

【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20年6月26日(2008.6.26)

【公表番号】特表2008-507539(P2008-507539A)

【公表日】平成20年3月13日(2008.3.13)

【年通号数】公開・登録公報2008-010

【出願番号】特願2007-522715(P2007-522715)

【国際特許分類】

C 07 D 217/02 (2006.01)  
C 07 D 401/12 (2006.01)  
C 07 D 401/14 (2006.01)  
C 07 D 405/12 (2006.01)  
C 07 D 405/14 (2006.01)  
C 07 D 417/14 (2006.01)  
C 07 D 413/14 (2006.01)  
C 07 D 471/04 (2006.01)  
C 07 D 409/14 (2006.01)  
C 07 D 519/00 (2006.01)  
A 61 K 31/4725 (2006.01)  
A 61 K 31/517 (2006.01)  
A 61 K 31/443 (2006.01)  
A 61 K 31/4439 (2006.01)  
A 61 K 31/4709 (2006.01)  
A 61 K 31/472 (2006.01)  
A 61 K 31/444 (2006.01)  
A 61 K 31/5415 (2006.01)  
A 61 K 31/4375 (2006.01)  
A 61 K 31/498 (2006.01)  
A 61 K 31/5377 (2006.01)  
A 61 K 31/4545 (2006.01)  
A 61 K 31/538 (2006.01)  
A 61 P 35/00 (2006.01)  
A 61 P 29/00 (2006.01)  
A 61 P 27/02 (2006.01)  
A 61 P 9/00 (2006.01)  
A 61 P 43/00 (2006.01)  
A 61 P 35/02 (2006.01)  
A 61 P 35/04 (2006.01)  
A 61 P 37/06 (2006.01)  
A 61 P 27/06 (2006.01)  
A 61 P 9/10 (2006.01)  
A 61 P 7/04 (2006.01)  
A 61 P 1/04 (2006.01)  
A 61 P 19/00 (2006.01)  
A 61 P 15/00 (2006.01)  
A 61 P 19/02 (2006.01)  
A 61 P 17/06 (2006.01)  
A 61 P 37/02 (2006.01)  
A 61 P 21/00 (2006.01)

A 6 1 P	17/00	(2006.01)
A 6 1 P	25/00	(2006.01)
A 6 1 P	17/02	(2006.01)
A 6 1 P	31/04	(2006.01)
A 6 1 P	29/02	(2006.01)
A 6 1 P	5/14	(2006.01)
A 6 1 P	31/12	(2006.01)
A 6 1 P	11/00	(2006.01)
A 6 1 P	37/08	(2006.01)
A 6 1 P	31/10	(2006.01)
A 6 1 P	7/06	(2006.01)
A 6 1 P	11/06	(2006.01)
A 6 1 P	31/22	(2006.01)
A 6 1 P	31/18	(2006.01)
A 6 1 P	33/02	(2006.01)
A 6 1 P	3/04	(2006.01)
A 6 1 P	27/10	(2006.01)
A 6 1 P	9/08	(2006.01)
A 6 1 P	7/02	(2006.01)
A 6 1 P	3/10	(2006.01)
A 0 1 K	67/00	(2006.01)

## 【 F I 】

C 0 7 D	217/02	C S P
C 0 7 D	401/12	
C 0 7 D	401/14	
C 0 7 D	405/12	
C 0 7 D	405/14	
C 0 7 D	417/14	
C 0 7 D	413/14	
C 0 7 D	471/04	1 1 3
C 0 7 D	471/04	1 1 4 A
C 0 7 D	471/04	1 0 4
C 0 7 D	409/14	
C 0 7 D	519/00	3 1 1
A 6 1 K	31/4725	
A 6 1 K	31/517	
A 6 1 K	31/443	
A 6 1 K	31/4439	
A 6 1 K	31/4709	
A 6 1 K	31/472	
A 6 1 K	31/444	
A 6 1 K	31/5415	
A 6 1 K	31/4375	
A 6 1 K	31/498	
A 6 1 K	31/5377	
A 6 1 K	31/4545	
A 6 1 K	31/538	
A 6 1 P	35/00	
A 6 1 P	29/00	
A 6 1 P	27/02	

A 6 1 P 9/00  
A 6 1 P 43/00 1 1 1  
A 6 1 P 35/02  
A 6 1 P 35/04  
A 6 1 P 37/06  
A 6 1 P 27/06  
A 6 1 P 9/10  
A 6 1 P 7/04  
A 6 1 P 1/04  
A 6 1 P 19/00  
A 6 1 P 15/00  
A 6 1 P 29/00 1 0 1  
A 6 1 P 19/02  
A 6 1 P 17/06  
A 6 1 P 37/02  
A 6 1 P 21/00  
A 6 1 P 17/00  
A 6 1 P 25/00  
A 6 1 P 9/10 1 0 3  
A 6 1 P 17/02  
A 6 1 P 31/04  
A 6 1 P 29/02  
A 6 1 P 5/14  
A 6 1 P 31/12  
A 6 1 P 11/00  
A 6 1 P 37/08  
A 6 1 P 31/10  
A 6 1 P 7/06  
A 6 1 P 11/06  
A 6 1 P 31/22  
A 6 1 P 31/18  
A 6 1 P 33/02  
A 6 1 P 3/04  
A 6 1 P 27/10  
A 6 1 P 9/08  
A 6 1 P 9/10 1 0 1  
A 6 1 P 7/02  
A 6 1 P 3/10  
A 0 1 K 67/00 Z

**【手続補正書】**

【提出日】平成20年5月2日(2008.5.2)

**【手続補正1】**

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

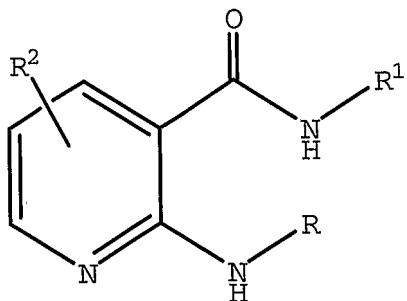
**【補正の内容】**

【特許請求の範囲】

**【請求項1】**

式 I :

【化 1】



I

(式中、

R は、少なくとも 1 個の窒素または酸素原子を含有する 9 または 10 員ヘテロシクリル環であり、前記環は、7 - イソキノリニル、2 - メチル - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロインダゾール - 6 - イル、[ 1 , 6 ] - ナフチリジン - 3 - イル、[ 1 , 7 ] - ナフチリジン - 2 - イル、1 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロベンゾフラン - 4 - イル、3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロベンゾフラン - 5 - イル、ジヒドロ - ベンゾジオキシニル、6 - キナゾリニル、2 - アミノ - 6 - キナゾリニル、4 - メチルアミノ - 6 - キナゾリニル、2 , 4 - ジアミノ - 6 - キナゾリニル、3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 1 , 4 - ベンズオキジン - 6 - イル、2 , 2 - ジフルオロ - 1 , 3 - ベンゾジオキソール - 5 - イルおよび 2 , 2 , 3 , 3 - テトラフルオロ - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 , 4 - ベンゾジオキシン - 6 - イルから選択され、これらの各々が、ハロ、ハロアルキル、C<sub>1 - 6</sub> アルキル、C<sub>2 - 8</sub> アルケニル、C<sub>2 - 8</sub> アルキニル、N - ジメチルアミノ - C<sub>1 - 6</sub> - アルキル、N - ジメチルアミノ - C<sub>1 - 6</sub> - アルコキシ、アミノ、アルキル - カルボニルアミノ、モルホリノ - スルホニル、アミノ - スルホニル、オキサゾリル、ピロリル、モルホリニル、カルボキシル、シアノおよびアセチルから選択される 1 個またはそれ以上の置換基で場合によっては置換されており；

$R^1$  は、非置換または置換

## フェニル、

## 5から6員ヘテロアリール、

## 9 から 10 員二環式ヘテロシクリルおよび

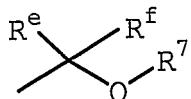
## 11から14員三環式ヘテロシクリル

から選択され；

この場合の置換 R<sup>1</sup> は、ハロ、場合によっては置換されている C<sub>1 - 6</sub> - アルキル、場合によっては置換されている C<sub>3 - 6</sub> - シクロアルキル、場合によっては置換されているフェニル、場合によっては置換されているフェニル - C<sub>1 - C<sub>4</sub></sub> - アルキレニル、C<sub>1 - 2</sub> - ハロアルコキシ、場合によっては置換されているフェニルオキシ、場合によっては置換されている 4 から 6 員ヘテロシクリル - C<sub>1 - C<sub>6</sub></sub> - アルキル、場合によっては置換されている 4 から 6 員ヘテロシクリル - C<sub>2 - C<sub>4</sub></sub> - アルケニル、場合によっては置換されている 4 から 6 員ヘテロシクリル、場合によっては置換されている 4 から 6 員ヘテロシクリルオキシ、場合によっては置換されている 4 から 6 員ヘテロシクリル - C<sub>1 - 4</sub> - アルコキシ、場合によっては置換されている 4 から 6 員ヘテロシクリルスルホニル、場合によっては置換されている 4 から 6 員ヘテロシクリルカルボニル、場合によっては置換されている 4 から 6 員ヘテロシクリル - C<sub>1 - 4</sub> - アルキルカルボニル、場合によっては置換されている 4 から 6 員ヘテロシクリルカルボニル - C<sub>1 - 4</sub> - アルキル、場合によっては置換されている 4 から 6 員ヘテロシクリル - C<sub>1 - 4</sub> - アルキルカルボニルアミノ、場合によっては置換されている 4 から 6 員ヘテロシクリル - オキシカルボニルアミノ、C<sub>1 - 2</sub> - ハロアルキル、C<sub>1 - 4</sub> - アミノアルキル、場合によっては置換されている C<sub>1 - 4</sub> - アミノアルキルカルボニル、ニトロ、アミノ、C<sub>1 - 3</sub> - アルキルスルホニルアミノ、ヒドロキシ、シアノ、ア

ミノスルホニル、C<sub>1-2</sub>-アルキルスルホニル、C<sub>1-2</sub>-アルキルスルホニルアミノ、C<sub>1-2</sub>-アルキルスルホニルアミノ-C<sub>1-4</sub>-アルコキシ、ハロスルホニル、C<sub>1-4</sub>-アルキルカルボニル、アミノ-C<sub>1-4</sub>-アルキルカルボニル、C<sub>1-3</sub>-アルキルアミノ-C<sub>1-4</sub>-アルキルカルボニル、C<sub>1-3</sub>-アルキルアミノ-C<sub>1-4</sub>-アルキルカルボニルアミノ、C<sub>1-4</sub>-アルコキシカルボニル-C<sub>1-4</sub>-アルキル、C<sub>1-3</sub>-アルキルアミノ-C<sub>1-3</sub>-アルキル、C<sub>1-3</sub>-アルキルアミノ-C<sub>1-3</sub>-アルコキシ、C<sub>1-3</sub>-アルキルアミノ-C<sub>1-3</sub>-アルコキシ-C<sub>1-3</sub>-アルコキシ、C<sub>1-4</sub>-アルコキシカルボニル、C<sub>1-4</sub>-アルコキシカルボニルアミノ-C<sub>1-4</sub>-アルキル、C<sub>1-3</sub>-アルキルスルホニルアミノ-C<sub>1-3</sub>-アルコキシ、C<sub>1-4</sub>-ヒドロキシアルキル、

## 【化2】



およびC<sub>1-4</sub>-アルコキシから選択される1個またはそれ以上の置換基で置換されており；

R<sup>e</sup>およびR<sup>f</sup>は、HおよびC<sub>1-2</sub>-ハロアルキルから独立して選択され；

R<sup>7</sup>は、H、C<sub>1-3</sub>-アルキル、場合によっては置換されているフェニル、場合によっては置換されているフェニル-C<sub>1-3</sub>-アルキル、4から6員ヘテロシクリル、場合によっては置換されている4から6員ヘテロシクリル-C<sub>1-C3</sub>-アルキル、C<sub>1-3</sub>-アルコキシ-C<sub>1-2</sub>-アルキルおよびC<sub>1-3</sub>-アルコキシ-C<sub>1-3</sub>-アルコキシ-C<sub>1-3</sub>-アルキルから選択され；ならびに

R<sup>2</sup>は、H、ハロ、ハロアルキルおよびC<sub>1-6</sub>アルキルから選択される)の化合物またはこの医薬適合性誘導体。

## 【請求項2】

Rが、7-イソキノリニルである、請求項1に記載の化合物。

## 【請求項3】

Rが、2-メチル-3-オキソ-2,3-ジヒドロインダゾール-6-イルである、請求項1に記載の化合物。

## 【請求項4】

Rが、[1,6]-ナフチリジン-3-イルである、請求項1に記載の化合物。

## 【請求項5】

Rが、[1,7]-ナフチリジン-2-イルである、請求項1に記載の化合物。

## 【請求項6】

Rが、1-オキソ-2,3-ジヒドロベンゾフラン-4-イルおよび3-オキソ-2,3-ジヒドロベンゾフラン-5-イルから選択される、請求項1に記載の化合物。

## 【請求項7】

Rが、ジヒドロ-ベンゾジオキシニルである、請求項1に記載の化合物。

## 【請求項8】

Rが、2-アミノ-6-キナゾリニルである、請求項1に記載の化合物。

## 【請求項9】

Rが、4-メチルアミノ-6-キナゾリニルである、請求項1に記載の化合物。

## 【請求項10】

Rが、2,4-ジアミノ-6-キナゾリニルである、請求項1に記載の化合物。

## 【請求項11】

Rが、3-オキソ-3,4-ジヒドロ-1,4-ベンズオキサジン-6-イル、2,2-ジフルオロ-1,3-ベンゾジオキソール-5-イルおよび2,2,3,3-テトラフルオロ-2,3-ジヒドロ-1,4-ベンゾジオキシン-6-イルから選択される、請求項1に記載の化合物。

## 【請求項 1 2】

Rが、6-キナゾリニルである、請求項1に記載の化合物。

## 【請求項 1 3】

R<sup>1</sup>が、フェニル、3-イソオキサゾリル、3-ピラゾリル、2-チアゾリル、1,3,4-チアジアゾール-2-イル、チエニル、3-ピリジル、ピリミジニル、ピリダジニル、1,2-ジヒドロキノリル、1,2,3,4-テトラヒドロキノリル、1,2,3,4-テトラヒドロ-イソキノリル、2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロキノリル、2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロキノリル、1',2'-ジヒドロ-スピロ[シクロプロパン-1,3'-[3H]インドール-6'-イル、イソキノリル、キノリル、インドール-6-イル、6-イソインドリル、3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-6-イル、3-オキソ-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-6-イル、2,3-ジヒドロ-1H-インドール-6-イル、ナフチリジニル、2-オキソ-3,4-ジヒドロ-1H-[1,8]ナフチリジン-7-イル、3,4-ジヒドロ[1,8]ナフチリジニル、1,2,3,4-テトラヒドロ-[1,8]ナフチリジニル、キノザリニル、2-オキソ-クロメン-7-イル、ベンゾ[d]イソチアゾリル、3,4-ジヒドロ-キナゾリニル、2,3,4,4a,9,9a-ヘキサヒドロ-1H-3-アザ-フルオニル、5,6,7-トリヒドロ-1,2,4-トリアゾロ[3,4-a]イソキノリル、5,6-ジヒドロ-[1,2,4]トリアゾロ[3,4-a]イソキノリン-9-イル、インダゾール-6-イル、2,1,3-ベンゾチアジアゾリル、ベンゾジオキサニル、ベンゾチエニル、2,3-ジヒドロ-ベンゾフラン-6-イル、ベンゾフラニル、ベンズイミダゾリル、ジヒドロ-ベンズイミダゾリル、ベンズオキサゾリルおよび5-ベンズチアゾール-5-イルから選択され、この場合、R<sup>1</sup>は、非置換であるか、またはプロモ、クロロ、フルオロ、ヨード、ニトロ、アミノ、シアノ、Boc-アミノエチル、ヒドロキシ、フルオロスルホニル、メチルスルホニル、アミノスルホニル、4-メチルピペラジニルスルホニル、シクロヘキシル、フェニル、フェニルメチル、4-ピリジルメチル、4-モルホリニルメチル、1-メチルピペラジン-4-イルメチル、1-メチルピペラジン-4-イルプロピル、モルホリニルプロピル、ピペリジン-1-イルメチル、1-メチルピペリジン-4-イルメチル、2-メチル-2-(1-メチルピペリジン-4-イル)エチル、2-メチル-2-(4-ピリミジニル)エチル、2-メチル-2-(ピラゾール-5-イル)メチル、2-メチル-2-(1-エトキシカルボニル-1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-4-イル)エチル、モルホリニルエチル、1-(4-モルホリニル)-2,2-ジメチルプロピル、1-(4-モルホリニル)-2,2-ジメチルエチル、ピペリジン-4-イルエチル、1-Boc-ピペリジン-4-イルエチル、ピペリジン-1-イルエチル、1-Boc-ピペリジン-4-イルエチル、ピペリジン-4-イルメチル、1-Boc-ピペリジン-4-イルメチル、ピペリジン-4-イルプロピル、1-Boc-ピペリジン-4-イルプロピル、1-メチルピペラジン-4-イルプロピル、ピペリジン-1-イルプロピル、ピロリジン-1-イルプロピル、1-Boc-ピロリジン-2-イルメチル、ピロリジニルプロペニル、ピロリジニルブテニル、メチルカルボニル、Boc、ピペリジン-1-イルメチルカルボニル、ピロリジン-1-イル-カルボニル、4-ピリジルカルボニル、4-メチルピペラジン-1-イルカルボニルエチル、CH<sub>3</sub>O-C(=O)-CH<sub>2</sub>-、メトキシカルボニル、アミノメチルカルボニル、ジメチルアミノメチルカルボニル、メチルスルホニルアミノ、ジメチルアミノメチルカルボニルアミノ、1-ピロリジニル-CH<sub>2</sub>-C(=O)-NH-、4-モルホリニル-CH<sub>2</sub>-C(=O)-NH-、3-テトラヒドロフリル-O-C(=O)-NH-、シクロヘキシル-N(CH<sub>3</sub>)-、(4-ピリミジニル)アミノ、(2-メチルチオ-4-ピリミジニル)アミノ、3-エトキシカルボニル-2-メチル-フル-5-イル、4-メチルピペラジン-1-イル、4-メチル-1-ピペリジル、1-Boc

o c - 4 - ピペリジル、ピペリジン - 4 - イル、1 - メチルピペリジン - 4 - イル、1 - メチル - (1, 2, 3, 6 - テトラヒドロピリジル)、イミダゾリル、モルホリニル、4 - トリフルオロメチル - 1 - ピペリジニル、ヒドロキシブチル、メチル、g e m - ジメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、t - ブチル、s - ブチル、トリフルオロメチル、ペンタフルオロエチル、ノナフルオロブチル、ジメチルアミノプロピル、1, 1 - ジ(トリフルオロメチル) - 1 - ヒドロキシメチル、1, 1 - ジ(トリフルオロメチル) - 1 - (ピペリジニルエトキシ)メチル、1, 1 - ジ(トリフルオロメチル) - 1 - (ピロリジン - 2 - イルメトキシ)メチル、1, 1 - ジ(トリフルオロメチル) - 1 - (メトキシエトキシエトキシ)メチル、1 - ヒドロキシエチル、2 - ヒドロキシエチル、トリフルオロメトキシ、1 - アミノエチル、2 - アミノエチル、1 - (N - イソプロピルアミノ)エチル、2 - (N - イソプロピルアミノ)エチル、3 - テトラヒドロフリルオキシ、ジメチルアミノエトキシ、4 - クロロフェノキシ、フェニルオキシ、アゼチジン - 3 - イルメトキシ、1 - B o c - アゼチジン - 3 - イルメトキシ、3 - テトラヒドロフリルメトキシ、ピロリジン - 2 - イルメトキシ、1 - メチルカルボニル - ピロリジン - 2 - イルメトキシ、1 - B o c - ピロリジン - 2 - イルメトキシ、ピロリジン - 1 - イルメトキシ、1 - メチル - ピロリジン - 2 - イルメトキシ、1 - イソプロピル - ピロリジン - 2 - イルメトキシ、1 - B o c - ピペリジン - 4 - イルメトキシ、(1 - ピロリジニル)エトキシ、ピペリジン - 4 - イルメトキシ、ピペリジン - 3 - イルメトキシ、1 - メチルピペリジン - 4 - イルオキシ、メチルスルホニルアミノエトキシ、イソプロポキシ、メトキシおよびエトキシから選択される1個またはそれ以上の置換基で置換されている、請求項1に記載の化合物。

【請求項14】

R<sup>1</sup>が、フェニル、1, 2, 3, 4 - テトラヒドロ - イソキノリル - 7 - イル、2, 3 - ジヒドロ - 1 H - インドール - 6 - イル、1, 2, 3, 4 - テトラヒドロ - [1, 8] ナフチリジニル、1', 2' - ジヒドロ - スピロ [シクロプロパン - 1, 3' - [3 H] インドール - 6'] - イル、テトラヒドロキノリン - 7 - イル、3 - イソオキサゾリル、3 - ピラゾリル、1, 3, 4 - チアジアゾール - 2 - イル、3 - ピリジル、2 - オキソ - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロキノール - 7 - イル、2 - オキソ - テトラヒドロキノリン - 7 - イル、1 - オキソ - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロ - イソキノール - 7 - イル、インドール - 6 - イル、3, 4 - ジヒドロ - 2 H - ベンゾ [1, 4] オキサジン - 6 - イル、3 - オキソ - 3, 4 - ジヒドロ - 2 H - ベンゾ [1, 4] オキサジン - 6 - イル、2 - オキソ - 3, 4 - ジヒドロ - 1 H - [1, 8] ナフチリジン - 7 - イル、2 - オキソ - クロメン - 7 - イル、5, 6 - ジヒドロ - [1, 2, 4] トリアゾロ [3, 4 - a] イソキノリン - 9 - イル、インダゾール - 6 - イル、2, 1, 3 - ベンゾチアジアゾリル、2, 3 - ジヒドロ - ベンゾフル - 6 - イル、および5 - ベンズチアゾール - 5 - イルから選択され、この場合、R<sup>1</sup>は、非置換であるか、またはクロロ、フルオロ、アセチル、オキソ、メチルスルホニル、2 - メチル - 2 - (1 - メチルピペリジン - 4 - イル)エチル、ピペリジン - エトキシ - ジトリフルオロメチル - メチル - 、1 - メチルピペリジン - 4 - イル、1 - メチルピペリジン - 4 - イル - メチル、1 - メチルピペリジン - 4 - イル - プロピル、ピロリジン - 1 - イル - カルボニル、メチルスルホニルアミノ、ジメチルアミノメチルカルボニルアミノ、1 - ピロリジニル - C H<sub>2</sub> - C (= O) - N H - 、N - メチル - ピロリジニル - C H<sub>2</sub> - O - 、N - イソプロピル - ピロリジニル - C H<sub>2</sub> - O - 、N - ピロリジニル - C H<sub>2</sub> C H<sub>2</sub> O - 、ピロリジニル - プロピル、モルホリン - プロピル、N - メチル - ピペラジン、ピペラジン - メチル、4 N - メチルスルホニル - ピペラジン - メチル、テトラフルオロエチル - O - 、4 - モルホリニル - C H<sub>2</sub> - C (= O) - N H - 、N - B o c - メチル C (O) - 、アミノ - C H<sub>2</sub> - C (O) - 、3 - テトラヒドロフリル - C (= O) - 、3 - テトラヒドロフリル - O - C (= O) - N H - 、3 - テトラヒドロフリル - C H<sub>2</sub> - O - 、N, N - ジメチルアミノ - C H<sub>2</sub> - C (O) - 、N, N - ジメチルアミノ - C H<sub>2</sub> - C (O) N H - 、N, N - ジメチルアミノ - C H<sub>2</sub> C H<sub>2</sub> C H<sub>2</sub> - 、ヒドロキシエチルアミノ、メチルシクロプロピル、メチル、g e m - ジメチル、エチル、t -

ブチル、*t* - ブトキシカルボニル、プロピル、イソプロピル、メトキシ、ピペリジンメチル、1,1-ジメチル-プロピル、アゼチジニル、トリフルオロメチル、ペンタフルオロエチル、1,1-ジ(トリフルオロメチル)-1-ヒドロキシメチル、1-ヒドロキシ-1,1-ジ(トリフルオロメチル)メチル、1,1-ジ(トリフルオロメチル)-1-(ピロリジン-2-イルメトキシ)メチル、3-テトラヒドロフリルオキシ、1-メチルカルボニル-ピロリジン-2-イルメトキシ、1-メチル-ピロリジン-2-イルメトキシ、2-ヒドロキシ-3-ピロリジン-プロポキシ、1,1-ジメチルエチルアセチル、1,1-ジメチル酢酸、およびメチルスルホニルアミノエトキシから選択される1個またはそれ以上の置換基で置換されている、請求項1に記載の化合物。

## 【請求項15】

R<sup>1</sup>が、メチル、エチル、イソプロピル、*t* - ブチル、2-メチル-2-(1-エトキシカルボニル-1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-4-イル)エチル、1-(4-モルホリニル)-2,2-ジメチルエチル、ピロリジン-1-イル-カルボニル、CH<sub>3</sub>O-C(=O)-CH<sub>2</sub>-、メチルスルホニルアミノ、ジメチルアミノメチルカルボニルアミノ、1-ピロリジニル-CH<sub>2</sub>-C(=O)-NH-、4-モルホリニル-CH<sub>2</sub>-C(=O)-NH-、3-テトラヒドロフリル-O-C(=O)-NH-、1,1-ジ(トリフルオロメチル)-1-(ピロリジン-2-イルメトキシ)メチル、3-テトラヒドロフリルオキシ、1-メチルカルボニル-ピロリジン-2-イルメトキシ、およびメチルスルホニルアミノエトキシから選択される1個またはそれ以上の置換基で置換されている、請求項1に記載の化合物。

## 【請求項16】

R<sup>1</sup>が、メチル、プロピル、イソプロピル、*n* - ブチル、イソブチル、*t* - ブチル、メトキシ、ヒドロキシ、フェニル、クロロ、エチル-2-プロパノイル、2-メチル-2-(1-メチルピペリジン-4-イル)エチル、メチルスルホニルアミノ、ジメチルアミノメチルカルボニルアミノ、ピペラジン-メチル、4-メチルスルホニル-1-ピペラジン-メチル、1-ピロリジニル-CH<sub>2</sub>-C(=O)NH-、1-メチル-ピロリジニル-CH<sub>2</sub>-O-、1-イソプロピル-ピロリジニル-CH<sub>2</sub>-O-、1-アセチル-ピロリジニル-CH<sub>2</sub>-O-、2-ヒドロキシ-3-ピロリジニル-プロポキシ、4-モルホリニル-CH<sub>2</sub>-C(=O)NH-、1-ピロリジニル-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O-、ピロリジニル-プロピル、ピペリジニル-プロピル、1-メチル-1,2,3,6-テトラヒドロ-4-ピリジニル、1-ピロリジニル-1-ブチニル、3,3-ジメチルアミノ-1-プロピニル、4-メチル-1-ピペラジニル、ピペラジニル、4-メチル-1-ピペラジニル-メチル、モルホリノ-プロピル、1-N-メチル-ピペリジニル-CH<sub>2</sub>-、1-ピペリジニル-プロピル、ヒドロキシエチルアミノ、3-テトラヒドロフリル-O-C(=O)NH-、3-テトラヒドロフリル-CH<sub>2</sub>O-、トリフルオロメチル、ペンタフルオロエチル、テトラフルオロエトキシル、1,1-ジ(トリフルオロメチル)-1-ヒドロキシメチル、1,1-ジ(トリフルオロメチル)-1-(ピロリジン-2-イルメトキシ)メチル、3-テトラヒドロフリルオキシ、1-メチルカルボニル-ピロリジン-2-イルメトキシ、1-メチル-ピロリジン-2-イルメトキシ、ピペリジニル-アミノ、N,N-ジメチル-グリシル-アミノ、イソプロピル-ピペリジニル-メトキシル、イソプロピル-ピペラジニル、ベンゾキシル、4-N-メチル-ピペラジニル-プロピル、4-N-プロピル-ピペラジニル、メチルスルホニル、メチルスルホニルアミノエトキシから選択される1個またはそれ以上の置換基で置換されているフェニルである、請求項1に記載の化合物。

## 【請求項17】

Rが、7-イソキノリニルである、請求項16に記載の化合物。

## 【請求項18】

R<sup>1</sup>が、4,4-ジメチル-1,2,3,4-テトラヒドロ-1H-キノリン-7-イルである、請求項1に記載の化合物。

## 【請求項19】

R<sup>1</sup> が、4,4-ジメチル-3,4-ジヒドロ-2-オキソ-1H-[1,8]ナフチリジニルである、請求項1に記載の化合物。

【請求項20】

R<sup>1</sup> が、ピロリジン-1-イル-カルボニル、ピロリジン-1-イル-メチル、1-メチル-4-ペリジニル、1-メチル-4-ペリジニル-メチル、1-4-ペリジニル、テトラヒドロ-2-フラニルカルボニル、アセチル、N,N-ジメチルグリシリル、メチルカルボニルおよびメチルスルホニルから選択される置換基で場合によっては置換されている3,3-ジメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インドール-6-イルである、請求項1に記載の化合物。

【請求項21】

R<sup>1</sup> が、4,4-ジメチル-1,2,3,4-テトラヒドロ-1H-イソキノリン-7-イルである、請求項1に記載の化合物。

【請求項22】

R<sup>1</sup> が、4,4-ジメチル-1,2,3,4-テトラヒドロ-2-オキソ-1H-イソキノリン-7-イルである、請求項1に記載の化合物。

【請求項23】

R<sup>2</sup> が、H、フルオロ、クロロ、ブロモ、ヨード、トリフルオロメチル、メチル、エチル、イソプロピルおよびt-ブチルから選択される、請求項1に記載の化合物。

【請求項24】

2-((2-アミノ-6-キナゾリニル)アミノ)-N-(3-メチル-4-(1-メチルエチル)フェニル)-3-ピリジンカルボキサミド；

N-(4,4-ジメチル-1,2,3,4-テトラヒドロ-7-キノリニル)-2-(6-キナゾリニルアミノ)-3-ピリジンカルボキサミド；

N-(4,4-ジメチル-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロ-7-キノリニル)-2-(7-イソキノリニルアミノ)-3-ピリジンカルボキサミド；

N-(5-(1,1-ジメチルエチル)-3-イソオキサゾリル)-2-(7-イソキノリニルアミノ)-3-ピリジンカルボキサミド；

N-(1-アセチル-3,3-ジメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インドール-6-イル)-2-(7-イソキノリニルアミノ)-3-ピリジンカルボキサミド；

N-(4,4-ジメチル-1,2,3,4-テトラヒドロ-7-イソキノリニル)-2-(7-イソキノリニルアミノ)-3-ピリジンカルボキサミド；

5-フルオロ-2-(7-イソキノリニルアミノ)-N-(3-メチル-4-(1-メチルエチル)フェニル)-3-ピリジンカルボキサミド；

N-(4,4-ジメチル-1,2,3,4-テトラヒドロ-7-キノリニル)-2-(7-イソキノリニルアミノ)-3-ピリジンカルボキサミド；

N-(3,3-ジメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インドール-6-イル)-2-(7-イソキノリニルアミノ)-3-ピリジンカルボキサミド；

N-(2-グリシリル-4,4-ジメチル-1,2,3,4-テトラヒドロ-7-イソキノリニル)-2-(7-イソキノリニルアミノ)-3-ピリジンカルボキサミド；

2-(7-イソキノリニルアミノ)-N-(3-メチル-4-(1-メチルエチル)フェニル)-3-ピリジンカルボキサミド；

N-(3,3-ジメチル-1-((2S)-テトラヒドロ-2-フラニルカルボニル)-2,3-ジヒドロ-1H-インドール-6-イル)-2-(7-イソキノリニルアミノ)-3-ピリジンカルボキサミド；

N-(4-(1,1-ジメチルエチル)フェニル)-2-(6-キナゾリニルアミノ)-3-ピリジンカルボキサミド；

N-(4,4-ジメチル-1,2,3,4-テトラヒドロ-7-イソキノリニル)-2-(6-キナゾリニルアミノ)-3-ピリジンカルボキサミド；

N-(5,5-ジメチル-7-オキソ-5,6,7,8-テトラヒドロ-1,8-ナフチリジン-2-イル)-2-(7-イソキノリニルアミノ)-3-ピリジンカルボキサミ

ド；

2 - ( 7 - イソキノリニルアミノ) - N - ( 4 - ( 2 , 2 , 2 - トリフルオロ - 1 - ヒドロキシ - 1 - ( トリフルオロメチル ) エチル ) フェニル ) - 3 - ピリジンカルボキサミド；

N - ( 4 , 4 - ジメチル - 2 - ( ( 2 R ) - テトラヒドロ - 2 - フラニルカルボニル ) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - 7 - イソキノリニル ) - 2 - ( 7 - イソキノリニルアミノ ) - 3 - ピリジンカルボキサミド；

N - ( 5 - ( 1 , 1 - ジメチルエチル ) - 3 - イソオキサゾリル ) - 2 - ( 6 - キナゾリニルアミノ ) - 3 - ピリジンカルボキサミド；

N - ( 5 , 5 - ジメチル - 7 - オキソ - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - 1 , 8 - ナフチリジン - 2 - イル ) - 2 - ( 6 - キナゾリニルアミノ ) - 3 - ピリジンカルボキサミド；

N - ( 4 - ( 1 , 1 - ジメチルエチル ) フェニル ) - 2 - ( 7 - イソキノリニルアミノ ) - 3 - ピリジンカルボキサミド；

N - ( 4 , 4 - ジメチル - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - 7 - イソキノリニル ) - 2 - ( 5 - イソキノリニルアミノ ) - 3 - ピリジンカルボキサミド；

N - ( 2 - アセチル - 4 , 4 - ジメチル - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - 7 - イソキノリニル ) - 2 - ( 7 - イソキノリニルアミノ ) - 3 - ピリジンカルボキサミド；

2 - ( 7 - イソキノリニルアミノ ) - N - ( 3 - メチル - 4 - ( ペンタフルオロエチル ) フェニル ) - 3 - ピリジンカルボキサミド；

N - ( 5 - ( 1 , 1 - ジメチルエチル ) - 3 - イソオキサゾリル ) - 2 - ( 5 - イソキノリニルアミノ ) - 3 - ピリジンカルボキサミド；

N - ( 4 - ( 1 , 1 - ジメチルプロピル ) フェニル ) - 2 - ( 7 - イソキノリニルアミノ ) - 3 - ピリジンカルボキサミド；

2 - ( 7 - イソキノリニルアミノ ) - N - ( 3 - ( メチルオキシ ) - 5 - ( トリフルオロメチル ) フェニル ) - 3 - ピリジンカルボキサミド；

N - ( 4 , 4 - ジメチル - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - 7 - イソキノリニル ) - 2 - ( 1 , 6 - ナフチリジン - 3 - イルアミノ ) - 3 - ピリジンカルボキサミド；

N - ( 6 - ( 1 , 1 - ジメチルエチル ) - 3 - ピリジニル ) - 2 - ( 7 - イソキノリニルアミノ ) - 3 - ピリジンカルボキサミド；

N - ( 4 - ( 1 , 1 - ジメチルエチル ) フェニル ) - 2 - ( 5 - イソキノリニルアミノ ) - 3 - ピリジンカルボキサミド；

2 - ( ( 1 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - イソインドール - 4 - イル ) アミノ ) - N - ( 4 - ( 2 , 2 , 2 - トリフルオロ - 1 - ( メチルオキシ ) - 1 - ( トリフルオロメチル ) エチル ) フェニル ) - 3 - ピリジンカルボキサミド；

N - ( 6 - ( 1 - メチルシクロプロピル ) - 3 - ピリジニル - 2 - ( ( 1 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - イソインドール - 4 - イル ) アミノ ) - 3 - ピリジンカルボキサミド；

2 - ( 1 H - 1 , 2 , 3 - ベンゾトリニアゾール - 5 - イルアミノ ) - N - ( 5 - ( 1 , 1 - ジメチルエチル ) - 3 - イソオキサゾリル ) - 3 - ピリジンカルボキサミド；

2 - ( ( 1 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - イソインドール - 4 - イル ) アミノ ) - N - ( 4 - ペンタフルオロエチル ) - 3 - ( 1 - ピペラジニルメチル ) フェニル ) - 3 - ピリジンカルボキサミド；

2 - ( 7 - イソキノリニルアミノ ) - N - ( 4 - ( ペンタフルオロエチル ) フェニル ) - 3 - ピリジンカルボキサミド；

2 - ( 7 - イソキノリニルアミノ ) - N - ( 4 - ( 2 , 2 , 2 - トリフルオロ - 1 - ( メチルオキシ ) - 1 - ( トリフルオロメチル ) エチル ) フェニル ) - 3 - ピリジンカルボキサミド；

2 - ( 1 H - インダゾール - 6 - イルアミノ ) - N - ( 6 - ( 1 - メチルシクロプロピル ) - 3 - ピリジニル ) - 3 - ピリジンカルボキサミド；

N - ( 4 - ( 1 , 1 - ジメチルエチル ) フェニル ) - 2 - ( 1 , 6 - ナフチリジン - 3 - イルアミノ ) - 3 - ピリジンカルボキサミド ;  
 2 - ( 7 - イソキノリニルアミノ ) - N - ( 2 - メチル - 1 , 3 - ベンゾチアゾール - 5 - イル ) - 3 - ピリジンカルボキサミド ;  
 N - ( 4 - クロロ - 3 - ( トリフルオロメチル ) フェニル ) - 2 - ( 7 - イソキノリニルアミノ ) - 3 - ピリジンカルボキサミド ;  
 2 - ( 7 - イソキノリニルアミノ ) - N - ( 4 - ( トリフルオロメチル ) フェニル ) - 3 - ピリジンカルボキサミド ;  
 2 - ( 1 , 6 - ナフチリジン - 3 - イルアミノ ) - N - ( 4 - ( 2 , 2 , 2 - トリフルオロ - 1 - ヒドロキシ - 1 - ( トリフルオロメチル ) エチル ) フェニル ) - 3 - ピリジンカルボキサミド ;  
 4 , 4 - ジメチル - 7 - ( ( ( 2 - ( 1 , 6 - ナフチリジン - 3 - イルアミノ ) - 3 - ピリジニル ) カルボニル ) アミノ ) - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 ( 1 H ) - イソキノリンカルボン酸 1 , 1 - ジメチルエチル ;  
 2 - ( ( 1 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - イソインドール - 4 - イル ) アミノ ) - N - ( 3 - ( ( 1 , 1 , 2 , 2 - テトラフルオロエチル ) オキシ ) フェニル ) ベンズアミド ;  
 N - ( 3 - ( ( 4 - ( メチルスルホニル ) - 1 - ピペラジニル ) メチル ) - 4 - ( ペンタフルオロエチル ) フェニル ) - 2 - ( ( 1 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - イソインドール - 4 - イル ) アミノ ) - 3 - ピリジンカルボキサミド ;  
 N - ( 4 , 4 - ジメチル - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - 7 - イソキノリニル ) - 2 - ( ( 1 - オキソ - 1 , 3 - ジヒドロ - 2 - ベンゾフラン - 4 - イル ) アミノ ) - 3 - ピリジンカルボキサミド ;  
 N - ( 3 - ( 1 , 1 - ジメチルエチル ) フェニル ) - 2 - ( ( 1 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - イソインドール - 4 - イル ) アミノ ) - 3 - ピリジンカルボキサミド ;  
 N - ( 4 - ( 1 , 1 - ジメチルエチル ) フェニル ) - 2 - ( ( 2 - メチル - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インダゾール - 6 - イル ) アミノ ) - 3 - ピリジンカルボキサミド ;  
 2 - ( ( 2 , 2 - ジフルオロ - 1 , 3 - ベンゾジオキソール - 5 - イル ) アミノ ) - N - ( 4 , 4 - ジメチル - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - 7 - イソキノリニル ) - 3 - ピリジンカルボキサミド ;  
 2 - ( ( 2 , 4 - ジアミノ - 6 - キナゾリニル ) アミノ ) - N - ( 4 - ( 1 , 1 - ジメチルエチル ) フェニル ) - 3 - ピリジンカルボキサミド ;  
 2 - ( ( 1 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - イソインドール - 4 - イル ) アミノ ) - N - ( 6 - ( トリフルオロメチル ) - 3 - ピリジニル ) - 3 - ピリジンカルボキサミド ;  
 N - ( 6 - クロロ - 3 - ピリジニル ) - 2 - ( ( 1 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - イソインドール - 4 - イル ) アミノ ) - 3 - ピリジンカルボキサミド ;  
 N - ( 2 - アセチル - 4 , 4 - ジメチル - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - 7 - イソキノリニル ) - 2 - ( ( 4 - ( メチルアミノ ) - 6 - キナゾリニル ) アミノ ) - 3 - ピリジンカルボキサミド ;  
 2 - ( 4 - ( 1 , 1 - ジメチルエチル ) フェニル ) - 4 - ( 1 H - インダゾール - 6 - イルアミノ ) - 1 , 2 - ジヒドロ - 3 H - ピロロ [ 3 , 4 - c ] ピリジン - 3 - オン ;  
 2 - ( 5 - イソキノリニルアミノ ) - N - ( 3 - ( ( ( 2 S ) - 1 - メチル - 2 - ピロリジニル ) メチル ) オキシ ) - 5 - ( トリフルオロメチル ) フェニル ) - 3 - ピリジンカルボキサミド ;  
 N - ( 1 - アセチル - 3 , 3 - ジメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インドール - 6 - イル ) - 2 - ( ( 1 - オキソ - 1 , 3 - ジヒドロ - 2 - ベンゾフラン - 4 - イル ) アミノ ) - 3 - ピリジンカルボキサミド ;  
 N - ( 4 - ( フェニルオキシ ) フェニル ) - 2 - ( ( 4 - ( トリフルオロメチル ) フェ

ニル)アミノ) - 3 - ピリジンカルボキサミド;

N - (3, 3 -ジメチル - 2, 3 -ジヒドロ - 1H - インドール - 6 -イル) - 2 - (1 - オキソ - 1, 3 -ジヒドロ - 2 -ベンゾフラン - 4 -イル)アミノ) - 3 - ピリジンカルボキサミド;

2 - ((1 - オキソ - 1, 3 -ジヒドロ - 2 -ベンゾフラン - 5 -イル)アミノ) - N - (4 - (ペントフルオロエチル)フェニル) - 3 - ピリジンカルボキサミド;

N - (4 - (1, 1 -ジメチルエチル)フェニル) - 2 - ((1 - オキソ - 1, 3 -ジヒドロ - 2 -ベンゾフラン - 4 -イル)アミノ) - 3 - ピリジンカルボキサミド;

2 - ((1 - オキソ - 1, 3 -ジヒドロ - 2 -ベンゾフラン - 4 -イル)アミノ) - N - (4 - (2, 2, 2 -トリフルオロ - 1 -ヒドロキシ - 1 - (トリフルオロメチル)エチル)フェニル) - 3 - ピリジンカルボキサミド;

N - (3, 3 -ジメチル - 2, 3 -ジヒドロ - 1H - インドール - 6 -イル) - 2 - (5 - イソキノリニルアミノ) - 3 - ピリジンカルボキサミド;

2 - ((3 - オキソ - 1, 3 -ジヒドロ - 2 -ベンゾフラン - 5 -イル)アミノ) - N - (4 - (ペントフルオロエチル)フェニル) - 3 - ピリジンカルボキサミド;

N - (6 - (1 - アゼチジニル) - 3 - ピリジニル) - 2 - (7 - イソキノリニルアミノ) - 3 - ピリジンカルボキサミド;

N - (5 - (1 - アゼチジニル) - 2 - ピリジニル) - 2 - (7 - イソキノリニルアミノ) - 3 - ピリジンカルボキサミド;

N - (5 - (1, 1 -ジメチルエチル) - 3 - イソオキサゾリル) - 2 - ((2, 2, 3, 3 - テトラフルオロ - 2, 3 -ジヒドロ - 1, 4 -ベンゾジオキシン - 6 -イル)アミノ) - 3 - ピリジンカルボキサミド;

N - (4 - (1, 1 -ジメチルエチル)フェニル) - 2 - ((2, 2, 3, 3 - テトラフルオロ - 2, 3 -ジヒドロ - 1, 4 -ベンゾジオキシン - 6 -イル)アミノ) - 3 - ピリジンカルボキサミド;

N - (4, 4 -ジメチル - 2 -オキソ - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロ - 7 -キノリニル) - 2 - ((2, 2, 3, 3 - テトラフルオロ - 2, 3 -ジヒドロ - 1, 4 -ベンゾジオキシン - 6 -イル)アミノ) - 3 - ピリジンカルボキサミド;

2 - (7 - イソキノリニルアミノ) - N - (3 - ((2R) - テトラヒドロ - 2 - フラニルメチル)オキシ) - 5 - (トリフルオロメチル)フェニル) - 3 - ピリジンカルボキサミド;

N - (5, 5 -ジメチル - 7 -オキソ - 5, 6, 7, 8 - テトラヒドロ - 1, 8 -ナフチリジン - 2 -イル) - 2 - ((3 - オキソ - 3, 4 -ジヒドロ - 2H - 1, 4 -ベンズオキサジン - 6 -イル)アミノ) - 3 - ピリジンカルボキサミド;

N - (5 - (1, 1 -ジメチルエチル) - 3 - イソオキサゾリル) - 2 - ((3 - オキソ - 3, 4 -ジヒドロ - 2H - 1, 4 -ベンズオキサジン - 6 -イル)アミノ) - 3 - ピリジンカルボキサミド;

(2S) - 2 - (4 - ((2 - (7 - イソキノリニルアミノ) - 3 - ピリジニル)カルボニル)アミノ)フェニル)プロパン酸エチル;

(2S) - 2 - (4 - ((2 - (7 - イソキノリニルアミノ) - 3 - ピリジニル)カルボニル)アミノ)フェニル)プロパン酸;

2 - (7 - イソキノリニルアミノ) - N - (3 - オキソ - 3, 4 -ジヒドロ - 2H - 1, 4 -ベンゾチアジン - 6 -イル) - 3 - ピリジンカルボキサミド; および

N - (4 - (1, 1 -ジメチルエチル)フェニル) - 2 - (5 - キノリニルアミノ) - 3 - ピリジンカルボキサミド

から選択される、請求項1に記載の化合物またはこの医薬適合性誘導体。

【請求項25】

ベンゼンスルホン酸塩、エタンスルホン酸塩、エタンジスルホン酸塩、メタンスルホン酸塩、p - トルエンスルホン酸塩、リン酸塩、臭化水素酸塩、硝酸塩、塩酸塩、クエン酸塩、メドロン酸塩、トシリル酸塩、マレイン酸塩、フマル酸塩、ナプシル酸塩、パモ酸塩、

サリチル酸塩およびステアリン酸塩から選択される、請求項24に記載の化合物の医薬的に許容される塩形態。

【請求項26】

塩酸塩、硫酸塩、スルホン酸塩およびリン酸塩のうちの1つである、  
 N-(4,4-ジメチル-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロ-7-キノリニル)-2-(7-イソキノリニルアミノ)-3-ピリジンカルボキサミド；  
 N-(4,4-ジメチル-1,2,3,4-テトラヒドロ-7-キノリニル)-2-(7-イソキノリニルアミノ)ベンズアミド；  
 N-(5-(1,1-ジメチルエチル)-3-イソオキサゾリル)-2-(7-イソキノリニルアミノ)-3-ピリジンカルボキサミド；  
 2-(7-イソキノリニルアミノ)-N-(3-メチル-4-(1-ピロリジニル)フェニル)-3-ピリジンカルボキサミド；  
 N-(1-アセチル-3,3-ジメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インドール-6-イル)-2-(7-イソキノリニルアミノ)-3-ピリジンカルボキサミド；  
 N-(4,4-ジメチル-1,2,3,4-テトラヒドロ-7-イソキノリニル)-2-(7-イソキノリニルアミノ)-3-ピリジンカルボキサミド；  
 5-フルオロ-2-(7-イソキノリニルアミノ)-N-(3-メチル-4-(1-メチルエチル)フェニル)-3-ピリジンカルボキサミド；  
 N-(4,4-ジメチル-1,2,3,4-テトラヒドロ-7-キノリニル)-2-(7-イソキノリニルアミノ)-3-ピリジンカルボキサミド；  
 N-(3,3-ジメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インドール-6-イル)-2-(7-イソキノリニルアミノ)-3-ピリジンカルボキサミド；  
 N-(2-グリシル-4,4-ジメチル-1,2,3,4-テトラヒドロ-7-イソキノリニル)-2-(7-イソキノリニルアミノ)-3-ピリジンカルボキサミド；  
 N-(3,3-ジメチル-1-((2S)-テトラヒドロ-2-フラニルカルボニル)-2,3-ジヒドロ-1H-インドール-6-イル)-2-(7-イソキノリニルアミノ)-3-ピリジンカルボキサミド；  
 N-(5,5-ジメチル-7-オキソ-5,6,7,8-テトラヒドロ-1,8-ナフチリジン-2-イル)-2-(7-イソキノリニルアミノ)-3-ピリジンカルボキサミド；  
 N-(4-(1,1-ジメチルエチル)フェニル)-2-(7-イソキノリニルアミノ)ベンズアミド；  
 2-(7-イソキノリニルアミノ)-N-(4-(2,2,2-トリフルオロ-1-ヒドロキシ-1-(トリフルオロメチル)エチル)フェニル)-3-ピリジンカルボキサミド；  
 N-(4,4-ジメチル-2-((2R)-テトラヒドロ-2-フラニルカルボニル)-1,2,3,4-テトラヒドロ-7-イソキノリニル)-2-(7-イソキノリニルアミノ)-3-ピリジンカルボキサミド；  
 N-(4-(1,1-ジメチルエチル)フェニル)-2-(7-イソキノリニルアミノ)-3-ピリジンカルボキサミド；  
 N-(2-アセチル-4,4-ジメチル-1,2,3,4-テトラヒドロ-7-イソキノリニル)-2-(7-イソキノリニルアミノ)-3-ピリジンカルボキサミド；  
 2-(7-イソキノリニルアミノ)-N-(3-メチル-4-(ペンタフルオロエチル)フェニル)-3-ピリジンカルボキサミド；  
 N-(4-(1,1-ジメチルエチル)フェニル)-3-フルオロ-2-(7-イソキノリニルアミノ)ベンズアミド；  
 2-(7-イソキノリニルアミノ)-N-(4-(1-メチルエチル)フェニル)-3-ピリジンカルボキサミド；  
 2-(7-イソキノリニルアミノ)-N-(3-メチル-4-(1-メチルエチル)フェニル)-3-ピリジンカルボキサミド；

N - ( 4 - ( 1 , 1 - ジメチルプロピル ) フェニル ) - 2 - ( 7 - イソキノリニルアミノ ) - 3 - ピリジンカルボキサミド ;  
 2 - ( 7 - イソキノリニルアミノ ) - N - ( 3 - ( メチルオキシ ) - 5 - ( トリフルオロメチル ) フェニル ) - 3 - ピリジンカルボキサミド ;  
 N - ( 3 - クロロ - 4 - メチルフェニル ) - 2 - ( 7 - イソキノリニルアミノ ) - 3 - ピリジンカルボキサミド ;  
 N - ( 6 - ( 1 , 1 - ジメチルエチル ) - 3 - ピリジニル ) - 2 - ( 7 - イソキノリニルアミノ ) - 3 - ピリジンカルボキサミド ;  
 2 - ( 7 - イソキノリニルアミノ ) - N - ( 4 - ( ペンタフルオロエチル ) フェニル ) - 3 - ピリジンカルボキサミド ;  
 2 - ( 7 - イソキノリニルアミノ ) - N - ( 4 - ( 2 , 2 , 2 - トリフルオロ - 1 - ( メチルオキシ ) - 1 - ( トリフルオロメチル ) エチル ) フェニル ) - 3 - ピリジンカルボキサミド ;  
 2 - ( 7 - イソキノリニルアミノ ) - N - ( 2 - メチル - 1 , 3 - ベンゾチアゾール - 5 - イル ) - 3 - ピリジンカルボキサミド ;  
 N - ( 4 - クロロ - 3 - ( トリフルオロメチル ) フェニル ) - 2 - ( 7 - イソキノリニルアミノ ) - 3 - ピリジンカルボキサミド ;  
 2 - ( 7 - イソキノリニルアミノ ) - N - ( 4 - ( トリフルオロメチル ) フェニル ) - 3 - ピリジンカルボキサミド ;  
 N - ( 6 - ( 1 - アゼチジニル ) - 3 - ピリジニル ) - 2 - ( 7 - イソキノリニルアミノ ) - 3 - ピリジンカルボキサミド ;  
 N - ( 5 - ( 1 - アゼチジニル ) - 2 - ピリジニル ) - 2 - ( 7 - イソキノリニルアミノ ) - 3 - ピリジンカルボキサミド ;  
 2 - ( 7 - イソキノリニルアミノ ) - N - ( 3 - ( ( ( 2 R ) - テトラヒドロ - 2 - フラニルメチル ) オキシ ) - 5 - ( トリフルオロメチル ) フェニル ) - 3 - ピリジンカルボキサミド ;  
 ( 2 S ) - 2 - ( 4 - ( ( ( 2 - ( 7 - イソキノリニルアミノ ) - 3 - ピリジニル ) カルボニル ) アミノ ) フェニル ) プロパン酸エチル ;  
 ( 2 S ) - 2 - ( 4 - ( ( ( 2 - ( 7 - イソキノリニルアミノ ) - 3 - ピリジニル ) カルボニル ) アミノ ) フェニル ) プロパン酸 ;  
 ( 2 R ) - 2 - ( 4 - ( ( ( 2 - ( 7 - イソキノリニルアミノ ) - 3 - ピリジニル ) カルボニル ) アミノ ) フェニル ) プロパン酸 ;  
 2 - ( 7 - イソキノリニルアミノ ) - N - ( 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 6 - イル ) - 3 - ピリジンカルボキサミド ;  
 2 - ( 7 - イソキノリニルアミノ ) - N - ( 4 - ( ( トリフルオロメチル ) オキシ ) フェニル ) - 3 - ピリジンカルボキサミド ; および  
 N - ( 3 - クロロ - 4 - ( トリフルオロメチル ) フェニル ) - 2 - ( 7 - イソキノリニルアミノ ) - 3 - ピリジンカルボキサミド  
 から選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 27】

ベンゼンスルホン酸塩、エタンスルホン酸塩、エタンジスルホン酸塩、メタンスルホン酸塩、p - トルエンスルホン酸塩、リン酸塩、臭化水素酸塩、硝酸塩、塩酸塩、クエン酸塩、メドロン酸塩、トシリ酸塩、マレイン酸塩、フマル酸塩、ナプシル酸塩、パモ酸塩、サリチル酸塩およびステアリン酸塩から選択される、請求項 1 に記載の化合物の医薬的に許容される塩形態。

【請求項 28】

医薬的に許容される担体と、請求項 1 から 27 のいずれかに記載の化合物の有効量と、を含む医薬組成物。

【請求項 29】

被験者における癌を治療するための、請求項 28 に記載の医薬組成物。

## 【請求項 3 0】

前記化合物の有効量が、抗腫瘍薬、抗脈管形成薬、化学療法薬およびペプチド性癌療法剤から選択される1つまたはそれ以上の化合物と併用で投与される、請求項29に記載の医薬組成物。

## 【請求項 3 1】

前記抗腫瘍薬が、抗生物質タイプの薬剤、アルキル化剤、代謝拮抗物質、ホルモン薬、免疫薬、インターフェロンタイプの薬剤、キナーゼ阻害剤、他の薬剤およびこれらの組み合わせから選択される、請求項30に記載の医薬組成物。

## 【請求項 3 2】

被験者における脈管形成を治療するための、請求項28に記載の医薬組成物。

## 【請求項 3 3】

被験者におけるVEGFR関連疾患を治療するための、請求項28に記載の医薬組成物。

## 【請求項 3 4】

被験者における少なくとも1つの増殖関連疾患を治療するための、請求項28に記載の医薬組成物。

## 【請求項 3 5】

前記疾患が、炎症または炎症関連疾患である、請求項34に記載の医薬組成物。

## 【請求項 3 6】

被験者における腫瘍の血流を減少させるための、請求項28に記載の医薬組成物。

## 【請求項 3 7】

被験者における腫瘍のサイズを減少させるための、請求項28に記載の医薬組成物。

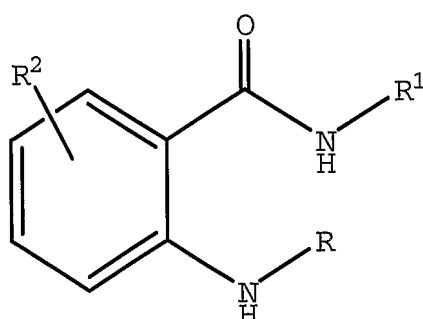
## 【請求項 3 8】

被験者における糖尿病性網膜症を治療するための、請求項28に記載の医薬組成物。

## 【請求項 3 9】

式II：

## 【化3】



II

(式中、

Rは、7-イソキノリニル、2-メチル-3-オキソ-2,3-ジヒドロインダゾール-6-イル、[1,6]-ナフチリジン-3-イル、[1,7]-ナフチリジン-2-イル、オキソ-2,3-ジヒドロベンゾフラニル、ジヒドロ-ベンゾジオキシニル、6-キナゾリニル、2-アミノ-6-キナゾリニル、4-メチルアミノ-6-キナゾリニル、2,4-ジアミノ-6-キナゾリニル、3-オキソ-3,4-ジヒドロ-1,4-ベンズオキサジン-6-イル、2,2,3,3-テトラフルオロ-2,3-ジヒドロ-1,4-ベンゾジオキシン-6-イルから選択され、これらの各々が、ハロ、ハロアルキル、C<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>2-8</sub>アルケニル、C<sub>2-8</sub>アルキニル、N-ジメチルアミノ-C<sub>1-6</sub>-アルキル、N-ジメチルアミノ-C<sub>1-6</sub>-アルコキシ、アミノ、カルボニルアミノ、モルホリノ-スルホ

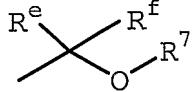
ニル、アミノ-スルホニル、オキサゾリル、ピロリル、モルホリニル、カルボキシル、シアノおよびアセチルから選択される1個またはそれ以上の置換基で場合によっては置換されており；

R<sup>1</sup>は、非置換または置換

1, 2-ジヒドロキノリル、1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル、1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-イソキノリル、2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル、2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル、1-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-イソキノリル、イソキノリル、キノリル、インドール-6-イル、6-イソインドリル、3, 4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1, 4]オキサジン-6-イル、3-オキソ-3, 4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1, 4]オキサジン-6-イル、2, 3-ジヒドロ-1H-インドール-6-イル、ナフチリジニル、2-オキソ-3, 4-ジヒドロ-1H-[1, 8]ナフチリジン-7-イル、3, 4-ジヒドロ[1, 8]ナフチリジニル、1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-[1, 8]ナフチリジニル、キノザリニル

から選択され、この場合の置換R<sup>1</sup>は、ハロ、場合によっては置換されているC<sub>1-6</sub>-アルキル、場合によっては置換されているC<sub>3-6</sub>-シクロアルキル、場合によっては置換されているフェニル、場合によっては置換されているフェニル-C<sub>1-C<sub>4</sub></sub>-アルキレニル、C<sub>1-C<sub>2</sub></sub>-ハロアルコキシ、場合によっては置換されているフェニルオキシ、場合によっては置換されている4から6員ヘテロシクリル-C<sub>1-C<sub>6</sub></sub>-アルキル、場合によっては置換されている4から6員ヘテロシクリル-C<sub>2-C<sub>4</sub></sub>-アルケニル、場合によっては置換されている4から6員ヘテロシクリルオキシ、場合によっては置換されている4から6員ヘテロシクリル-C<sub>1-C<sub>4</sub></sub>-アルコキシ、場合によっては置換されている4から6員ヘテロシクリルスルホニル、場合によっては置換されている4から6員ヘテロシクリルアミノ、場合によっては置換されている4から6員ヘテロシクリルカルボニル、場合によっては置換されている4から6員ヘテロシクリル-C<sub>1-C<sub>4</sub></sub>-アルキルカルボニル、場合によっては置換されている4から6員ヘテロシクリルカルボニル-C<sub>1-C<sub>4</sub></sub>-アルキル、場合によっては置換されている4から6員ヘテロシクリル-C<sub>1-C<sub>4</sub></sub>-アルキルカルボニルアミノ、場合によっては置換されている4から6員ヘテロシクリル-オキシカルボニルアミノ、C<sub>1-C<sub>2</sub></sub>-ハロアルキル、C<sub>1-C<sub>4</sub></sub>-アミノアルキル、場合によっては置換されているC<sub>1-C<sub>4</sub></sub>-アミノアルキルカルボニル、ニトロ、アミノ、C<sub>1-C<sub>3</sub></sub>-アルキルスルホニルアミノ、ヒドロキシ、シアノ、アミノスルホニル、C<sub>1-C<sub>2</sub></sub>-アルキルスルホニル、C<sub>1-C<sub>2</sub></sub>-アルキルスルホニルアミノ、C<sub>1-C<sub>2</sub></sub>-アルキルスルホニルアミノ-C<sub>1-C<sub>4</sub></sub>-アルコキシ、ハロスルホニル、C<sub>1-C<sub>4</sub></sub>-アルキルカルボニル、アミノ-C<sub>1-C<sub>4</sub></sub>-アルキルカルボニル、C<sub>1-C<sub>3</sub></sub>-アルキルアミノ-C<sub>1-C<sub>4</sub></sub>-アルキルカルボニルアミノ、C<sub>1-C<sub>4</sub></sub>-アルコキシカルボニル-C<sub>1-C<sub>4</sub></sub>-アルキル、C<sub>1-C<sub>3</sub></sub>-アルキルアミノ-C<sub>1-C<sub>3</sub></sub>-アルコキシ、C<sub>1-C<sub>3</sub></sub>-アルキルアミノ-C<sub>1-C<sub>3</sub></sub>-アルコキシ-C<sub>1-C<sub>3</sub></sub>-アルコキシ、C<sub>1-C<sub>4</sub></sub>-アルコキシカルボニル、C<sub>1-C<sub>4</sub></sub>-アルコキシカルボニルアミノ-C<sub>1-C<sub>4</sub></sub>-アルキル、C<sub>1-C<sub>3</sub></sub>-アルキルスルホニルアミノ-C<sub>1-C<sub>3</sub></sub>-アルコキシ、C<sub>1-C<sub>4</sub></sub>-ヒドロキシアルキル、

【化4】



およびC<sub>1-C<sub>4</sub></sub>-アルコキシから選択される1個またはそれ以上の置換基で置換されており；

R<sup>e</sup>およびR<sup>f</sup>は、HおよびC<sub>1-C<sub>2</sub></sub>-ハロアルキルから独立して選択され；

R<sup>7</sup>は、H、C<sub>1-C<sub>3</sub></sub>-アルキル、場合によっては置換されているフェニル、場合によっては置換されているフェニル-C<sub>1-C<sub>3</sub></sub>-アルキル、4から6員ヘテロシクリル、場合によっては置換されている4から6員ヘテロシクリル-C<sub>1-C<sub>3</sub></sub>-アルキル、C<sub>1-C<sub>3</sub></sub>-

アルコキシ - C<sub>1</sub> -<sub>2</sub> - アルキルおよび C<sub>1</sub> -<sub>3</sub> - アルコキシ - C<sub>1</sub> -<sub>3</sub> - アルコキシ - C<sub>1</sub> -<sub>3</sub> - アルキルから選択され；ならびに  
R<sup>2</sup> は、H、ハロ、ハロアルキルおよび C<sub>1</sub> -<sub>6</sub> アルキルから選択される)  
によって定義される化合物またはこの医薬適合性誘導体。

【請求項 4 0】

ベンゼンスルホン酸塩、エタンスルホン酸塩、エタンジスルホン酸塩、メタンスルホン酸塩、p - トルエンスルホン酸塩、リン酸塩、臭化水素酸塩、硝酸塩、塩酸塩、クエン酸塩、メドロン酸塩、トシリ酸塩、マレイン酸塩、フマル酸塩、ナプシリ酸塩、バモ酸塩、サリチル酸塩およびステアリン酸塩から選択される、請求項 3 9 に記載の化合物の医薬的に許容される塩形態。

【請求項 4 1】

医薬的に許容される担体と、請求項 3 9 に記載の化合物の有効量と、を含む医薬組成物。

【請求項 4 2】

被験者における癌を治療するための、請求項 4 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 4 3】

前記化合物の有効量が、抗腫瘍薬、抗脈管形成薬、化学療法薬およびペプチド性癌療法剤から選択される 1 つまたはそれ以上の化合物と併用で投与される、請求項 4 2 に記載の医薬組成物。

【請求項 4 4】

前記抗腫瘍薬が、抗生物質タイプの薬剤、アルキル化剤、代謝拮抗物質、ホルモン薬、免疫薬、インターフェロンタイプの薬剤、キナーゼ阻害剤、他の薬剤およびこれらの組み合わせから選択される、請求項 4 3 に記載の医薬組成物。

【請求項 4 5】

被験者における脈管形成を治療するための、請求項 4 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 4 6】

被験者における V E G F R 関連疾患を治療するための、請求項 4 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 4 7】

被験者における少なくとも 1 つの増殖関連疾患を治療するための、請求項 4 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 4 8】

前記疾患が、炎症または炎症関連疾患である、請求項 4 7 に記載の医薬組成物。

【請求項 4 9】

被験者における腫瘍の血流を減少させるための、請求項 4 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 5 0】

被験者における腫瘍のサイズを減少させるための、請求項 4 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 5 1】

被験者における糖尿病性網膜症を治療するための、請求項 4 1 に記載の医薬組成物。