_3$  基は、それぞれの前記  $CH_2$  又は  $CH_3$  基において、一つ若しくはそれより多いハロゲノ又は(1-6C)アルキル置換基を、或いはヒドロキシ、シアノ、アミノ、カルボキシ、カルバモイル、スルファモイル、(2-6C)アルケニル、(2-6C)アルキニル、(1-6C)アルコキシ、(1-6C)アルキルチオ、(1-6C)アルキルスルフィニル、(1-6C)アルキルスルホニル、(1-6C)アルキルアミノ、ジ-[ (1-6C)アルキル]アミノ、N - (1-6C)アルキルカルバモイル、N, N-ジ-[ (1-6C)アルキル]カルバモイル、(2-6C)アルカノイル、(2-6C)アルカノイルオキシ、(2-6C)アルカノイルアミノ、N - (1-6C)アルキ

ル - ( 2 - 6 C ) アルカノイルアミノ、N - ( 1 - 6 C ) アルキルスルファモイル、N , N - ジ - [ ( 1 - 6 C ) アルキル ] スルファモイル、( 1 - 6 C ) アルカンスルホニルアミノ及びN - ( 1 - 6 C ) アルキル - ( 1 - 6 C ) アルカンスルホニルアミノから選択される置換基を所望により保有していくてもよい ; ]

のキナゾリン誘導体、又は医薬的に受容可能なその塩。

【請求項 2】

mが、0、1又は2であり；

同一又は異なることができるそれぞれのR<sup>1</sup>は、ヒドロキシ、( 1 - 6 C ) アルコキシ、( 3 - 7 C ) シクロアルキル - オキシ及び( 3 - 7 C ) シクロアルキル - ( 1 - 6 C ) アルコキシから選択され、

そしてここにおいて、R<sup>1</sup>置換基内のいずれものCH<sub>2</sub>又はCH<sub>3</sub>基は、それぞれの前記CH<sub>2</sub>又はCH<sub>3</sub>基において、一つ若しくはそれより多いハロゲノ又は( 1 - 6 C ) アルキル置換基を、或いはヒドロキシ及び( 1 - 6 C ) アルコキシから選択される置換基を所望により保有していくてもよく；

R<sup>2</sup>は、水素又は( 1 - 4 C ) アルキルであり；

nは、0、1、2、3又は4であり；

同一又は異なることができるそれぞれのR<sup>3</sup>は、ハロゲノ、( 1 - 4 C ) アルキル、トリフルオロメチル、( 1 - 4 C ) アルコキシ、( 2 - 4 C ) アルケニル及び( 2 - 4 C ) アルキニルから選択され；

X<sup>1</sup>は、O、S、SO、SO<sub>2</sub>、N(R<sup>7</sup>)、CH(OR<sup>7</sup>)、CON(R<sup>7</sup>)、N(R<sup>7</sup>)CO、SO<sub>2</sub>N(R<sup>7</sup>)、N(R<sup>7</sup>)SO<sub>2</sub>、OC(R<sup>7</sup>)<sub>2</sub>、C(R<sup>7</sup>)<sub>2</sub>O、SC(R<sup>7</sup>)<sub>2</sub>、C(R<sup>7</sup>)<sub>2</sub>S、CO、C(R<sup>7</sup>)<sub>2</sub>N(R<sup>7</sup>)及びN(R<sup>7</sup>)C(R<sup>7</sup>)<sub>2</sub>から選択され、ここにおいて同一又は異なることができるそれぞれのR<sup>7</sup>は、水素又は( 1 - 6 C ) アルキルであり；

Q<sup>1</sup>は、アリール又はヘテロアリールであり、

そしてここにおいて、Q<sup>1</sup>は、ハロゲノ、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、アミノ、カルボキシ、カルバモイル、スルファモイル、ホルミル、メルカプト、( 1 - 6 C ) アルキル、( 2 - 8 C ) アルケニル、( 2 - 8 C ) アルキニル、( 1 - 6 C ) アルコキシ、( 2 - 6 C ) アルケニルオキシ、( 2 - 6 C ) アルキニルオキシ、( 1 - 6 C ) アルキルチオ、( 1 - 6 C ) アルキルスルフィニル、( 1 - 6 C ) アルキルスルホニル、( 1 - 6 C ) アルキルアミノ、ジ - [ ( 1 - 6 C ) アルキル ] アミノ、( 1 - 6 C ) アルコキシカルボニル、N - ( 1 - 6 C ) アルキルカルバモイル、N , N - ジ - [ ( 1 - 6 C ) アルキル ] カルバモイル、( 2 - 6 C ) アルカノイル、( 3 - 6 C ) アルケノイル、( 3 - 6 C ) アルキノイル、( 2 - 6 C ) アルカノイルオキシ、( 2 - 6 C ) アルカノイルアミノ、N - ( 1 - 6 C ) アルキル - ( 2 - 6 C ) アルカノイルアミノ、( 3 - 6 C ) アルケノイルアミノ、N - ( 1 - 6 C ) アルキル - ( 3 - 6 C ) アルケノイルアミノ、( 3 - 6 C ) アルキノイルアミノ、N - ( 1 - 6 C ) アルキル - ( 3 - 6 C ) アルキノイルアミノ、N - ( 1 - 6 C ) アルキルスルファモイル、N , N - ジ - [ ( 1 - 6 C ) アルキル ] スルファモイル、( 1 - 6 C ) アルカンスルホニルアミノ、N - ( 1 - 6 C ) アルキル - ( 1 - 6 C ) アルカンスルホニルアミノ、及び以下の式：

- X<sup>2</sup> - R<sup>8</sup>

の基から選択される、同一又は異なることができる一つ又はそれより多い置換基を所望により保有していくてもよく、

式中、X<sup>2</sup>は、直接結合であるか、又はO、CO及びN(R<sup>9</sup>)から選択され、ここにおいてR<sup>9</sup>は、水素又は( 1 - 6 C ) アルキルであり、そしてR<sup>8</sup>は、ハロゲノ - ( 1 - 6 C ) アルキル、ヒドロキシ - ( 1 - 6 C ) アルキル、カルボキシ - ( 1 - 6 C ) アルキル、( 1 - 6 C ) アルコキシ - ( 1 - 6 C ) アルキル、シアノ - ( 1 - 6 C ) アルキル、アミノ - ( 1 - 6 C ) アルキル、N - ( 1 - 6 C ) アルキルアミノ - ( 1 - 6 C ) アルキル、N , N - ジ - [ ( 1 - 6 C ) アルキル ] アミノ - ( 1 - 6 C ) アルキル、( 2 - 6 C ) アルカノイルアミノ - ( 1 - 6 C ) アルキル、N - ( 1 - 6 C ) アルキル - ( 2 - 6 C )

) アルカノイルアミノ - ( 1 - 6 C ) アルキル、( 1 - 6 C ) アルコキシカルボニルアミノ - ( 1 - 6 C ) アルキル、カルバモイル - ( 1 - 6 C ) アルキル、N - ( 1 - 6 C ) アルキルカルバモイル - ( 1 - 6 C ) アルキル、N , N - ジ - [ ( 1 - 6 C ) アルキル ] カルバモイル - ( 1 - 6 C ) アルキル、( 1 - 6 C ) アルキルチオ - ( 1 - 6 C ) アルキル、( 1 - 6 C ) アルキルスルフィニル - ( 1 - 6 C ) アルキル、( 1 - 6 C ) アルキルスルホニル - ( 1 - 6 C ) アルキルスルファモイル ( 1 - 6 C ) アルキル、N , N - ジ - ( 1 - 6 C ) アルキルスルファモイル ( 1 - 6 C ) アルキル、( 2 - 6 C ) アルカノイル - ( 1 - 6 C ) アルキル、( 2 - 6 C ) アルカノイルオキシ - ( 1 - 6 C ) アルキル又は ( 1 - 6 C ) アルコキシカルボニル - ( 1 - 6 C ) アルキルであり、

そしてここにおいて、- X<sup>1</sup> - Q<sup>1</sup> 内のいずれもの C H<sub>2</sub> 又は C H<sub>3</sub> 基は、それぞれの前記 C H<sub>2</sub> 又は C H<sub>3</sub> 基において、一つ若しくはそれより多いハロゲノ又は ( 1 - 6 C ) アルキル置換基を、或いはヒドロキシ、シアノ、アミノ、( 1 - 4 C ) アルコキシ、( 1 - 4 C ) アルキルアミノ及びジ - [ ( 1 - 4 C ) アルキルアミノ ] から選択される置換基を所望により保有していくてもよく；

同一又は異なっていることができる R<sup>4</sup> 、 R<sup>4 a</sup> 、 R<sup>5</sup> 及び R<sup>5 a</sup> は、水素及び ( 1 - 6 C ) アルキルから選択されるか、或いは

R<sup>4</sup> 及び R<sup>4 a</sup> は、これらが接続している炭素原子といっしょに、( 3 - 7 C ) シクロアルキル環を形成し、或いは

R<sup>5</sup> 及び R<sup>5 a</sup> は、これらが接続している炭素原子といっしょに、( 3 - 7 C ) シクロアルキル環を形成し、

そしてここにおいて、いずれもの R<sup>4</sup> 、 R<sup>4 a</sup> 、 R<sup>5</sup> 及び R<sup>5 a</sup> 内のいずれもの C H<sub>2</sub> 又は C H<sub>3</sub> 基は、それぞれの前記 C H<sub>2</sub> 又は C H<sub>3</sub> 基において、一つ又はそれより多いハロゲノ置換基を、或いはヒドロキシ、シアノ、( 1 - 6 C ) アルコキシ、アミノ、( 2 - 6 C ) アルカノイル、( 1 - 6 C ) アルキルアミノ及びジ - [ ( 1 - 6 C ) アルキルアミノ ] から選択される置換基を所望により保有していくてもよく；

R<sup>6</sup> は、水素、( 1 - 6 C ) アルキル、( 2 - 6 C ) アルケニル、( 2 - 6 C ) アルキニル、( 3 - 7 C ) シクロアルキル、( 3 - 7 C ) シクロアルキル - ( 1 - 6 C ) アルキル、( 3 - 7 C ) シクロアルケニル、( 3 - 7 C ) シクロアルケニル - ( 1 - 6 C ) アルキル、ヘテロシクリル及びヘテロシクリル - ( 1 - 6 C ) アルキルから選択され、

そしてここにおいて、R<sup>6</sup> 置換基内のいずれものヘテロシクリル基は、ハロゲノ、トリフルオロメチル、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、アミノ、ホルミル、メルカプト、( 1 - 6 C ) アルキル、( 2 - 6 C ) アルケニル、( 2 - 6 C ) アルキニル、( 1 - 6 C ) アルコキシ、( 1 - 6 C ) アルキルチオ、( 1 - 6 C ) アルキルスルフィニル、( 1 - 6 C ) アルキルスルホニル、( 1 - 6 C ) アルキルアミノ、ジ - [ ( 1 - 6 C ) アルキル ] アミノ、( 2 - 6 C ) アルカノイル、( 2 - 6 C ) アルカノイルオキシから、及び以下の式：  
- X<sup>3</sup> - R<sup>1 0</sup>

の基から選択される同一又は異なっていることができる、一つ若しくはそれより多い置換基を所望により保有していくてもよく、

式中、X<sup>3</sup> は、直接結合であるか、又は O 、 CO 、 SO<sub>2</sub> 及び N ( R<sup>1 1</sup> ) から選択され、ここにおいて R<sup>1 1</sup> は、水素又は ( 1 - 4 C ) アルキルであり、そして R<sup>1 0</sup> は、ハロゲノ - ( 1 - 4 C ) アルキル、ヒドロキシ - ( 1 - 4 C ) アルキル、( 1 - 4 C ) アルコキシ - ( 1 - 4 C ) アルキル、シアノ - ( 1 - 4 C ) アルキル、アミノ - ( 1 - 4 C ) アルキル、N - ( 1 - 4 C ) アルキルアミノ - ( 1 - 4 C ) アルキル及びN , N - ジ - [ ( 1 - 4 C ) アルキル ] アミノ - ( 1 - 4 C ) アルキルであり、

そしてここにおいて、R<sup>6</sup> 置換基内のいずれものヘテロシクリル基は、1 又は 2 個のオキソ或いはチオキソ置換基を所望により保有していくてもよく；

そしてここにおいて、R<sup>6</sup> 置換基内の、ヘテロシクリル基内の C H<sub>2</sub> 基以外の、いずれもの C H<sub>2</sub> 又は C H<sub>3</sub> 基は、それぞれの前記 C H<sub>2</sub> 又は C H<sub>3</sub> 基において、一つ若しくはそれより多いハロゲノ又は ( 1 - 6 C ) アルキル置換基を、或いはヒドロキシ、シアノ、

アミノ、カルボキシ、カルバモイル、スルファモイル、(2-6C)アルケニル、(2-6C)アルキニル、(1-6C)アルコキシ、(1-6C)アルキルチオ、(1-6C)アルキルスルフィニル、(1-6C)アルキルスルホニル、(1-6C)アルキルアミノ、ジ-[(1-6C)アルキル]アミノ、N-(1-6C)アルキルカルバモイル、N,N-ジ-[(1-6C)アルキル]カルバモイル、(2-6C)アルカノイル、(2-6C)アルカノイルオキシ、(2-6C)アルカノイルアミノ、N-(1-6C)アルキル-[(2-6C)アルカノイルアミノ、N-(1-6C)アルキルスルファモイル、N,N-ジ-[(1-6C)アルキル]スルファモイル、(1-6C)アルカンスルホニルアミノ及びN-(1-6C)アルキル-[(1-6C)アルカンスルホニルアミノから選択される置換基を所望により保有していくてもよく；

Aは、水素、式Z-(CR<sup>1-2</sup>R<sup>1-3</sup>)<sub>p</sub>-の基及びR<sup>1-4</sup>から選択され、

ここにおいてpは、1、2、3、又は4であり、

同一又は異なることができるそれぞれのR<sup>1-2</sup>及びR<sup>1-3</sup>は、水素、(1-6C)アルキル、(2-6C)アルケニル及び(2-6C)アルキニルから選択され、

或いは同一の炭素原子に接続しているR<sup>1-2</sup>及びR<sup>1-3</sup>基は、(3-7C)シクロアルキル又は(3-7C)シクロアルケニル環を形成し、

そしてここにおいて、いずれものR<sup>1-2</sup>及びR<sup>1-3</sup>内のいずれものCH<sub>2</sub>又はCH<sub>3</sub>基は、それぞれの前記CH<sub>2</sub>又はCH<sub>3</sub>基において、一つ若しくはそれより多いハロゲン又は(1-6C)アルキル置換基を、或いはヒドロキシ、シアノ、(1-6C)アルキル、(1-6C)アルコキシ、アミノ、(2-6C)アルカノイル、(1-6C)アルキルアミノ及びジ-[(1-6C)アルキル]アミノから選択される置換基を所望により保有していくてもよく、

Zは、水素、OR<sup>1-5</sup>、NR<sup>1-6</sup>R<sup>1-7</sup>、(1-6C)アルキルスルホニル、(1-6C)アルカンスルホニルアミノ及びN-(1-6C)アルキル-[(1-6C)アルカンスルホニルアミノから選択され、ここにおいて同一又は異なることができるそれぞれのR<sup>1-5</sup>、R<sup>1-6</sup>及びR<sup>1-7</sup>は、水素、(1-6C)アルキル、(2-6C)アルケニル及び(2-6C)アルキニルから選択され、

或いはZは、以下の式：

Q<sup>2</sup>-X<sup>4</sup>-

の基であり、

式中、X<sup>4</sup>は、O、N(R<sup>1-8</sup>)、SO<sub>2</sub>及びSO<sub>2</sub>N(R<sup>1-8</sup>)から選択され、ここにおいてR<sup>1-8</sup>は、水素又は(1-6C)アルキルであり、そしてQ<sup>2</sup>は、(3-7C)シクロアルキル、(3-7C)シクロアルケニル又はヘテロシクリルであり、

R<sup>1-4</sup>は、水素、OR<sup>1-9</sup>及びNR<sup>1-6</sup>R<sup>1-7</sup>から選択され、ここにおいてR<sup>1-9</sup>は、(1-6C)アルキル、(2-6C)アルケニル及び(2-6C)アルキニルから選択され、そしてここにおいて、R<sup>1-6</sup>及びR<sup>1-7</sup>は、先に定義したとおりであり、

或いはR<sup>1-4</sup>は、以下の式：

Q<sup>3</sup>-X<sup>5</sup>-

の基であり、

式中、X<sup>5</sup>は、O及びN(R<sup>2-0</sup>)から選択され、ここにおいてR<sup>2-0</sup>は、水素又は(1-6C)アルキルであり、そしてQ<sup>3</sup>は、(3-7C)シクロアルキル、(3-7C)シクロアルキル-[(1-6C)アルキル、(3-7C)シクロアルケニル、(3-7C)シクロアルケニル-[(1-6C)アルキル、ヘテロシクリル及びヘテロシクリル-[(1-6C)アルキルであり、

或いはR<sup>1-4</sup>は、Q<sup>4</sup>であり、ここにおいてQ<sup>4</sup>は、(3-7C)シクロアルキル、(3-7C)シクロアルケニル又はヘテロシクリルであり、

そしてここにおいて、Z又はR<sup>1-4</sup>置換基内のいずれもの(2-6C)アルキレン鎖中の隣接する炭素原子は、O、S、SO、SO<sub>2</sub>、N(R<sup>2-1</sup>)、CO、-C=C-及び-C-C-から選択される基の、鎖への挿入によって所望により分離されていてもよく、ここにおいてR<sup>2-1</sup>は、水素又は(1-6C)アルキルであり、

そしてここにおいて、Z又はR<sup>1-4</sup>置換基内のいずれものヘテロシクリル基は、ハロゲノ、トリフルオロメチル、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、アミノ、ホルミル、メルカプト、(1-6C)アルキル、(2-6C)アルケニル、(2-6C)アルキニル、(1-6C)アルコキシ、(1-6C)アルキルチオ、(1-6C)アルキルスルフィニル、(1-6C)アルキルスルホニル、(1-6C)アルキルアミノ、ジ-[(1-6C)アルキル]アミノ、(2-6C)アルカノイル、(2-6C)アルカノイルオキシから、及び以下の式：

$$-X^6 - R^{2-2}$$

の基から選択される同一又は異なっていることができる、一つ若しくはそれより多い置換基を所望により保有してもよく、

式中、X<sup>6</sup>は、直接結合であるか、又はO、CO、SO<sub>2</sub>及びN(R<sup>2-3</sup>)から選択され、ここにおいてR<sup>2-3</sup>は、水素又は(1-4C)アルキルであり、そしてR<sup>2-2</sup>は、ハロゲノ-(1-4C)アルキル、ヒドロキシ-(1-4C)アルキル、(1-4C)アルコキシ-(1-4C)アルキル、シアノ-(1-4C)アルキル、アミノ-(1-4C)アルキル、N-(1-4C)アルキルアミノ-(1-4C)アルキル及びN,N-ジ-[(1-4C)アルキル]アミノ-(1-4C)アルキルであり、

そしてここにおいて、Z又はR<sup>1-4</sup>置換基内のいずれものヘテロシクリル基は、1若しくは2個のオキソ又はチオキソ置換基を所望により保有してもよく、

そしてここにおいて、Z又はR<sup>1-4</sup>基内の、ヘテロシクリル環内のCH<sub>2</sub>基以外のいずれものCH<sub>2</sub>又はCH<sub>3</sub>基は、それぞれの前記CH<sub>2</sub>又はCH<sub>3</sub>基において、一つ若しくはそれより多いハロゲノ又は(1-6C)アルキル置換基を、或いはヒドロキシ、シアノ、アミノ、カルボキシ、カルバモイル、スルファモイル、(2-6C)アルケニル、(2-6C)アルキニル、(1-6C)アルコキシ、(1-6C)アルキルチオ、(1-6C)アルキルスルフィニル、(1-6C)アルキルスルホニル、(1-6C)アルキルアミノ、ジ-[(1-6C)アルキル]アミノ、N-(1-6C)アルキルカルバモイル、N,N-ジ-[(1-6C)アルキル]カルバモイル、(2-6C)アルカノイル、(2-6C)アルカノイルオキシ、(2-6C)アルカノイルアミノ、N-(1-6C)アルキルスルファモイル、N,N-ジ-[(1-6C)アルキル]スルファモイル、(1-6C)アルカンスルホニルアミノ及びN-(1-6C)アルキル-(1-6C)アルカンスルホニルアミノから選択される置換基を所望により保有してもよい；

請求項1に記載のキナゾリン誘導体、又は医薬的に受容可能なその塩。

### 【請求項3】

同一又は異なることができるR<sup>4</sup>、R<sup>4-a</sup>、R<sup>5</sup>及びR<sup>5-a</sup>が、水素及び(1-6C)アルキルから選択され、そしてここにおいて、いずれものR<sup>4</sup>、R<sup>4-a</sup>、R<sup>5</sup>及びR<sup>5-a</sup>内のいずれものCH<sub>2</sub>又はCH<sub>3</sub>基が、それぞれの前記CH<sub>2</sub>又はCH<sub>3</sub>基において、一つ又はそれより多いハロゲノ置換基を、或いはヒドロキシ、シアノ、(1-6C)アルコキシ、アミノ、(2-6C)アルカノイル、(1-6C)アルキルアミノ及びジ-[(1-6C)アルキルアミノ]から選択される置換基を所望により保有してもよい、請求項1又は請求項2のいずれか1項に記載のキナゾリン誘導体。

### 【請求項4】

mが0である、請求項1ないし3のいずれか1項に記載のキナゾリン誘導体。

### 【請求項5】

R<sup>2</sup>が水素である、請求項1ないし4のいずれか1項に記載のキナゾリン誘導体。

### 【請求項6】

nが、0、1又は2であり、そして存在する場合、少なくとも一つのR<sup>3</sup>が、式I中のアニリノ基の窒素に関してメタ位(3位)にある、請求項1ないし5のいずれか1項に記載のキナゾリン誘導体。

### 【請求項7】

nが1であり、そしてR<sup>3</sup>が、ハロゲノ及び(1-4C)アルキルから選択される、請

求項 1 ないし 6 のいずれか 1 項に記載のキナゾリン誘導体。

【請求項 8】

$R^3$  がクロロである、請求項 7 に記載のキナゾリン誘導体。

【請求項 9】

$R^3$  がメチルである、請求項 7 に記載のキナゾリン誘導体。

【請求項 10】

$X^1$  が、O、S、 $OC(R^7)_2$ 、 $SC(R^7)_2$ 、 $SO$ 、 $SO_2$ 、 $N(R^7)$ 、 $CO$  及び  $N(R^7)C(R^7)_2$  から選択され、ここにおいて同一又は異なっていることができるそれぞれの  $R^7$  は、水素又は (1 - 6 C) アルキルから選択される、請求項 1 ないし 9 のいずれか 1 項に記載のキナゾリン誘導体。

【請求項 11】

$X^1$  が、O、S 及び  $OC(R^7)_2$  から選択され、ここにおいてそれぞれの  $R^7$  は、独立に水素又は (1 - 4 C) アルキルである、請求項 1 ないし 10 のいずれか 1 項に記載のキナゾリン誘導体。

【請求項 12】

$X^1$  が  $OC_2H_5$  である、請求項 1 ないし 11 のいずれか 1 項に記載のキナゾリン誘導体。

【請求項 13】

$Q^1$  が、フェニル及び 5 - 又は 6 員の単環式ヘテロアリール環から選択され、この環は、酸素、窒素及び硫黄から独立に選択される 1、2 又は 3 個のヘテロ原子を含有し、

そしてここにおいて、 $Q^1$  は、ハロゲノ、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、アミノ、カルボキシ、カルバモイル、スルファモイル、ホルミル、メルカプト、(1 - 6 C) アルキル、(2 - 8 C) アルケニル、(2 - 8 C) アルキニル、(1 - 6 C) アルコキシ、(2 - 6 C) アルケニルオキシ、(2 - 6 C) アルキニルオキシ、(1 - 6 C) アルキルチオ、(1 - 6 C) アルキルスルフィニル、(1 - 6 C) アルキルスルホニル、(1 - 6 C) アルキルアミノ、ジ - [(1 - 6 C) アルキル] アミノ、(1 - 6 C) アルコキシカルボニル、 $N - (1 - 6 C)$  アルキルカルバモイル、 $N, N - \text{ジ} - [(1 - 6 C) \text{アルキル}]$  カルバモイル、(2 - 6 C) アルカノイル、(3 - 6 C) アルケノイル、(3 - 6 C) アルキノイル、(2 - 6 C) アルカノイルオキシ、(2 - 6 C) アルカノイルアミノ、 $N - (1 - 6 C)$  アルキル - (2 - 6 C) アルカノイルアミノ、(3 - 6 C) アルケノイルアミノ、 $N - (1 - 6 C)$  アルキル - (3 - 6 C) アルケノイルアミノ、(3 - 6 C) アルキノイルアミノ、 $N - (1 - 6 C)$  アルキル - (3 - 6 C) アルキノイルアミノ、 $N, N - \text{ジ} - [(1 - 6 C) \text{アルキル}]$  スルファモイル、(1 - 6 C) アルカンスルホニルアミノ、 $N - (1 - 6 C)$  アルキル - (1 - 6 C) アルカンスルホニルアミノ、及び以下の式：

-  $X^2 - R^8$

の基から選択される同一又は異なっていることができる、一つ若しくはそれより多い置換基を所望により保有していてもよく、

式中、 $X^2$  は、直接結合であるか、又は O、CO 及び  $N(R^9)$  から選択され、ここにおいて  $R^9$  は、水素又は (1 - 6 C) アルキルであり、そして  $R^8$  は、ハロゲノ - (1 - 6 C) アルキル、ヒドロキシ - (1 - 6 C) アルキル、カルボキシ - (1 - 6 C) アルキル、(1 - 6 C) アルコキシ - (1 - 6 C) アルキル、シアノ - (1 - 6 C) アルキル、アミノ - (1 - 6 C) アルキル、 $N - (1 - 6 C)$  アルキルアミノ - (1 - 6 C) アルキル、 $N, N - \text{ジ} - [(1 - 6 C) \text{アルキル}]$  アミノ - (1 - 6 C) アルキル、(2 - 6 C) アルカノイルアミノ - (1 - 6 C) アルキル、 $N - (1 - 6 C)$  アルキル - (2 - 6 C) アルカノイルアミノ - (1 - 6 C) アルキル、(1 - 6 C) アルコキシカルボニルアミノ - (1 - 6 C) アルキル、カルバモイル - (1 - 6 C) アルキル、 $N - (1 - 6 C)$  アルキルカルバモイル - (1 - 6 C) アルキル、 $N, N - \text{ジ} - [(1 - 6 C) \text{アルキル}]$  カルバモイル - (1 - 6 C) アルキル、(1 - 6 C) アルキルチオ - (1 - 6 C) アルキル、(1 - 6 C) アルキルスルフィニル - (1 - 6 C) アルキル、(1 - 6 C) アルキルス

ルホニル - (1 - 6 C) アルキルスルファモイル (1 - 6 C) アルキル、N - (1 - 6 C) アルキルスルファモイル (1 - 6 C) アルキル、N, N - ジ - (1 - 6 C) アルキルスルファモイル (1 - 6 C) アルキル、(2 - 6 C) アルカノイル - (1 - 6 C) アルキル、(2 - 6 C) アルカノイルオキシ - (1 - 6 C) アルキル又は (1 - 6 C) アルコキシカルボニル - (1 - 6 C) アルキルであり、

そしてここにおいて、-X<sup>1</sup>-Q<sup>1</sup>内のいずれものCH<sub>2</sub>又はCH<sub>3</sub>基は、それぞれの前記CH<sub>2</sub>又はCH<sub>3</sub>基において、一つ若しくはそれより多いハロゲノ又は(1 - 6 C)アルキル置換基を、或いはヒドロキシ、シアノ、アミノ、(1 - 4 C)アルコキシ、(1 - 4 C)アルキルアミノ及びジ - [(1 - 4 C)アルキルアミノ]から選択される一つの置換基を所望により保有していてもよい、請求項1ないし12のいずれか1項に記載のキナゾリン誘導体。

#### 【請求項14】

Q<sup>1</sup>が、フェニル、ピリジル、ピラジニル、1,3-チアゾリル、1H-イミダゾリル、1H-ピラゾリル、1,3-オキサゾリル及びイソオキサゾリルから選択される、請求項1ないし13のいずれか1項に記載のキナゾリン誘導体。

#### 【請求項15】

R<sup>6</sup>が、水素、(1 - 3 C)アルキル、(2 - 3 C)アルケニル、(2 - 3 C)アルキニル、(3 - 5 C)シクロアルキル、(3 - 5 C)シクロアルキル - (1 - 3 C)アルキル、ヘテロシクリル及びヘテロシクリル - (1 - 3 C)アルキルから選択され、

ここにおいてR<sup>6</sup>内のいずれものヘテロシクリル基が、酸素、窒素及び硫黄から選択される1若しくは2個のヘテロ原子を含有する4、5、6又は7員の単環式の飽和或いは部分的に飽和のヘテロシクリル環であり、このヘテロシクリル基は、環の炭素原子によってこれが接続している基に連結し、

そしてここにおいて、R<sup>6</sup>置換基内のいずれものヘテロシクリル基は、ハロゲノ、トリフルオロメチル、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、アミノ、メルカブト、(1 - 6 C)アルキル、(2 - 6 C)アルケニル、(2 - 6 C)アルキニル、(1 - 6 C)アルコキシ、(1 - 6 C)アルキルチオ、(1 - 6 C)アルキルスルフィニル、(1 - 6 C)アルキルスルホニル、(1 - 6 C)アルキルアミノ、ジ - [(1 - 6 C)アルキル]アミノ、(2 - 6 C)アルカノイル、(2 - 6 C)アルカノイルオキシから、及び以下の式：

$$-X^3-R^{10}$$

の基から選択される同一又は異なっていることができる、一つ若しくはそれより多い置換基を所望により保有していてもよく、

式中、X<sup>3</sup>は、直接結合であるか、又はO及びN(R<sup>11</sup>)から選択され、ここにおいてR<sup>11</sup>は、水素又は(1 - 4 C)アルキルであり、そしてR<sup>10</sup>は、ハロゲノ - (1 - 4 C)アルキル、ヒドロキシ - (1 - 4 C)アルキル、(1 - 4 C)アルコキシ - (1 - 4 C)アルキル、シアノ - (1 - 4 C)アルキル、アミノ - (1 - 4 C)アルキル、N - (1 - 4 C)アルキルアミノ - (1 - 4 C)アルキル及びN, N - ジ - [(1 - 4 C)アルキル]アミノ - (1 - 4 C)アルキルであり、

そしてここにおいて、R<sup>6</sup>置換基内のいずれものヘテロシクリル基は、1又は2個のオキソ置換基を所望により保有していてもよく；

そしてここにおいて、R<sup>6</sup>置換基内の、ヘテロシクリル基内のCH<sub>2</sub>基以外のいずれものCH<sub>2</sub>又はCH<sub>3</sub>基は、それぞれの前記CH<sub>2</sub>又はCH<sub>3</sub>基において、一つ又はそれより多いハロゲノ又は(1 - 6 C)アルキル置換基を、或いはヒドロキシ、アミノ、(1 - 6 C)アルコキシ、(1 - 6 C)アルキルアミノ及びジ - [(1 - 6 C)アルキル]アミノから選択される置換基を所望により保有していてもよい、請求項1ないし14のいずれか1項に記載のキナゾリン誘導体。

#### 【請求項16】

R<sup>6</sup>が、(1 - 3 C)アルキルであり、

そしてここにおいて、R<sup>6</sup>置換基内の、ヘテロシクリル基内のCH<sub>2</sub>基以外のいずれものCH<sub>2</sub>又はCH<sub>3</sub>基は、それぞれの前記CH<sub>2</sub>又はCH<sub>3</sub>基において、一つ又はそれよ

り多いハロゲノ又は(1-6C)アルキル置換基を、或いはヒドロキシ、アミノ、(1-6C)アルコキシ、(1-6C)アルキルアミノ及びジ-[((1-6C)アルキル]アミノから選択される置換基を所望により保有していてもよい、請求項15に記載のキナゾリン誘導体。

【請求項17】

Aが、式Z-(CR<sup>1-2</sup> R<sup>1-3</sup>)<sub>p</sub>-の基及びR<sup>1-4</sup>から選択され、ここにおいてpは、1、2又は3であり、同一又は異なることができるそれぞれのR<sup>1-2</sup>及びR<sup>1-3</sup>は、水素及び(1-6C)アルキルから選択され、

そしてここにおいて、いずれものR<sup>1-2</sup>及びR<sup>1-3</sup>内のいずれものCH<sub>2</sub>又はCH<sub>3</sub>基は、それぞれの前記CH<sub>2</sub>又はCH<sub>3</sub>基において、一つ若しくはそれより多いハロゲノ置換基を、或いはヒドロキシ及び(1-6C)アルコキシから選択される置換基を所望により保有していてもよく、

Zは、水素、OR<sup>1-5</sup>、NR<sup>1-6</sup>R<sup>1-7</sup>及び(1-6C)アルキルスルホニルから選択され、ここにおいて同一又は異なることができるそれぞれのR<sup>1-5</sup>、R<sup>1-6</sup>及びR<sup>1-7</sup>は、水素、(1-6C)アルキル及び(1-6C)アルコキシカルボニルから選択され、

R<sup>1-4</sup>は、OR<sup>1-9</sup>及びNR<sup>1-6</sup>R<sup>1-7</sup>から選択され、ここにおいてR<sup>1-9</sup>は、(1-6C)アルキルから選択され、そしてここにおいて、R<sup>1-6</sup>及びR<sup>1-7</sup>は、先に定義したとおりであり、

或いはR<sup>1-4</sup>はQであり、ここにおいてQは、(3-7C)シクロアルキル、ヘテロシクリル又はヘテロシクリル-(1-6C)アルキルであり、

そしてここにおいて、Z又はR<sup>1-4</sup>置換基内のいずれものヘテロシクリル基は、ハロゲノ、ヒドロキシ、(1-6C)アルキル及び(1-6C)アルコキシから選択される同一又は異なることができる一つ又はそれより多い置換基を所望により保有していてもよく、

そしてここにおいて、Z又はR<sup>1-4</sup>基内の、ヘテロシクリル環内のCH<sub>2</sub>基以外のいずれものCH<sub>2</sub>又はCH<sub>3</sub>基は、それぞれの前記CH<sub>2</sub>又はCH<sub>3</sub>基において、一つ若しくはそれより多いハロゲノ又は(1-6C)アルキル置換基を、或いはヒドロキシ及び(1-6C)アルコキシから選択される置換基を所望により保有していてもよい、請求項1ないし16のいずれか1項に記載のキナゾリン誘導体。

【請求項18】

以下：

N-{2-[ (4-{3-クロロ-4-(ピリジン-2-イルメトキシ)アニリノ}キナゾリン-5-イル)オキシ]エチル}-2-メトキシ-N-メチルアセトアミド；

N-{2-[ (4-{3-クロロ-4-(ピリジン-2-イルメトキシ)アニリノ}キナゾリン-5-イル)オキシ]エチル}-2-(ジメチルアミノ)-N-メチルアセトアミド；

N-{(2R)-2-[ (4-{3-クロロ-4-(ピリジン-2-イルメトキシ)アニリノ}キナゾリン-5-イル)オキシ]プロピル}-2-メトキシ-N-メチルアセトアミド；

2-ヒドロキシ-N-メチル-N-{2-[ (4-{3-メチル-4-(ピラジン-2-イルメトキシ)アニリノ}キナゾリン-5-イル)オキシ]エチル}アセトアミド；

2-ヒドロキシ-N-メチル-N-{2-[ (4-{3-メチル-4-(1,3-チアゾール-4-イルメトキシ)アニリノ}キナゾリン-5-イル)オキシ]エチル}アセトアミド；

2-ヒドロキシ-N-メチル-N-{2-[ [4-(3-メチル-4-[ (5-メチルイソオキサゾール-3-イル)メトキシ]アニリノ)キナゾリン-5-イル]オキシ]エチル}アセトアミド；

N-{(2R)-2-[ (4-{3-クロロ-4-(ピリジン-2-イルメトキシ)ア



## アセトアミド；

N - { ( 2 R ) - 2 - [ ( 4 - { 3 - クロロ - 4 - ( 1 , 3 - チアゾール - 4 - イルメトキシ ) アニリノ } キナゾリン - 5 - イル ) オキシ ] プロピル } - 2 - ヒドロキシ - N - メチルアセトアミド ;

N - { ( 2 R ) - 2 - [ ( 4 - { 3 - クロロ - 4 - ( ピリジン - 2 - イルメトキシ ) アニリノ } キナゾリン - 5 - イル ) オキシ ] プロピル } - N - メチルアセトアミド ;

N - { 2 - [ ( 4 - { [ 3 - クロロ - 4 - ( ピリジン - 2 - イルメトキシ ) フェニル ]  
アミノ } キナゾリン - 5 - イル ) オキシ ] エチル } - N - エチルアセトアミド ;

N - { 2 - [ ( 4 - { [ 3 - クロロ - 4 - ( ピリジン - 2 - イルメトキシ ) フェニル ]  
アミノ } キナゾリン - 5 - イル ) オキシ ] エチル } - N - エチル - 2 - ヒドロキシアセト  
アミド ;

N - { 2 - [ ( 4 - { [ 3 - クロロ - 4 - ( ピリジン - 2 - イルメトキシ ) フェニル ]  
アミノ } キナゾリン - 5 - イル ) オキシ ] エチル } - N - プロピルアセトアミド ;

N - { 2 - [ ( 4 - { [ 3 - クロロ - 4 - ( ピリジン - 2 - イルメトキシ ) フェニル ]  
アミノ } キナゾリン - 5 - イル ) オキシ ] エチル } - 2 - ヒドロキシ - N - プロピルアセ

トアミド；  
N - { 2 - [ ( 4 - { [ 3 - クロロ - 4 - ( ピリジン - 2 - イルメトキシ ) フェニル ]

アミノ} キナゾリン - 5 - イル) オキシ] エチル} - N - イソプロピルアセトアミド;  
 N - { 2 - [ ( 4 - { [ 3 - クロロ - 4 - ( ピリジン - 2 - イルメトキシ ) フェニル ]  
 アミノ} キナゾリン - 5 - イル) オキシ] エチル} - 2 - ヒドロキシ - N - イソプロピル  
 アセトアミド;

N - アリル - N - { 2 - [ ( 4 - { [ 3 - クロロ - 4 - ( ピリジン - 2 - イルメトキシ ) フェニル ] アミノ } キナゾリン - 5 - イル ) オキシ ] エチル } アセトアミド :

N - アリル - N - { 2 - [ ( 4 - { [ 3 - クロロ - 4 - ( ピリジン - 2 - イルメトキシ ) フェニル ] アミノ } キナゾリン - 5 - イル ) オキシ ] エチル } - 2 - ヒドロキシアセトアミド :

N - { 2 - [ ( 4 - { [ 3 - クロロ - 4 - ( ピリジン - 2 - イルメトキシ ) フェニル ] アミノ } キナゾリン - 5 - イル ) オキシ ] T チル } - N - シクロプロピルアセトアミド :

N - { 2 - [ ( 4 - { [ 3 - クロロ - 4 - ( ピリジン - 2 - イルメトキシ ) フェニル ] アミノ } キナゾリン - 5 - イル ) オキシ ] エチル } - N - シクロプロピル - 2 - ヒドロキシアセトアミド :

N - { 2 - [ ( 4 - { [ 3 - クロロ - 4 - ( ピリジン - 2 - イルメトキシ ) フェニル ] アミノ } キナゾリン - 5 - イル ) オキシ ] エチル } - N - ( シクロプロピルメチル ) アセトアミド :

N - { 2 - [ ( 4 - { [ 3 - クロロ - 4 - ( ピリジン - 2 - イルメトキシ ) フェニル ] アミノ } キナゾリン - 5 - イル ) オキシ ] エチル } - N - ( シクロプロピルメチル ) - 2 - ヒドロキシアセトアミド :

N - { 2 - [ ( 4 - { [ 3 - クロロ - 4 - ( ピリジン - 2 - イルメトキシ ) フェニル ]  
アミノ } キナゾリン - 5 - イル ) オキシ ] チル } - N - シクロブチルアセトアミド :

N - { 2 - [ ( 4 - { [ 3 - クロロ - 4 - ( ピリジン - 2 - イルメトキシ ) フェニル ] アミノ } キナゾリン - 5 - イル ) オキシ ] エチル } - N - シクロブチル - 2 - ヒドロキシアセトアミド :

N - { 2 - [ ( 4 - { [ 3 - クロロ - 4 - ( ピリジン - 2 - イルメトキシ ) フェニル ] アミノ } キナゾリン - 5 - イル ) オキシ ] エチル } - N - ( 1 - メチルピペリジン - 4 - イル ) アセトアミド :

N - { 2 - [ ( 4 - { [ 3 - クロロ - 4 - ( ピリジン - 2 - イルメトキシ ) フェニル ]  
 アミノ } キナゾリン - 5 - イル ) オキシ ] エチル } - N - ( テトラヒドロ - 2 H - ピラン  
 - 4 - イル ) アカトアニド )

N - { 2 - [ ( 4 - { [ 3 - クロロ - 4 - ( ピリジン - 2 - イルメトキシ ) フェニル ] アミノ ) オキシカルボニル - 5 - イル ) オキシカルボニル ] - 2 - ヒドロキシ - N - ( テトラヒド

口 - 2 H - ピラン - 4 - イル) アセトアミド ;

N - { 2 - [ ( 4 - { [ 3 - クロロ - 4 - ( ピリジン - 2 - イルメトキシ ) フェニル ] アミノ } キナゾリン - 5 - イル ) オキシ ] エチル } - N - ( 2 - ヒドロキシエチル ) アセトアミド ;

N - { 2 - [ ( 4 - { [ 3 - クロロ - 4 - ( ピリジン - 2 - イルメトキシ ) フェニル ] アミノ } キナゾリン - 5 - イル ) オキシ ] エチル } - 2 - ヒドロキシ - N - ( 2 - ヒドロキシエチル ) アセトアミド ;

N - { 2 - [ ( 4 - { [ 3 - クロロ - 4 - ( ピリジン - 2 - イルメトキシ ) フェニル ] アミノ } キナゾリン - 5 - イル ) オキシ ] エチル } - N - ( 2 - メトキシエチル ) アセトアミド ;

N - { 2 - [ ( 4 - { [ 3 - クロロ - 4 - ( ピリジン - 2 - イルメトキシ ) フェニル ] アミノ } キナゾリン - 5 - イル ) オキシ ] エチル } - 2 - ヒドロキシ - N - ( 2 - メトキシエチル ) アセトアミド ;

N - { 2 - [ ( 4 - { [ 3 - クロロ - 4 - ( ピリジン - 2 - イルメトキシ ) フェニル ] アミノ } キナゾリン - 5 - イル ) オキシ ] エチル } - N - プロパ - 2 - イン - 1 - イルアセトアミド ;

N - { 2 - [ ( 4 - { [ 3 - クロロ - 4 - ( ピリジン - 2 - イルメトキシ ) フェニル ] アミノ } キナゾリン - 5 - イル ) オキシ ] エチル } - 2 - ヒドロキシ - N - プロパ - 2 - イン - 1 - イルアセトアミド ;

N - { 2 - [ ( 4 - { [ 3 - クロロ - 4 - ( ピリジン - 2 - イルメトキシ ) フェニル ] アミノ } キナゾリン - 5 - イル ) オキシ ] エチル } - 2 - ヒドロキシ - N - メチルプロパンアミド ;

N - { 2 - [ ( 4 - { [ 3 - クロロ - 4 - ( ピリジン - 2 - イルメトキシ ) フェニル ] アミノ } キナゾリン - 5 - イル ) オキシ ] エチル } - N - メチル - テトラヒドロフラニル - 2 - カルボキシアミド ;

N - { 2 - [ ( 4 - { [ 3 - クロロ - 4 - ( ピリジン - 2 - イルメトキシ ) フェニル ] アミノ } キナゾリン - 5 - イル ) オキシ ] エチル } - N , 1 - ジメチルプロリンアミド ;

N - { 2 - [ ( 4 - { [ 3 - クロロ - 4 - ( ピリジン - 2 - イルメトキシ ) フェニル ] アミノ } キナゾリン - 5 - イル ) オキシ ] エチル } - 2 - ヒドロキシ - N , 2 - ジメチルプロパンアミド ;

N - { 2 - [ ( 4 - { [ 3 - クロロ - 4 - ( ピリジン - 2 - イルメトキシ ) フェニル ] アミノ } キナゾリン - 5 - イル ) オキシ ] エチル } - 1 - ヒドロキシ - N - メチルシクロプロパンカルボキシアミド ;

N<sup>1</sup> - { 2 - [ ( 4 - { [ 3 - クロロ - 4 - ( ピリジン - 2 - イルメトキシ ) フェニル ] アミノ } キナゾリン - 5 - イル ) オキシ ] エチル } - N<sup>1</sup> , N<sup>2</sup> - ジメチルグリシンアミド ;

N - { 2 - [ ( 4 - { [ 3 - クロロ - 4 - ( ピリジン - 2 - イルメトキシ ) フェニル ] アミノ } キナゾリン - 5 - イル ) オキシ ] エチル } - 3 - ヒドロキシ - N , 2 , 2 - トリメチルプロパンアミド ;

N - { 2 - [ ( 4 - { [ 3 - クロロ - 4 - ( ピリジン - 2 - イルメトキシ ) フェニル ] アミノ } キナゾリン - 5 - イル ) オキシ ] エチル } - 3 - ヒドロキシ - N - メチルプロパンアミド ;

N - { ( 2 S ) - 2 - [ ( 4 - { [ 3 - クロロ - 4 - ( ピリジン - 2 - イルメトキシ ) フェニル ] アミノ } キナゾリン - 5 - イル ) オキシ ] プロピル } アセトアミド ;

N - { ( 2 S ) - 2 - [ ( 4 - { [ 3 - クロロ - 4 - ( ピリジン - 2 - イルメトキシ ) フェニル ] アミノ } キナゾリン - 5 - イル ) オキシ ] プロピル } - 2 - ヒドロキシアセトアミド ;

N<sup>1</sup> - { ( 2 S ) - 2 - [ ( 4 - { [ 3 - クロロ - 4 - ( ピリジン - 2 - イルメトキシ ) フェニル ] アミノ } キナゾリン - 5 - イル ) オキシ ] プロピル } - N<sup>2</sup> , N<sup>2</sup> - ジメチルグリシンアミド ;

N - { ( 2 S ) - 2 - [ ( 4 - { [ 3 - クロロ - 4 - ( ピリジン - 2 - イルメトキシ ) フェニル ] アミノ } キナゾリン - 5 - イル ) オキシ ] プロピル } - 2 - メトキシアセトアミド ;

N - { ( 2 S ) - 2 - [ ( 4 - { [ 3 - クロロ - 4 - ( ピリジン - 2 - イルメトキシ ) フェニル ] アミノ } キナゾリン - 5 - イル ) オキシ ] プロピル } - 2 - ( メチルスルホニル ) アセトアミド ;

N - { 2 - [ ( 4 - { [ 3 - クロロ - 4 - ( ピリジン - 2 - イルメトキシ ) フェニル ] アミノ } キナゾリン - 5 - イル ) オキシ ] エチル } - 2 - ヒドロキシアセトアミド ;

N<sup>1</sup> - { 2 - [ ( 4 - { [ 3 - クロロ - 4 - ( ピリジン - 2 - イルメトキシ ) フェニル ] アミノ } キナゾリン - 5 - イル ) オキシ ] エチル } - N<sup>2</sup> , N<sup>2</sup> - ジメチルグリシンアミド ;

N - { 2 - [ ( 4 - { [ 3 - クロロ - 4 - ( ピリジン - 2 - イルメトキシ ) フェニル ] アミノ } キナゾリン - 5 - イル ) オキシ ] エチル } - 2 - メトキシアセトアミド ;

N - { 2 - [ ( 4 - { [ 3 - クロロ - 4 - ( ピリジン - 2 - イルメトキシ ) フェニル ] アミノ } キナゾリン - 5 - イル ) オキシ ] エチル } - 2 - ( メチルスルホニル ) アセトアミド ;

N - { ( 2 S ) - 2 - [ ( 4 - { [ 3 - クロロ - 4 - ( ピリジン - 2 - イルメトキシ ) フェニル ] アミノ } キナゾリン - 5 - イル ) オキシ ] プロピル } - N - メチルアセトアミド ;

N - { ( 2 S ) - 2 - [ ( 4 - { [ 3 - クロロ - 4 - ( ピリジン - 2 - イルメトキシ ) フェニル ] アミノ } キナゾリン - 5 - イル ) オキシ ] プロピル } - 2 - ヒドロキシ - N - メチルアセトアミド ;

N<sup>1</sup> - { ( 2 S ) - 2 - [ ( 4 - { [ 3 - クロロ - 4 - ( ピリジン - 2 - イルメトキシ ) フェニル ] アミノ } キナゾリン - 5 - イル ) オキシ ] プロピル } - N<sup>1</sup> , N<sup>2</sup> , N<sup>2</sup> - トリメチルグリシンアミド ;

N - { ( 2 S ) - 2 - [ ( 4 - { [ 3 - クロロ - 4 - ( ピリジン - 2 - イルメトキシ ) フェニル ] アミノ } キナゾリン - 5 - イル ) オキシ ] プロピル } - 2 - メトキシ - N - メチルアセトアミド ;

N - { ( 2 S ) - 2 - [ ( 4 - { [ 3 - クロロ - 4 - ( ピリジン - 2 - イルメトキシ ) フェニル ] アミノ } キナゾリン - 5 - イル ) オキシ ] プロピル } - N - メチル - 2 - ( メチルスルホニル ) アセトアミド ;

N - { ( 2 R ) - 2 - [ ( 4 - { [ 3 - クロロ - 4 - ( ピラジン - 2 - イルメトキシ ) フェニル ] アミノ } キナゾリン - 5 - イル ) オキシ ] プロピル } - N - メチルアセトアミド ;

N - { ( 2 R ) - 2 - [ ( 4 - { [ 3 - クロロ - 4 - ( 1 , 3 - チアゾール - 4 - イルメトキシ ) フェニル ] アミノ } キナゾリン - 5 - イル ) オキシ ] プロピル } - N - メチルアセトアミド ;

N - { ( 2 R ) - 2 - { [ 4 - ( { 3 - クロロ - 4 - [ ( 3 - フルオロベンジル ) オキシ ] フェニル } アミノ ) キナゾリン - 5 - イル ] オキシ } プロピル } - N - メチルアセトアミド ;

N - { ( 2 R ) - 2 - { [ 4 - ( { 3 - クロロ - 4 - [ ( 2 - フルオロベンジル ) オキシ ] フェニル } アミノ ) キナゾリン - 5 - イル ] オキシ } プロピル } - N - メチルアセトアミド ;

N - { ( 1 R ) - 2 - [ ( 4 - { [ 3 - クロロ - 4 - ( ピリジン - 2 - イルメトキシ ) フェニル ] アミノ } キナゾリン - 5 - イル ) オキシ ] - 1 - メチルエチル } - 2 - ヒドロキシ - N - メチルアセトアミド ;

N - { ( 1 R ) - 2 - [ ( 4 - { [ 3 - クロロ - 4 - ( ピリジン - 2 - イルメトキシ ) フェニル ] アミノ } キナゾリン - 5 - イル ) オキシ ] - 1 - メチルエチル } - N - メチルアセトアミド ;

N - { ( 1 S ) - 2 - [ ( 4 - { [ 3 - クロロ - 4 - ( ピリジン - 2 - イルメトキシ )

フェニル]アミノ}キナゾリン-5-イル)オキシ]-1-メチルエチル}-2-ヒドロキシ-N-メチルアセトアミド;  
 N-{(1S)-2-[ (4-{[3-クロロ-4-(ピリジン-2-イルメトキシ)フェニル]アミノ}キナゾリン-5-イル)オキシ]-1-メチルエチル}-N-メチルアセトアミド;  
 N-{(1S)-2-[ (4-{[3-クロロ-4-(ピリジン-2-イルメトキシ)フェニル]アミノ}キナゾリン-5-イル)オキシ]-1-メチルエチル}-2-メトキシ-N-メチルアセトアミド;  
 N-{(1S)-2-[ (4-{[3-クロロ-4-(ピリジン-2-イルメトキシ)フェニル]アミノ}キナゾリン-5-イル)オキシ]-1-メチルエチル}-2-ヒドロキシアセトアミド;  
 N-{(1S)-2-[ (4-{[3-クロロ-4-(ピリジン-2-イルメトキシ)フェニル]アミノ}キナゾリン-5-イル)オキシ]-1-メチルエチル}アセトアミド;  
 N<sup>1</sup>-{ (1S)-2-[ (4-{[3-クロロ-4-(ピリジン-2-イルメトキシ)フェニル]アミノ}キナゾリン-5-イル)オキシ]-1-メチルエチル}-N<sup>2</sup>, N<sup>2</sup>-ジメチルグリシンアミド;  
 N<sup>1</sup>-{ (2R)-2-[ (4-{[3-クロロ-4-(ピリジン-2-イルメトキシ)フェニル]アミノ}キナゾリン-5-イル)オキシ]プロピル}-N<sup>2</sup>, N<sup>2</sup>-ジメチルグリシンアミド;  
 (2S)-N-{2-[ (4-{[3-クロロ-4-(ピリジン-2-イルメトキシ)フェニル]アミノ}キナゾリン-5-イル)オキシ]エチル}-2, 4-ジヒドロキシブタンアミド;  
 (2R)-N-{2-[ (4-{[3-クロロ-4-(ピリジン-2-イルメトキシ)フェニル]アミノ}キナゾリン-5-イル)オキシ]エチル}-2, 4-ジヒドロキシブタンアミド;  
 (2R)-N-{ (2R)-2-[ (4-{[3-クロロ-4-(ピリジン-2-イルメトキシ)フェニル]アミノ}キナゾリン-5-イル)オキシ]プロピル}-2, 4-ジヒドロキシブタンアミド;  
 (2S)-N-{ (2R)-2-[ (4-{[3-クロロ-4-(ピリジン-2-イルメトキシ)フェニル]アミノ}キナゾリン-5-イル)オキシ]プロピル}-2, 4-ジヒドロキシブタンアミド;  
 (2R)-N-{ (2S)-2-[ (4-{[3-クロロ-4-(ピリジン-2-イルメトキシ)フェニル]アミノ}キナゾリン-5-イル)オキシ]プロピル}-2, 4-ジヒドロキシブタンアミド;  
 (2S)-N-{ (2S)-2-[ (4-{[3-クロロ-4-(ピリジン-2-イルメトキシ)フェニル]アミノ}キナゾリン-5-イル)オキシ]プロピル}-2, 4-ジヒドロキシブタンアミド;  
 (2S)-N-{ (1R)-2-[ (4-{[3-クロロ-4-(ピリジン-2-イルメトキシ)フェニル]アミノ}キナゾリン-5-イル)オキシ]-1-メチルエチル}-2, 4-ジヒドロキシブタンアミド;  
 (2R)-N-{ (1R)-2-[ (4-{[3-クロロ-4-(ピリジン-2-イルメトキシ)フェニル]アミノ}キナゾリン-5-イル)オキシ]-1-メチルエチル}-2, 4-ジヒドロキシブタンアミド;  
 (2R)-N-{2-[ (4-{[3-クロロ-4-(1, 3-チアゾール-4-イルメトキシ)フェニル]アミノ}キナゾリン-5-イル)オキシ]エチル}-2, 4-ジヒドロキシブタンアミド;  
 (2S)-N-{2-[ (4-{[3-クロロ-4-(1, 3-チアゾール-4-イルメトキシ)フェニル]アミノ}キナゾリン-5-イル)オキシ]エチル}-2, 4-ジヒドロキシブタンアミド;

( 2 R ) - N - { ( 1 R ) - 2 - [ ( 4 - { [ 3 - クロロ - 4 - ( 1 , 3 - チアゾール - 4 - イルメトキシ ) フェニル ] アミノ } キナゾリン - 5 - イル ) オキシ ] - 1 - メチルエチル } - 2 , 4 - ジヒドロキシブタンアミド ;

( 2 S ) - N - { ( 1 R ) - 2 - [ ( 4 - { [ 3 - クロロ - 4 - ( 1 , 3 - チアゾール - 4 - イルメトキシ ) フェニル ] アミノ } キナゾリン - 5 - イル ) オキシ ] - 1 - メチルエチル } - 2 , 4 - ジヒドロキシブタンアミド ;

N - メチル - N - { 2 - [ ( 4 - { [ 3 - メチル - 4 - ( ピリジン - 2 - イルメトキシ ) フェニル ] アミノ } キナゾリン - 5 - イル ) オキシ ] エチル } アセトアミド ;

N - メチル - N - { 2 - [ ( 4 - { [ 3 - メチル - 4 - ( 1 , 3 - チアゾール - 4 - イルメトキシ ) フェニル ] アミノ } キナゾリン - 5 - イル ) オキシ ] エチル } アセトアミド ;

N - メチル - N - ( 2 - { [ 4 - ( { 3 - メチル - 4 - [ ( 5 - メチルイソオキサゾール - 3 - イル ) メトキシ ] フェニル ] アミノ } キナゾリン - 5 - イル ) オキシ } エチル ) アセトアミド ;

2 - ヒドロキシ - N - メチル - N - { 2 - [ ( 4 - { [ 3 - メチル - 4 - ( 1 , 3 - チアゾール - 2 - イルメトキシ ) フェニル ] アミノ } キナゾリン - 5 - イル ) オキシ ] エチル } アセトアミド ;

2 - ヒドロキシ - N - { 2 - [ ( 4 - { [ 3 - メチル - 4 - ( ピリジン - 2 - イルメトキシ ) フェニル ] アミノ } キナゾリン - 5 - イル ) オキシ ] エチル } アセトアミド ;

2 - ヒドロキシ - N - { 2 - [ ( 4 - { [ 3 - メチル - 4 - ( 1 , 3 - チアゾール - 4 - イルメトキシ ) フェニル ] アミノ } キナゾリン - 5 - イル ) オキシ ] エチル } アセトアミド ;

N - { 2 - [ ( 4 - { [ 3 - クロロ - 4 - ( ピリジン - 2 - イルメトキシ ) フェニル ] アミノ } キナゾリン - 5 - イル ) オキシ ] - 1 , 1 - ジメチルエチル } - 2 - ヒドロキシアセトアミド ;

2 - ヒドロキシ - N - { ( 2 R ) - 2 - [ ( 4 - { [ 3 - メチル - 4 - ( ピリジン - 2 - イルメトキシ ) フェニル ] アミノ } キナゾリン - 5 - イル ) オキシ ] プロピル } アセトアミド ;

2 - ヒドロキシ - N - { ( 2 R ) - 2 - [ ( 4 - { [ 3 - メチル - 4 - ( 1 , 3 - チアゾール - 4 - イルメトキシ ) フェニル ] アミノ } キナゾリン - 5 - イル ) オキシ ] プロピル } アセトアミド ;

N - ( ( 2 R ) - 2 - { [ 4 - ( { 4 - [ ( 3 - フルオロベンジル ) オキシ ] - 3 - メチルフェニル } アミノ ) キナゾリン - 5 - イル ] オキシ } プロピル ) - 2 - ヒドロキシアセトアミド ;

2 - ヒドロキシ - N - { ( 2 R ) - 2 - [ ( 4 - { [ 3 - メチル - 4 - ( 1 , 3 - チアゾール - 2 - イルメトキシ ) フェニル ] アミノ } キナゾリン - 5 - イル ) オキシ ] プロピル } アセトアミド ;

N - { ( 2 R ) - 2 - [ ( 4 - { [ 3 - メチル - 4 - ( ピリジン - 2 - イルメトキシ ) フェニル ] アミノ } キナゾリン - 5 - イル ) オキシ ] プロピル } アセトアミド ;

N - { ( 2 R ) - 2 - [ ( 4 - { [ 3 - メチル - 4 - ( 1 , 3 - チアゾール - 4 - イルメトキシ ) フェニル ] アミノ } キナゾリン - 5 - イル ) オキシ ] プロピル } アセトアミド ;

N - ( ( 2 R ) - 2 - { [ 4 - ( { 4 - [ ( 3 - フルオロベンジル ) オキシ ] 3 - メチルフェニル } アミノ ) キナゾリン - 5 - イル ] オキシ } プロピル ) アセトアミド ;

N - { ( 2 R ) - 2 - [ ( 4 - { [ 3 - メチル - 4 - ( 1 , 3 - チアゾール - 2 - イルメトキシ ) フェニル ] アミノ } キナゾリン - 5 - イル ) オキシ ] プロピル } アセトアミド ;

2 - ヒドロキシ - N - メチル - N - { ( 2 R ) - 2 - [ ( 4 - { [ 3 - メチル - 4 - ( ピリジン - 2 - イルメトキシ ) フェニル ] アミノ } キナゾリン - 5 - イル ) オキシ ] プロピル } アセトアミド ;

2 - ヒドロキシ - N - メチル - N - { ( 2 R ) - 2 - [ ( 4 - { [ 3 - メチル - 4 - ( 1 , 3 - チアゾール - 4 - イルメトキシ ) フェニル ] アミノ } キナゾリン - 5 - イル ) オキシ ] プロピル } アセトアミド ;

2 - ヒドロキシ - N - メチル - N - ( ( 2 R ) - 2 - { [ 4 - ( { 3 - メチル - 4 - [ ( 5 - メチルイソオキサゾール - 3 - イル ) メトキシ ] フェニル } アミノ ) キナゾリン - 5 - イル ] オキシ } プロピル ) アセトアミド ;

N - メチル - N - { ( 1 R ) - 1 - メチル - 2 - [ ( 4 - { [ 3 - メチル - 4 - ( ピリジン - 2 - イルメトキシ ) フェニル ] アミノ } キナゾリン - 5 - イル ) オキシ ] エチル } アセトアミド ;

N - メチル - N - { ( 1 R ) - 1 - メチル - 2 - [ ( 4 - { [ 3 - メチル - 4 - ( 1 , 3 - チアゾール - 4 - イルメトキシ ) フェニル ] アミノ } キナゾリン - 5 - イル ) オキシ ] エチル } アセトアミド ;

N - { ( 1 R ) - 2 - [ ( 4 - { [ 3 - クロロ - 4 - ( 1 , 3 - チアゾール - 4 - イルメトキシ ) フェニル ] アミノ } キナゾリン - 5 - イル ) オキシ ] - 1 - メチルエチル } - 2 - ヒドロキシ - N - メチルアセトアミド ;

2 - ヒドロキシ - N - メチル - N - { ( 1 R ) - 1 - メチル - 2 - [ ( 4 - { [ 3 - メチル - 4 - ( ピリジン - 2 - イルメトキシ ) フェニル ] アミノ } キナゾリン - 5 - イル ) オキシ ] エチル } アセトアミド ;

2 - ヒドロキシ - N - メチル - N - { ( 1 R ) - 1 - メチル - 2 - [ ( 4 - { [ 3 - メチル - 4 - ( 1 , 3 - チアゾール - 4 - イルメトキシ ) フェニル ] アミノ } キナゾリン - 5 - イル ) オキシ ] エチル } アセトアミド ;

N - { ( 2 R ) - 2 - [ ( 4 - { [ 3 - クロロ - 4 - ( ピリジン - 2 - イルメトキシ ) フェニル ] アミノ } キナゾリン - 5 - イル ) オキシ ] プロピル } - 1 - ヒドロキシ - N - メチルシクロプロパンカルボキシアミド ;

( 2 S ) - N - { ( 2 R ) - 2 - [ ( 4 - { [ 3 - クロロ - 4 - ( ピリジン - 2 - イルメトキシ ) フェニル ] アミノ } キナゾリン - 5 - イル ) オキシ ] プロピル } - 2 - ヒドロキシ - N - メチルプロパンアミド ;

N - { ( 2 R ) - 2 - [ ( 4 - { [ 3 - クロロ - 4 - ( ピリジン - 2 - イルメトキシ ) フェニル ] アミノ } キナゾリン - 5 - イル ) オキシ ] プロピル } - 2 - ヒドロキシ - N - ジメチルプロパンアミド ;

( 2 R ) - N - { ( 2 R ) - 2 - [ ( 4 - { [ 3 - クロロ - 4 - ( ピリジン - 2 - イルメトキシ ) フェニル ] アミノ } キナゾリン - 5 - イル ) オキシ ] プロピル } - 2 - ヒドロキシ - N - メチルプロパンアミド ;

( 2 R ) - N - { ( 2 R ) - 2 - [ ( 4 - { [ 3 - クロロ - 4 - ( ピリジン - 2 - イルメトキシ ) フェニル ] アミノ } キナゾリン - 5 - イル ) オキシ ] プロピル } - 2 - メトキシ - N - メチルプロパンアミド ;

2 - ヒドロキシ - N - メチル - N - ( ( 2 R ) - 2 - { [ 4 - ( { 3 - メチル - 4 - ( 6 - メチルピリジン - 3 - イル ) オキシ ] フェニル } アミノ ) キナゾリン - 5 - イル ] オキシ } プロピル ) アセトアミド ;

N - メチル - N - ( ( 2 R ) - 2 - { [ 4 - ( { 3 - メチル - 4 - [ ( 6 - メチルピリジン - 3 - イル ) オキシ ] フェニル } アミノ ) キナゾリン - 5 - イル ] オキシ } プロピル ) アセトアミド ;

N<sup>1</sup> , N<sup>2</sup> , N<sup>2</sup> - トリメチル - N<sup>1</sup> - ( ( 2 R ) - 2 - { [ 4 - ( { 3 - メチル - 4 - [ ( 6 - メチルピリジン - 3 - イル ) オキシ ] フェニル } アミノ ) キナゾリン - 5 - イル ] オキシ } プロピル ) グリシンアミド ;

N - メチル - N - ( ( 2 R ) - 2 - { [ 4 - ( { 3 - メチル - 4 - [ ( 6 - メチルピリジン - 3 - イル ) オキシ ] フェニル } アミノ ) キナゾリン - 5 - イル ] オキシ } プロピル ) - 2 - ピロリジン - 1 - イルアセトアミド ;

N - メチル - N - ( ( 2 R ) - 2 - { [ 4 - ( { 3 - メチル - 4 - [ ( 6 - メチルピリジン - 3 - イル ) オキシ ] フェニル } アミノ ) キナゾリン - 5 - イル ] オキシ } プロピル

) - 2 - モルホリン - 4 - イルアセトアミド；  
 N - メチル - N - ( ( 2 R ) - 2 - { [ 4 - ( { 3 - メチル - 4 - [ ( 6 - メチルピリジン - 3 - イル ) オキシ ] フェニル } アミノ ) キナゾリン - 5 - イル ] オキシ } プロピル ) - 2 - ( 4 - メチルピペラジン - 1 - イル ) アセトアミド；  
 2 - ヒドロキシ - N - メチル - N - ( ( 2 S ) - 2 - { [ 4 - ( { 3 - メチル - 4 - [ ( 6 - メチルピリジン - 3 - イル ) オキシ ] フェニル } アミノ ) キナゾリン - 5 - イル ] オキシ } プロピル ) アセトアミド；  
 N - メチル - N - ( ( 2 S ) - 2 - { [ 4 - ( { 3 - メチル - 4 - [ ( 6 - メチルピリジン - 3 - イル ) オキシ ] フェニル } アミノ ) キナゾリン - 5 - イル ] オキシ } プロピル ) アセトアミド；  
 N - メチル - N - ( ( 2 S ) - 2 - { [ 4 - ( { 3 - メチル - 4 - [ ( 6 - メチルピリジン - 3 - イル ) オキシ ] フェニル } アミノ ) キナゾリン - 5 - イル ] オキシ } プロピル ) - 2 - ピロリジン - 1 - イルアセトアミド；  
 ( 2 S ) - 2 , 4 - ジヒドロキシ - N - ( ( 2 R ) - 2 - { [ 4 - ( { 3 - メチル - 4 - [ ( 6 - メチルピリジン - 3 - イル ) オキシ ] フェニル } アミノ ) キナゾリン - 5 - イル ] オキシ } プロピル ) ブタンアミド；  
 ( 2 S ) - 4 - ブロモ - 2 - ヒドロキシ - N - ( ( 2 R ) - 2 - { [ 4 - ( { 3 - メチル - 4 - [ ( 6 - メチルピリジン - 3 - イル ) オキシ ] フェニル } アミノ ) キナゾリン - 5 - イル ] オキシ } プロピル ) ブタンアミド；  
 N - ( 2 - クロロエチル ) - N ' - ( ( 2 R ) - 2 - { [ 4 - ( { 3 - メチル - 4 - [ ( 6 - メチルピリジン - 3 - イル ) オキシ ] フェニル } アミノ ) キナゾリン - 5 - イル ] オキシ } プロピル ) 尿素；  
 2 - ヒドロキシ - N - メチル - N - ( ( 1 R ) - 1 - メチル - 2 - { [ 4 - ( { 3 - メチル - 4 - [ ( 6 - メチルピリジン - 3 - イル ) オキシ ] フェニル } アミノ ) キナゾリン - 5 - イル ] オキシ } エチル ) アセトアミド；  
 N - メチル - N - ( ( 1 R ) - 1 - メチル - 2 - { [ 4 - ( { 3 - メチル - 4 - [ ( 6 - メチルピリジン - 3 - イル ) オキシ ] フェニル } アミノ ) キナゾリン - 5 - イル ] オキシ } エチル ) アセトアミド；  
 2 - ヒドロキシ - N - メチル - N - ( ( 1 S ) - 1 - メチル - 2 - { [ 4 - ( { 3 - メチル - 4 - [ ( 6 - メチルピリジン - 3 - イル ) オキシ ] フェニル } アミノ ) キナゾリン - 5 - イル ] オキシ } エチル ) アセトアミド；  
 N - メチル - N - ( ( 1 S ) - 1 - メチル - 2 - { [ 4 - ( { 3 - メチル - 4 - [ ( 6 - メチルピリジン - 3 - イル ) オキシ ] フェニル } アミノ ) キナゾリン - 5 - イル ] オキシ } エチル ) アセトアミド；  
 メチル - { 2 - [ ( 4 - { [ 3 - クロロ - 4 - ( ピリジン - 2 - イルメトキシ ) フェニル ] アミノ } キナゾリン - 5 - イル ] オキシ } エチル } メチルカルバメート；  
 N - { 2 - [ ( 4 - { [ 3 - クロロ - 4 - ( ピリジン - 2 - イルメトキシ ) フェニル ] アミノ } キナゾリン - 5 - イル ] オキシ } エチル } - N , N ' - ジメチル尿素；  
 N ' - ( 2 - クロロエチル ) - N - { 2 - [ ( 4 - { [ 3 - クロロ - 4 - ( ピリジン - 2 - イルメトキシ ) フェニル ] アミノ } キナゾリン - 5 - イル ] オキシ } エチル } - N - メチル尿素；  
 N - { ( 2 R ) - 2 - [ ( 4 - { [ 3 - クロロ - 4 - ( ピリジン - 2 - イルメトキシ ) フェニル ] アミノ } キナゾリン - 5 - イル ] オキシ } プロピル } - N ' - メチル尿素；  
 [ ( ( R ) - 2 - { 4 - [ 3 - クロロ - 4 - ( ピリジン - 2 - イルメトキシ ) フェニル ] アミノ } キナゾリン - 5 - イルオキシ } プロピルカルバモイル ) メチル ] メチルカルバミン酸 t e r t - プチルエステル；  
 N <sup>1</sup> - { ( 2 R ) - 2 - [ ( 4 - { [ 3 - クロロ - 4 - ( ピリジン - 2 - イルメトキシ ) フェニル ] アミノ } キナゾリン - 5 - イル ] オキシ } プロピル } - N <sup>2</sup> - メチルグリシンアミド；  
 2 - ヒドロキシ - N - メチル - N - ( 2 - { [ 4 - ( { 3 - メチル - 4 - [ ( 6 - メチ

ルピリジン - 3 - イル ) オキシ ] フェニル } アミノ ) キナゾリン - 5 - イル ] オキシ } エチル ) アセトアミド ;

N - メチル - N - ( 2 - { [ 4 - ( { 3 - メチル - 4 - [ ( 6 - メチルピリジン - 3 - イル ) オキシ ] フェニル } アミノ ) キナゾリン - 5 - イル ] オキシ } エチル ) アセトアミド ; 及び

N - { 2 - [ ( 4 - { [ 3 - クロロ - 4 - ( 1 - メチル - 1 - ピリジン - 2 - イルエトキシ ) フェニル ] アミノ } キナゾリン - 5 - イル ) オキシ ] エチル } - N - メチルアセトアミド ;

の一つ若しくはそれより多くから選択されるキナゾリン誘導体、又は医薬的に受容可能なその塩。

【請求項 19】

請求項 1 ないし 18 のいずれか 1 項に記載の式 I のキナゾリン誘導体、又は医薬的に受容可能なその塩を、医薬的に受容可能な希釈剤又は担体と共に含んでなる医薬組成物。

【請求項 20】

医薬として使用するための、請求項 1 ないし 18 のいずれか 1 項に記載の式 I のキナゾリン誘導体、又は医薬的に受容可能なその塩。

【請求項 21】

その効果が、ヒトのような温血動物の  $\text{e r b B}_2$  受容体チロシンキナーゼを、単独で又は部分的に阻害することによって発現される、抗増殖性効果の発現における使用のための、請求項 1 ないし 18 のいずれか 1 項に記載の式 I のキナゾリン誘導体、又は医薬的に受容可能なその塩。

【請求項 22】

ヒトのような温血動物における  $\text{e r b B}_2$  受容体チロシンキナーゼ阻害効果の発現における使用のための、請求項 1 ないし 18 のいずれか 1 項に記載の式 I のキナゾリン誘導体、又は医薬的に受容可能なその塩。

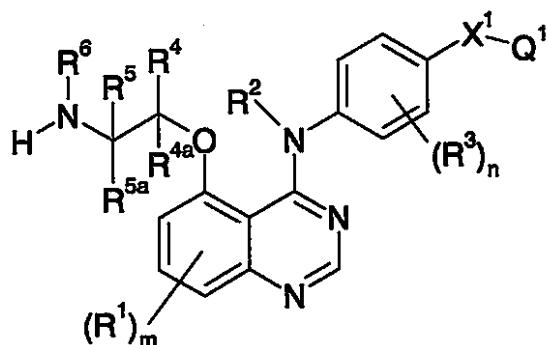
【請求項 23】

ヒトのような温血動物における選択的  $\text{e r b B}_2$  受容体チロシンキナーゼ阻害効果の発現における使用のための、請求項 1 ないし 18 のいずれか 1 項に記載の式 I のキナゾリン誘導体、又は医薬的に受容可能なその塩。

【請求項 24】

( a ) 都合よくは適した塩基の存在中の、 $\text{R}^1$ 、 $\text{R}^2$ 、 $\text{R}^3$ 、 $\text{R}^4$ 、 $\text{R}^{4a}$ 、 $\text{R}^5$ 、 $\text{R}^{5a}$ 、 $\text{R}^6$ 、 $\text{X}^1$ 、 $\text{Q}^1$ 、 $\text{m}$ 、及び $n$  が、いずれもの官能基が必要な場合保護されている以外は請求項 1 において定義したいずれかの意味を有する以下の式 I I :

【化 2】



II

のキナゾリンの、A が、いずれもの官能基が必要な場合保護されている以外は請求項 1 において定義した意味のいずれかを有する以下の式 I I I :

A - COOH

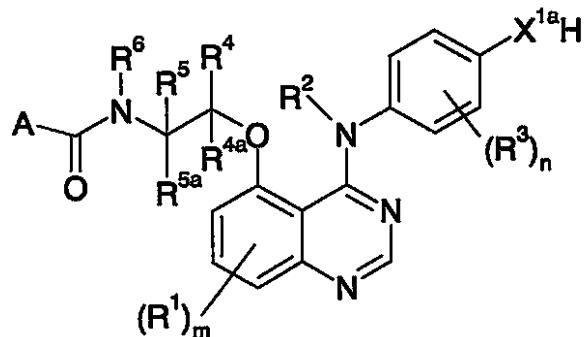
I I I

のカルボン酸又は反応性のその誘導体とのカップリング；

又は

(b)  $X^1$  が  $OC(R^7)_2$ 、 $SC(R^7)_2$  又は  $N(R^7)C(R^7)_2$  である式 I の化合物の製造について、都合よくは適した塩基の存在中の、 $X^{1a}$  が O、S 又は N( $R^7$ ) であり、そして  $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^{4a}$ 、 $R^5$ 、 $R^{5a}$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、A、m、及び n が、いずれもの官能基が必要な場合保護されている以外は請求項 1 において定義した意味のいずれかを有する以下の式 IV：

【化 3】



IV

のキナゾリンの、 $L^1$  が適した置換可能な基であり、そして  $Q^1$  及び  $R^7$  が、いずれもの官能基が必要な場合保護されている以外は請求項 1 において定義した意味のいずれかを有する以下の式 V：



の化合物又はその塩との反応；

(c) A が  $R^{1-4}$  であり、そして  $R^{1-4}$  が  $NHR^{1-7}$  又は  $Q^3 - X^5$  - (ここにおいて  $R^{1-7}$  及び  $Q^3$  は、請求項 1 において定義したとおりであり、そして  $X^5$  は NH である) である式 I の化合物の製造について、(a) において先に定義したとおりの式 I I のキナゾリンの、A が、いずれもの官能基が必要な場合保護されている以外はこの項で先に定義したとおりの  $R^{1-4}$  である以下の式 I I I a：

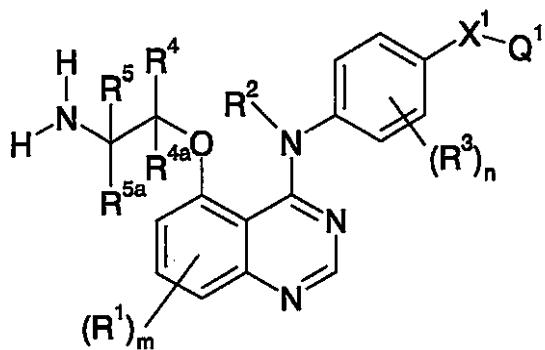


I I I a

のイソシアナートとのカップリング；

(d)  $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^{4a}$ 、 $R^5$ 、 $R^{5a}$ 、 $X^1$ 、 $Q^1$ 、m、及び n が、いずれもの官能基が必要な場合保護されている以外は請求項 1 において定義した意味のいずれかを有する、 $R^6$  が水素である以下の式 I I ；

【化 4】



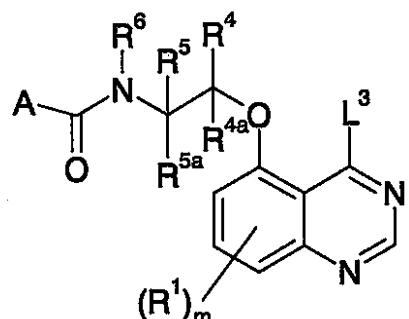
II

のキナゾリンの、いずれもの官能基が必要な場合保護されている - ヒドロキシ - - プチロラクトンとの反応；

又は

(e)  $R^1$ 、 $R^4$ 、 $R^{4a}$ 、 $R^5$ 、 $R^{5a}$ 、 $R^6$ 、A 及びmが、いずれもの官能基が必要な場合保護されている以外は請求項1において定義した意味のいずれかを有する以下の式V I :

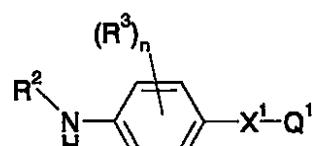
【化5】



VI

のキナゾリンの、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $X^1$ 、 $Q^1$ 及びnが、いずれもの官能基が必要な場合保護されている以外は請求項1において定義した意味のいずれかを有する以下の式I I b :

【化6】

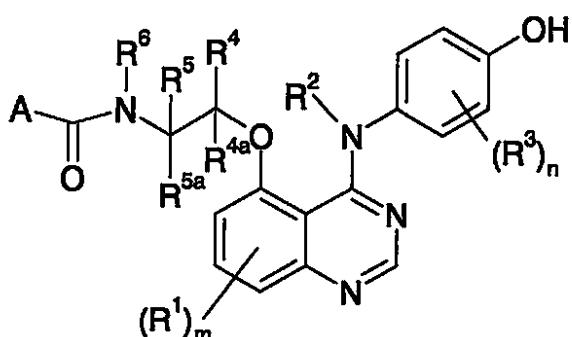


IIb

の化合物とのカップリング；

(f)  $X^1$ がOであり、そして $Q^1$ が2-ピリジル、4-ピリジル、2-ピリミジル、4-ピリミジル、2-ピラジニル又は3-ピリダジニルである式Iの化合物の製造について、都合よくは適した塩基及び適した触媒の存在中の、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^{4a}$ 、 $R^5$ 、 $R^{5a}$ 、 $R^6$ 、A、m、及びnが、いずれもの官能基が必要な場合保護されている以外は請求項1において定義した意味のいずれかを有する以下の式V I I :

【化7】



VII

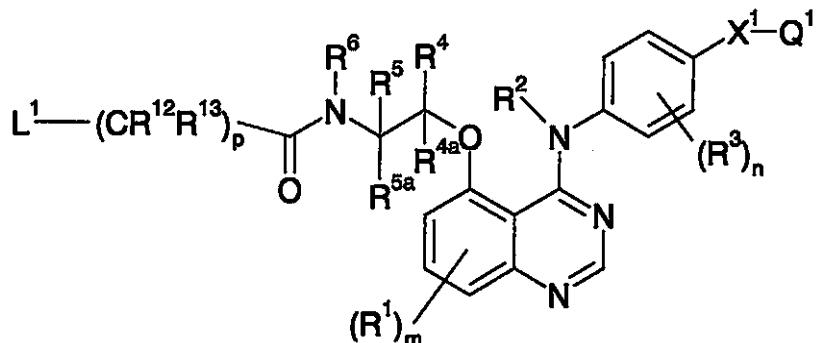
のキナゾリンの、2-ブロモピリジン、4-ブロモピリジン、2-クロロピリミジン、4

-クロロピリミジン、2-クロロピラジン又は3-クロロピリダジンとの反応；或いは

(g) Aが $Z-(CR^{1-2}R^{1-3})_p-$ であり、ここにおいてZは $NR^{1-6}R^{1-7}$ で

ある式 I の化合物について、都合よくは適した塩基の存在中の、 $L^1$  が適した置換可能な基であり、そして  $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^{4a}$ 、 $R^5$ 、 $R^{5a}$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^8$ 、 $R^9$ 、 $X^1$ 、 $Q^1$ 、 $m$ 、 $n$  及び  $p$  が、いずれもの官能基が必要な場合保護されている以外は請求項 1 において定義した意味のいずれかを有する以下の式 V I I I :

【化 8】



VIII

のキナゾリンの、 $R^1$ ~ $R^6$  及び  $R^7$ ~ $R^{12}$  が、いずれもの官能基が必要な場合保護されている以外は、請求項 1 において定義した意味のいずれかを有する以下の式 I X a :



I X a

の化合物又は反応性のその誘導体との反応；

そしてその後、必要な場合：

- (i) 式 I のキナゾリン誘導体を、もう一つの式 I のキナゾリン誘導体に転換すること；
- (i i) 存在するいずれもの保護基を、慣用的な手段によって除去すること；
- (i i i) 医薬的に受容可能な塩を形成すること；

を含んでなる、請求項 1 に記載の式 I のキナゾリン誘導体、又は医薬的に受容可能なその塩の製造のための方法。

【請求項 2 5】

ヒトのような温血動物における癌の治療のための方法であって、請求項 1 に記載の式 I のキナゾリン誘導体、又は医薬的に受容可能なその塩を前記動物に投与することを含む方法。