

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 公表特許公報(A)

(11) 特許出願公表番号

特表2008-526734

(P2008-526734A)

(43) 公表日 平成20年7月24日(2008.7.24)

(51) Int.Cl.	F I	テーマコード (参考)
C O 7 D 239/94 (2006.01)	C O 7 D 239/94 C S P	4 C O 6 3
C O 7 D 239/95 (2006.01)	C O 7 D 239/95	4 C O 8 6
C O 7 D 401/12 (2006.01)	C O 7 D 401/12	
A 6 1 K 31/517 (2006.01)	A 6 1 K 31/517	
A 6 1 K 31/5377 (2006.01)	A 6 1 K 31/5377	
審査請求 有 予備審査請求 未請求 (全 125 頁) 最終頁に続く		

(21) 出願番号	特願2007-549270 (P2007-549270)	(71) 出願人	500116041
(86) (22) 出願日	平成17年12月30日 (2005.12.30)		エスケー ケミカルズ カンパニー リミ
(85) 翻訳文提出日	平成19年8月28日 (2007.8.28)		テッド
(86) 国際出願番号	PCT/KR2005/004664		大韓民国 キュンギドウ スーウォンシ
(87) 国際公開番号	W02006/071095		チャンガンダ ジュンジャ 1 ドン 6
(87) 国際公開日	平成18年7月6日 (2006.7.6)		〇〇
(31) 優先権主張番号	10-2004-0117708		
(32) 優先日	平成16年12月31日 (2004.12.31)		
(33) 優先権主張国	韓国 (KR)		

最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 糖尿及び肥満治療予防に有効なキナゾリン誘導体

(57) 【要約】

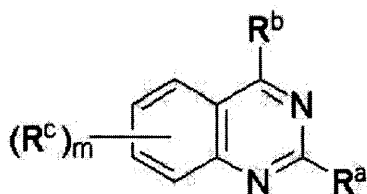
本発明は血糖降下、体重減少を現わす新規のキナゾリン誘導体と、この化合物を有効成分として含む糖尿及び肥満治療予防剤に関する。

【選択図】 図 1

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

下記の化学式 1 で表示されるキナゾリン誘導体又は薬剤学的に許容可能なこれらの塩：
[化学式 1]



10

前記化学式 1 において、

R^a は、水素、 $(C_1 - C_{18})$ アルキル、 $(C_2 - C_8)$ アルケニル、 $(C_2 - C_8)$ アルキニル、ハロゲノ- $(C_1 - C_6)$ アルキル、ヒドロキシ- $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_1 - C_6)$ アルコキシ- $(C_1 - C_6)$ アルキル、シアノ- $(C_1 - C_6)$ アルキル、アミノ- $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルアミノ- $(C_1 - C_6)$ アルキル、ジ- $[(C_1 - C_6)$ アルキル]アミノ- $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルチオ- $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルスルフィニル- $(C_1 - C_6)$ アルキル又は $(C_1 - C_6)$ アルキルスルホニル- $(C_1 - C_6)$ アルキルから選択された置換基、又は、化学式- $X^1 - Q^1$ [ここで、 X^1 は直接結合であるか、O、S、SO、 SO_2 、 $N(R^4)$ 、CO、 CO_2 、 $CH(OR^4)$ 、 $CON(R^4)$ 、 $N(R^4)CO$ 、 $SO_2N(R^4)$ 、 $N(R^4)SO_2$ 、 $C(R^4)_2O$ 、 $C(R^4)_2S$ 、 $N(R^4)C(R^4)_2$ 、 $N(R^4)CON(R^4)$ 、 $N(R^4)CSN(R^4)$] から選択されて、 R^4 は水素、 $(C_1 - C_6)$ アルキル、アリール、アリール- $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_3 - C_7)$ シクロアルキル、 $(C_3 - C_7)$ シクロアルキル- $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_3 - C_7)$ シクロアルケニル、 $(C_3 - C_7)$ シクロアルケニル- $(C_1 - C_6)$ アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリール- $(C_1 - C_6)$ アルキル、ヘテロシクリル又はヘテロシクリル- $(C_1 - C_6)$ アルキルの基で、 Q^1 は R^4 と等しい又は相異なる置換基から選択されることができ、

20

30

そして、ここで R^a 基内での $(C_2 - C_6)$ アルキレン基で隣接炭素原子はO、S、SO、 SO_2 、 $N(R^5)$ 、CO、 $CH(OR^5)$ 、 $CON(R^5)$ 、 $N(R^5)CO$ 、 $SO_2N(R^5)$ 、 $N(R^5)SO_2$ 、 $C(R^5)=C(R^5)$ 及び $C \equiv C$ から選択された基の挿入によって分離されることができ、ここで R^5 は水素又は $(C_1 - C_6)$ アルキルで、

ここで R^a 基内での任意の $CH_2=CH-$ 又は $HC \equiv C-$ 基は末端 $CH_2=$ 又は $HC \equiv$ 位置でハロゲノ、カルボキシル、カルバモイル、 $(C_1 - C_6)$ アルコキシカルボニル、 $N-(C_1 - C_6)$ アルキルカルバモイル、 N 、 N -ジ- $[(C_1 - C_6)$ アルキル]カルバモイル、アミノ- $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルアミノ- $(C_1 - C_6)$ アルキル及びジ- $[(C_1 - C_6)$ アルキル]アミノ- $(C_1 - C_6)$ アルキルから選択されるか又は化学式 $Q^2 - X^2$ - [ここで、 X^2 は直接結合であるか、CO 及び $N(R^6)CO$ から選択されて、ここで R^6 は水素又は $(C_1 - C_6)$ アルキルで、 Q^2 はアリール、アリール- $(C_1 - C_6)$ アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリール- $(C_1 - C_6)$ アルキル、ヘテロシクリル又はヘテロシクリル- $(C_1 - C_6)$ アルキル]の基から選択された置換基を含むことができ、

40

ここで R^a 基内での任意の CH_2 又は CH_3 基はそれぞれの CH_2 又は CH_3 基から 1 以上のハロゲノ、 $(C_1 - C_6)$ アルキル置換基、ヒドロキシ、シアノ、アミノ、カルボキシル、カルバモイル、 $(C_1 - C_6)$ アルコキシ、 $(C_1 - C_6)$ アルキルチオ、 $(C_1 - C_6)$ アルキルスルフィニル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルスルホニル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルアミノ、ジ- $[(C_1 - C_6)$ アルキル]アミノ、 $(C_1 - C_6)$ アルコキシカルボニル

50

、N-(C₁-C₆)アルキルカルバモイル、N、N-ジ[(C₁-C₆)アルキル]カルバモイル、(C₁-C₆)アルカノイル、(C₂-C₆)アルカノイルオキシ、(C₂-C₆)アルカノイルアミノ、N-(C₁-C₆)アルキル-(C₂-C₆)アルカノイルアミノ、N-(C₁-C₆)アルキルスルファモイル、N、N-ジ-[(C₁-C₆)アルキル]スルファモイル、(C₁-C₆)アルカンスルホニルアミノ及びN-(C₁-C₆)アルキル-(C₁-C₆)アルカンスルホニルアミノから選択された置換基又は、化学式-X³-Q³[ここで、X³は直接結合であるか、O、S、SO、SO₂、N(R⁷)、CO、CH(OR⁷)、CON(R⁷)、N(R⁷)CO、SO₂N(R⁷)、N(R⁷)SO₂、C(R⁷)₂O、C(R⁷)₂S、N(R⁷)C(R⁷)₂、N(R⁷)CON(R⁷)及びN(R⁷)CSN(R⁷)から選択されて、R⁷は水素、(C₁-C₆)アルキル、アリール、アリール-(C₁-C₆)アルキル、(C₃-C₇)シクロアルキル、(C₃-C₇)シクロアルキル-(C₁-C₆)アルキル、(C₃-C₇)シクロアルケニル、(C₃-C₇)シクロアルケニル-(C₁-C₆)アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリール-(C₁-C₆)アルキル、ヘテロシクリル又はヘテロシクリル-(C₁-C₆)アルキルの基で、Q³はR⁷と等しい又は相異なる置換基から選択されることができ、

ここで、R^aの置換体内での任意のアリール、ヘテロアリール又はヘテロシクリル基は0ないし3個の置換基を含むことができ、この置換基は等しいか相異なっていることができ、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、カルボキシル、カルバモイル、(C₁-C₆)アルキル、(C₂-C₈)アルケニル、(C₂-C₈)アルキニル、(C₁-C₆)アルコキシ、(C₂-C₆)アルケニルオキシ、(C₂-C₆)アルキニルオキシ、(C₁-C₆)アルキルチオ、(C₁-C₆)アルキルスルフィニル、(C₁-C₆)アルキルスルホニル、(C₁-C₆)アルキルアミノ、ジ-[(C₁-C₆)アルキル]アミノ、(C₁-C₆)アルコキシカルボニル、N-(C₁-C₆)アルキルカルバモイル、N、N-ジ-[(C₁-C₆)アルキル]カルバモイル、(C₂-C₆)アルカノイル、(C₂-C₆)アルカノイルオキシ、(C₂-C₆)アルカノイルアミノ、N-(C₁-C₆)アルキル-(C₂-C₆)アルカノイルアミノ、N-(C₁-C₆)アルキルスルファモイル、N、N-ジ-[(C₁-C₆)アルキル]スルファモイル、(C₁-C₆)アルカンスルホニルアミノ及びN-(C₁-C₆)アルキル-(C₁-C₆)アルカンスルホニルアミノから選択されるか又は、化学式-X⁴-R⁸[ここで、X⁴は直接結合であるか、O及びN(R⁹)から選択されて、ここでR⁹は水素又は(C₁-C₆)アルキルで、R⁸はハロゲノ-(C₁-C₆)アルキル、ヒドロキシ-(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)アルコキシ-(C₁-C₆)アルキル、シアノ-(C₁-C₆)アルキル、アミノ-(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)アルキルアミノ-(C₁-C₆)アルキル、ジ-[(C₁-C₆)アルキル]アミノ-(C₁-C₆)アルキル、(C₂-C₆)アルカノイルアミノ-(C₁-C₆)アルキル又は(C₁-C₆)アルコキシカルボニルアミノ-(C₁-C₆)アルキルである]の基から選択されるか、又は化学式-X⁵-Q⁴[ここで、X⁵は直接結合であるかO、CO及びN(R¹⁰)から選択されて、ここでR¹⁰は水素又は(C₁-C₆)アルキルで、Q⁴はアリール、アリール-(C₁-C₆)アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリール-(C₁-C₆)アルキル、ヘテロシクリル又はヘテロシクリル-(C₁-C₆)アルキルで、これは1又は2個の置換基を含むことができ、この置換基は等しいか相異なっていることができ、ハロゲノ、(C₁-C₆)アルキル及び(C₁-C₆)アルコキシから選択されること]の基から選択されて、

そして、ここでR^aの置換体内でヘテロシクリル基は1又は2個のオクソ又はチオキソ置換基を含むことができ、

R^bは水素、(C₁-C₁₈)アルキル、(C₂-C₈)アルケニル、(C₂-C₈)アルキニル、ハロゲノ-(C₁-C₆)アルキル、ヒドロキシ-(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)アルコキシ-(C₁-C₆)アルキル、シアノ-(C₁-C₆)アルキル、アミノ-(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)アルキルアミノ-(C₁-C₆)アルキル、ジ-[(C₁-C₆)アルキル]アミノ-(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)アルキルチオ-(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)アルキルスルフィニル-(C₁-C₆)アルキル又は(C

10

20

30

40

50

$1-C_6$) アルキルスルホニル- (C_1-C_6) アルキルから選択された置換基、又は、化学式- X^1-Q^1 [ここで、 X^1 は直接結合であるか、O、S、SO、 SO_2 、 $N(R^4)$ 、CO、 $CO_2(R^4)$ 、 $CH(OR^4)$ 、 $CON(R^4)$ 、 $N(R^4)CO$ 、 $SO_2N(R^4)$ 、 $N(R^4)SO_2$ 、 $C(R^4)_2O$ 、 $C(R^4)_2S$ 、 $N(R^4)C(R^4)_2$ 、 $N(R^4)CON(R^4)$ 、 $N(R^4)CSN(R^4)$] から選択されて、 R^4 は水素、(C_1-C_6) アルキル、アリール、アリール- (C_1-C_6) アルキル、(C_3-C_7) シクロアルキル、(C_3-C_7) シクロアルキル- (C_1-C_6) アルキル、(C_3-C_7) シクロアルケニル、(C_3-C_7) シクロアルケニル- (C_1-C_6) アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリール- (C_1-C_6) アルキル、ヘテロシクリル又はヘテロシクリル- (C_1-C_6) アルキルの基で、 Q^1 は R^4 と等しいか相異なる置換基から選択されることができ、

10

そして、ここで R^b 基内での(C_2-C_6) アルキレン基で隣接炭素原子はO、S、SO、 SO_2 、 $N(R^5)$ 、CO、 $CH(OR^5)$ 、 $CON(R^5)$ 、 $N(R^5)CO$ 、 $SO_2N(R^5)$ 、 $N(R^5)SO_2$ 、 $CH=CH$ 及び $C\equiv C$ から選択された基の挿入によって分離されることができ、ここで R^5 は水素又は(C_1-C_6) アルキルで、

ここで R^b 基内での任意の $CH_2=CH-$ 又は $HC\equiv C-$ 基は末端 $CH_2=$ 又は $HC\equiv$ 位置でハロゲノ、カルボキシル、カルバモイル、(C_1-C_6) アルコキシカルボニル、 $N-(C_1-C_6)$ アルキルカルバモイル、 N 、 N -ジ-[(C_1-C_6) アルキル]カルバモイル、アミノ- (C_1-C_6) アルキル、(C_1-C_6) アルキルアミノ- (C_1-C_6) アルキル及びジ-[(C_1-C_6) アルキル]アミノ- (C_1-C_6) アルキルから選択されるか又は化学式 Q^2-X^2 -[ここで、 X^2 は直接結合であるか、CO及び $N(R^6)CO$ から選択されて、ここで R^b の置換体内での任意のアリール、ヘテロアリール又はヘテロシクリル基 R^6 は水素又は(C_1-C_6) アルキルで、 Q^2 はアリール、アリール- (C_1-C_6) アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリール- (C_1-C_6) アルキル、ヘテロシクリル又はヘテロシクリル- (C_1-C_6) アルキル]の基から選択された置換基を含むことができ、

20

ここで R^b 基内での任意の CH_2 又は CH_3 基はそれぞれの CH_2 又は CH_3 基から1以上のハロゲノ-又は(C_1-C_6) アルキル置換基、又はヒドロキシ、シアノ、アミノ、カルボキシル、カルバモイル、(C_1-C_6) アルコキシ、(C_1-C_6) アルキルチオ、(C_1-C_6) アルキルスルフィニル、(C_1-C_6) アルキルスルホニル、(C_1-C_6) アルキルアミノ、ジ-[(C_1-C_6) アルキル]アミノ、(C_1-C_6) アルコキシカルボニル、 $N-(C_1-C_6)$ アルキルカルバモイル、 N 、 N -ジ-[(C_1-C_6) アルキル]カルバモイル、(C_2-C_6) アルカノイル、(C_2-C_6) アルカノイルオキシ、(C_2-C_6) アルカノイルアミノ、 $N-(C_1-C_6)$ アルキル- (C_2-C_6) アルカノイルアミノ、 $N-(C_1-C_6)$ アルキルスルファモイル、 N 、 N -ジ-[(C_1-C_6) アルキル]スルファモイル、(C_1-C_6) アルカンスルホニルアミノ及び $N-(C_1-C_6)$ アルキル- (C_1-C_6) アルカンスルホニルアミノから選択された置換基又は、化学式- X^3-Q^3 [ここで、 X^3 は直接結合であるか、O、S、SO、 SO_2 、 $N(R^7)$ 、CO、 $CH(OR^7)$ 、 $CON(R^7)$ 、 $N(R^7)CO$ 、 $SO_2N(R^7)$ 、 $N(R^7)SO_2$ 、 $C(R^7)_2O$ 、 $C(R^7)_2S$ 、 $N(R^7)C(R^7)_2$ 、 $N(R^7)CON(R^7)$ 及び $N(R^7)CSN(R^7)$ から選択されて、 R^7 は水素、(C_1-C_6) アルキル、アリール、アリール- (C_1-C_6) アルキル、(C_3-C_7) シクロアルキル、(C_3-C_7) シクロアルキル- (C_1-C_6) アルキル、(C_3-C_7) シクロアルケニル、(C_3-C_7) シクロアルケニル- (C_1-C_6) アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリール- (C_1-C_6) アルキル、ヘテロシクリル又はヘテロシクリル- (C_1-C_6) アルキルの基で、 Q^3 は R^7 に等しいか相異なる置換基から選択されることができ、

30

40

R^b 基内での任意のアリール、ヘテロアリール又はヘテロシクリル基は1、2又は3個の置換基を含むことができ、この置換基は等しいか相異なっていることができ、水素、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、カルボキシル、カルバモイル、(C_1-C_6) アルキル、(C_2-C_8) アルケニル、(C_2-C_8) アルキニル、(C_1-C_6) アルコキシ、(C_2-C_6) アルケニルオキシ、(C_2-C_6) アル

50

キニルオキシ、(C₁-C₆)アルキルチオ、(C₁-C₆)アルキルスルフィニル、(C₁-C₆)アルキルスルホニル、(C₁-C₆)アルキルアミノ、ジ-[(C₁-C₆)アルキル]アミノ、(C₁-C₆)アルコキシカルボニル、N-(C₁-C₆)アルキルカルバモイル、N、N-ジ-[(C₁-C₆)アルキル]カルバモイル、(C₂-C₆)アルカノイル、(C₂-C₆)アルカノイルオキシ、(C₂-C₆)アルカノイルアミノ、N-(C₁-C₆)アルキル-(C₂-C₆)アルカノイルアミノ、(C₃-C₆)アルケノイルアミノ、N-(C₁-C₆)アルキル-(C₃-C₆)アルケノイルアミノ、(C₃-C₆)アルキノイルアミノ、N-(C₁-C₆)アルキル-(C₃-C₆)アルキノイルアミノ、N-(C₁-C₆)アルキルスルファモイル、N、N-ジ-[(C₁-C₆)アルキル]スルファモイル、(C₁-C₆)アルカンスルホニルアミノ及びN-(C₁-C₆)アルキル-(C₁-C₆)アルカンスルホニルアミノから選択されるか化学式-X⁴-R⁸[ここで、X⁴は直接結合であるか、O及びN(R⁹)から選択されて、ここでR⁹は水素又は(C₁-C₆)アルキルで、R⁸はハロゲノ-(C₁-C₆)アルキル、ヒドロキシ-(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)アルコキシ-(C₁-C₆)アルキル、シアノ-(C₁-C₆)アルキル、アミノ-(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)アルキルアミノ-(C₁-C₆)アルキル又はジ-[(C₁-C₆)アルキル]アミノ-(C₁-C₆)アルキル]の基から選択されるか又は化学式-X⁵-Q⁴[ここで、X⁵は直接結合であるかO、CO及びN(R¹⁰)から選択されて、ここでR¹⁰は水素又は(C₁-C₆)アルキルで、Q⁴はアリール、アリール-(C₁-C₆)アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリール-(C₁-C₆)アルキル、ヘテロシクリル又はヘテロシクリル-(C₁-C₆)アルキルで、これは1又は2個の置換基を含むことができ、この置換基は等しいか相異なっていることができ、ハロゲノ、(C₁-C₆)アルキル及び(C₁-C₆)アルコキシから選択されること]の基から選択されて、

ここでR^bの置換体内でヘテロシクリル基は1又は2個のオクソ又はチオキソ置換基を含むことができ、

そしてR^b基内での任意のアリール、ヘテロアリール又はヘテロシクリル基の等しいか相異なる置換基は互いに結合して化学式CH=CH-CH=CH-、-N=CH-CH=CH-、-CH=CH-N=CH-、-CH=CH-CH=N-、-N=CH-N=CH-、-CH=CH-N=CH-、-N=CH-CH=N-、-N=CH-CH=N-、-N=N-CH=CH-、-CH=CH-N=N-、-CH=CH-O-、-O-CH=CH-、-CH=CH-S-、-S-CH=CH-、-C(R¹¹)₂-C(R¹¹)₂-O-、-O-C(R¹¹)₂-C(R¹¹)₂-、-C(R¹¹)₂-C(R¹¹)₂-S-、-S-C(R¹¹)₂-C(R¹¹)₂-、-O-C(R¹¹)₂-O-、-O-C(R¹¹)₂-C(R¹¹)₂-O-、-S-C(R¹¹)₂-S-、-S-C(R¹¹)₂-C(R¹¹)₂-S-、-CH=CH-NH-、-NH-CH=CH-、-C(R¹¹)₂-C(R¹¹)₂-NH-、-NH-C(R¹¹)₂-C(R¹¹)₂-、-N=CH-NH-、-NH-CH=N-、-NH-C(R¹¹)₂-NH-、-O-CH=N-、-N=CH-O-、-S-CH=N-、-N=CH-S-、-O-C(R¹¹)₂-NH-、-NH-C(R¹¹)₂-O-、-S-C(R¹¹)₂-NH-、-NH-C(R¹¹)₂-S-、-O-N=CH-、-CH=N-O-、-S-N=CH-、-CH=N-S-、-O-NH-C(R¹¹)₂-、-C(R¹¹)₂-NH-O-、-S-NH-C(R¹¹)₂-、-C(R¹¹)₂-NH-S-、-NH-N=CH-、-CH=N-NH-、-NH-NH-C(R¹¹)₂-、-C(R¹¹)₂-NH-NH-、-N=N-NH-又は-NH-N=N-の基[ここで、R¹¹は水素又は(C₁-C₆)アルキル]を形成することができ、

前記化学式で、mは0、1、2、3又は4で、

それぞれのR^c基は等しいか相異なっていることができ、水素、ハロゲノ、トリフルオロメチル、シアノ、イソシアノ、ニトロ、ヒドロキシ、メルカプト、アミノ、ホルミル、カルボキシル、カルバモイル、(C₁-C₆)アルキル、(C₂-C₈)アルケニル、(C₂-C₈)アルキニル、(C₁-C₆)アルコキシ、(C₂-C₈)アルケニルオキシ、(C₂-C₆)アルキニルオキシ、(C₁-C₆)アルキルチオ、(C₁-C₆)アルキルスルフィニル、(C₁-C₆)アルキルスルホニル、(C₁-C₆)アルキルアミノ、ジ-[(C₁-C₆)アルキル]アミノ、(C₁-C₆)アルコキシカルボニル、N-(C₁-C₆)

10

20

30

40

50

アルキルカルバモイル、N、N-ジ-[(C₁-C₆)アルキル]カルバモイル、(C₂-C₆)アルカノイル、(C₂-C₆)アルカノイルオキシ、(C₂-C₆)アルカノイルアミノ、N-(C₁-C₆)アルキル-(C₂-C₆)アルカノイルアミノ、(C₃-C₆)アルケノイルアミノ、N-(C₁-C₆)アルキル-(C₃-C₆)アルケノイルアミノ、(C₃-C₆)アルキノイルアミノ、N-(C₁-C₆)アルキル-(C₃-C₆)アルキノイルアミノ、N-(C₁-C₆)アルキルスルファモイル、N、N-ジ-[(C₁-C₆)アルキル]スルファモイル、(C₁-C₆)アルカンスルホニルアミノ及びN-(C₁-C₆)アルキル-(C₁-C₆)アルカンスルホニルアミノ、アリール、アリール-(C₁-C₆)アルキル、(C₃-C₇)シクロアルキル、(C₃-C₇)シクロアルキル-(C₁-C₆)アルキル、(C₃-C₇)シクロアルケニル、(C₃-C₇)シクロアルケニル-(C₁-C₆)アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリール-(C₁-C₆)アルキル、ヘテロシクリル又はヘテロシクリル-(C₁-C₆)アルキル]の基から選択される。

ここでR^C置換体内での任意の(C₂-C₆)アルキレン基で隣接炭素原子はO、S、SO、SO₂、N(R^{1 2})、CO、CH(OR^{1 2})、CON(R^{1 2})、N(R^{1 2})CO、SO₂N(R^{1 2})、N(R^{1 2})SO₂、CH=CH及びC≡Cから選択された基の基の挿入によって分離することができ、ここでR^{1 2}は水素又は(C₁-C₆)アルキルで、

ここでR^C置換体内での任意のCH₂=CH-又はHC≡C-基は末端CH₂=又はHC≡位置でハロゲノ、カルボキシル、カルバモイル、(C₁-C₆)アルコキシカルボニル、N-(C₁-C₆)アルキルカルバモイル、N、N-ジ-[(C₁-C₆)アルキル]カルバモイル、アミノ-(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)アルキルアミノ-(C₁-C₆)アルキル及びジ-[(C₁-C₆)アルキル]アミノ-(C₁-C₆)アルキルから選択されるか又は化学式Q⁵-X⁶-[ここで、X⁶は直接結合であるか、CO及びN(R^{1 3})COから選択されて、ここでR^{1 3}は水素又は(C₁-C₆)アルキルで、Q⁵はアリール、アリール-(C₁-C₆)アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリール-(C₁-C₆)アルキル、ヘテロシクリル又はヘテロシクリル-(C₁-C₆)アルキル]の基から選択された置換基を含むことができ、

ここでR^C置換体内での任意のCH₂又はCH₃基はそれぞれのCH₂又はCH₃基から1以上のハロゲノ又は(C₁-C₆)アルキル置換基、又はヒドロキシ、シアノ、アミノ、カルボキシル、カルバモイル、(C₁-C₆)アルコキシ、(C₁-C₆)アルキルチオ、(C₁-C₆)アルキルスルフィニル、(C₁-C₆)アルキルスルホニル、(C₁-C₆)アルキルアミノ、ジ-[(C₁-C₆)アルキル]アミノ、(C₁-C₆)アルコキシカルボニル、N-(C₁-C₆)アルキルカルバモイル、N、N-ジ-[(C₁-C₆)アルキル]カルバモイル、(C₂-C₆)アルカノイル、(C₂-C₆)アルカノイルオキシ、(C₂-C₆)アルカノイルアミノ、N-(C₁-C₆)アルキル-(C₂-C₆)アルカノイルアミノ、N-(C₁-C₆)アルキルスルファモイル、N、N-ジ-[(C₁-C₆)アルキル]スルファモイル、(C₁-C₆)アルカンスルホニルアミノ及びN-(C₁-C₆)アルキル-(C₁-C₆)アルカンスルホニルアミノから選択された置換基又は、化学式-X⁷-Q⁶[ここで、X⁷は直接結合であるか、O、S、SO、SO₂、N(R^{1 4})、CO、CH(OR^{1 4})、CON(R^{1 4})、N(R^{1 4})CO、SO₂N(R^{1 4})、N(R^{1 4})SO₂、C(R^{1 4})₂O、C(R^{1 4})₂S及びN(R^{1 4})C(R^{1 4})₂から選択されて、ここでR^{1 4}は水素又は(C₁-C₆)アルキルで、Q⁶はアリール、アリール-(C₁-C₆)アルキル、(C₃-C₇)シクロアルキル、(C₃-C₇)シクロアルキル-(C₁-C₆)アルキル、(C₃-C₇)シクロアルケニル、(C₃-C₇)シクロアルケニル-(C₁-C₆)アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリール-(C₁-C₆)アルキル、ヘテロシクリル又はヘテロシクリル-(C₁-C₆)アルキル]の基から選択される置換基を含むことができ、

ここで、R^C基内での任意のアリール、ヘテロアリール又はヘテロシクリル基は1、2又は3個の置換基を含むことができ、この置換基は等しいか相異なっていることができ、水素、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、カルボキ

10

20

30

40

50

シル、カルバモイル、(C₁-C₆)アルキル、(C₂-C₈)アルケニル、(C₂-C₈)アルキニル、(C₁-C₆)アルコキシ、(C₂-C₆)アルケニルオキシ、(C₂-C₆)アルキニルオキシ、(C₁-C₆)アルキルチオ、(C₁-C₆)アルキルスルフィニル、(C₁-C₆)アルキルスルホニル、(C₁-C₆)アルキルアミノ、ジ-[(C₁-C₆)アルキル]アミノ、(C₁-C₆)アルコキシカルボニル、N-(C₁-C₆)アルキルカルバモイル、N、N-ジ-[(C₁-C₆)アルキル]カルバモイル、(C₂-C₆)アルカノイル、(C₂-C₆)アルカノイルオキシ、(C₂-C₆)アルカノイルアミノ、N-(C₁-C₆)アルキル-(C₂-C₆)アルカノイルアミノ、(C₃-C₆)アルケノイルアミノ、N-(C₁-C₆)アルキル-(C₃-C₆)アルケノイルアミノ、(C₃-C₆)アルキノイルアミノ、N-(C₁-C₆)アルキル-(C₃-C₆)アルキノイルアミノ、N-(C₁-C₆)アルキルスルファモイル、N、N-ジ-[(C₁-C₆)アルキル]スルファモイル、(C₁-C₆)アルカンスルホニルアミノー及びN-(C₁-C₆)アルキル-(C₁-C₆)アルカンスルホニルアミノから選択されるか化学式-X⁸-R¹⁵[ここで、X⁸は直接結合であるか、O及びN(R¹⁶)から選択されて、ここでR⁸は水素又は(C₁-C₆)アルキルで、R¹⁵はハロゲノ-(C₁-C₆)アルキル、ヒドロキシ-(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)アルコキシ-(C₁-C₆)アルキル、シアノ-(C₁-C₆)アルキル、アミノ-(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)アルキルアミノ-(C₁-C₆)アルキル又はジ-[(C₁-C₆)アルキル]アミノ-(C₁-C₆)アルキルである]の基から選択されるか又は化学式-X⁹-Q⁷[ここで、X⁹は直接結合であるかO、CO及びN(R¹⁷)から選択されて、R¹⁷は水素又は(C₁-C₆)アルキルで、Q⁷は1又は2個の置換基を持つことができる、アリール、アリール-(C₁-C₆)アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリール-(C₁-C₆)アルキル、ヘテロシクリル又はヘテロシクリル-(C₁-C₆)アルキルで、この置換基は等しいか相異なっていることができ、ハロゲノ、(C₁-C₆)アルキル及び(C₁-C₆)アルコキシから選択されて、Q⁷内での任意のヘテロシクリル基は1又は2個のオクソ又はチオキソ置換基を含むことができる]の基から選択されて、

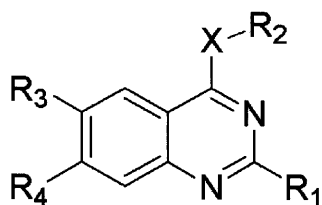
ここでR^Cの置換体内でヘテロシクリル基は1又は2個のオクソ又はチオキソ置換基を含むことができ、R^C基内での任意のアリール、ヘテロアリール又はヘテロシクリル基の等しいか相異なる置換基は互いに結合して化学式

CH=CH-CH=CH-、-N=CH-CH=CH-、-CH=N-CH=CH-、-CH=CH-N=CH-、CH=CH-CH=N-、-N=CH-N=CH-、-CH=N-CH=N-、-N=CH-CH=N-、-N=N-CH=CH-、-CH=CH-N=N-、-CH=CH-O-、-O-CH=CH-、-CH=CH-S-、-SCH=CH-、-C(R¹⁸)₂-C(R¹⁸)₂-O-、-O-C(R¹⁸)₂-C(R¹⁸)₂-、-C(R¹⁸)₂-C(R¹⁸)₂-S-、-S-C(R¹⁸)₂-C(R¹⁸)₂-、-O-C(R¹⁸)₂-O-、-O-C(R¹⁸)₂-C(R¹⁸)₂-O-、-S-C(R¹⁸)₂-S-、-S-C(R¹⁸)₂-C(R¹⁸)₂-S-、-CH=CH-NH-、-NH-CH=CH-、-C(R¹⁸)₂-C(R¹⁸)₂-NH-、-NH-C(R¹⁸)₂-C(R¹⁸)₂-、-N=CH-NH-、-NH-CH=N-、-NH-C(R¹⁸)₂-NH-、-O-CH=N-、-N=CHO-、-S-CH=N-、-N=CH-S-、-O-C(R¹⁸)₂-NH-、-NH-C(R¹⁸)₂-O-、-S-C(R¹⁸)₂-NH-、-NH-C(R¹⁸)₂-S-、-ON=CH-、-CH=N-O-、-S-N=CH-、-CH=N-S-、-O-NH-C(R¹⁸)₂-、-C(R¹⁸)₂-NH-O-、-S-NH-C(R¹⁸)₂-、-C(R¹⁸)₂-NH-S-、-NH-N=CH-、-CH=N-NH-、-NH-NH-C(R¹⁸)₂-、-C(R¹⁸)₂-NH-NH-、-N=N-NH-又は-NH-N=N-心意気[ここで、R¹⁸は水素又は(C₁-C₆)アルキル]を形成することができる。

【請求項2】

請求項1において、次の化学式1-1で表示されることを特徴とする化合物:

[化学式1-1]



前記化学式 1-1 で、

Xは直接結合であるか、O、S、SO、SO₂又はNR⁵から選択されて、R⁵は水素、(C₁-C₆)アルキル、アリール、アリール-(C₁-C₆)アルキル、(C₃-C₇)シクロアルキル、(C₃-C₇)シクロアルキル-(C₁-C₆)アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリール-(C₁-C₆)アルキル、ヘテロシクリル又はヘテロシクリル-(C₁-C₆)アルキルの基で、R₁は水素、(C₁-C₈)アルキル、ハロゲノ-(C₁-C₆)アルキル、ヒドロキシ-(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)アルコキシ-(C₁-C₆)アルキル、アミノ-(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)アルキルアミノ-(C₁-C₆)アルキル、ジ-[(C₁-C₆)アルキル]アミノ-(C₁-C₆)アルキル及び(C₁-C₆)アルキルスルフィニルの中から選択された置換基、又は化学式-X¹-Q¹[ここで、X¹は直接結合であるか、O、S又はNR⁵]から選択されて、Q¹はR⁵と等しいか相異なる置換基から選択されることができ、

そして、ここでR₁基内での(C₂-C₆)アルキレン基で隣接炭素原子はO、S及びN(R⁵)から選択された基の挿入によって分離させることができ、ここでR₁基内での任意のCH₂又はCH₃基それぞれのCH₂又はCH₃基から1以上のハロゲノ、(C₁-C₆)アルキル置換基、ヒドロキシ、アミノ、(C₁-C₆)アルコキシ(C₁-C₆)アルキルチオ、(C₁-C₆)アルキルスルフィニル、(C₁-C₆)アルキルアミノ及びジ-[(C₁-C₆)アルキル]アミノから選択された置換基を含むことができ、

ここでR₁の置換体内での任意のアリール、ヘテロアリール又はヘテロシクリル基は0ないし3個の置換基を含むことができ、この置換基は等しいか相異なっていることができ、ハロゲノ、ヒドロキシ、アミノ、(C₁-C₆)アルキル、アリール、アリール-(C₁-C₆)アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリール-(C₁-C₆)アルキル、ヘテロシクリル又はヘテロシクリル-(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)アルコキシ、(C₁-C₆)アルキルチオ(C₁-C₆)アルキルスルフィニルの中から選択された置換基を含むことができ、

そして、ここでR₁の置換体内でヘテロシクリル基は1又は2個のオクソ又はチオキソ置換基を含むことができ、R₂は水素、(C₁-C₁₈)アルキル、(C₂-C₈)アルケニル、ハロゲノ-(C₁-C₈)アルキル、ヒドロキシ-(C₁-C₈)アルキル、(C₁-C₈)アルコキシ-(C₁-C₈)アルキル、アミノ-(C₁-C₈)アルキル、(C₁-C₈)アルキルアミノ-(C₁-C₈)アルキル、ジ-[(C₁-C₈)アルキル]アミノ-(C₁-C₈)アルキル、(C₁-C₈)アルキルスルフィニル、アリール、アリール-(C₁-C₈)アルキル、(C₃-C₇)シクロアルキル、(C₃-C₇)シクロアルキル-(C₁-C₈)アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリール-(C₁-C₈)アルキル、ヘテロシクリル及びヘテロシクリル-(C₁-C₈)アルキル中の置換基から選択されることができ、

そして、ここでR₂基内での(C₂-C₆)アルキレン基で隣接炭素原子はO、S、N(R⁵)、CO、CH(OR⁵)、CON(R⁵)、N(R⁵)CO、SO₂N(R⁵)、N(R⁵)SO₂及びCH=CHから選択された基の挿入によって分離させることができ、

ここでR₂基内での任意のCH₂又はCH₃基はそれぞれのCH₂又はCH₃基から1以上のハロゲノ、(C₁-C₆)アルキル置換基、ヒドロキシ、シアノ、アミノ、カルボキシル、カルバモイル、(C₁-C₆)アルコキシ(C₁-C₆)アルキルチオ及び(C₁-C₆)アルキルスルフィニル、(C₁-C₆)アルキルアミノ、ジ-[(C₁-C₆)アル

キル]アミノ、 (C_1-C_6) アルコキシカルボニル、 $N-(C_1-C_6)$ アルキルカルバモイル、 N 、 N -ジ- $[(C_1-C_6)$ アルキル]カルバモイル、アリール、アリール- (C_1-C_6) アルキル、 (C_3-C_7) シクロアルキル、 (C_3-C_7) シクロアルキル- (C_1-C_6) アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリール- (C_1-C_6) アルキル、ヘテロシクリル及びヘテロシクリル- (C_1-C_6) アルキル基の中から選択された置換基を含むことができ、

ここで R_2 の置換体内での任意のアリール、ヘテロアリール又はヘテロシクリル基は1ないし3個の置換基を含むことができ、この置換基は等しいか相異なっていることができ、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、カルボキシル、カルバモイル、 (C_1-C_6) アルキル、アリール、アリール- (C_1-C_6) アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリール- (C_1-C_6) アルキル、ヘテロシクリル又はヘテロシクリル- (C_1-C_6) アルキル、 (C_2-C_8) アルケニル、 (C_2-C_8) アルキニル、 (C_1-C_6) アルコキシ、 (C_1-C_6) アルキルチオ、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル、 (C_1-C_6) アルキルアミノ、ジ- $[(C_1-C_6)$ アルキル]アミノ、 (C_1-C_6) アルコキシカルボニル、 $N-(C_1-C_6)$ アルキルカルバモイル及び N 、 N -ジ- $[(C_1-C_6)$ アルキル]カルバモイルから選択された置換基を含むことができ、

そして、ここで R_2 の置換体内でヘテロシクリル基は1又は2個のオクソ又はチオキソ置換基を含むことができ、そして R_2 基内での任意のアリール、ヘテロアリール又はヘテロシクリル基の等しいか相異なっている置換基は互いに結合して化学式 $CH=CH-CH=CH-$ 、 $-N=CH-CH=CH-$ 、 $-CH=N-CH=CH-$ 、 $-CH=CH-N=CH-$ 、 $CH=CH-CH=N-$ 、 $-N=CH-N=CH-$ 、 $-CH=N-CH=N-$ 、 $-N=CH-CH=N-$ 、 $-CH=CH-O-$ 、 $-O-CH=CH-$ 、 $-CH=CH-S-$ 、 $-S-CH=CH-$ 、 $-C(R^6)_2-C(R^6)_2-O-$ 、 $-O-C(R^6)_2-C(R^6)_2-$ 、 $-C(R^6)_2-C(R^6)_2-S-$ 、 $-S-C(R^6)_2-C(R^6)_2-$ 、 $-O-C(R^6)_2-O-$ 、 $-O-C(R^6)_2-C(R^6)_2-O-$ 、 $-S-C(R^6)_2-S-$ 、 $-S-C(R^6)_2-C(R^6)_2-S-$ 、 $-CH=CH-NH-$ 、 $-NH-CH=CH-$ 、 $-C(R^6)_2-C(R^6)_2-NH-$ 、 $-NH-C(R^6)_2-C(R^6)_2-$ 、 $-N=CHNH-$ 、 $-NH-CH=N-$ 、 $-NH-C(R^6)_2-NH-$ 、 $-O-CH=N-$ 、 $-N=CH-O-$ 、 $-S-CH=N-$ 、 $-N=CH-S-$ 、 $-O-C(R^6)_2-NH-$ 、 $-NHC(R^6)_2-O-$ 、 $-S-C(R^6)_2-NH-$ 、 $-NH-C(R^6)_2-S-$ 、 $-N=N-NH-$ 又は $-NH-N=N-$ の基[ここで、 R_6 は水素又は (C_1-C_3) アルキル基]を形成することができ、

R_3 及び R_4 はそれぞれ等しいか相異なっていることができ、水素、ハロゲノ、トリフルオロメチル、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、メルカプト、アミノ、ホルミル、カルボキシル、カルバモイル、 (C_1-C_6) アルキル、 (C_2-C_6) アルケニル、 (C_2-C_6) アルコキシ、 (C_1-C_6) アルキルチオ、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル、 (C_1-C_6) アルキルアミノ、ジ- $[(C_1-C_6)$ アルキル]アミノ、 (C_1-C_6) アルコキシカルボニル、 $N-(C_1-C_6)$ アルキルカルバモイル、 N 、 N -ジ- $[(C_1-C_6)$ アルキル]カルバモイル、アリール、アリール- (C_1-C_6) アルキル、 (C_3-C_7) シクロアルキル、 (C_3-C_7) シクロアルキル- (C_1-C_6) アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリール- (C_1-C_6) アルキル、ヘテロシクリル又はヘテロシクリル- (C_1-C_6) アルキル基から選択されることができ、

ここで R_3 及び R_4 置換基内での任意の CH_2 又は CH_3 基それぞれの CH_2 又は CH_3 基から1以上のハロゲノ、ヒドロキシ、アミノ、カルボキシル、カルバモイル、 (C_1-C_6) アルコキシ、 (C_1-C_6) アルキルチオ、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル、 (C_1-C_6) アルキルアミノ、ジ- $[(C_1-C_6)$ アルキル]アミノ、 (C_1-C_6) アルコキシカルボニル、 $N-(C_1-C_6)$ アルキルカルバモイル、 N 、 N -ジ- $[(C_1-C_6)$ アルキル]カルバモイル、アリール、アリール- (C_1-C_6) アルキル、 (C_3-C_7) シクロアルキル、 (C_3-C_7) シクロアルキル- (C_1-C_6) アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリール- (C_1-C_6) アルキル、ヘテロシクリル及びヘテロシクリル- (C_1-C_6) アルキル基の中から選択される置換基を含むことができ、

ここで R_3 及び R_4 基内での任意のアリール、ヘテロアリール又はヘテロシクリル基は

10

20

30

40

50

1、2又は3個の置換基を含むことができ、この置換基は等しいか相異なっていることができるしハロゲン、トリフルオロメチル、ニトロ、ヒドロキシ、アミノ、(C₁-C₆)アルコキシ、(C₁-C₆)アルキルチオ、(C₁-C₆)アルキルアミノ、ジ-[(C₁-C₆)アルキル]アミノ、(C₁-C₆)アルコキシカルボニル、N-(C₁-C₆)アルキルカルバモイル及びN、N-ジ-[(C₁-C₆)アルキル]カルバモイル基から選択される置換基を含むことができ、

ここでR₃及びR₄の置換体内でヘテロシクリル基は1又は2個のオクソ又はチオキノ置換基を含むことができる。

【請求項3】

請求項2において、

前記XはO、S又はNR₅で、R₁は水素原子、C₁-C₆アルキル基、C₁-C₄ハロアルキル基、C₁-C₆アルキルヒドロキシ、C₁-C₆アルキルスルファニル基、フェニル基、フェニルC₁-C₈アルキル基、ピリジン基、フラノ基、チオフェノ基、C₃-C₇シクロアルキル基、ピロリジン基、ピペリジン基、モルホリン基、又はN-(C₁-C₆)アルキルピペラジン基で、R₂はC₁-C₁₈アルキル基、C₂-C₈ハロアルキル基、C₃-C₇シクロアルキル基、(C₃-C₇)シクロアルキルC₁-C₈アルキル基、C₂-C₈アルケニルギ、(C₃-C₇)サクロアルケニルC₁-C₈アルキル基、(C₁-C₈)アルキルC₁-C₈アルコキシアルキルギ、C₁-C₈のヒドロキシアルキル、ヒドロキシ-(C₁-C₈)アルキル-(C₁-C₈)アルコキシアルキル基、フェニル基、フェニルC₁-C₈アルキル基、ジ-フェニルC₁-C₈アルキル基、フェニルC₁-C₈アルキルヒドロキシ、フェニルC₁-C₈アルキル基、ピペリジンC₁-C₈アルキル基、N-[フェニル-(C₁-C₆)アルキル]ピペリジン基、N-(C₁-C₆)アルキルピペリジンC₁-C₈アルキル基、ピロリジンN-(C₁-C₈)アルキル基、ナフタリンC₁-C₈アルキル基、モルホリンC₁-C₈アルキル基、ピペラジンC₁-C₈アルキル基、N-(C₁-C₆)アルキルピペラジンC₁-C₈アルキル基、ピリジンC₁-C₈アルキル基、ピロリジンC₁-C₈アルキル基、N-(C₁-C₆)アルキルピロリジンC₁-C₈アルキル基、チオフェンC₁-C₈アルキル基又はベンゾジオキソールC₁-C₈アルキル基、R₃及びR₄はそれぞれ水素原子、ニトロ基、又はC₁-C₈アルコキシ基で、R₅は水素原子、C₁-C₄アルキル基又はC₁-C₈のヒドロキシアルキルで、そして、前記C₃-C₇シクロアルキル、フェニル、ピペリジン、ナフタリン、モルホリン、ピリジン、ピロリジン、ピロリジノン、ピペラジン、チオフェン、及びベンゾジオキソールの中から選択された置換基はC₁-C₈アルキル基、ハロゲン原子、ヒドロキシ、C₁-C₈アルコキシ基、ニトロ基、及びトリフルオロメチル基の中から選択された置換基が1ないし3個置換されたことを特徴とする化合物。

【請求項4】

請求項1において、

前記化学式1で表示される化合物が下記から選択されたことを特徴とする化合物：

化合物番号1． 2-[2-(2-フェニル-キナゾリン-4-イルアミノ)-エトキシ]-エチルアルコール

化合物番号2． イソプロピル-(2-トリクロロメチル-キナゾリン-4-イル)-アミン

化合物番号3． シクロプロピル-(2-トリクロロメチル-キナゾリン-4-イル)-アミン

化合物番号4． (2-ピペリジン-1-イルエチル)-(2-トリクロロメチル-キナゾリン-4-イル)-アミン

化合物番号5． (1-フェニル-エチル)-(2-トリクロロメチル-キナゾリン-4-イル)-アミン

化合物番号6． (4-フェニル-ブチル)-(2-トリクロロメチル-キナゾリン-4-イル)-アミン

化合物番号7． プロピル-(2-トリクロロメチル-キナゾリン-4-イル)-アミン

化合物番号8． (2-エチルスルファニル-キナゾリン-4-イル)-イソプロピル-アミン

化合物番号9． (2-エチルスルファニル-キナゾリン-4-イル)-(3-フルオロベンジ

10

20

30

40

50

ル) -アミン

化合物番号 10. (2-エチルスルファニル-キナゾリン-4-イル) -[2-(3-フルオロフェニル)-エチル]-アミン

化合物番号 11. (2-エチルスルファニル-キナゾリン-4-イル) - (2-モルホリン-4-イル-エチル) -アミン

化合物番号 12. (2-エチルスルファニル-キナゾリン-4-イル) -[2-(3-トリフルオロメチル-フェニル)エチル]-アミン

化合物番号 13. (6-ニトロ-キナゾリン-4-イル) -フェニル-アミン

化合物番号 14. (6,7-ジエトキシ-キナゾリン-4-イル) -ナフタリン-1-イルメチル-アミン

化合物番号 15. (6,7-ジエトキシ-キナゾリン-4-イル) - (3-モルホリン-4-イル-プロピル) -アミン

化合物番号 16. アリル- (6,7-ジエトキシ-キナゾリン-4-イル) -アミン

化合物番号 17. (6,7-ジエトキシ-キナゾリン-4-イル) - (2-ピリジン-2-イル-エチル) -アミン

化合物番号 18. (4-塩素-ベンジル) - (6,7-ジエトキシ-キナゾリン-4-イル) -アミン

化合物番号 19. ブチル- (2-エチルスルファニル-キナゾリン-4-イル) -アミン

化合物番号 20. Sec-ブチル- (2-エチルスルファニル-キナゾリン-4-イル) -アミン

化合物番号 21. (2-エチルスルファニル-キナゾリン-4-イル) -イソブチルアミン

化合物番号 22. ベンジル- (2-エチルスルファニル-キナゾリン-4-イル) -アミン

化合物番号 23. (2-エチルスルファニル-キナゾリン-4-イル) - (1-フェニル-エチル) -アミン

化合物番号 24. (2-エチルスルファニル-キナゾリン-4-イル) - (3-メトキシ-ベンジル) -アミン

化合物番号 25. (2-エチルスルファニル-キナゾリン-4-イル) - (4-メトキシ-ベンジル) -アミン

化合物番号 26. (2-エチルスルファニル-キナゾリン-4-イル) - (3-トリフルオロメチル-ベンジル) -アミン

化合物番号 27. シクロヘキシル- (2-エチルスルファニル-キナゾリン-4-イル) -アミン

化合物番号 28. シクロヘキシル- (2-エチルスルファニル-キナゾリン-4-イル) -アミン

化合物番号 29. (2-エチルスルファニル-キナゾリン-4-イル) -フェネチル-アミン

化合物番号 30. (2-エチルスルファニル-キナゾリン-4-イル) - (4-フェニル-ブチル) -アミン

化合物番号 31. (2-エチルスルファニル-キナゾリン-4-イル) -プロピル-アミン

化合物番号 32. (2-エチルスルファニル-キナゾリン-4-イル) - (3-フェニル-プロピル) -アミン

化合物番号 33. (2-エチルスルファニル-キナゾリン-4-イル) - (3-イソプロポキシプロピル) -アミン

化合物番号 34. (2-エチルスルファニル-キナゾリン-4-イル) - (2-メトキシ-エチル) -アミン

化合物番号 35. (2-エチルスルファニル-キナゾリン-4-イル) -ナフタリン-1-イルメチル-アミン

化合物番号 36. (2-エチルスルファニル-キナゾリン-4-イル) - (3-モルホリン-4-イル-プロピル) -アミン

化合物番号 37. ベンゾ[1,3]ジオキソール-5-イルメチル- (2-エチルスルファニル-キナゾリン-4-イル) -アミン

10

20

30

40

50

化合物番号 38. (3, 5-ジメトキシ-ベンジル) - (2-エチルスルファニル-キナゾリン-4-イル) - アミン

化合物番号 39. (2-エチルスルファニル-キナゾリン-4-イル) - (2-フルオロベンジル) - アミン

化合物番号 40. (2-エチルスルファニル-キナゾリン-4-イル) - (1-メトキシメチル-プロピル) - アミン

化合物番号 41. (1-ベンジル-ピペリジン-4-イル) - (2-エチルスルファニル-キナゾリン-4-イル) - アミン

化合物番号 42. アリル- (2-エチルスルファニル-キナゾリン-4-イル) - アミン

化合物番号 43. (2-エチルスルファニル-キナゾリン-4-イル) - ヘキサデシル-アミン 10

化合物番号 44. (2-エチルスルファニル-キナゾリン-4-イル) - (2-ピペリジン-1-イル-エチル) - アミン

化合物番号 45. (2-エチルスルファニル-キナゾリン-4-イル) - (2-ピロリジン-1-イル-エチル) - アミン

化合物番号 46. (2-エチルスルファニル-キナゾリン-4-イル) - (2-ピリジン-2-イル-エチル) - アミン

化合物番号 47. 2- (2-エチルスルファニル-キナゾリン-4-イルアミノ) - エチルアルコール

化合物番号 48. (2-エチルスルファニル-キナゾリン-4-イル) - [3- (2-メチル-ピペリジン-1-イル) - プロピル] - アミン 20

化合物番号 49. (2-塩素-6-フルオロベンジル) - (2-エチルスルファニル-キナゾリン-4-イル) - アミン

化合物番号 50. 2- [2- (2-エチルスルファニル-キナゾリン-4-イルアミノ) - エトキシ] - エチルアルコール

化合物番号 51. シクロヘキシル- (2-フェニル-キナゾリン-4-イル) - アミン

化合物番号 52. (4-フェニル-ブチル) - (2-フェニル-キナゾリン-4-イル) - アミン

化合物番号 53. (5-フェニル-ペンチル) - (2-フェニル-キナゾリン-4-イル) - アミン 30

化合物番号 54. (4-メチル-ベンジル) - (2-フェニル-キナゾリン-4-イル) - アミン

化合物番号 55. イソブチル- (2-フェニル-キナゾリン-4-イル) - アミン

化合物番号 56. ブチル- (2-フェニル-キナゾリン-4-イル) - アミン

化合物番号 57. ナフタリン-1-イルメチル- (2-フェニル-キナゾリン-4-イル) - アミン

化合物番号 58. (2-フェニル-キナゾリン-4-イル) - ピリジン-2-イルメチル-アミン

化合物番号 59. (1-フェニル-キナゾリン-4-イル) - チオフェニル-2-イルメチル-アミン 40

化合物番号 60. イソプロピル- (2-フェニル-キナゾリン-4-イル) - アミン

化合物番号 61. (2-フェニル-キナゾリン-4-イル) - プロピル-アミン

化合物番号 62. (3-イソプロポキシプロピル) - (2-フェニル-キナゾリン-4-イル) - アミン

化合物番号 63. (3-フルオロベンジル) - (2-フェニル-キナゾリン-4-イル) - アミン

化合物番号 64. (2-フェニル-キナゾリン-4-イル) - [2- (3-トリフルオロメチル-フェニル) - エチル] - アミン

化合物番号 65. ベンゾ[1, 3]ジオキソール-5-イルメチル- (2-フェニル-キナゾリン-4-イル) - アミン 50

- 化合物番号 66. (2-フェニル-キナゾリン-4-イル) - (3-トリフルオロメチル-ベンジル) - アミン
- 化合物番号 67. (2-メトキシ-エチル) - (2-フェニル-キナゾリン-4-イル) - アミン
- 化合物番号 68. フェネチル - (2-フェニル-キナゾリン-4-イル) - アミン
- 化合物番号 69. フェニル - (2-フェニル-キナゾリン-4-イル) - アミン
- 化合物番号 70. (4-メトキシ-フェニル) - (2-フェニル-キナゾリン-4-イル) - アミン
- 化合物番号 71. (2-フェニル-キナゾリン-4-イル) - O-トルリル-アミン
- 化合物番号 72. (4-イソプロピル-フェニル) - (2-フェニル-キナゾリン-4-イル) - アミン 10
- 化合物番号 73. (2, 4-ジメチル-フェニル) - (2-フェニル-キナゾリン-4-イル) - アミン
- 化合物番号 74. (2-フェニル-キナゾリン-4-イル) - (4-ウンデシル-フェニル) - アミン
- 化合物番号 75. (4-エチル-フェニル) - (2-フェニル-キナゾリン-4-イル) - アミン
- 化合物番号 76. (4-フルオロフェニル) - (2-フェニル-キナゾリン-4-イル) - アミン
- 化合物番号 77. (2-メトキシ-フェニル) - (2-フェニル-キナゾリン-4-イル) - アミン 20
- 化合物番号 78. (2-フェニル-キナゾリン-4-イル) - (2, 4, 6-トリメチル-フェニル) - アミン
- 化合物番号 79. (4-ブチル-フェニル) - (2-フェニル-キナゾリン-4-イル) - アミン
- 化合物番号 80. (2-フェノキシ-フェニル) - (2-フェニル-キナゾリン-4-イル) - アミン
- 化合物番号 81. (3-フェノキシ-フェニル) - (2-フェニル-キナゾリン-4-イル) - アミン
- 化合物番号 82. (4-フェノキシ-フェニル) - (2-フェニル-キナゾリン-4-イル) - アミン 30
- 化合物番号 83. (3-ブロモフェニル) - (2-フェニル-キナゾリン-4-イル) - アミン
- 化合物番号 84. 2-メトキシ-5-(2-フェニル-キナゾリン-4-イルアミノ)フェノール
- 化合物番号 85. 5-(2-フェニル-キナゾリン-4-イルアミノ) - ペンタン-1-ol
- 化合物番号 86. ベンジル - (2-フェニル-キナゾリン-4-イル) - アミン
- 化合物番号 87. (1-フェニル-エチル) - (2-フェニル-キナゾリン-4-イル) - アミン
- 化合物番号 88. (4-クロロベンジル) - (2-フェニル-キナゾリン-4-イル) - アミン 40
- 化合物番号 89. (3, 4-ジクロロベンジル) - (2-フェニル-キナゾリン-4-イル) - アミン
- 化合物番号 90. (3-メトキシ-ベンジル) - (2-フェニル-キナゾリン-4-イル) - アミン
- 化合物番号 91. (2-メトキシ-ベンジル) - (2-フェニル-キナゾリン-4-イル) - アミン
- 化合物番号 92. (3, 5-ジメトキシ-ベンジル) - (2-フェニル-キナゾリン-4-イル) - アミン
- 化合物番号 93. (2, 3-ジメトキシ-ベンジル) - (2-フェニル-キナゾリン-4-イル) - アミン 50

ル) - アミン

化合物番号 94. (2-フルオロベンジル) - (2-フェニル-キナゾリン-4-イル) - アミン

化合物番号 95. シクロヘキシル- (2-フェニル-キナゾリン-4-イル) - アミン

化合物番号 96. Sec-ブチル- (2-フェニル-キナゾリン-4-イル) - アミン

化合物番号 97. アリル- (2-フェニル-キナゾリン-4-イル) - アミン

化合物番号 98. (2-フェニル-キナゾリン-4-イル) - (2-トリフルオロメチル-ベンジル) - アミン

化合物番号 99. ヘキサデシル- (2-フェニル-キナゾリン-4-イル) - アミン

化合物番号 100. (2-フェニル-キナゾリン-4-イル) - (2-ピロリジン-1-イル-エチル) - アミン

10

化合物番号 101. (2-フェニル-キナゾリン-4-イル) - (2-ピペリジン-1-イル-エチル) - アミン

化合物番号 102. (2-フェニル-キナゾリン-4-イル) - (2-ピリジン-2-イル-エチル) - アミン

化合物番号 103. [2- (3-フルオロ-フェニル) - エチル] - (2-フェニル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

化合物番号 104. (1-メトキシメチル-プロピル) - (2-フェニル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

化合物番号 105. (1-ベンジル-ピペリジノ-4-イル) - (2-フェニル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

20

化合物番号 106. (2-モルポリン-4-イル-エチル) - (2-フェニル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

化合物番号 107. [2- (3, 4-ジメトキシ-フェニル) - エチル] - (2-フェニル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

化合物番号 108. (2, 4-ジクロロ-ベンジル) - (2-フェニル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

化合物番号 109. (2-クロロ-ベンジル) - (2-フェニル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

化合物番号 110. シクロプロピル- (2-フェニル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

30

化合物番号 111. (2-フェニル-キナゾルリノ-4-イル) - ピリジン-3-イルメチル-アミン

化合物番号 112. 2- (2-フェニル-キナゾルリノ-4-イルアミノ) - プロパン-1-ol

化合物番号 113. 2-メトキシ-4- [(2-フェニル-キナゾルリノ-4-イルアミノ) - メチル] - フェノール

化合物番号 114. (2-フルオロ-エチル) - (2-フェニル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

化合物番号 115. (2, 3-ジクロロ-ベンジル) - (2-フェニル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

化合物番号 116. (3-ニトロ-ベンジル) - (2-フェニル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

40

化合物番号 117. (1-エチル-ピロリジノ-2-イルメチル) - (2-フェニル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

化合物番号 118. (3, 4-ジメトキシ-ベンジル) - (2-フェニル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

化合物番号 119. (2-フェニル-キナゾルリノ-4-イル) - (2-p-トルリル-エチル) - アミン

化合物番号 120. [2- (3-メトキシ-フェニル) - エチル] - (2-フェニル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

化合物番号 121. (1-エチル-プロピル) - (2-フェニル-キナゾルリノ-4-イル) - ア

50

ミン

化合物番号 1 2 2. [2- (2、5-ジメトキシ-フェニル) -エチル]- (2-フェニル-キナゾ
ルリノ-4-イル) -アミン

化合物番号 1 2 3. [2- (4-クロロ-フェニル) -エチル]- (2-フェニル-キナゾルリノ-4
-イル) -アミン

化合物番号 1 2 4. [2- (4-メトキシ-フェニル) -エチル]- (2-フェニル-キナゾルリノ
-4-イル) -アミン

化合物番号 1 2 5. (1、3-ジメチル-ブチル) - (2-フェニル-キナゾルリノ-4-イル) -
アミン

化合物番号 1 2 6. [2- (3-クロロ-フェニル) -エチル]- (2-フェニル-キナゾルリノ-4 10
-イル) -アミン

化合物番号 1 2 7. [2- (2、4-ジクロロ-フェニル) -エチル]- (2-フェニル-キナゾル
リノ-4-イル) -アミン

化合物番号 1 2 8. [2- (3、4-ジフルオロ-フェニル) -エチル]- (2-フェニル-キナゾ
ルリノ-4-イル) -アミン

化合物番号 1 2 9. (2-フェニル-キナゾルリノ-4-イル) - (3、4、5-トリメトキシ-ベ
ンジル) -アミン

化合物番号 1 3 0. (3-メチル-ブチル) - (2-フェニル-キナゾルリノ-4-イル) -アミ
ン

化合物番号 1 3 1. (2-シクロヘキサ-1-エニル-エチル) - (2-フェニル-キナゾルリノ 20
-4-イル) -アミン

化合物番号 1 3 2. シクロヘキシルメチル- (2-フェニル-キナゾルリノ-4-イル) -アミ
ン

化合物番号 1 3 3. (2、2-ジフェニル-エチル) - (2-フェニル-キナゾルリノ-4-イル
) -アミン

化合物番号 1 3 4. (2、4-ジフルオロベンジル) - (2-フェニル-キナゾルリノ-4-イル
) -アミン

化合物番号 1 3 5. (2、5-ジフルオロベンジル) - (2-フェニル-キナゾルリノ-4-イル
) -アミン

化合物番号 1 3 6. (3、3-ジフェニル-プロピル) - (2-フェニル-キナゾルリノ-4-イ 30
ル) -アミン

化合物番号 1 3 7. [2- (4-ブロモ-フェニル) -エチル]- (2-フェニル-キナゾルリノ-4
-イル) -アミン

化合物番号 1 3 8. ブチル-メチル- (2-フェニル-キナゾルリノ-4-イル) -アミン

化合物番号 1 3 9. (2-フェニル-キナゾルリノ-4-イル) - (4-トリプルオロメチル-ベ
ンジル) -アミン

化合物番号 1 4 0. [2- (2-フルオロ-フェニル) -エチル]- (2-フェニル-キナゾルリノ
-4-イル) -アミン

化合物番号 1 4 1. (2-フェニル-キナゾルリノ-4-イル) -ピリジン-4-イルメチル-ア 40
ミン

化合物番号 1 4 2. (2-フェニル-キナゾルリノ-4-イル) -ピリジン-2-イルメチル-ア
ミン

化合物番号 1 4 3. (2、3-ジメチル-シクロヘキシル) - (2-フェニル-キナゾルリノ-4
-イル) -アミン

化合物番号 1 4 4. (2、4-ジメトキシ-ベンジル) - (2-フェニル-キナゾルリノ-4-イ
ル) -アミン

化合物番号 1 4 5. (3-クロロ-ベンジル) - (2-フェニル-キナゾルリノ-4-イル) -ア
ミン

化合物番号 1 4 7. (2、5-ジメトキシ-ベンジル) - (2-フェニル-キナゾルリノ-4-イ 50
ル) -アミン

化合物番号 148. (4-プロモ-ベンジル) - (2-フェニル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

化合物番号 149. [2- (3, 4-ジクロロ-フェニル) -エチル]- (2-フェニル-キナゾルリノ-4-イル) -アミン

化合物番号 150. 1-[3- (2-フェニル-キナゾルリノ-4-イルアミノ) -プロピル]-ピロリジノ-2-one

化合物番号 151. [2- (2-クロロ-フェニル) -エチル]- (2-フェニル-キナゾルリノ-4-イル) -アミン

化合物番号 152. 2-[2- (2-フェニル-キナゾルリノ-4-イルアミノ) -エチル]-フェノール

化合物番号 153. (3-プロモ-ベンジル) - (2-フェニル-キナゾルリノ-4-イル) -アミン

化合物番号 154. (2, 6-ジメトキシ-ベンジル) - (2-フェニル-キナゾルリノ-4-イル) -アミン

化合物番号 155. (2-プロモ-ベンジル) - (2-フェニル-キナゾルリノ-4-イル) -アミン

化合物番号 156. (3-モルポリン-4-イル-プロピル) - (2-フェニル-キナゾルリノ-4-イル) -アミン

化合物番号 157. 2-[ブチル- (2-フェニル-キナゾルリノ-4-イル) -アミノ]-エチルアルコール

化合物番号 158. [2- (4-メチル-ピペラジン-1-イル) -エチル]- (2-フェニル-キナゾルリノ-4-イル) -アミン

化合物番号 159. シクロペンチル-メチル- (2-フェニル-キナゾルリノ-4-イル) -アミン

化合物番号 160. (2-フェニル-キナゾルリノ-4-イル) - (2-ピペラジン-1-イル-エチル) -アミン

化合物番号 161. 0- (4-ニトロ-ベンジル) -N- (2-フェニル-キナゾルリノ-4-イル) -ヒドロキシルアミン

化合物番号 162. (4-クロロ-フェニル) - (2-フェニル-キナゾルリノ-4-イル) -アミン

化合物番号 163. ベンジル- (2-メチル-キナゾルリノ-4-イル) -アミン

化合物番号 164. (3-メトキシ-ベンジル) - (2-メチル-キナゾルリノ-4-イル) -アミン

化合物番号 165. (4-メトキシ-ベンジル) - (2-メチル-キナゾルリノ-4-イル) -アミン

化合物番号 166. (2-メチル-キナゾルリノ-4-イル) - (3-トリクロロメチル-ベンジル) -アミン

化合物番号 167. (2-メチル-キナゾルリノ-4-イル) -フェネチル-アミン

化合物番号 168. (2-メチル-キナゾルリノ-4-イル) - (4-フェニル-ブチル) -アミン

化合物番号 169. (2-メチル-キナゾルリノ-4-イル) -ナフタリン-1-イルメチル-アミン

化合物番号 170. ベンゾ[1, 3]ジオキソール-5-イルメチル- (2-メチル-キナゾルリノ-4-イル) -アミン

化合物番号 171. (3-フルオロベンジル) - (2-メチル-キナゾルリノ-4-イル) -アミン

化合物番号 172. [2- (3-フルオロ-フェニル) -エチル]- (2-メチル-キナゾルリノ-4-イル) -アミン

化合物番号 173. 2-[2- (2-メチル-キナゾルリノ-4-イルアミノ) -エトキシ]-エチルアルコール

10

20

30

40

50

- 化合物番号 174. 2-(2-メチル-キナゾリノ-4-イルアミノ)-エチルアルコール
化合物番号 175. ベンジル-(2-イソプロピル-キナゾリノ-4-イル)-アミン
化合物番号 176. (2-イソプロピル-キナゾリノ-4-イル)-(3-メトキシ-ベンジル)-アミン
化合物番号 177. (2-イソプロピル-キナゾリノ-4-イル)-(4-メトキシ-ベンジル)-アミン
化合物番号 178. (2-イソプロピル-キナゾリノ-4-イル)-(3-トリクロロメチル-ベンジル)-アミン
化合物番号 179. (2-イソプロピル-キナゾリノ-4-イル)-フェネチル-アミン
化合物番号 180. (2-イソプロピル-キナゾリノ-4-イル)-(4-フェニル-ブチル)-アミン 10
化合物番号 181. (2-イソプロピル-キナゾリノ-4-イル)-ナフタリン-1-イルメチル-アミン
化合物番号 182. ベンゾ[1,3]ジオキソール-5-イルメチル-(2-イソプロピル-キナゾリノ-4-イル)-アミン
化合物番号 183. (3-フルオロベンジル)-(2-イソプロピル-キナゾリノ-4-イル)-アミン
化合物番号 184. [2-(3-フルオロ-フェニル)-エチル]-(2-イソプロピル-キナゾリノ-4-イル)-アミン
化合物番号 185. 2-[2-(2-イソプロピル-キナゾリノ-4-イルアミノ)-エトキシ]-エチルアルコール 20
化合物番号 186. 2-(2-イソプロピル-キナゾリノ-4-イルアミノ)-エチルアルコール
化合物番号 187. ベンジル-(2-tert-ブチル-キナゾリノ-4-イル)-アミン
化合物番号 188. (2-tert-ブチル-キナゾリノ-4-イル)-(3-メトキシ-ベンジル)-アミン
化合物番号 189. (2-tert-ブチル-キナゾリノ-4-イル)-(4-メトキシ-ベンジル)-アミン
化合物番号 190. (2-tert-ブチル-キナゾリノ-4-イル)-(3-トリクロロメチル-ベンジル)-アミン 30
化合物番号 191. (2-tert-ブチル-キナゾリノ-4-イル)-フェネチル-アミン
化合物番号 192. (2-tert-ブチル-キナゾリノ-4-イル)-(4-フェニル-ブチル)-アミン
化合物番号 193. (2-tert-ブチル-キナゾリノ-4-イル)-ナフタリン-1-イルメチル-アミン
化合物番号 194. ベンゾ[1,3]ジオキソール-5-イルメチル-(2-tert-ブチル-キナゾリノ-4-イル)-アミン
化合物番号 195. (2-tert-ブチル-キナゾリノ-4-イル)-(3-フルオロベンジル)-アミン
化合物番号 196. (2-tert-ブチル-キナゾリノ-4-イル)-[2-(3-フルオロ-フェニル)-エチル]-アミン 40
化合物番号 197. 2-[2-(2-tert-ブチル-キナゾリノ-4-イルアミノ)-エトキシ]-エチルアルコール
化合物番号 198. 2-(2-tert-ブチル-キナゾリノ-4-イルアミノ)-エチルアルコール
化合物番号 199. ベンジル-(2-シクロヘキシル-キナゾリノ-4-イル)-アミン
化合物番号 200. (2-シクロヘキシル-キナゾリノ-4-イル)-(3-メトキシ-ベンジル)-アミン
化合物番号 201. (2-シクロヘキシル-キナゾリノ-4-イル)-(4-メトキシ-ベンジル)-アミン 50

- 化合物番号 202. (2-シクロヘキシル-キナゾリノ-4-イル) - (3-トリクロロメチル-ベンジル) - アミン
- 化合物番号 203. (2-シクロヘキシル-キナゾリノ-4-イル) - フェネチル-アミン
- 化合物番号 204. (2-シクロヘキシル-キナゾリノ-4-イル) - (4-フェニル-ブチル) - アミン
- 化合物番号 205. (2-シクロヘキシル-キナゾリノ-4-イル) - ナフタリン-1-イルメチル-アミン
- 化合物番号 206. ベンゾ[1,3]ジオキソール-5-イルメチル- (2-シクロヘキシル-キナゾリノ-4-イル) - アミン
- 化合物番号 207. (2-シクロヘキシル-キナゾリノ-4-イル) - (3-フルオロベンジル) - アミン 10
- 化合物番号 208. (2-シクロヘキシル-キナゾリノ-4-イル) - [2- (3-フルオロ-フェニル) -エチル] - アミン
- 化合物番号 209. 2-[2- (2-シクロヘキシル-キナゾリノ-4-イルアミノ) -エトキシ] -エチルアルコール
- 化合物番号 210. 2- (2-シクロヘキシル-キナゾリノ-4-イルアミノ) -エチルアルコール
- 化合物番号 211. ベンジル- (2-ベンジル-キナゾリノ-4-イル) - アミン
- 化合物番号 212. (2-ベンジル-キナゾリノ-4-イル) - (3-メトキシ-ベンジル) - アミン 20
- 化合物番号 213. (2-ベンジル-キナゾリノ-4-イル) - (4-メトキシ-ベンジル) - アミン
- 化合物番号 214. (2-ベンジル-キナゾリノ-4-イル) - (3-トリクロロメチル-ベンジル) - アミン
- 化合物番号 215. (2-ベンジル-キナゾリノ-4-イル) - フェネチル-アミン
- 化合物番号 216. (2-ベンジル-キナゾリノ-4-イル) - (4-フェニル-ブチル) - アミン
- 化合物番号 217. (2-ベンジル-キナゾリノ-4-イル) - ナフタリン-1-イルメチル-アミン
- 化合物番号 218. ベンゾ[1,3]ジオキソール-5-イルメチル- (2-ベンジル-キナゾリノ-4-イル) - アミン 30
- 化合物番号 219. (2-ベンジル-キナゾリノ-4-イル) - (3-フルオロベンジル) - アミン
- 化合物番号 220. (2-ベンジル-キナゾリノ-4-イル) - [2- (3-フルオロ-フェニル) -エチル] - アミン
- 化合物番号 221. 2-[2- (2-ベンジル-キナゾリノ-4-イルアミノ) -エトキシ] -エチルアルコール
- 化合物番号 222. 2- (2-ベンジル-キナゾリノ-4-イルアミノ) -エチルアルコール
- 化合物番号 223. ベンジル- (2-ピリジン-2-イル-キナゾリノ-4-イル) - アミン
- 化合物番号 224. (3-メトキシ-ベンジル) - (2-ピリジン-2-イル-キナゾリノ-4-イル) - アミン 40
- 化合物番号 225. (4-メトキシ-ベンジル) - (2-ピリジン-2-イル-キナゾリノ-4-イル) - アミン
- 化合物番号 226. (2-ピリジン-2-イル-キナゾリノ-4-イル) - (3-トリクロロメチル-ベンジル) - アミン
- 化合物番号 227. フェネチル- (2-ピリジン-2-イル-キナゾリノ-4-イル) - アミン
- 化合物番号 228. (4-フェニル-ブチル) - (2-ピリジン-2-イル-キナゾリノ-4-イル) - アミン
- 化合物番号 229. ナフタリン-1-イルメチル- (2-ピリジン-2-イル-キナゾリノ-4-イル) - アミン 50

化合物番号 230. ベンゾ[1,3]ジオキソール-5-イルメチル- (2-ピリジン-2-イル-キナゾルリノ-4-イル) -アミン

化合物番号 231. (3-フルオロベンジル) - (2-ピリジン-2-イル-キナゾルリノ-4-イル) -アミン

化合物番号 232. [2- (3-フルオロ-フェニル) -エチル]- (2-ピリジン-2-イル-キナゾルリノ-4-イル) -アミン

化合物番号 233. 2-[2- (2-ピリジン-2-イル-キナゾルリノ-4-イルアミノ) -エトキシ]-エチルアルコール

化合物番号 234. 2- (2-ピリジン-2-イル-キナゾルリノ-4-イルアミノ) -エチルアルコール

化合物番号 235. ベンジル- (2-ピリジン-3-イル-キナゾルリノ-4-イル) -アミン

化合物番号 236. (3-メトキシ-ベンジル) - (2-ピリジン-3-イル-キナゾルリノ-4-イル) -アミン

化合物番号 237. (4-メトキシ-ベンジル) - (2-ピリジン-3-イル-キナゾルリノ-4-イル) -アミン

化合物番号 238. (2-ピリジン-3-イル-キナゾルリノ-4-イル) - (3-トリクロロメチル-ベンジル) -アミン

化合物番号 239. フェネチル- (2-ピリジン-3-イル-キナゾルリノ-4-イル) -アミン

化合物番号 240. (4-フェニル-ブチル) - (2-ピリジン-3-イル-キナゾルリノ-4-イル) -アミン

化合物番号 241. ナフタリン-1-イルメチル- (2-ピリジン-3-イル-キナゾルリノ-4-イル) -アミン

化合物番号 242. ベンゾ[1,3]ジオキソール-5-イルメチル- (2-ピリジン-3-イル-キナゾルリノ-4-イル) -アミン

化合物番号 243. (3-フルオロベンジル) - (2-ピリジン-3-イル-キナゾルリノ-4-イル) -アミン

化合物番号 244. [2- (3-フルオロ-フェニル) -エチル]- (2-ピリジン-3-イル-キナゾルリノ-4-イル) -アミン

化合物番号 245. 2-[2- (2-ピリジン-3-イル-キナゾルリノ-4-イルアミノ) -エトキシ]-エチルアルコール

化合物番号 246. 2- (2-ピリジン-3-イル-キナゾルリノ-4-イルアミノ) -エチルアルコール

化合物番号 247. ベンジル- (2-ピリジン-4-イル-キナゾルリノ-4-イル) -アミン

化合物番号 248. (3-メトキシ-ベンジル) - (2-ピリジン-4-イル-キナゾルリノ-4-イル) -アミン

化合物番号 249. (4-メトキシ-ベンジル) - (2-ピリジン-4-イル-キナゾルリノ-4-イル) -アミン

化合物番号 250. (2-ピリジン-4-イル-キナゾルリノ-4-イル) - (3-トリクロロメチル-ベンジル) -アミン

化合物番号 251. フェネチル- (2-ピリジン-4-イル-キナゾルリノ-4-イル) -アミン

化合物番号 252. (4-フェニル-ブチル) - (2-ピリジン-4-イル-キナゾルリノ-4-イル) -アミン

化合物番号 253. ナフタリン-1-イルメチル- (2-ピリジン-4-イル-キナゾルリノ-4-イル) -アミン

化合物番号 254. ベンゾ[1,3]ジオキソール-5-イルメチル- (2-ピリジン-4-イル-キナゾルリノ-4-イル) -アミン

化合物番号 255. (3-フルオロベンジル) - (2-ピリジン-4-イル-キナゾルリノ-4-イル) -アミン

化合物番号 256. [2- (3-フルオロ-フェニル) -エチル]- (2-ピリジン-4-イル-キナゾルリノ-4-イル) -アミン

10

20

30

40

50

化合物番号 257. 2-[2-(2-ピリジン-4-イル-キナゾルリノ-4-イルアミノ)-エトキシ]-エチルアルコール

化合物番号 258. 2-(2-ピリジン-4-イル-キナゾルリノ-4-イルアミノ)-エチルアルコール

化合物番号 259. ベンジル-[2-(4-クロロ-フェニル)-キナゾルリノ-4-イル]-アミン

化合物番号 260. [2-(4-クロロ-フェニル)-キナゾルリノ-4-イル]-(3-メトキシ-ベンジル)-アミン

化合物番号 261. [2-(4-クロロ-フェニル)-キナゾルリノ-4-イル]-(4-メトキシ-ベンジル)-アミン

化合物番号 262. [2-(4-クロロ-フェニル)-キナゾルリノ-4-イル]-(3-トリクロロメチル-ベンジル)-アミン

化合物番号 263. [2-(4-クロロ-フェニル)-キナゾルリノ-4-イル]-フェネチル-アミン

化合物番号 264. [2-(4-クロロ-フェニル)-キナゾルリノ-4-イル]-(4-フェニル-ブチル)-アミン

化合物番号 265. [2-(4-クロロ-フェニル)-キナゾルリノ-4-イル]-ナフタリン-1-イルメチル-アミン

化合物番号 266. ベンゾ[1,3]ジオキソール-5-イルメチル-[2-(4-クロロ-フェニル)-キナゾルリノ-4-イル]-アミン

化合物番号 267. [2-(4-クロロ-フェニル)-キナゾルリノ-4-イル]-(3-フルオロベンジル)-アミン

化合物番号 268. [2-(4-クロロ-フェニル)-キナゾルリノ-4-イル]-[2-(3-フルオロ-フェニル)-エチル]-アミン

化合物番号 269. 2-{2-[2-(4-クロロ-フェニル)-キナゾルリノ-4-イルアミノ]-エトキシ}-エチルアルコール

化合物番号 270. 2-[2-(4-クロロ-フェニル)-キナゾルリノ-4-イルアミノ]-エチルアルコール

化合物番号 271. (2,4-ジメトキシ-ベンジル)-(2-イソプロピル-キナゾルリノ-4-イル)-アミン

化合物番号 272. (2-ベンジル-キナゾルリノ-4-イル)-(2,4-ジメトキシ-ベンジル)-アミン

化合物番号 273. 4-(2,4-ジメトキシ-ベンジルオキシ)-2-フェニル-キナゾルリノ

化合物番号 274. 4-(2,4-ジメトキシ-ベンジルスルファニル)-2-フェニル-キナゾルリノ

化合物番号 275. (2-メトキシ-ベンジル)-(2-ピロリジノ-1-イル-キナゾルリノ-4-イル)-アミン

化合物番号 278. (2-メトキシ-ベンジル)-(2-ピペラジノ-1-イル-キナゾルリノ-4-イル)-アミン

化合物番号 277. (2-メトキシ-ベンジル)-(2-モルボリン-4-イル-キナゾルリノ-4-イル)-アミン

化合物番号 278. (2-メトキシ-ベンジル)-[2-(4-メチル-ピペラジノ-1-イル)-キナゾルリノ-4-イル]-アミン

化合物番号 279. (3-メトキシ-ベンジル)-(2-ピロリジノ-1-イル-キナゾルリノ-4-イル)-アミン

化合物番号 280. (3-メトキシ-ベンジル)-(2-ピペラジノ-1-イル-キナゾルリノ-4-イル)-アミン

化合物番号 281. (3-メトキシ-ベンジル)-(2-モルボリン-4-イル-キナゾルリノ-4-イル)-アミン

10

20

30

40

50

化合物番号 282. (3-メトキシ-ベンジル) - [2- (4-メチル-ピペラジン-1-イル) - キナゾルリノ-4-イル] - アミン

化合物番号 283. (4-メトキシ-ベンジル) - (2-ピロリジノ-1-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

化合物番号 284. (4-メトキシ-ベンジル) - (2-ピペラジノ-1-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

化合物番号 285. (4-メトキシ-ベンジル) - (2-モルボリン-4-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

化合物番号 286. (4-メトキシ-ベンジル) - [2- (4-メチル-ピペラジン-1-イル) - キナゾルリノ-4-イル] - アミン

化合物番号 287. (2, 3-ジメトキシ-ベンジル) - (2-ピロリジノ-1-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

化合物番号 288. (2, 3-ジメトキシ-ベンジル) - (2-ピペラジノ-1-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

化合物番号 289. (2, 3-ジメトキシ-ベンジル) - (2-モルボリン-4-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

化合物番号 290. (2, 3-ジメトキシ-ベンジル) - [2- (4-メチル-ピペラジン-1-イル) - キナゾルリノ-4-イル] - アミン

化合物番号 291. (2, 4-ジメトキシ-ベンジル) - (2-ピロリジノ-1-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

化合物番号 292. (2, 4-ジメトキシ-ベンジル) - (2-ピペラジノ-1-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

化合物番号 293. (2, 4-ジメトキシ-ベンジル) - (2-モルボリン-4-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

化合物番号 294. (2, 4-ジメトキシ-ベンジル) - [2- (4-メチル-ピペラジン-1-イル) - キナゾルリノ-4-イル] - アミン

化合物番号 295. (2, 5-ジメトキシ-ベンジル) - (2-ピロリジノ-1-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

化合物番号 296. (2, 5-ジメトキシ-ベンジル) - (2-ピペラジノ-1-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

化合物番号 297. (2, 5-ジメトキシ-ベンジル) - (2-モルボリン-4-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

化合物番号 298. (2, 5-ジメトキシ-ベンジル) - [2- (4-メチル-ピペラジン-1-イル) - キナゾルリノ-4-イル] - アミン

化合物番号 299. (3, 4-ジメトキシ-ベンジル) - (2-ピロリジノ-1-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

化合物番号 300. (3, 4-ジメトキシ-ベンジル) - (2-ピペラジノ-1-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

化合物番号 301. (3, 4-ジメトキシ-ベンジル) - (2-モルボリン-4-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

化合物番号 302. (3, 4-ジメトキシ-ベンジル) - [2- (4-メチル-ピペラジン-1-イル) - キナゾルリノ-4-イル] - アミン

化合物番号 303. (3, 5-ジメトキシ-ベンジル) - (2-ピロリジノ-1-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

化合物番号 304. (3, 5-ジメトキシ-ベンジル) - (2-ピペラジノ-1-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

化合物番号 305. (3, 5-ジメトキシ-ベンジル) - (2-モルボリン-4-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

化合物番号 306. (3, 5-ジメトキシ-ベンジル) - [2- (4-メチル-ピペラジン-1-イル) - キナゾルリノ-4-イル] - アミン

10

20

30

40

50

化合物番号 307. ベンゾ[1, 3]ジオキソール-5-イルメチル- (2-ピロリジノ-1-イル-キナゾルリノ-4-イル) -アミン

化合物番号 308. ベンゾ[1, 3]ジオキソール-5-イルメチル- (2-ピペラジノ-1-イル-キナゾルリノ-4-イル) -アミン

化合物番号 309. ベンゾ[1, 3]ジオキソール-5-イルメチル- (2-モルポリン-4-イル-キナゾルリノ-4-イル) -アミン

化合物番号 310. ベンゾ[1, 3]ジオキソール-5-イルメチル-[2- (4-メチル-ピペラジン-1-イル) -キナゾルリノ-4-イル]-アミン

化合物番号 311. (2-ピロリジノ-1-イル-キナゾルリノ-4-イル) - (3, 4, 5-トリメトキシ-ベンジル) -アミン

化合物番号 312. (2-ピペラジノ-1-イル-キナゾルリノ-4-イル) - (3, 4, 5-トリメトキシ-ベンジル) -アミン

化合物番号 313. (2-モルポリン-4-イル-キナゾルリノ-4-イル) - (3, 4, 5-トリメトキシ-ベンジル) -アミン

化合物番号 314. [2- (4-メチル-ピペラジン-1-イル) -キナゾルリノ-4-イル]- (3, 4, 5-トリメトキシ-ベンジル) -アミン

化合物番号 315. (2-ピロリジノ-1-イル-キナゾルリノ-4-イル) - (2, 4, 6-トリメトキシ-ベンジル) -アミン

化合物番号 316. (2-ピペラジノ-1-イル-キナゾルリノ-4-イル) - (2, 4, 6-トリメトキシ-ベンジル) -アミン

化合物番号 317. (2-モルポリン-4-イル-キナゾルリノ-4-イル) - (2, 4, 6-トリメトキシ-ベンジル) -アミン

化合物番号 318. [2- (4-メチル-ピペラジン-1-イル) -キナゾルリノ-4-イル]- (2, 4, 6-トリメトキシ-ベンジル) -アミン

化合物番号 319. (2, 4-ジメトキシ-ベンジル) - (2-エトキシ-キナゾルリノ-4-イル) -アミン

化合物番号 320. ベンゾ[1, 3]ジオキソール-5-イルメチル- (2-エトキシ-キナゾルリノ-4-イル) -アミン

化合物番号 321. (2-イソプロピル-キナゾルリノ-4-イル) - (2-メトキシ-ベンジル) -アミン

化合物番号 322. (2, 3-ジメトキシ-ベンジル) - (2-イソプロピル-キナゾルリノ-4-イル) -アミン

化合物番号 323. (3, 5-ジメトキシ-ベンジル) - (2-イソプロピル-キナゾルリノ-4-イル) -アミン

化合物番号 324. (3, 4-ジメトキシ-ベンジル) - (2-イソプロピル-キナゾルリノ-4-イル) -アミン

化合物番号 325. (2-イソプロピル-キナゾルリノ-4-イル) - (3, 4, 5-トリメトキシ-ベンジル) -アミン

化合物番号 326. (2, 5-ジメトキシ-ベンジル) - (2-イソプロピル-キナゾルリノ-4-イル) -アミン

化合物番号 327. (2-イソプロピル-キナゾルリノ-4-イル) - (2, 4, 6-トリメトキシ-ベンジル) -アミン

化合物番号 328. (2-ベンジル-キナゾルリノ-4-イル) - (2-メトキシ-ベンジル) -アミン

化合物番号 329. (2-ベンジル-キナゾルリノ-4-イル) - (2, 3-ジメトキシ-ベンジル) -アミン

化合物番号 330. (2-ベンジル-キナゾルリノ-4-イル) - (3, 5-ジメトキシ-ベンジル) -アミン

化合物番号 331. (2-ベンジル-キナゾルリノ-4-イル) - (3, 4-ジメトキシ-ベンジル) -アミン

10

20

30

40

50

化合物番号 3 3 2. (2-ベンジル-キナゾルリノ-4-イル) - (3, 4, 5-トリメトキシ-ベンジル) - アミン

化合物番号 3 3 3. (2-ベンジル-キナゾルリノ-4-イル) - (2, 4-ジメトキシ-ベンジル) - アミン

化合物番号 3 3 4. (2-ベンジル-キナゾルリノ-4-イル) - (2, 5-ジメトキシ-ベンジル) - アミン

化合物番号 3 3 5. (2-ベンジル-キナゾルリノ-4-イル) - (2, 4, 6-トリメトキシ-ベンジル) - アミン

化合物番号 3 3 6. (2-フェニル-キナゾルリノ-4-イル) - (3, 4, 5-トリメトキシ-ベンジル) - アミン

化合物番号 3 3 7. (2-フェニル-キナゾルリノ-4-イル) - (2, 4, 6-トリメトキシ-ベンジル) - アミン

化合物番号 3 3 8. (2-フラノ-2-イル-キナゾルリノ-4-イル) - (2-メトキシ-ベンジル) - アミン

化合物番号 3 3 9. (2-フラノ-2-イル-キナゾルリノ-4-イル) - (3-メトキシ-ベンジル) - アミン

化合物番号 3 4 0. (2-フラノ-2-イル-キナゾルリノ-4-イル) - (4-メトキシ-ベンジル) - アミン

化合物番号 3 4 1. ベンゾ[1, 3]ジオキソール-5-イルメチル- (2-フラノ-2-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

化合物番号 3 4 2. (2, 3-ジメトキシ-ベンジル) - (2-フラノ-2-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

化合物番号 3 4 3. (3, 5-ジメトキシ-ベンジル) - (2-フラノ-2-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

化合物番号 3 4 4. (3, 4-ジメトキシ-ベンジル) - (2-フラノ-2-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

化合物番号 3 4 5. (2-フラノ-2-イル-キナゾルリノ-4-イル) - (3, 4, 5-トリメトキシ-ベンジル) - アミン

化合物番号 3 4 6. (2, 4-ジメトキシ-ベンジル) - (2-フラノ-2-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

化合物番号 3 4 7. (2, 5-ジメトキシ-ベンジル) - (2-フラノ-2-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

化合物番号 3 4 8. (2-フラノ-2-イル-キナゾルリノ-4-イル) - (2, 4, 6-トリメトキシ-ベンジル) - アミン

化合物番号 3 4 9. (2-メトキシ-ベンジル) - (2-チオフェニル-2-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

化合物番号 3 5 0. (3-メトキシ-ベンジル) - (2-チオフェニル-2-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

化合物番号 3 5 1. (4-メトキシ-ベンジル) - (2-チオフェニル-2-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

化合物番号 3 5 2. ベンゾ[1, 3]ジオキソール-5-イルメチル- (2-チオフェニル-2-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

化合物番号 3 5 3. (2, 3-ジメトキシ-ベンジル) - (2-チオフェニル-2-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

化合物番号 3 5 4. (3, 5-ジメトキシ-ベンジル) - (2-チオフェニル-2-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

化合物番号 3 5 5. (3, 4-ジメトキシ-ベンジル) - (2-チオフェニル-2-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

化合物番号 3 5 6. (2-チオフェニル-2-イル-キナゾルリノ-4-イル) - (3, 4, 5-トリメトキシ-ベンジル) - アミン

10

20

30

40

50

化合物番号 357. (2, 4-ジメトキシ-ベンジル) - (2-チオフェニル-2-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

化合物番号 358. (2, 5-ジメトキシ-ベンジル) - (2-チオフェニル-2-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

化合物番号 359. (2-チオフェニル-2-イル-キナゾルリノ-4-イル) - (2, 4, 6-トリメトキシ-ベンジル) - アミン

化合物番号 360. (2-メトキシ-ベンジル) - [2- (メトキシ-フェニル-メチル) - キナゾルリノ-4-イル] - アミン

化合物番号 361. (3-メトキシ-ベンジル) - [2- (メトキシ-フェニル-メチル) - キナゾルリノ-4-イル] - アミン

化合物番号 362. (4-メトキシ-ベンジル) - [2- (メトキシ-フェニル-メチル) - キナゾルリノ-4-イル] - アミン

化合物番号 363. ベンゾ[1, 3]ジオキソール-5-イルメチル-[2- (メトキシ-フェニル-メチル) - キナゾルリノ-4-イル] - アミン

化合物番号 364. (2, 3-ジメトキシ-ベンジル) - [2- (メトキシ-フェニル-メチル) - キナゾルリノ-4-イル] - アミン

化合物番号 365. (3, 5-ジメトキシ-ベンジル) - [2- (メトキシ-フェニル-メチル) - キナゾルリノ-4-イル] - アミン

化合物番号 366. (3, 4-ジメトキシ-ベンジル) - [2- (メトキシ-フェニル-メチル) - キナゾルリノ-4-イル] - アミン

化合物番号 367. [2- (メトキシ-フェニル-メチル) - キナゾルリノ-4-イル] - (3, 4, 5-トリメトキシ-ベンジル) - アミン

化合物番号 368. (2, 4-ジメトキシ-ベンジル) - [2- (メトキシ-フェニル-メチル) - キナゾルリノ-4-イル] - アミン

化合物番号 369. (2, 5-ジメトキシ-ベンジル) - [2- (メトキシ-フェニル-メチル) - キナゾルリノ-4-イル] - アミン

化合物番号 370. [2- (メトキシ-フェニル-メチル) - キナゾルリノ-4-イル] - (2, 4, 6-トリメトキシ-ベンジル) - アミン

化合物番号 371. (2-メトキシ-ベンジル) - [2- (1-フェニル-エチル) - キナゾルリノ-4-イル] - アミン

化合物番号 372. (3-メトキシ-ベンジル) - [2- (1-フェニル-エチル) - キナゾルリノ-4-イル] - アミン

化合物番号 373. (4-メトキシ-ベンジル) - [2- (1-フェニル-エチル) - キナゾルリノ-4-イル] - アミン

化合物番号 374. ベンゾ[1, 3]ジオキソール-5-イルメチル-[2- (1-フェニル-エチル) - キナゾルリノ-4-イル] - アミン

化合物番号 375. (2, 3-ジメトキシ-ベンジル) - [2- (1-フェニル-エチル) - キナゾルリノ-4-イル] - アミン

化合物番号 376. (3, 5-ジメトキシ-ベンジル) - [2- (1-フェニル-エチル) - キナゾルリノ-4-イル] - アミン

化合物番号 377. (3, 4-ジメトキシ-ベンジル) - [2- (1-フェニル-エチル) - キナゾルリノ-4-イル] - アミン

化合物番号 378. [2- (1-フェニル-エチル) - キナゾルリノ-4-イル] - (3, 4, 5-トリメトキシ-ベンジル) - アミン

化合物番号 379. (2, 4-ジメトキシ-ベンジル) - [2- (1-フェニル-エチル) - キナゾルリノ-4-イル] - アミン

化合物番号 380. (2, 5-ジメトキシ-ベンジル) - [2- (1-フェニル-エチル) - キナゾルリノ-4-イル] - アミン

化合物番号 381. [2- (1-フェニル-エチル) - キナゾルリノ-4-イル] - (2, 4, 6-トリメトキシ-ベンジル) - アミン

10

20

30

40

50

化合物番号 382. (2-シクロプロピル-キナゾリノ-4-イル) - (2-メトキシ-ベンジル) - アミン

化合物番号 383. (2-シクロプロピル-キナゾリノ-4-イル) - (3-メトキシ-ベンジル) - アミン

化合物番号 384. (2-シクロプロピル-キナゾリノ-4-イル) - (4-メトキシ-ベンジル) - アミン

化合物番号 385. ベンゾ[1,3]ジオキサール-5-イルメチル- (2-シクロプロピル-キナゾリノ-4-イル) - アミン

化合物番号 386. (2-シクロプロピル-キナゾリノ-4-イル) - (2,3-ジメトキシ-ベンジル) - アミン

化合物番号 387. (2-シクロプロピル-キナゾリノ-4-イル) - (3,5-ジメトキシ-ベンジル) - アミン

化合物番号 388. (2-シクロプロピル-キナゾリノ-4-イル) - (3,4-ジメトキシ-ベンジル) - アミン

化合物番号 389. (2-シクロプロピル-キナゾリノ-4-イル) - (3,4,5-トリメトキシ-ベンジル) - アミン

化合物番号 390. (2-シクロプロピル-キナゾリノ-4-イル) - (2,4-ジメトキシ-ベンジル) - アミン

化合物番号 391. (2-シクロプロピル-キナゾリノ-4-イル) - (2,5-ジメトキシ-ベンジル) - アミン

化合物番号 392. (2-シクロプロピル-キナゾリノ-4-イル) - (2,4,6-トリメトキシ-ベンジル) - アミン

化合物番号 393. (2-メトキシ-ベンジル) - (2-プロピル-キナゾリノ-4-イル) - アミン

化合物番号 394. (3-メトキシ-ベンジル) - (2-プロピル-キナゾリノ-4-イル) - アミン

化合物番号 395. (4-メトキシ-ベンジル) - (2-プロピル-キナゾリノ-4-イル) - アミン

化合物番号 396. ベンゾ[1,3]ジオキサール-5-イルメチル- (2-プロピル-キナゾリノ-4-イル) - アミン

化合物番号 397. (2,3-ジメトキシ-ベンジル) - (2-プロピル-キナゾリノ-4-イル) - アミン

化合物番号 398. (3,5-ジメトキシ-ベンジル) - (2-プロピル-キナゾリノ-4-イル) - アミン

化合物番号 399. (3,4-ジメトキシ-ベンジル) - (2-プロピル-キナゾリノ-4-イル) - アミン

化合物番号 400. (2-プロピル-キナゾリノ-4-イル) - (3,4,5-トリメトキシ-ベンジル) - アミン

化合物番号 401. (2,4-ジメトキシ-ベンジル) - (2-プロピル-キナゾリノ-4-イル) - アミン

化合物番号 402. (2,5-ジメトキシ-ベンジル) - (2-プロピル-キナゾリノ-4-イル) - アミン

化合物番号 403. (2-プロピル-キナゾリノ-4-イル) - (2,4,6-トリメトキシ-ベンジル) - アミン

化合物番号 404. (2-メトキシ-ベンジル) - キナゾリノ-4-イル-アミン

化合物番号 405. (3-メトキシ-ベンジル) - キナゾリノ-4-イル-アミン

化合物番号 406. (4-メトキシ-ベンジル) - キナゾリノ-4-イル-アミン

化合物番号 407. ベンゾ[1,3]ジオキサール-5-イルメチル-キナゾリノ-4-イル-アミン

化合物番号 408. (2,3-ジメトキシ-ベンジル) - キナゾリノ-4-イル-アミン

10

20

30

40

50

化合物番号 409. (3, 5-ジメトキシ-ベンジル) -キナゾルリノ-4-イル-アミン

化合物番号 410. (3, 4-ジメトキシ-ベンジル) -キナゾルリノ-4-イル-アミン

化合物番号 411. キナゾルリノ-4-イル- (3, 4, 5-トリメトキシ-ベンジル) -アミン

化合物番号 412. (2, 4-ジメトキシ-ベンジル) -キナゾルリノ-4-イル-アミン

化合物番号 413. (2, 5-ジメトキシ-ベンジル) -キナゾルリノ-4-イル-アミン

化合物番号 414. キナゾルリノ-4-イル- (2, 4, 6-トリメトキシ-ベンジル) -アミン

化合物番号 415. 4-ベンジルオキシ-2-イソプロピル-キナゾルリノ

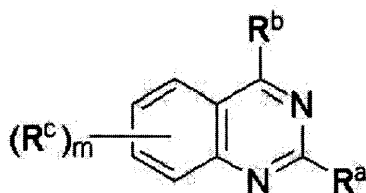
化合物番号 416. 4-ベンジルスルファニル-2-イソプロピル-キナゾルリノ

【請求項 5】

下記の化学式1で表示されるキナゾリン誘導体、これの薬剤学的に許容可能な塩、又は
これのプロドラッグを含むことを特徴とする糖尿又は肥満の治療及び予防用組成物。

10

〔化学式 1〕



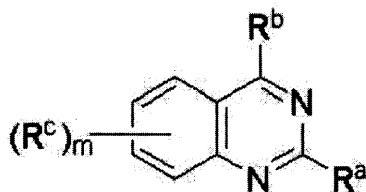
20

前記化学式 1 で、 R^a 、 R^b 、 R^c 、及び m はそれぞれ請求項 1 で定義したものである。

【請求項 6】

下記の化学式 1 で表示されるキナゾリン誘導体、これの薬剤学的に許容可能な塩、又
はこれのプロドラッグを含むことを特徴とする糖尿治療及び予防剤。

〔化学式 1〕



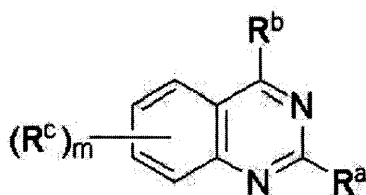
30

前記化学式 1 で、 R^a 、 R^b 、 R^c 、及び m はそれぞれ請求項 1 で定義したものである。

【請求項 7】

下記の化学式 1 で表示されるキナゾリン誘導体、これの薬剤学的に許容可能な塩、
又はこれのプロドラッグを含むことを特徴とする肥満治療及び予防剤。

〔化学式 1〕



40

前記化学式 1 で、 R^a 、 R^b 、 R^c 、及び m はそれぞれ請求項 1 で定義したものである。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

50

本発明は血糖降下、体重減少を現わす新規のキナゾリン誘導体と、この化合物を有効成分として含む糖尿及び肥満治療予防剤に関する。

【背景技術】

【0002】

現在一番有り勝ちな文化病の一つである糖尿病は我が国でも発生頻度が徐々に増加されているし、その病態の深刻性と後遺症で深刻な社会問題になっている。経済発展による生活水準の向上によって生活与件が向上しながら運動不足現象をもたらして、全般的な食生活の向上に攝取熱量が大きく増加して深刻な肥満が発生されることで第2型糖尿病が増加している。

【0003】

糖尿病が長く持続すれば血糖の増加以外にも血中脂質濃度が増加して動脈硬化、管状心臓疾患などの心血管疾患、糖尿病性腎臓及び網膜疾患などの合併症を誘発するのでこの治療剤の開発が必要である。

【0004】

糖尿病は大きくインシュリン依存型糖尿病（Insulin dependent diabetes mellitus、以下“IDDM”と言う）とインシュリン非依存型糖尿病（Non insulin dependent diabetes mellitus、以下“NIDDM”と言う）に大別される。インシュリン依存型糖尿病（IDDM）即ち、第1型糖尿病は免疫学的な原因によって膵臓のベータ細胞が破壊されてインシュリン合成が成り立たない疾患である。

【0005】

一方、インシュリン非依存型糖尿病（NIDDM）即ち、第2型糖尿病はインシュリン分泌障害とインシュリン抵抗性の複合障害という二つの原因で発生される疾患で、糖尿病の95%以上を占める。

【0006】

インシュリン分泌障害と言うのは血糖濃度によって膵臓のベータ細胞で適切な量のインシュリンが分泌されない状況を称えて、これはインシュリンを分泌するベータ細胞の量的な減少や機能的な分配障害をすべて含む。

【0007】

インシュリン抵抗性は分泌されたインシュリンが血流に乗って標的臓器に到達したがその標的細胞でインシュリンの作用が低下された状況を意味することで、一般的に細胞膜水溶体結合後の信号伝達障害だと思って、その原因では遺伝的な要因、肥満、肉体的活動低下及び高血糖又は異常脂質血症などを上げられる。

【0008】

ここで重要な事実はこの二つの病因が互いにかみ合っているという事である。即ち、インシュリン抵抗性があれば抵抗性を乗り越えるためにもっと多い量のインシュリンが分泌されなければならないし、反対にインシュリン分泌が十分ではなくて生じた高血糖自体がまたインシュリン抵抗性を悪化させることができる。

【0009】

従って、NIDDMの病因を理解するために国内外的にインシュリン信号伝達体系、グルコース移送及び代謝過程に関する研究が膨大に成り立っているがNIDDMの病因が非常に複雑で多様で正確な病理メカニズムが明かされていなくてそれによる適切な治療方法が改善されていない。

【0010】

一方、第2型糖尿病（NIDDM）が肥満と係わっていることはよく知られているが、まだ正確な相互作用や関連性に関するメカニズムが正確に明かされなかった。しかし肥満とそれによる脂肪酸代謝障害が代謝疾患の発病と不可分の関係があるはずだという前提で、最近糖尿病病因研究の焦点が“葡萄糖代謝”から“脂肪酸代謝”中心に移されている。

【0011】

第2型糖尿病患者で高血糖以外に脂質代謝の遺贈、即ち血中脂肪酸の増加、中性脂肪増加、高密度脂蛋白コレステロール減少、筋肉内脂肪の蓄積、腹部脂肪量増加、脂肪肝の発

10

20

30

40

50

生などをよく見つけることができる。

【0012】

もちろんこのような脂質恒常性の障害が糖尿病による高血糖の結果なのかそれとも糖尿病発生の原因で作用したかはまだ確かではない。

【0013】

しかし、インシュリン抵抗性発生に先行してインシュリン標的臓器の骨格筋、心臓筋肉、肝組織などに中性脂肪の非正常的な蓄積や脂肪組織で脂肪酸増加など脂肪酸代謝障害が先行して現われて、このような現象が持続すればインシュリン抵抗性が悪くなりながら、食後又は空腹時高血糖が現われ始めて、これはまたインシュリン抵抗性及び脂肪酸代謝障害をもっと悪化させるようになる悪循環で結局他の代謝疾患を誘発するようになる。

10

【0014】

このような病理現象はイン・ビトロ実験又は動物実験のみならず人を対象にした研究で比較的一貫されるように証明されている。しかし、何がこのような脂肪代謝障害を誘発するのか又はどんなメカニズムによってインシュリン抵抗性が招来されて生理的恒常性を破壊するかに対してはまだ明確ではない。

【0015】

こんな状況下で現在インシュリン抵抗性 (insulin resistance) がNIDDMの一番重要な病理メカニズムに認識されているし、これは体内インシュリンが十分だと言っても糖を共に活用することができない現象を意味しているし、これを治療するために多様な血糖降下剤が使われている。血糖降下剤は治療メカニズム及び作用薬物の作用点によって次のように分類される。

20

【0016】

1) スルホニルウレア系薬物は主に膵臓のベータ細胞の中にあるインシュリンを含んだ顆粒胞の移動を促進して間接的にインシュリンを分泌させる薬物で、低血糖誘発などの深刻な副作用が報告されているが最近では副作用を最小化した薬物が開発されたりした。

2) ビグアニド系薬物は筋肉細胞で糖を移動させて肝で糖の合成 (gluconeogenesis) を抑制する薬物で、低血糖を起こさない長所を持っているが高齢者と心血管疾患患者には使用時注意が要求されている。

3) アルファグルクロニダーゼ抑制剤は所長で葡萄糖を作る酵素活動を抑制させて食後に一時的に血糖が急上昇することを阻んでくれて、副作用がひどくない方なので軽症糖尿病治療に利用される。

30

4) チアゾリジンジオン (thiazolidione: TZD) 係薬物は最近開発されたことで、脂肪細胞の分化に係る PPAR- γ を活性化することで知られている。

【0017】

このような経口用血糖降下剤だけでは血糖が効果的に落ちないので、すでに知られた大部分の薬物で副作用が現われるのでより安全な糖尿病治療剤開発が至急を要する。また、第2型糖尿病はインシュリン信号伝達体系及び炭水化物と脂質代謝過程での多様な問題点によって発生するから新しい治療剤開発のためにはこのような信号伝達及び代謝過程を全般的に調節する新しい目標蛋白質の発掘が切実な実情である。

【0018】

最近 5'AMP 活性化蛋白質リン酸化酵素 (5'AMP-activated protein kinase 以下 “AMPK” という) が炭水化物及び脂質代謝そして葡萄糖吸収を調節する役目が明かされながらこれの活性物質が第2型糖尿病治療剤としての開発可能性が提示されているし、このような根拠は次のようである。

40

【0019】

1) 運動をさせた鼠の筋肉細胞でATP消耗の結果でAMPの量が増加して、これによりAMPKの活性度が増加して、その結果葡萄糖吸収が増加する事実が観察された。

2) AMPKによって葡萄糖吸収が増加されるメカニズムはインシュリン信号伝達体系と独立的で、この事実はインシュリン信号伝達体系に異常が発見される大部分の第2型糖尿病患者に新しい治療目標物質になることができるという事実を意味する。

50

3) 実際に第2型糖尿病患者の大部分が運動をすることで血糖量を減少させることができ、糖尿モデル動物実験結果運動によってAMPKが活性化される同時に血糖量が減少される事実も報告されている。

4) こののみならずAMPKは生体内で多様な役目を遂行するのに膵臓細胞でインシュリンの分泌を調節するだけではなく脂肪細胞でアセチルCoAカルボキシラーゼ(ACC)とHMG-CoA還元酵素の活性を阻害して脂肪生成及びコレステロール合成を抑制して肥満の調節にも重要な役目をする。

【0020】

結論的に、AMPKはその名前で示唆するところのように筋肉収縮や運動後細胞内のエネルギー枯渇の結果で蓄積されたAMPによって活性化されエネルギー恒常性調節と炭水化物及び脂質代謝調節の中核的な役目をしている。またエネルギー不均衡によって招来される糖尿及び肥満など代謝性疾患治療のための新しい目標物質に認識されている。

10

【0021】

運動による葡萄糖吸収過程でAMPKの大切さは現在広く認識されているし、このメカニズムはインシュリン信号伝達体系と独立的に起きているし、この事実はインシュリン信号伝達体系に異常が発見される大部分の第2型糖尿病患者で新しい治療目標物質になることができるという事実を意味する。

【0022】

実際に第2型糖尿病患者の大部分が運動をすることで血糖量を減少させることができ、糖尿モデル動物で運動によってAMPKが活性化される同時に血糖量が減少される事実も報告されている。

20

【0023】

また、現在糖尿治療剤として広く使われるメトフォルミン(Metformin)あるいはチアゾリジンジオン(TZD)系列の薬物もその効果が部分的にAMPKを通じて血糖を降下させるという報告がある。

このような事実を総合的に見れば、AMPKを活性化させることができる薬物発掘は運動によった多様な代謝成疾患改善効果を模倣できる新しい概念の治療剤開発に繋がると予想される。

【0024】

しかし、AMPKの活性剤として第2型糖尿病と肥満症に選択的に効果がありながら糖尿病実験動物に対してめっきり血糖を減少させる低害物質に対しては報告が不備である。よって、本発明はAMPK酵素の活性増加、肥満及び糖尿予防及び治療などに明らかな効果がある新規物質を合成して、その効果を確認することで完成するようになった。

30

【発明の開示】

【発明が解決しようとする課題】

【0025】

本発明者たちは前記のような問題を解決するためにキナゾリン骨格を持った色々な化合物を合成して血糖降下活性と体重減少を測定した結果卓越な活性と体重減少を現わすことを確認した。従って、本発明は糖尿病及び肥満治療に必須な血糖降下効果と体重減少効果が優秀な新規のキナゾリン化合物を提供することに目的がある。

40

【0026】

また、本発明は新規のキナゾリン化合物、薬剤学的に許容可能なこれの塩、又は薬剤学的に許容可能なこれのプロドラッグを有効成分として含む、毒性及び副作用がない糖尿病及び肥満治療剤を提供することに目的がある。

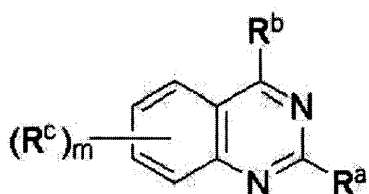
【課題を解決するための手段】

【0027】

本発明は糖尿及び肥満治療剤で有効な下記の化学式1で表示されるキナゾリン誘導体、薬剤学的に許容可能なこれの塩、又は薬剤学的に許容可能なこれのプロドラッグをその特徴とする。

[化学式1]

50



前記化学式 1 で、

R^a は水素、 $(C_1 - C_{18})$ アルキル、 $(C_2 - C_8)$ アルケニル、 $(C_2 - C_8)$ アルキニル、ハロゲノ- $(C_1 - C_6)$ アルキル、ヒドロキシ- $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_1 - C_6)$ アルコキシ- $(C_1 - C_6)$ アルキル、シアノ- $(C_1 - C_6)$ アルキル、アミノ- $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルアミノ- $(C_1 - C_6)$ アルキル、ジ- $(C_1 - C_6)$ アルキル]アミノ- $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルチオ- $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルスルフィニル- $(C_1 - C_6)$ アルキル又は $(C_1 - C_6)$ アルキルスルホニル- $(C_1 - C_6)$ アルキルから選択された置換基、又は化学式- $X^1 - Q^1$ [ここで、 X^1 は直接結合であるか、O、S、SO、 SO_2 、 $N(R^4)$ 、CO、 CO_2 、 $CH(OR^4)$ 、 $CON(R^4)$ 、 $N(R^4)CO$ 、 $SO_2N(R^4)$ 、 $N(R^4)SO_2$ 、 $C(R^4)_2O$ 、 $C(R^4)_2S$ 、 $N(R^4)C(R^4)_2$ 、 $N(R^4)CON(R^4)$ 、 $N(R^4)CSN(R^4)$] から選択されて、 R^4 は水素、 $(C_1 - C_6)$ アルキル、アリール、アリール- $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_3 - C_7)$ シクロアルキル、 $(C_3 - C_7)$ シクロアルキル- $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_3 - C_7)$ シクロアルケニル、 $(C_3 - C_7)$ シクロアルケニル- $(C_1 - C_6)$ アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリール- $(C_1 - C_6)$ アルキル、ヘテロシクリル又はヘテロシクリル- $(C_1 - C_6)$ アルキルの基で、 Q^1 は R^4 と等しいか相異なる置換基から選択されることができ、

そして、ここで R^a 基内での $(C_2 - C_6)$ アルキレン基で隣接炭素原子はO、S、SO、 SO_2 、 $N(R^5)$ 、CO、 $CH(OR^5)$ 、 $CON(R^5)$ 、 $N(R^5)CO$ 、 $SO_2N(R^5)$ 、 $N(R^5)SO_2$ 、 $C(R^5)=C(R^5)$ 及び $C \equiv C$ から選択された基の挿入によって分離されることができ、ここで R^5 は水素又は $(C_1 - C_6)$ アルキルで、

ここで R^a 基内での任意の $CH_2=CH-$ 又は $HC \equiv C-$ 基は末端 $CH_2=$ 又は $HC \equiv$ 位置でハロゲノ、カルボキシル、カルバモイル、 $(C_1 - C_6)$ アルコキシカルボニル、 $N-(C_1 - C_6)$ アルキルカルバモイル、 N 、 N -ジ- $(C_1 - C_6)$ アルキル]カルバモイル、アミノ- $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルアミノ- $(C_1 - C_6)$ アルキル及びジ- $(C_1 - C_6)$ アルキル]アミノ- $(C_1 - C_6)$ アルキルから選択されるか又は化学式 $Q^2 - X^2$ [ここで、 X^2 は直接結合であるか、CO及び $N(R^6)CO$ から選択されて、ここで R^6 は水素又は $(C_1 - C_6)$ アルキルで、 Q^2 はアリール、アリール- $(C_1 - C_6)$ アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリール- $(C_1 - C_6)$ アルキル、ヘテロシクリル又はヘテロシクリル- $(C_1 - C_6)$ アルキル]の基から選択された置換基を含むことができ、

ここで R^a 基内での任意の CH_2 又は CH_3 基はそれぞれの CH_2 又は CH_3 基から1以上のハロゲノ、 $(C_1 - C_6)$ アルキル置換基、ヒドロキシ、シアノ、アミノ、カルボキシル、カルバモイル、 $(C_1 - C_6)$ アルコキシ、 $(C_1 - C_6)$ アルキルチオ、 $(C_1 - C_6)$ アルキルスルフィニル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルスルホニル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルアミノ、ジ- $(C_1 - C_6)$ アルキル]アミノ、 $(C_1 - C_6)$ アルコキシカルボニル、 $N-(C_1 - C_6)$ アルキルカルバモイル、 N 、 N -ジ- $(C_1 - C_6)$ アルキル]カルバモイル、 $(C_1 - C_6)$ アルカノイル、 $(C_2 - C_6)$ アルカノイルオキシ、 $(C_2 - C_6)$ アルカノイルアミノ、 $N-(C_1 - C_6)$ アルキル- $(C_2 - C_6)$ アルカノイルアミノ、 $N-(C_1 - C_6)$ アルキルスルファモイル、 N 、 N -ジ- $(C_1 - C_6)$ アルキル]スルファ

モイル、 (C_1-C_6) アルカンスルホニルアミノ及びN- (C_1-C_6) アルキル- (C_1-C_6) アルカンスルホニルアミノから選択された置換基又は、化学式- X^3-Q^3 [ここで、 X^3 は直接結合であるか、O、S、SO、 SO_2 、 $N(R^7)$ 、CO、 $CH(OR^7)$ 、 $CON(R^7)$ 、 $N(R^7)CO$ 、 $SO_2N(R^7)$ 、 $N(R^7)SO_2$ 、 $C(R^7)_2O$ 、 $C(R^7)_2S$ 、 $N(R^7)C(R^7)_2$ 、 $N(R^7)CON(R^7)$ 及び $N(R^7)CSN(R^7)$ から選択されて、 R^7 は水素、 (C_1-C_6) アルキル、アリール、アリール- (C_1-C_6) アルキル、 (C_3-C_7) シクロアルキル、 (C_3-C_7) シクロアルキル- (C_1-C_6) アルキル、 (C_3-C_7) シクロアルケニル、 (C_3-C_7) シクロアルケニル- (C_1-C_6) アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリール- (C_1-C_6) アルキル、ヘテロシクリル又はヘテロシクリル- (C_1-C_6) アルキルの基で、 Q^3 は R^7 と等しいか相異なる置換基から選択されることができ、

ここで、 R^a の置換体内での任意のアリール、ヘテロアリール又はヘテロシクリル基は0ないし3個の置換基を含むことができ、この置換基は等しいか相異なっていることができ、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、カルボキシル、カルバモイル、 (C_1-C_6) アルキル、 (C_2-C_8) アルケニル、 (C_2-C_8) アルキニル、 (C_1-C_6) アルコキシ、 (C_2-C_6) アルケニルオキシ、 (C_2-C_6) アルキニルオキシ、 (C_1-C_6) アルキルチオ、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル、 (C_1-C_6) アルキルアミノ、ジ- $[(C_1-C_6)$ アルキル]アミノ、 (C_1-C_6) アルコキシカルボニル、N- (C_1-C_6) アルキルカルバモイル、N、N-ジ- $[(C_1-C_6)$ アルキル]カルバモイル、 (C_2-C_6) アルカノイル、 (C_2-C_6) アルカノイルオキシ、 (C_2-C_6) アルカノイルアミノ、N- (C_1-C_6) アルキル- (C_2-C_6) アルカノイルアミノ、N- (C_1-C_6) アルキルスルファモイル、N、N-ジ- $[(C_1-C_6)$ アルキル]スルファモイル、 (C_1-C_6) アルカンスルホニルアミノ及びN- (C_1-C_6) アルキル- (C_1-C_6) アルカンスルホニルアミノから選択されるか又は、化学式- X^4-R^8 [ここで、 X^4 は直接結合であるか、O及び $N(R^9)$ から選択されて、ここで R^9 は水素又は (C_1-C_6) アルキルで、 R^8 はハロゲノ- (C_1-C_6) アルキル、ヒドロキシ- (C_1-C_6) アルキル、 (C_1-C_6) アルコキシ- (C_1-C_6) アルキル、シアノ- (C_1-C_6) アルキル、アミノ- (C_1-C_6) アルキル、 (C_1-C_6) アルキルアミノ- (C_1-C_6) アルキル、ジ- $[(C_1-C_6)$ アルキル]アミノ- (C_1-C_6) アルキル、 (C_2-C_6) アルカノイルアミノ- (C_1-C_6) アルキル又は (C_1-C_6) アルコキシカルボニルアミノ- (C_1-C_6) アルキルである]の基から選択されるか、又は化学式- X^5-Q^4 [ここで、 X^5 は直接結合であるかO、CO及び $N(R^{10})$ から選択されて、ここで R^{10} は水素又は (C_1-C_6) アルキルで、 Q^4 はアリール、アリール- (C_1-C_6) アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリール- (C_1-C_6) アルキル、ヘテロシクリル又はヘテロシクリル- (C_1-C_6) アルキルで、これは1又は2個の置換基を含むことができ、この置換基は等しいか相異なっていることができ、ハロゲノ、 (C_1-C_6) アルキル及び (C_1-C_6) アルコキシから選択されること]の基から選択されて、

そして、ここで R^a の置換体内でヘテロシクリル基は1又は2個のオクソ又はチオキソ置換基を含むことができ、

R^b は水素、 (C_1-C_{18}) アルキル、 (C_2-C_8) アルケニル、 (C_2-C_8) アルキニル、ハロゲノ- (C_1-C_6) アルキル、ヒドロキシ- (C_1-C_6) アルキル、 (C_1-C_6) アルコキシ- (C_1-C_6) アルキル、シアノ- (C_1-C_6) アルキル、アミノ- (C_1-C_6) アルキル、 (C_1-C_6) アルキルアミノ- (C_1-C_6) アルキル、ジ- $[(C_1-C_6)$ アルキル]アミノ- (C_1-C_6) アルキル、 (C_1-C_6) アルキルチオ- (C_1-C_6) アルキル、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル- (C_1-C_6) アルキル又は (C_1-C_6) アルキルスルホニル- (C_1-C_6) アルキルから選択された置換基、又は化学式- X^1-Q^1 [ここで、 X^1 は直接結合であるか、O、S、SO、 SO_2 、 $N(R^4)$ 、CO、 $CO_2(R^4)$ 、 $CH(OR^4)$ 、 $CON(R^4)$ 、 $N(R^4)CO$ 、 $SO_2N(R^4)$ 、 $N(R^4)SO_2$ 、 $C(R^4)_2O$ 、 $C(R^4)_2S$ 、 $N(R^4)C(R^4)_2$

、 $N(R^4)CON(R^4)$ 、 $N(R^4)CSN(R^4)$]から選択されて、 R^4 は水素、 (C_1-C_6) アルキル、アリール、アリール- (C_1-C_6) アルキル、 (C_3-C_7) シクロアルキル、 (C_3-C_7) シクロアルキル- (C_1-C_6) アルキル、 (C_3-C_7) シクロアルケニル、 (C_3-C_7) シクロアルケニル- (C_1-C_6) アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリール- (C_1-C_6) アルキル、ヘテロシクリル又はヘテロシクリル- (C_1-C_6) アルキルの基で、 Q^1 は R^4 と等しいか相異なる置換基から選択されることができ、

そして、ここで R^b 基内での (C_2-C_6) アルキレン基で隣接炭素原子はO、S、SO、 SO_2 、 $N(R^5)$ 、CO、CH(OR⁵)、 $CON(R^5)$ 、 $N(R^5)CO$ 、 $SO_2N(R^5)$ 、 $N(R^5)SO_2$ 、CH=CH及びC≡Cから選択された基の挿入によ

10

って分離されることができ、ここで R^5 は水素又は (C_1-C_6) アルキルで、
ここで R^b 基内での任意のCH₂=CH-又はHC≡C-基は末端CH₂=又はHC≡位置でハロゲノ、カルボキシル、カルバモイル、 (C_1-C_6) アルコキシカルボニル、N- (C_1-C_6) アルキルカルバモイル、N、N-ジ- (C_1-C_6) アルキルカルバモイル、アミノ- (C_1-C_6) アルキル、 (C_1-C_6) アルキルアミノ- (C_1-C_6) アルキル及びジ- (C_1-C_6) アルキルアミノ- (C_1-C_6) アルキルから選択されるか又は化学式 Q^2-X^2 -[ここで、 X^2 は直接結合であるか、CO及び $N(R^6)CO$ から選択されて、ここで R^b の置換体内での任意のアリール、ヘテロアリール又はヘテロシクリル基 R^6 は水素又は (C_1-C_6) アルキルで、 Q^2 はアリール、アリール- (C_1-C_6) アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリール- (C_1-C_6) アルキル、ヘテロシクリル又は

20

ヘテロシクリル- (C_1-C_6) アルキル]の基から選択された置換基を含むことができ、
ここで R^b 基内での任意のCH₂又はCH₃基はそれぞれのCH₂又はCH₃基から1以上のハロゲノ-又は (C_1-C_6) アルキル置換基、又はヒドロキシ、シアノ、アミノ、カルボキシル、カルバモイル、 (C_1-C_6) アルコキシ、 (C_1-C_6) アルキルチオ、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル、 (C_1-C_6) アルキルアミノ、ジ- (C_1-C_6) アルキルアミノ、 (C_1-C_6) アルコキシカルボニル、N- (C_1-C_6) アルキルカルバモイル、N、N-ジ- (C_1-C_6) アルキルカルバモイル、 (C_2-C_6) アルカノイル、 (C_2-C_6) アルカノイルオキシ、 (C_2-C_6) アルカノイルアミノ、N- (C_1-C_6) アルキル- (C_2-C_6) アルカノイルアミノ、N- (C_1-C_6) アルキルスルファモイル、N、N-ジ- (C_1-C_6) アルキル

30

スルファモイル、 (C_1-C_6) アルカンスルホニルアミノ及びN- (C_1-C_6) アルキル- (C_1-C_6) アルカンスルホニルアミノから選択された置換基又は、化学式- X^3-Q^3 [ここで、 X^3 は直接結合であるか、O、S、SO、 SO_2 、 $N(R^7)$ 、CO、CH(OR⁷)、 $CON(R^7)$ 、 $N(R^7)CO$ 、 $SO_2N(R^7)$ 、 $N(R^7)SO_2$ 、 $C(R^7)_2O$ 、 $C(R^7)_2S$ 、 $N(R^7)C(R^7)_2$ 、 $N(R^7)CON(R^7)$ 及び $N(R^7)CSN(R^7)$ から選択されて、 R^7 は水素、 (C_1-C_6) アルキル、アリール、アリール- (C_1-C_6) アルキル、 (C_3-C_7) シクロアルキル、 (C_3-C_7) シクロアルキル- (C_1-C_6) アルキル、 (C_3-C_7) シクロアルケニル、 (C_3-C_7) シクロアルケニル- (C_1-C_6) アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリール- (C_1-C_6) アルキル、ヘテロシクリル又はヘテロシクリル- (C_1-C_6) アルキルの

40

基で、 Q^3 は R^7 と等しいか相異なる置換基から選択されることができ、
 R^b 基内での任意のアリール、ヘテロアリール又はヘテロシクリル基は1、2又は3個の置換基を含むことができ、この置換基は等しいか相異なっていることができ、水素、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、カルボキシル、カルバモイル、 (C_1-C_6) アルキル、 (C_2-C_8) アルケニル、 (C_2-C_8) アルキニル、 (C_1-C_6) アルコキシ、 (C_2-C_6) アルケニルオキシ、 (C_2-C_6) アルキニルオキシ、 (C_1-C_6) アルキルチオ、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル、 (C_1-C_6) アルキルアミノ、ジ- (C_1-C_6) アルキルアミノ、 (C_1-C_6) アルコキシカルボニル、N- (C_1-C_6) アルキルカルバモイル、N、N-ジ- (C_1-C_6) アルキルカルバモイル、 (C_2-C_6) アルカノイル、

50

(C₂-C₆) アルカノイルオキシ、(C₂-C₆) アルカノイルアミノ、N-(C₁-C₆) アルキル-(C₂-C₆) アルカノイルアミノ、(C₃-C₆) アルケノイルアミノ、N-(C₁-C₆) アルキル-(C₃-C₆) アルケノイルアミノ、(C₃-C₆) アルキノイルアミノ、N-(C₁-C₆) アルキル-(C₃-C₆) アルキノイルアミノ、N-(C₁-C₆) アルキルスルファモイル、N、N-ジ-[(C₁-C₆) アルキル]スルファモイル、(C₁-C₆) アルカンスルホニルアミノ及びN-(C₁-C₆) アルキル-(C₁-C₆) アルカンスルホニルアミノから選択されるか化学式-X⁴-R⁸[ここで、X⁴は直接結合であるか、O及びN(R⁹)から選択されて、ここでR⁹は水素又は(C₁-C₆)アルキルで、R⁸はハロゲノ-(C₁-C₆)アルキル、ヒドロキシ-(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)アルコキシ-(C₁-C₆)アルキル、シアノ-(C₁-C₆)アルキル、アミノ-(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)アルキルアミノ-(C₁-C₆)アルキル又はジ-[(C₁-C₆)アルキル]アミノ-(C₁-C₆)アルキル]の基から選択されるか又は化学式-X⁵-Q⁴[ここで、X⁵は直接結合であるかO、CO及びN(R¹⁰)から選択されて、ここでR¹⁰は水素又は(C₁-C₆)アルキルで、Q⁴はアリール、アリール-(C₁-C₆)アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリール-(C₁-C₆)アルキル、ヘテロシクリル又はヘテロシクリル-(C₁-C₆)アルキルで、これは1又は2個の置換基を含むことができ、この置換基は等しいか相異なっていることができ、ハロゲノ、(C₁-C₆)アルキル及び(C₁-C₆)アルコキシから選択されること]の基から選択されて、

10

ここでR^bの置換体内でヘテロシクリル基は1又は2個のオクソ又はチオキソ置換基を含むことができ、

20

そしてR^b基内での任意のアリール、ヘテロアリール又はヘテロシクリル基の等しいか相異なる置換基は互いに結合して化学式CH=CH-CH=CH-、-N=CH-CH=CH-、-CH=CH-N=CH-、-CH=CH-N=CH-、CH=CH-CH=N-、-N=CH-N=CH-、-CH=CH-N=CH-、-N=CH-CH=N-、-N=CH-CH=N-、-N=N-CH=CH-、-CH=CH-N=N-、-CH=CH-O-、-O-CH=CH-、-CH=CH-S-、-S-CH=CH-、-C(R¹¹)₂-C(R¹¹)₂-O-、-O-C(R¹¹)₂-C(R¹¹)₂-、-C(R¹¹)₂-C(R¹¹)₂-S-、-S-C(R¹¹)₂-C(R¹¹)₂-、-O-C(R¹¹)₂-O-、-O-C(R¹¹)₂-C(R¹¹)₂-O-、-S-C(R¹¹)₂-S-、-S-C(R¹¹)₂-C(R¹¹)₂-S-、-CH=CH-NH-、-NH-CH=CH-、-C(R¹¹)₂-C(R¹¹)₂-N-、-NH-C(R¹¹)₂-C(R¹¹)₂-、-N=CH-NH-、-NH-CH=N-、-NH-C(R¹¹)₂-NH-、-O-CH=N-、-N=CH-O-、-S-CH=N-、-N=CH-S-、-O-C(R¹¹)₂-NH-、-NH-C(R¹¹)₂-O-、-S-C(R¹¹)₂-NH-、-NH-C(R¹¹)₂-S-、-O-N=CH-、-CH=N-O-、-S-N=CH-、-CH=N-S-、-O-NH-C(R¹¹)₂-、-C(R¹¹)₂-NH-O-、-S-NH-C(R¹¹)₂-、-C(R¹¹)₂-NH-S-、-NH-N=CH-、-CH=N-NH-、-NH-NH-C(R¹¹)₂-、-C(R¹¹)₂-NH-NH-、-N=N-NH-又は-NH-N=N-の基[ここで、R¹¹は水素又は(C₁-C₆)アルキル]を形成することができ、

30

前記化学式で、mは0、1、2、3又は4で、

それぞれのR^c基は等しいか相異なっていることができ、水素、ハロゲノ、トリフルオロメチル、シアノ、イソシアノ、ニトロ、ヒドロキシ、メルカプト、アミノ、ホルミル、カルボキシル、カルバモイル、(C₁-C₆)アルキル、(C₂-C₈)アルケニル、(C₂-C₈)アルキニル、(C₁-C₆)アルコキシ、(C₂-C₈)アルケニルオキシ、(C₂-C₆)アルキニルオキシ、(C₁-C₆)アルキルチオ、(C₁-C₆)アルキルスルフィニル、(C₁-C₆)アルキルスルホニル、(C₁-C₆)アルキルアミノ、ジ-[(C₁-C₆)アルキル]アミノ、(C₁-C₆)アルコキシカルボニル、N-(C₁-C₆)アルキルカルバモイル、N、N-ジ-[(C₁-C₆)アルキル]カルバモイル、(C₂-C₆)アルカノイル、(C₂-C₆)アルカノイルオキシ、(C₂-C₆)アルカノイルアミノ、N-(C₁-C₆)アルキル-(C₂-C₆)アルカノイルアミノ、(C₃-C₆)アルケノイルアミノ、N-(C₁-C₆)アルキル-(C₃-C₆)アルケノイルアミノ、(C₃-

40

50

C₆) アルキノイルアミノ、N-(C₁-C₆) アルキル-(C₃-C₆) アルキノイルアミノ、N-(C₁-C₆) アルキルスルファモイル、N、N-ジ-[(C₁-C₆) アルキル]スルファモイル、(C₁-C₆) アルカンスルホニルアミノ及びN-(C₁-C₆) アルキル-(C₁-C₆) アルカンスルホニルアミノ、アリール、アリール-(C₁-C₆) アルキル、(C₃-C₇) シクロアルキル、(C₃-C₇) シクロアルキル-(C₁-C₆) アルキル、(C₃-C₇) シクロアルケニル、(C₃-C₇) シクロアルケニル-(C₁-C₆) アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリール-(C₁-C₆) アルキル、ヘテロシクリル又はヘテロシクリル-(C₁-C₆) アルキル]の基から選択される。

【0028】

ここでR^C置換体内での任意の(C₂-C₆) アルキレン基で隣接炭素原子はO、S、SO、SO₂、N(R^{1 2})、CO、CH(OR^{1 2})、CON(R^{1 2})、N(R^{1 2})CO、SO₂N(R^{1 2})、N(R^{1 2})SO₂、CH=CH及びC≡Cから選択された基の基の挿入によって分離することができ、ここでR^{1 2}は水素又は(C₁-C₆) アルキルで、

ここでR^C置換体内での任意のCH₂=CH-又はHC≡C-基は末端CH₂=又はHC≡位置でハロゲノ、カルボキシル、カルバモイル、(C₁-C₆) アルコキシカルボニル、N-(C₁-C₆) アルキルカルバモイル、N、N-ジ-[(C₁-C₆) アルキル]カルバモイル、アミノ-(C₁-C₆) アルキル、(C₁-C₆) アルキルアミノ-(C₁-C₆) アルキル及びジ-[(C₁-C₆) アルキル]アミノ-(C₁-C₆) アルキルから選択されるか又は化学式Q⁵-X⁶-[ここで、X⁶は直接結合であるか、CO及びN(R^{1 3})COから選択されて、ここでR^{1 3}は水素又は(C₁-C₆) アルキルで、Q⁵はアリール、アリール-(C₁-C₆) アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリール-(C₁-C₆) アルキル、ヘテロシクリル又はヘテロシクリル-(C₁-C₆) アルキル]の基から選択された置換基を含むことができ、

ここでR^C置換体内での任意のCH₂又はCH₃基はそれぞれのCH₂又はCH₃基から1以上のハロゲノ又は(C₁-C₆) アルキル置換基、又はヒドロキシ、シアノ、アミノ、カルボキシル、カルバモイル、(C₁-C₆) アルコキシ、(C₁-C₆) アルキルチオ、(C₁-C₆) アルキルスルフィニル、(C₁-C₆) アルキルスルホニル、(C₁-C₆) アルキルアミノ、ジ-[(C₁-C₆) アルキル]アミノ、(C₁-C₆) アルコキシカルボニル、N-(C₁-C₆) アルキルカルバモイル、N、N-ジ-[(C₁-C₆) アルキル]カルバモイル、(C₂-C₆) アルカノイル、(C₂-C₆) アルカノイルオキシ、(C₂-C₆) アルカノイルアミノ、N-(C₁-C₆) アルキル-(C₂-C₆) アルカノイルアミノ、N-(C₁-C₆) アルキルスルファモイル、N、N-ジ-[(C₁-C₆) アルキル]スルファモイル、(C₁-C₆) アルカンスルホニルアミノ及びN-(C₁-C₆) アルキル-(C₁-C₆) アルカンスルホニルアミノから選択された置換基又は、化学式-X⁷-Q⁶[ここで、X⁷は直接結合であるか、O、S、SO、SO₂、N(R^{1 4})、CO、CH(OR^{1 4})、CON(R^{1 4})、N(R^{1 4})CO、SO₂N(R^{1 4})、N(R^{1 4})SO₂、C(R^{1 4})₂O、C(R^{1 4})₂S及びN(R^{1 4})C(R^{1 4})₂から選択されて、ここでR^{1 4}は水素又は(C₁-C₆) アルキルで、Q⁶はアリール、アリール-(C₁-C₆) アルキル、(C₃-C₇) シクロアルキル、(C₃-C₇) シクロアルキル-(C₁-C₆) アルキル、(C₃-C₇) シクロアルケニル、(C₃-C₇) シクロアルケニル-(C₁-C₆) アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリール-(C₁-C₆) アルキル、ヘテロシクリル又はヘテロシクリル-(C₁-C₆) アルキル]の基から選択される置換基を含むことができ、

ここで、R^C基内での任意のアリール、ヘテロアリール又はヘテロシクリル基は1、2又は3個の置換基を含むことができ、この置換基は等しいか相異なっていることができ、水素、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、カルボキシル、カルバモイル、(C₁-C₆) アルキル、(C₂-C₈) アルケニル、(C₂-C₈) アルキニル、(C₁-C₆) アルコキシ、(C₂-C₆) アルケニルオキシ、(C₂-C₆) アルキニルオキシ、(C₁-C₆) アルキルチオ、(C₁-C₆) アルキルスルフィニ

10

20

30

40

50

ル、(C₁-C₆)アルキルスルホニル、(C₁-C₆)アルキルアミノ、ジ-[(C₁-C₆)アルキル]アミノ、(C₁-C₆)アルコキシカルボニル、N-(C₁-C₆)アルキルカルバモイル、N、N-ジ-[(C₁-C₆)アルキル]カルバモイル、(C₂-C₆)アルカノイル、(C₂-C₆)アルカノイルオキシ、(C₂-C₆)アルカノイルアミノ、N-(C₁-C₆)アルキル-(C₂-C₆)アルカノイルアミノ、(C₃-C₆)アルケノイルアミノ、N-(C₁-C₆)アルキル-(C₃-C₆)アルケノイルアミノ、(C₃-C₆)アルキノイルアミノ、N-(C₁-C₆)アルキル-(C₃-C₆)アルキノイルアミノ、N-(C₁-C₆)アルキルスルファモイル、N、N-ジ-[(C₁-C₆)アルキル]スルファモイル、(C₁-C₆)アルカンスルホニルアミノー及びN-(C₁-C₆)アルキル-(C₁-C₆)アルカンスルホニルアミノから選択されるか化学式-X⁸-R¹⁵[ここで、X⁸は直接結合であるか、O及びN(R¹⁶)から選択されて、ここでR⁸は水素又は(C₁-C₆)アルキルで、R¹⁵はハロゲン-(C₁-C₆)アルキル、ヒドロキシ-(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)アルコキシ-(C₁-C₆)アルキル、シアノ-(C₁-C₆)アルキル、アミノ-(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)アルキルアミノ-(C₁-C₆)アルキル又はジ-[(C₁-C₆)アルキル]アミノ-(C₁-C₆)アルキルである]の基から選択されるか又は化学式-X⁹-Q⁷[ここで、X⁹は直接結合であるかO、CO及びN(R¹⁷)から選択されて、R¹⁷は水素又は(C₁-C₆)アルキルで、Q⁷は1又は2個の置換基を持つことができる、アリール、アリール-(C₁-C₆)アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリール-(C₁-C₆)アルキル、ヘテロシクリル又はヘテロシクリル-(C₁-C₆)アルキルで、この置換基は等しいか相異なっていることができ、ハロゲン、(C₁-C₆)アルキル及び(C₁-C₆)アルコキシから選択されて、Q⁷内での任意のヘテロシクリル基は1又は2個のオクソ又はチオキソ置換基を含むことができる]の基から選択されて、

10

20

ここでR^Cの置換体内でヘテロシクリル基は1又は2個のオクソ又はチオキソ置換基を含むことができ、R^C基内での任意のアリール、ヘテロアリール又はヘテロシクリル基の等しいか相異なる置換基は互いに結合して化学式

CH=CH-CH=CH-、-N=CH-CH=CH-、-CH=N-CH=CH-、-CH=CH-N=CH-、CH=CH-CH=N-、-N=CH-N=CH-、-CH=N-CH=N-、-N=CH-CH=N-、-N=N-CH=CH-、-CH=CH-N=N-、-CH=CH-O-、-O-CH=CH-、-CH=CH-S-、-SCH=CH-、-C(R¹⁸)₂-C(R¹⁸)₂-O-、-O-C(R¹⁸)₂-C(R¹⁸)₂-、-C(R¹⁸)₂-C(R¹⁸)₂-S-、-S-C(R¹⁸)₂-C(R¹⁸)₂-、-O-C(R¹⁸)₂-O-、-O-C(R¹⁸)₂-C(R¹⁸)₂-O-、-S-C(R¹⁸)₂-S-、-S-C(R¹⁸)₂-C(R¹⁸)₂-S-、-CH=CH-NH-、-NH-CH=CH-、-C(R¹⁸)₂-C(R¹⁸)₂-NH-、-NH-C(R¹⁸)₂-C(R¹⁸)₂-、-N=CH-NH-、-NH-CH=N-、-NH-C(R¹⁸)₂-NH-、-O-CH=N-、-N=CHO-、-S-CH=N-、-N=CH-S-、-O-C(R¹⁸)₂-NH-、-NH-C(R¹⁸)₂-O-、-S-C(R¹⁸)₂-NH-、-NH-C(R¹⁸)₂-S-、-ON=CH-、-CH=N-O-、-S-N=CH-、-CH=N-S-、-O-NH-C(R¹⁸)₂-、-C(R¹⁸)₂-NH-O-、-S-NH-C(R¹⁸)₂-、-C(R¹⁸)₂-NH-S-、-NH-N=CH-、-CH=N-NH-、-NH-NH-C(R¹⁸)₂-、-C(R¹⁸)₂-NH-NH-、-N=N-NH-又は-NH-N=N-心意気[ここで、R¹⁸は水素又は(C₁-C₆)アルキル]を形成することができる。

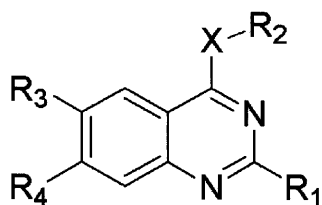
30

40

【0029】

前記化学式1で表示されるキナゾリン化合物の中でも望ましいのは次の化学式1-1で表示される化合物である。

[化学式1-1]



前記化学式 1-1 で、

Xは直接結合であるか、O、S、SO、SO₂又はNR⁵から選択されて、R⁵は水素、(C₁-C₆)アルキル、アリール、アリール-(C₁-C₆)アルキル、(C₃-C₇)シクロアルキル、(C₃-C₇)シクロアルキル-(C₁-C₆)アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリール-(C₁-C₆)アルキル、ヘテロシクリル又はヘテロシクリル-(C₁-C₆)アルキルの基で、R₁は水素、(C₁-C₈)アルキル、ハロゲノ-(C₁-C₆)アルキル、ヒドロキシ-(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)アルコキシ-(C₁-C₆)アルキル、アミノ-(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)アルキルアミノ-(C₁-C₆)アルキル、ジ-[(C₁-C₆)アルキル]アミノ-(C₁-C₆)アルキル及び(C₁-C₆)アルキルスルフィニルの中から選択された置換基、又は化学式-X¹-Q¹[ここで、X¹は直接結合であるか、O、S又はNR⁵]から選択されて、Q¹はR⁵と等しいか相異なる置換基から選択されることができ、

そして、ここでR₁基内での(C₂-C₆)アルキレン基で隣接炭素原子はO、S及びN(R⁵)から選択された基の挿入によって分離させることができ、ここでR₁基内での任意のCH₂又はCH₃基それぞれのCH₂又はCH₃基から1以上のハロゲノ、(C₁-C₆)アルキル置換基、ヒドロキシ、アミノ、(C₁-C₆)アルコキシ(C₁-C₆)アルキルチオ、(C₁-C₆)アルキルスルフィニル、(C₁-C₆)アルキルアミノ及びジ-[(C₁-C₆)アルキル]アミノから選択された置換基を含むことができ、

ここでR₁の置換体内での任意のアリール、ヘテロアリール又はヘテロシクリル基は0ないし3個の置換基を含むことができ、この置換基は等しいか相異なっていることができ、ハロゲノ、ヒドロキシ、アミノ、(C₁-C₆)アルキル、アリール、アリール-(C₁-C₆)アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリール-(C₁-C₆)アルキル、ヘテロシクリル又はヘテロシクリル-(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)アルコキシ、(C₁-C₆)アルキルチオ(C₁-C₆)アルキルスルフィニルの中から選択された置換基を含むことができ、

そして、ここでR₁の置換体内でヘテロシクリル基は1又は2個のオクソ又はチオキソ置換基を含むことができ、R₂は水素、(C₁-C₁₈)アルキル、(C₂-C₈)アルケニル、ハロゲノ-(C₁-C₈)アルキル、ヒドロキシ-(C₁-C₈)アルキル、(C₁-C₈)アルコキシ-(C₁-C₈)アルキル、アミノ-(C₁-C₈)アルキル、(C₁-C₈)アルキルアミノ-(C₁-C₈)アルキル、ジ-[(C₁-C₈)アルキル]アミノ-(C₁-C₈)アルキル、(C₁-C₈)アルキルスルフィニル、アリール、アリール-(C₁-C₈)アルキル、(C₃-C₇)シクロアルキル、(C₃-C₇)シクロアルキル-(C₁-C₈)アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリール-(C₁-C₈)アルキル、ヘテロシクリル及びヘテロシクリル-(C₁-C₈)アルキル中の置換基から選択されることができ、

そして、ここでR₂基内での(C₂-C₆)アルキレン基で隣接炭素原子はO、S、N(R⁵)、CO、CH(OR⁵)、CON(R⁵)、N(R⁵)CO、SO₂N(R⁵)、N(R⁵)SO₂及びCH=CHから選択された基の挿入によって分離させることができ、

ここでR₂基内での任意のCH₂又はCH₃基はそれぞれのCH₂又はCH₃基から1以上のハロゲノ、(C₁-C₆)アルキル置換基、ヒドロキシ、シアノ、アミノ、カルボキシル、カルバモイル、(C₁-C₆)アルコキシ(C₁-C₆)アルキルチオ及び(C₁-C₆)アルキルスルフィニル、(C₁-C₆)アルキルアミノ、ジ-[(C₁-C₆)アル

キル]アミノ、 (C_1-C_6) アルコキシカルボニル、 $N-(C_1-C_6)$ アルキルカルバモイル、 N 、 N -ジ- $[(C_1-C_6)$ アルキル]カルバモイル、アリール、アリール- (C_1-C_6) アルキル、 (C_3-C_7) シクロアルキル、 (C_3-C_7) シクロアルキル- (C_1-C_6) アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリール- (C_1-C_6) アルキル、ヘテロシクリル及びヘテロシクリル- (C_1-C_6) アルキル基の中から選択された置換基を含むことができ、

ここで R_2 の置換体内での任意のアリール、ヘテロアリール又はヘテロシクリル基は1ないし3個の置換基を含むことができ、この置換基は等しいか相異なっていることができ、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、カルボキシル、カルバモイル、 (C_1-C_6) アルキル、アリール、アリール- (C_1-C_6) アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリール- (C_1-C_6) アルキル、ヘテロシクリル又はヘテロシクリル- (C_1-C_6) アルキル、 (C_2-C_8) アルケニル、 (C_2-C_8) アルキニル、 (C_1-C_6) アルコキシ、 (C_1-C_6) アルキルチオ、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル、 (C_1-C_6) アルキルアミノ、ジ- $[(C_1-C_6)$ アルキル]アミノ、 (C_1-C_6) アルコキシカルボニル、 $N-(C_1-C_6)$ アルキルカルバモイル及び N 、 N -ジ- $[(C_1-C_6)$ アルキル]カルバモイルから選択された置換基を含むことができ、

そして、ここで R_2 の置換体内でヘテロシクリル基は1又は2個のオクソ又はチオキソ置換基を含むことができ、そして R_2 基内での任意のアリール、ヘテロアリール又はヘテロシクリル基の等しいか相異なっている置換基は互いに結合して化学式 $CH=CH-CH=CH-$ 、 $-N=CH-CH=CH-$ 、 $-CH=N-CH=CH-$ 、 $-CH=CH-N=CH-$ 、 $CH=CH-CH=N-$ 、 $-N=CH-N=CH-$ 、 $-CH=N-CH=N-$ 、 $-N=CH-CH=N-$ 、 $-CH=CH-O-$ 、 $-O-CH=CH-$ 、 $-CH=CH-S-$ 、 $-S-CH=CH-$ 、 $-C(R^6)_2-C(R^6)_2-O-$ 、 $-O-C(R^6)_2-C(R^6)_2-$ 、 $-C(R^6)_2-C(R^6)_2-S-$ 、 $-S-C(R^6)_2-C(R^6)_2-$ 、 $-O-C(R^6)_2-O-$ 、 $-O-C(R^6)_2-C(R^6)_2-O-$ 、 $-S-C(R^6)_2-S-$ 、 $-S-C(R^6)_2-C(R^6)_2-S-$ 、 $-CH=CH-NH-$ 、 $-NH-CH=CH-$ 、 $-C(R^6)_2-C(R^6)_2-NH-$ 、 $-NH-C(R^6)_2-C(R^6)_2-$ 、 $-N=CHNH-$ 、 $-NH-CH=N-$ 、 $-NH-C(R^6)_2-NH-$ 、 $-O-CH=N-$ 、 $-N=CH-O-$ 、 $-S-CH=N-$ 、 $-N=CH-S-$ 、 $-O-C(R^6)_2-NH-$ 、 $-NHC(R^6)_2-O-$ 、 $-S-C(R^6)_2-NH-$ 、 $-NH-C(R^6)_2-S-$ 、 $-N=N-NH-$ 又は $-NH-N=N-$ の基[ここで、 R_6 は水素又は (C_1-C_3) アルキル基]を形成することができ、

R_3 及び R_4 はそれぞれ等しいか相異なっていることができ、水素、ハロゲノ、トリフルオロメチル、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、メルカプト、アミノ、ホルミル、カルボキシル、カルバモイル、 (C_1-C_6) アルキル、 (C_2-C_6) アルケニル、 (C_2-C_6) アルコキシ、 (C_1-C_6) アルキルチオ、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル、 (C_1-C_6) アルキルアミノ、ジ- $[(C_1-C_6)$ アルキル]アミノ、 (C_1-C_6) アルコキシカルボニル、 $N-(C_1-C_6)$ アルキルカルバモイル、 N 、 N -ジ- $[(C_1-C_6)$ アルキル]カルバモイル、アリール、アリール- (C_1-C_6) アルキル、 (C_3-C_7) シクロアルキル、 (C_3-C_7) シクロアルキル- (C_1-C_6) アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリール- (C_1-C_6) アルキル、ヘテロシクリル又はヘテロシクリル- (C_1-C_6) アルキル基から選択されることができ、

ここで R_3 及び R_4 置換基内での任意の CH_2 又は CH_3 基それぞれの CH_2 又は CH_3 基から1以上のハロゲノ、ヒドロキシ、アミノ、カルボキシル、カルバモイル、 (C_1-C_6) アルコキシ、 (C_1-C_6) アルキルチオ、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル、 (C_1-C_6) アルキルアミノ、ジ- $[(C_1-C_6)$ アルキル]アミノ、 (C_1-C_6) アルコキシカルボニル、 $N-(C_1-C_6)$ アルキルカルバモイル、 N 、 N -ジ- $[(C_1-C_6)$ アルキル]カルバモイル、アリール、アリール- (C_1-C_6) アルキル、 (C_3-C_7) シクロアルキル、 (C_3-C_7) シクロアルキル- (C_1-C_6) アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリール- (C_1-C_6) アルキル、ヘテロシクリル及びヘテロシクリル- (C_1-C_6) アルキル基の中から選択される置換基を含むことができ、

ここで R_3 及び R_4 機内での任意のアリール、ヘテロアリール又はヘテロシクリル基は

10

20

30

40

50

1、2又は3個の置換基を含むことができ、この置換基は等しいか相異なっていることができるしハロゲン、トリフルオロメチル、ニトロ、ヒドロキシ、アミノ、(C₁-C₆)アルコキシ、(C₁-C₆)アルキルチオ、(C₁-C₆)アルキルアミノ、ジ-[(C₁-C₆)アルキル]アミノ、(C₁-C₆)アルコキシカルボニル、N-(C₁-C₆)アルキルカルバモイル及びN、N-ジ-[(C₁-C₆)アルキル]カルバモイル基から選択される置換基を含むことができ、

ここでR₃及びR₄の置換体内でヘテロシクリル基は1又は2個のオクソ又はチオキノ置換基を含むことができる。

【0030】

前記化学式1-1で表示されるキナゾルリノ化合物において、より望ましくは次のようである。

10

【0031】

前記XはO、S又はNR₅で、R₁は水素原子、C₁-C₆アルキル基、C₁-C₄ハロアルキル基、C₁-C₆アルキルヒドロキシ、C₁-C₆アルキルスルファニル基、フェニル基、フェニルC₁-C₈アルキル基、ピリジン基、フラノ基、チオフェノ基、C₃-C₇シクロアルキル基、ピロリジン基、ピペリジン基、モルホリン基、又はN-(C₁-C₆)アルキルピペラジン基で、R₂はC₁-C₁₈アルキル基、C₂-C₈ハロアルキル基、C₃-C₇シクロアルキル基、(C₃-C₇)シクロアルキルC₁-C₈アルキル基、C₂-C₈アルケニルギ、(C₃-C₇)サクロアルケニルC₁-C₈アルキル基、(C₁-C₈)アルキルC₁-C₈アルコキシアルキルギ、C₁-C₈のヒドロキシアルキル、ヒドロキシ-(C₁-C₈)アルキル-(C₁-C₈)アルコキシアルキル基、フェニル基、フェニルC₁-C₈アルキル基、ジ-フェニルC₁-C₈アルキル基、フェニルC₁-C₈アルキルヒドロキシ、フェニルC₁-C₈アルキル基、ピペリジンC₁-C₈アルキル基、N-[フェニル-(C₁-C₆)アルキル]ピペリジン基、N-(C₁-C₆)アルキルピペリジンC₁-C₈アルキル基、ピロリジンN-(C₁-C₈)アルキル基、ナフタリンC₁-C₈アルキル基、モルホリンC₁-C₈アルキル基、ピペラジンC₁-C₈アルキル基、N-(C₁-C₆)アルキルピペラジンC₁-C₈アルキル基、ピリジンC₁-C₈アルキル基、ピロリジンC₁-C₈アルキル基、N-(C₁-C₆)アルキルピロリジンC₁-C₈アルキル基、チオフェンC₁-C₈アルキル基又はベンゾジオキサールC₁-C₈アルキル基、R₃及びR₄はそれぞれ水素原子、ニトロ基、又はC₁-C₈アルコキシ基で、R₅は水素原子、C₁-C₄アルキル基又はC₁-C₈のヒドロキシアルキルで、そして、前記C₃-C₇シクロアルキル、フェニル、ピペリジン、ナフタリン、モルホリン、ピリジン、ピロリジン、ピロリジノン、ピペラジン、チオフェン、及びベンゾジオキサールの中から選択された置換基はC₁-C₈アルキル基、ハロゲン原子、ヒドロキシ、C₁-C₈アルコキシ基、ニトロ基、及びトリフルオロメチル基の中から選択された置換基が1ないし3個置換された化合物の場合である。

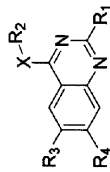
20

30

前記化学式1-1に表示される化合物を具体的に表1-1～表1-13に例示する。

[表1-1]

化合物番号	X	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
1	NH	フェニル	2- (2-ヒドロキシ-エトキシ) -メチル	H	H
2	NH	トリクロロメチル	イソプロピル	H	H
3	NH	トリクロロメチル	イソプロピル	H	H
4	NH	トリクロロメチル	2-ピペリジノ-1-ylメチル	H	H
5	NH	トリクロロメチル	1-フェニルメチル	H	H
6	NH	トリクロロメチル	4-フェニルブチル	H	H
7	NH	トリクロロメチル	n-プロピル	H	H
8	NH	エチルスルファニル	イソプロピル	H	H
9	NH	エチルスルファニル	3-フルオロベンジル	H	H
10	NH	エチルスルファニル	2- (3-フルオロフェニル) -メチル	H	H
11	NH	エチルスルファニル	2-モルホリノ-4-ylメチル	H	H
12	NH	エチルスルファニル	2- (3-トリフルオロメチル-フェニル) -メチル	H	H
13	NH	H	フェニル	ニトロ	H
14	NH	H	ナフタレノ-1-ylメチル	エトキシ	エトキシ
15	NH	H	3-モルホリノ-4-ylプロピル	エトキシ	エトキシ
16	NH	H	アリル	エトキシ	エトキシ
17	NH	H	2-ピリジノ-2-ylメチル	エトキシ	エトキシ
18	NH	H	4-クロロベンジル	エトキシ	エトキシ
19	NH	エチルスルファニル	n-ブチル	H	H
20	NH	エチルスルファニル	Sec-ブチル	H	H
21	NH	エチルスルファニル	イソブチル	H	H
22	NH	エチルスルファニル	ベンジル	H	H
23	NH	エチルスルファニル	1-フェニルメチル	H	H
24	NH	エチルスルファニル	3-メトキシベンジル	H	H
25	NH	エチルスルファニル	4-メトキシベンジル	H	H



[表 1 - 2]

10

20

30

40

26	NH	エチルスルファニル	3-トリフルオロメチル	H	H
27	NH	エチルスルファニル	シクロヘキシル	H	H
28	NH	エチルスルファニル	シクロペンチル	H	H
29	NH	エチルスルファニル	フェネチル	H	H
30	NH	エチルスルファニル	4-フェニルブチル	H	H
31	NH	エチルスルファニル	n-プロピル	H	H
32	NH	エチルスルファニル	3-フェニルプロピル	H	H
33	NH	エチルスルファニル	3-イソプロポキシ-プロピル	H	H
34	NH	エチルスルファニル	2-メトキシ-メチル	H	H
35	NH	エチルスルファニル	ナフタレノ-1-ylメチル	H	H
36	NH	エチルスルファニル	3-モルホリノ-4-ylプロピル	H	H
37	NH	エチルスルファニル	ベンゾ[1,3]ジオキソール-5-ylメチル	H	H
38	NH	エチルスルファニル	3,5-ジメトキシベンジル	H	H
39	NH	エチルスルファニル	2-フルオロベンジル	H	H
40	NH	エチルスルファニル	1-メトキシメチルプロピル	H	H
41	NH	エチルスルファニル	1-ベンジル-ピペリジノ-4-yl	H	H
42	NH	エチルスルファニル	アリル	H	H
43	NH	エチルスルファニル	n-ヘキサデシル	H	H
44	NH	エチルスルファニル	2-ピペリジノ-1-ylメチル	H	H
45	NH	エチルスルファニル	2-ピロリジノ-1-ylメチル	H	H
46	NH	エチルスルファニル	2-ピロリジノ-2-ylメチル	H	H
47	NH	エチルスルファニル	2-エタノール	H	H
48	NH	エチルスルファニル	3-(2-メチル-ピペリジノ-1-yl)-プロピル	H	H
49	NH	エチルスルファニル	2-クロロ-6-フルオロベンジル	H	H
50	NH	エチルスルファニル	2-(2-ヒドロキシ-エトキシ)-メチル	H	H
51	NH	フェニル	シクロヘキシル	H	H
52	NH	フェニル	4-フェニルブチル	H	H
53	NH	フェニル	5-フェニル-ペンチル	H	H
54	NH	フェニル	4-メチルベンジル	H	H
55	NH	フェニル	イソブチル	H	H
56	NH	フェニル	n-ブチル	H	H
57	NH	フェニル	ナフタレノ-1-ylメチル	H	H
58	NH	フェニル	ピロリジノ-2-ylメチル	H	H

10

20

30

40

59	NH	フェニル	thiopenyl-2-ylメチル	H	H
60	NH	フェニル	イソプロピル	H	H
61	NH	フェニル	n-プロピル	H	H
62	NH	フェニル	3-イソプロポキシプロピル	H	H
63	NH	フェニル	3-フルオロベンジル	H	H
64	NH	フェニル	2-(3-トリフルオロメチル-フェニル)-メチル	H	H
65	NH	フェニル	ベンジル[1,3]ジオキソール-5-ylメチル	H	H
66	NH	フェニル	3-トリフルオロメチルベンジル	H	H
67	NH	フェニル	2-メトキシメチル	H	H
68	NH	フェニル	フェネチル	H	H
69	NH	フェニル	フェニル	H	H
70	NH	フェニル	4-メトキシフェニル	H	H
71	NH	フェニル	o-tolyl	H	H
72	NH	フェニル	4-イソプロピル-フェニル	H	H
73	NH	フェニル	2,4-ジメチル-フェニル	H	H
74	NH	フェニル	4-n-アンチシル-フェニル	H	H
75	NH	フェニル	4-メチル-フェニル	H	H
76	NH	フェニル	4-フルオロフェニル	H	H
77	NH	フェニル	2-メトキシフェニル	H	H
78	NH	フェニル	2,4,6-トリメチル-フェニル	H	H
79	NH	フェニル	4-n-ブチル-フェニル	H	H
80	NH	フェニル	2-フェノキシフェニル	H	H
81	NH	フェニル	3-フェノキシフェニル	H	H
82	NH	フェニル	4-フェノキシフェニル	H	H
83	NH	フェニル	3-プロモフェニル	H	H
84	NH	フェニル	2-メトキシ-5-フェノール	H	H
85	NH	フェニル	5-ヒドロキシペンタン-1-yl	H	H
86	NH	フェニル	ベンジル	H	H
87	NH	フェニル	1-フェニルメチル	H	H
88	NH	フェニル	4-クロロベンジル	H	H
89	NH	フェニル	3,4-ジクロロベンジル	H	H
90	NH	フェニル	3-メトキシベンジル	H	H
91	NH	フェニル	2-メトキシベンジル	H	H

[表 1 - 4]

10

20

30

40

9 2	NH	フェニル	3、5-ジメトキシベンジル	H	H
9 3	NH	フェニル	2、3-ジメトキシベンジル	H	H
9 4	NH	フェニル	2-フルオロベンジル	H	H
9 5	NH	フェニル	シクロペンチル	H	H
9 6	NH	フェニル	Sec-ブチル	H	H
9 7	NH	フェニル	アリル	H	H
9 8	NH	フェニル	2-トリフルオロメチルベンジル	H	H
9 9	NH	フェニル	n-ヘキサデシル	H	H
1 0 0	NH	フェニル	2-ピリジノ-1-ylメチル	H	H
1 0 1	NH	フェニル	2-ペリジノ-1-ylメチル	H	H
1 0 2	NH	フェニル	2-ピリジノ-2-ylメチル	H	H
1 0 3	NH	フェニル	2-(3-フルオロフェニル)-メチル	H	H
1 0 4	NH	フェニル	1-メトキシメチルプロピル	H	H
1 0 5	NH	フェニル	1-ベンジル-ピペリジノ-4-yl	H	H
1 0 6	NH	フェニル	2-ホルホルノ-4-ylメチル	H	H
1 0 7	NH	フェニル	2-(3、4-ジメトキシフェニル)-メチル	H	H
1 0 8	NH	フェニル	2、4-ジクロロベンジル	H	H
1 0 9	NH	フェニル	2-クロロベンジル	H	H
1 1 0	NH	フェニル	イソプロピル	H	H
1 1 1	NH	フェニル	ピリジノ-3-ylメチル	H	H
1 1 2	NH	フェニル	1-ヒドロキシ-プロパン-2-yl	H	H
1 1 3	NH	フェニル	(4-ヒドロキシ-3-メトキシフェニル)-メチル	H	H
1 1 4	NH	フェニル	2-フルオロ-メチル	H	H
1 1 5	NH	フェニル	2、3-ジクロロベンジル	H	H
1 1 6	NH	フェニル	3-ニトロベンジル	H	H
1 1 7	NH	フェニル	1-メチル-ピリジノ-2-ylメチル	H	H
1 1 8	NH	フェニル	3、4-ジメトキシベンジル	H	H
1 1 9	NH	フェニル	2-p-tolylメチル	H	H
1 2 0	NH	フェニル	2-(3-メトキシフェニル)-メチル	H	H
1 2 1	NH	フェニル	1-メチルプロピル	H	H
1 2 2	NH	フェニル	2-(2、5-ジメトキシフェニル)-メチル	H	H
1 2 3	NH	フェニル	2-(4-クロロフェニル)-メチル	H	H
1 2 4	NH	フェニル	2-(4-メトキシフェニル)-メチル	H	H

[表 1 - 5]

10

20

30

40

125	NH	フェニル	1、3-ジメチルブチル	H	H
126	NH	フェニル	2- (3-クロロフェニル) -メチル	H	H
127	NH	フェニル	2- (2、4-ジクロロフェニル) -メチル	H	H
128	NH	フェニル	2- (3、4-ジフルオロフェニル) -メチル	H	H
129	NH	フェニル	3、4、5-トリメトキシベンジル	H	H
130	NH	フェニル	3-メチルブチル	H	H
131	NH	フェニル	2-シクロヘキサ-1-エニルメチル	H	H
132	NH	フェニル	シクロヘキサメチル	H	H
133	NH	フェニル	2、2-ジフェニルメチル	H	H
134	NH	フェニル	2、4-ジフルオロベンジル	H	H
135	NH	フェニル	2、5-ジフルオロベンジル	H	H
136	NH	フェニル	3、3-ジフェニルプロピル	H	H
137	NH	フェニル	2- (4-ブromoフェニル) -メチル	H	H
138	NMe	フェニル	n-ブチル	H	H
139	NH	フェニル	4-トリフルオロメチルベンジル	H	H
140	NH	フェニル	2- (2-フルオロフェニル) -メチル	H	H
141	NH	フェニル	ピリジノ-4-ylメチル	H	H
142	NH	フェニル	ピリジノ-2-ylメチル	H	H
143	NH	フェニル	2、3-ジメチルシクロヘキシル	H	H
144	NH	フェニル	2、4-ジメトキシベンジル	H	H
145	NH	フェニル	3-クロロベンジル	H	H
146	NH	フェニル	2-ヒドロキシ-2-フェニルメチル	H	H
147	NH	フェニル	2、5-ジメトキシベンジル	H	H
148	NH	フェニル	4-ブromoベンジル	H	H
149	NH	フェニル	2- (3、4-ジクロロフェニル) -メチル	H	H
150	NH	フェニル	3- (2-オクソ-ピリジノ-1-yl) -プロパン-1-yl	H	H
151	NH	フェニル	2- (2-クロロフェニル) -メチル	H	H
152	NH	フェニル	2- (2-ヒドロキシフェニル) -メチル	H	H
153	NH	フェニル	3-ブromoベンジル	H	H
154	NH	フェニル	2、6-ジメトキシベンジル	H	H
155	NH	フェニル	2-ブromoベンジル	H	H
156	NH	フェニル	3-ホルリノ-4-ylプロピル	H	H
157	N-n-Bu	フェニル	2-ヒドロキシ-メチル	H	H

[表 1 - 6]

10

20

30

40

158	NH	フェニル	2-(4-メチルpipeRazino-1-yl)-メチル	H	H
159	NMe	フェニル	シクロペンチル	H	H
160	NH	フェニル	2-pipeRazino-1-ylメチル	H	H
161	NH	フェニル	0-(4-ニトロベンジル)-ヒドロキシ]	H	H
162	NH	フェニル	4-クロロフェニル	H	H
163	NH	メチル	ベンジル	H	H
164	NH	メチル	3-メトキシベンジル	H	H
165	NH	メチル	4-メトキシベンジル	H	H
166	NH	メチル	3-トリフルオロメチルベンジル	H	H
167	NH	メチル	フェネチル	H	H
168	NH	メチル	4-フェニルブチル	H	H
169	NH	メチル	ナフタレノ-1-ylメチル	H	H
170	NH	メチル	ベンゾ[1,3]ジオキソール-5-ylメチル	H	H
171	NH	メチル	3-フルオロベンジル	H	H
172	NH	メチル	2-(3-フルオロフェニル)-メチル	H	H
173	NH	メチル	2-(2-ヒドロキシ-エトキシ)-メチル	H	H
174	NH	メチル	2-ヒドロキシ-メチル	H	H
175	NH	イソプロピル	ベンジル	H	H
176	NH	イソプロピル	3-メトキシベンジル	H	H
177	NH	イソプロピル	4-メトキシベンジル	H	H
178	NH	イソプロピル	3-トリフルオロメチルベンジル	H	H
179	NH	イソプロピル	フェネチル	H	H
180	NH	イソプロピル	4-フェニルブチル	H	H
181	NH	イソプロピル	ナフタレノ-1-ylメチル	H	H
182	NH	イソプロピル	ベンゾ[1,3]ジオキソール-5-ylメチル	H	H
183	NH	イソプロピル	3-フルオロベンジル	H	H
184	NH	イソプロピル	2-(3-フルオロフェニル)-メチル	H	H
185	NH	イソプロピル	2-(2-ヒドロキシ-エトキシ)-メチル	H	H
186	NH	イソプロピル	2-ヒドロキシ-メチル	H	H
187	NH	tert-ブチル	ベンジル	H	H
188	NH	tert-ブチル	3-メトキシベンジル	H	H
189	NH	tert-ブチル	4-メトキシベンジル	H	H
190	NH	tert-ブチル	3-トリフルオロメチルベンジル	H	H

[表 1 - 7]

10

20

30

40

191	NH	teRt-ブチル	フェネチル	H	H
192	NH	teRt-ブチル	4-フェニルブチル	H	H
193	NH	teRt-ブチル	ナフタレノ-1-ylメチル	H	H
194	NH	teRt-ブチル	ベンゾ[1,3]ジオキソール-5-ylメチル	H	H
195	NH	teRt-ブチル	3-フルオロベンジル	H	H
196	NH	teRt-ブチル	2-(3-フルオロフェニル)-メチル	H	H
197	NH	teRt-ブチル	2-(2-ヒドロキシ-エトキシ)-メチル	H	H
198	NH	teRt-ブチル	2-ヒドロキシ-メチル	H	H
199	NH	シクロヘキシル	ベンジル	H	H
200	NH	シクロヘキシル	3-メトキシベンジル	H	H
201	NH	シクロヘキシル	4-メトキシベンジル	H	H
202	NH	シクロヘキシル	3-トリフルオロメチルベンジル	H	H
203	NH	シクロヘキシル	フェネチル	H	H
204	NH	シクロヘキシル	4-フェニルブチル	H	H
205	NH	シクロヘキシル	ナフタレノ-1-ylメチル	H	H
206	NH	シクロヘキシル	ベンゾ[1,3]ジオキソール-5-ylメチル	H	H
207	NH	シクロヘキシル	3-フルオロベンジル	H	H
208	NH	シクロヘキシル	2-(3-フルオロフェニル)-メチル	H	H
209	NH	シクロヘキシル	2-(2-ヒドロキシ-エトキシ)-メチル	H	H
210	NH	シクロヘキシル	2-ヒドロキシ-メチル	H	H
211	NH	ベンジル	ベンジル	H	H
212	NH	ベンジル	3-メトキシベンジル	H	H
213	NH	ベンジル	4-メトキシベンジル	H	H
214	NH	ベンジル	3-トリフルオロメチルベンジル	H	H
215	NH	ベンジル	フェネチル	H	H
216	NH	ベンジル	4-フェニルブチル	H	H
217	NH	ベンジル	ナフタレノ-1-ylメチル	H	H
218	NH	ベンジル	ベンゾ[1,3]ジオキソール-5-ylメチル	H	H
219	NH	ベンジル	3-フルオロベンジル	H	H
220	NH	ベンジル	2-(3-フルオロフェニル)-メチル	H	H
221	NH	ベンジル	2-(2-ヒドロキシ-エトキシ)-メチル	H	H
222	NH	ベンジル	2-ヒドロキシ-メチル	H	H
223	NH	ヒリジノ-2-yl	ベンジル	H	H

[表 1 - 8]

10

20

30

2 2 4	NH	ポリジノ-2-yl	3-メトキシベンジル	H	H
2 2 5	NH	ポリジノ-2-yl	4-メトキシベンジル	H	H
2 2 6	NH	ポリジノ-2-yl	3-トリフルオロメチルベンジル	H	H
2 2 7	NH	ポリジノ-2-yl	フェネチル	H	H
2 2 8	NH	ポリジノ-2-yl	4-フェニルブチル	H	H
2 2 9	NH	ポリジノ-2-yl	ナフタレノ-1-ylメチル	H	H
2 3 0	NH	ポリジノ-2-yl	ベンゾ[1, 3]ジオキサール-5-ylメチル	H	H
2 3 1	NH	ポリジノ-2-yl	3-フルオロベンジル	H	H
2 3 2	NH	ポリジノ-2-yl	2- (3-フルオロフェニル) -メチル	H	H
2 3 3	NH	ポリジノ-2-yl	2- (2-ヒドロキシ-エトキシ) -メチル	H	H
2 3 4	NH	ポリジノ-2-yl	2-ヒドロキシ-メチル	H	H
2 3 5	NH	ポリジノ-3-yl	ベンジル	H	H
2 3 6	NH	ポリジノ-3-yl	3-メトキシベンジル	H	H
2 3 7	NH	ポリジノ-3-yl	4-メトキシベンジル	H	H
2 3 8	NH	ポリジノ-3-yl	3-トリフルオロメチルベンジル	H	H
2 3 9	NH	ポリジノ-3-yl	フェネチル	H	H
2 4 0	NH	ポリジノ-3-yl	4-フェニルブチル	H	H
2 4 1	NH	ポリジノ-3-yl	ナフタレノ-1-ylメチル	H	H
2 4 2	NH	ポリジノ-3-yl	ベンゾ[1, 3]ジオキサール-5-ylメチル	H	H
2 4 3	NH	ポリジノ-3-yl	3-フルオロベンジル	H	H
2 4 4	NH	ポリジノ-3-yl	2- (3-フルオロフェニル) -メチル	H	H
2 4 5	NH	ポリジノ-3-yl	2- (2-ヒドロキシ-エトキシ) -メチル	H	H
2 4 6	NH	ポリジノ-3-yl	2-ヒドロキシ-メチル	H	H
2 4 7	NH	ポリジノ-4-yl	ベンジル	H	H
2 4 8	NH	ポリジノ-4-yl	3-メトキシベンジル	H	H
2 4 9	NH	ポリジノ-4-yl	4-メトキシベンジル	H	H
2 5 0	NH	ポリジノ-4-yl	3-トリフルオロメチルベンジル	H	H
2 5 1	NH	ポリジノ-4-yl	フェネチル	H	H
2 5 2	NH	ポリジノ-4-yl	4-フェニルブチル	H	H
2 5 3	NH	ポリジノ-4-yl	ナフタレノ-1-ylメチル	H	H
2 5 4	NH	ポリジノ-4-yl	ベンゾ[1, 3]ジオキサール-5-ylメチル	H	H
2 5 5	NH	ポリジノ-4-yl	3-フルオロベンジル	H	H
2 5 6	NH	ポリジノ-4-yl	2- (3-フルオロフェニル) -メチル	H	H

257	NH	ピリジノ-4-yl	2-(2-ヒドロキシ-エトキシ)-メチル	H	H
258	NH	ピリジノ-4-yl	2-ヒドロキシ-メチル	H	H
259	NH	4-クロロフェニル	ベンジル	H	H
260	NH	4-クロロフェニル	3-メトキシベンジル	H	H
261	NH	4-クロロフェニル	4-メトキシベンジル	H	H
262	NH	4-クロロフェニル	3-トリフルオロメチルベンジル	H	H
263	NH	4-クロロフェニル	フェネチル	H	H
264	NH	4-クロロフェニル	4-フェニルブチル	H	H
265	NH	4-クロロフェニル	ナフタレノ-1-ylメチル	H	H
266	NH	4-クロロフェニル	ベンゾ[1,3]ジオキサソール-5-ylメチル	H	H
267	NH	4-クロロフェニル	3-フルオロベンジル	H	H
268	NH	4-クロロフェニル	2-(3-フルオロフェニル)-メチル	H	H
269	NH	4-クロロフェニル	2-(2-ヒドロキシ-エトキシ)-メチル	H	H
270	NH	4-クロロフェニル	2-ヒドロキシ-メチル	H	H
271	NH	イソプロピル	2,4-ジメトキシベンジル	H	H
272	NH	ベンジル	2,4-ジメトキシベンジル	H	H
273	0	フェニル	2,4-ジメトキシベンジル	H	H
274	S	フェニル	2,4-ジメトキシベンジル	H	H
275	NH	ピペリジノ-1-yl	2-メトキシベンジル	H	H
276	NH	ピペリジノ-1-yl	2-メトキシベンジル	H	H
277	NH	モルホリノ-4-yl	2-メトキシベンジル	H	H
278	NH	4-メチルパイペラジノ-1	2-メトキシベンジル	H	H
279	NH	ピペリジノ-1-yl	3-メトキシベンジル	H	H
280	NH	ピペリジノ-1-yl	3-メトキシベンジル	H	H
281	NH	モルホリノ-4-yl	3-メトキシベンジル	H	H
282	NH	4-メチルパイペラジノ-1	3-メトキシベンジル	H	H
283	NH	ピペリジノ-1-yl	4-メトキシベンジル	H	H
284	NH	ピペリジノ-1-yl	4-メトキシベンジル	H	H
285	NH	モルホリノ-4-yl	4-メトキシベンジル	H	H
286	NH	4-メチルパイペラジノ-1	4-メトキシベンジル	H	H
287	NH	ピペリジノ-1-yl	2,3-ジメトキシベンジル	H	H
288	NH	ピペリジノ-1-yl	2,3-ジメトキシベンジル	H	H
289	NH	モルホリノ-4-yl	2,3-ジメトキシベンジル	H	H

10

20

30

290	NH	4-メチルパイプR azino-1	2、3-ジメトキシベンジル	H	H
291	NH	ピロリジン-1-yl	2、4-ジメトキシベンジル	H	H
292	NH	ピペリジン-1-yl	2、4-ジメトキシベンジル	H	H
293	NH	モルホリノ-4-yl	2、4-ジメトキシベンジル	H	H
294	NH	4-メチルパイプR azino-1	2、4-ジメトキシベンジル	H	H
295	NH	ピロリジン-1-yl	2、5-ジメトキシベンジル	H	H
296	NH	ピペリジン-1-yl	2、5-ジメトキシベンジル	H	H
297	NH	モルホリノ-4-yl	2、5-ジメトキシベンジル	H	H
298	NH	4-メチルパイプR azino-1	2、5-ジメトキシベンジル	H	H
299	NH	ピロリジン-1-yl	3、4-ジメトキシベンジル	H	H
300	NH	ピペリジン-1-yl	3、4-ジメトキシベンジル	H	H
301	NH	モルホリノ-4-yl	3、4-ジメトキシベンジル	H	H
302	NH	4-メチルパイプR azino-1	3、4-ジメトキシベンジル	H	H
303	NH	ピロリジン-1-yl	3、5-ジメトキシベンジル	H	H
304	NH	ピペリジン-1-yl	3、5-ジメトキシベンジル	H	H
305	NH	モルホリノ-4-yl	3、5-ジメトキシベンジル	H	H
306	NH	4-メチルパイプR azino-1	3、5-ジメトキシベンジル	H	H
307	NH	ピロリジン-1-yl	ベンゾ[1,3]ジオキサゾール-5-ylメチル	H	H
308	NH	ピペリジン-1-yl	ベンゾ[1,3]ジオキサゾール-5-ylメチル	H	H
309	NH	モルホリノ-4-yl	ベンゾ[1,3]ジオキサゾール-5-ylメチル	H	H
310	NH	4-メチルパイプR azino-1	ベンゾ[1,3]ジオキサゾール-5-ylメチル	H	H
311	NH	ピロリジン-1-yl	3、4、5-トリメトキシベンジル	H	H
312	NH	ピペリジン-1-yl	3、4、5-トリメトキシベンジル	H	H
313	NH	モルホリノ-4-yl	3、4、5-トリメトキシベンジル	H	H
314	NH	4-メチルパイプR azino-1	3、4、5-トリメトキシベンジル	H	H
315	NH	ピロリジン-1-yl	2、4、6-トリメトキシベンジル	H	H
316	NH	ピペリジン-1-yl	2、4、6-トリメトキシベンジル	H	H
317	NH	モルホリノ-4-yl	2、4、6-トリメトキシベンジル	H	H
318	NH	4-メチルパイプR azino-1	2、4、6-トリメトキシベンジル	H	H
319	NH	エトキシ	2、4-ジメトキシベンジル	H	H
320	NH	エトキシ	ベンゾ[1,3]ジオキサゾール-5-ylメチル	H	H
321	NH	イソプロピル	2-メトキシベンジル	H	H
322	NH	イソプロピル	2、3-ジメトキシベンジル	H	H

10

20

30

40

3 2 3	NH	イソプロピル		3, 5-ジメトキシベンジル	H	H
3 2 4	NH	イソプロピル		3, 4-ジメトキシベンジル	H	H
3 2 5	NH	イソプロピル		3, 4, 5-トリメトキシベンジル	H	H
3 2 6	NH	イソプロピル		2, 5-ジメトキシベンジル	H	H
3 2 7	NH	イソプロピル		2, 4, 6-トリメトキシベンジル	H	H
3 2 8	NH	ベンジル		2-メトキシベンジル	H	H
3 2 9	NH	ベンジル		2, 3-ジメトキシベンジル	H	H
3 3 0	NH	ベンジル		3, 5-ジメトキシベンジル	H	H
3 3 1	NH	ベンジル		3, 4-ジメトキシベンジル	H	H
3 3 2	NH	ベンジル		3, 4, 5-トリメトキシベンジル	H	H
3 3 3	NH	ベンジル		2, 4-ジメトキシベンジル	H	H
3 3 4	NH	ベンジル		2, 5-ジメトキシベンジル	H	H
3 3 5	NH	ベンジル		2, 4, 6-トリメトキシベンジル	H	H
3 3 6	NH	フェニル		3, 4, 5-トリメトキシベンジル	H	H
3 3 7	NH	フェニル		2, 4, 6-トリメトキシベンジル	H	H
3 3 8	NH	fuRan-2-yl		2-メトキシベンジル	H	H
3 3 9	NH	fuRan-2-yl		3-メトキシベンジル	H	H
3 4 0	NH	fuRan-2-yl		4-メトキシベンジル	H	H
3 4 1	NH	fuRan-2-yl		ベンゾ[1, 3]ジオキソール-5-ylメチル	H	H
3 4 2	NH	fuRan-2-yl		2, 3-ジメトキシベンジル	H	H
3 4 3	NH	fuRan-2-yl		3, 5-ジメトキシベンジル	H	H
3 4 4	NH	fuRan-2-yl		3, 4-ジメトキシベンジル	H	H
3 4 5	NH	fuRan-2-yl		3, 4, 5-トリメトキシベンジル	H	H
3 4 6	NH	fuRan-2-yl		2, 4-ジメトキシベンジル	H	H
3 4 7	NH	fuRan-2-yl		2, 5-ジメトキシベンジル	H	H
3 4 8	NH	fuRan-2-yl		2, 4, 6-トリメトキシベンジル	H	H
3 4 9	NH	thiopenyl-2-yl		2-メトキシベンジル	H	H
3 5 0	NH	thiopenyl-2-yl		3-メトキシベンジル	H	H
3 5 1	NH	thiopenyl-2-yl		4-メトキシベンジル	H	H
3 5 2	NH	thiopenyl-2-yl		ベンゾ[1, 3]ジオキソール-5-ylメチル	H	H
3 5 3	NH	thiopenyl-2-yl		2, 3-ジメトキシベンジル	H	H
3 5 4	NH	thiopenyl-2-yl		3, 5-ジメトキシベンジル	H	H
3 5 5	NH	thiopenyl-2-yl		3, 4-ジメトキシベンジル	H	H

356	NH	thiopenyl-2-yl	3, 4, 5-トリメトキシベンジル	H	H
357	NH	thiopenyl-2-yl	2, 4-ジメトキシベンジル	H	H
358	NH	thiopenyl-2-yl	2, 5-ジメトキシベンジル	H	H
359	NH	thiopenyl-2-yl	2, 4, 6-トリメトキシベンジル	H	H
360	NH	メトキシフェニルメチル	2-メトキシベンジル	H	H
361	NH	メトキシフェニルメチル	3-メトキシベンジル	H	H
362	NH	メトキシフェニルメチル	4-メトキシベンジル	H	H
363	NH	メトキシフェニルメチル	ペンゾ[1, 3]ジオキソール-5-ylメチル	H	H
364	NH	メトキシフェニルメチル	2, 3-ジメトキシベンジル	H	H
365	NH	メトキシフェニルメチル	3, 5-ジメトキシベンジル	H	H
366	NH	メトキシフェニルメチル	3, 4-ジメトキシベンジル	H	H
367	NH	メトキシフェニルメチル	3, 4, 5-トリメトキシベンジル	H	H
368	NH	メトキシフェニルメチル	2, 4-ジメトキシベンジル	H	H
369	NH	メトキシフェニルメチル	2, 5-ジメトキシベンジル	H	H
370	NH	メトキシフェニルメチル	2, 4, 6-トリメトキシベンジル	H	H
371	NH	1-フェニルメチル	2-メトキシベンジル	H	H
372	NH	1-フェニルメチル	3-メトキシベンジル	H	H
373	NH	1-フェニルメチル	4-メトキシベンジル	H	H
374	NH	1-フェニルメチル	ペンゾ[1, 3]ジオキソール-5-ylメチル	H	H
375	NH	1-フェニルメチル	2, 3-ジメトキシベンジル	H	H
376	NH	1-フェニルメチル	3, 5-ジメトキシベンジル	H	H
377	NH	1-フェニルメチル	3, 4-ジメトキシベンジル	H	H
378	NH	1-フェニルメチル	3, 4, 5-トリメトキシベンジル	H	H
379	NH	1-フェニルメチル	2, 4-ジメトキシベンジル	H	H
380	NH	1-フェニルメチル	2, 5-ジメトキシベンジル	H	H
381	NH	1-フェニルメチル	2, 4, 6-トリメトキシベンジル	H	H
382	NH	イソプロピル	2-メトキシベンジル	H	H
383	NH	イソプロピル	3-メトキシベンジル	H	H
384	NH	イソプロピル	4-メトキシベンジル	H	H
385	NH	イソプロピル	ペンゾ[1, 3]ジオキソール-5-ylメチル	H	H
386	NH	イソプロピル	2, 3-ジメトキシベンジル	H	H
387	NH	イソプロピル	3, 5-ジメトキシベンジル	H	H
388	NH	イソプロピル	3, 4-ジメトキシベンジル	H	H

389	NH	イソプロピル	3、4、5-トリメトキシベンジル	H	H	H
390	NH	イソプロピル	2、4-ジメトキシベンジル	H	H	H
391	NH	イソプロピル	2、5-ジメトキシベンジル	H	H	H
392	NH	イソプロピル	2、4、6-トリメトキシベンジル	H	H	H
393	NH	n-プロピル	2-メトキシベンジル	H	H	H
394	NH	n-プロピル	3-メトキシベンジル	H	H	H
395	NH	n-プロピル	4-メトキシベンジル	H	H	H
396	NH	n-プロピル	ベンゾ[1,3]ジオキソール-5-ylメチル	H	H	H
397	NH	n-プロピル	2、3-ジメトキシベンジル	H	H	H
398	NH	n-プロピル	3、5-ジメトキシベンジル	H	H	H
399	NH	n-プロピル	3、4-ジメトキシベンジル	H	H	H
400	NH	n-プロピル	3、4、5-トリメトキシベンジル	H	H	H
401	NH	n-プロピル	2、4-ジメトキシベンジル	H	H	H
402	NH	n-プロピル	2、5-ジメトキシベンジル	H	H	H
403	NH	n-プロピル	2、4、6-トリメトキシベンジル	H	H	H
404	NH	H	2-メトキシベンジル	H	H	H
405	NH	H	3-メトキシベンジル	H	H	H
406	NH	H	4-メトキシベンジル	H	H	H
407	NH	H	ベンゾ[1,3]ジオキソール-5-ylメチル	H	H	H
408	NH	H	2、3-ジメトキシベンジル	H	H	H
409	NH	H	3、5-ジメトキシベンジル	H	H	H
410	NH	H	3、4-ジメトキシベンジル	H	H	H
411	NH	H	3、4、5-トリメトキシベンジル	H	H	H
412	NH	H	2、4-ジメトキシベンジル	H	H	H
413	NH	H	2、5-ジメトキシベンジル	H	H	H
414	NH	H	2、4、6-トリメトキシベンジル	H	H	H
415	0	イソプロピル	ベンジル	H	H	H
416	S	イソプロピル	ベンジル	H	H	H

【0032】

本発明による前記化学式1に表示される化合物は薬剤学的に許容可能な塩を形成することもできるので、例えば塩酸塩、硫酸塩、リン酸塩、二リン酸塩、ブロム化水素塩及び窒酸塩のような無機酸との塩、又はリンゴ酸、マレイン酸、フマル酸、酒石酸塩、琥珀酸、クエン酸、アセテート、乳酸塩、メタンスルホン酸、p-トルエンスルホン酸、パルミテート、サリチル酸及びステアリン酸のような有機酸と塩を含む。

【0033】

本発明の化合物の一部は水性及び有機溶媒のような溶媒から結晶化されるか又は再結晶化されることができる。この場合、溶媒化物が形成されることができる。凍結乾燥のような方法で製造可能な多様な量の水含有化合物以外に水化物を含めた化学両論的溶媒化物も

本発明の範囲に属する。

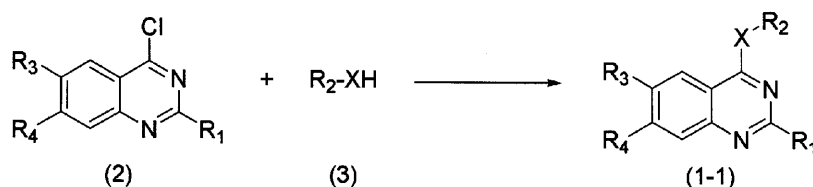
【0034】

前記化学式 1 に表示される化合物は鏡状上異性体、立体異性体又は相互変異性体であるかも知れない。相異なる異性体は通常の方法によって分離又は分解されるか、又は任意の所定の異性体は通常の方法によって又は立体特異的又は非対称的合成によって修得することができる。また、本発明は前記化学式 1 で表示される化合物の放射性誘導体を含んで、これら放射性化合物は生体研究分野に有効である。

【0035】

一方、本発明は前記化学式 1 で表示されるキナゾリン誘導体と薬剤学的に許容可能なこれらの塩の製造過程を含む。下記の反応式 1 は下記の化学式 2 で表示される 4-クロロ-2-置換-キナゾリン誘導体と下記の化学式 3 で表示されるアミン化合物との置換反応による前記化学式 1-1 に示した化合物を合成することができる。

[反応式 1]



前記反応式 1 で、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 及び X はそれぞれ前記化学式 1 で定義したところのようである。

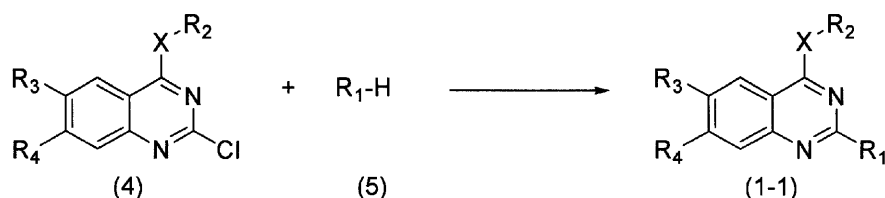
【0036】

前記反応式 1 による置換反応は塩基と有機極性溶媒を使う条件で遂行する。塩基はピリジン又はアルキルアミン類を含む有機塩基、又はアルカリ金属及び土金属塩を含む無機塩基を使うことができる。

【0037】

また、前記化学式 1 による置換反応で使われた前記化学式 2 及び 3 で表示される化合物はそれぞれ公知化合物として、有機合成分野ではよく知られた公知合成法に基づいて製造して使うことができる。例えば前記化学式 2 で表示される化合物において、 R_3 = エチルセルパニル基であるキナゾリン誘導体は下記の反応式 2 による製造方法によって合成できる。

[反応式 2]



【0038】

前記反応式 2 で、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 及び X はそれぞれ前記化学式 1 で定義したようである。前記反応式 2 による置換反応は塩基と有機極性溶媒を使う条件で遂行する。塩基はピリジン又はアルキルアミン類を含む有機塩基、又はアルカリ金属及び土金属塩を含む無機塩基を使うことができる。

【0039】

本発明による前記化学式 1-1 で表示される化合物のまた他の製造方法では、下記の反応式 3 に現わしたように下記の化学式 6 で表示される 2-メチル-3H-キナゾリノ-4-one の 4 番位置が X に置換された誘導体と下記の化学式 7 で表示される化合物との置換反応して合成できる。

10

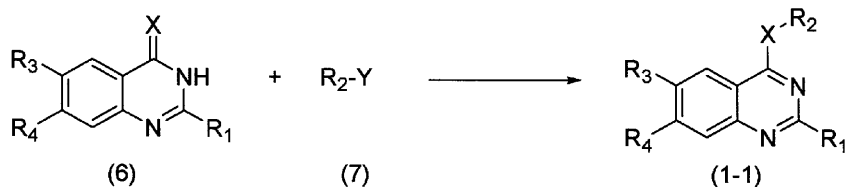
20

30

40

50

[反応式 3]



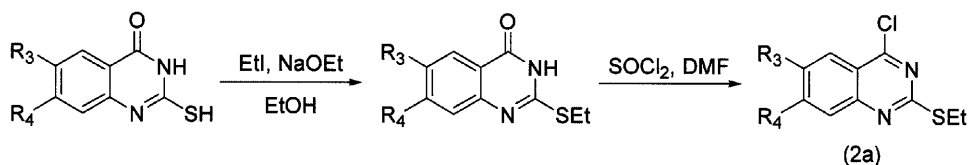
【0040】

前記反応式 3 による置換反応は塩基と有機極性溶媒を使う条件で遂行する。塩基はピリジン又はアルキルアミン類を含む有機塩基、又はアルカリ金属及び土金属塩を含む無機塩基を使うことができる。

【0041】

一方、前記反応式 1 による置換反応で使われた原料物質として前記化学式 2 及び 3 で表示される化合物はそれぞれ公知化合物として、有機合成分野ではよく知られた公知合成法に基づいて製造して使うことができる。前記化学式 2 で表示される化合物において、 R_1 = エチルスルファニル基であるキナゾリノ誘導体は下記の反応式 4 による製造方法によって合成できる。

[反応式 4]



【0042】

前記反応式 4 で、 R_3 、及び R_4 はそれぞれ前記化学式 1 で定義したところのようである。前記反応式 4 によれば、先に 2-メルカプト-3H-キナゾリノ-4-one をナトリウムエトキシド (NaOEt) 及びヨウ化エチル (EtI) と共に室温ないし溶媒の還流温度範囲で攪拌反応させて、C-2 位置にエチルスルファニル基を取り入れる。

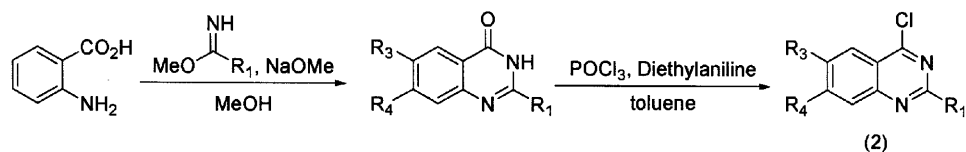
【0043】

その後、前記で製造された 2-エチルスルファニル-3H-キナゾリノ-4-one は -20 ないし 10°C 温度で塩化チオニル (SOCl_2) を加えた後、N、N-ジメチルホルムアミド触媒存在下で還流反応させて、C-4 位置のケトン基を塩素 (Cl) で切り替える。

【0044】

また、前記化学式 2 で表示される化合物において、 R_1 = 水素、アルキル又はアリール誘導体は下記の反応式 5 による製造方法によって合成できる。

[反応式 5]



【0045】

前記反応式 5 で、 R_3 、及び R_4 はそれぞれ前記化学式 1 で定義したものである。

【0046】

前記反応式 5 によれば、先にイミダート化合物をアントラニル酸及びナトリウムメトキ

10

20

30

40

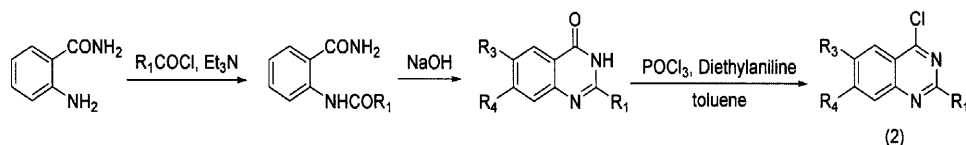
50

シド (NaOMe) と共に室温ないし溶媒の還流温度範囲で攪拌反応させて、願う置換体 R_1 を含む 3H-キナゾリノ-4-one を製造する。この後、オキシ塩化リンとジエチルアニリンを添加して室温ないし溶媒の還流温度範囲で攪拌反応させて、C-4 位置のケトン基を塩素 (Cl) で切り替える。

【0047】

また、前記化学式 2 で表示される化合物において、 R_1 = 水素、アルキル又はアリール誘導体は前記反応式 4 と共に下記の反応式 6 による製造方法によって合成できる。

[反応式 6]



10

【0048】

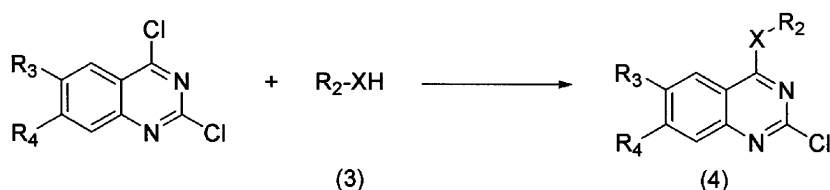
前記反応式 6 で、 R_1 、 R_3 、及び R_4 はそれぞれ前記化学式 1 で定義したところのようである。前記反応式 6 によれば、先にアシルハロゲン化合物をアントラニルアミドと反応させた後 NaOH 存在下で還流反応させて、願う置換体 R_1 を含む 3H-キナゾリノ-4-one を製造する。その後、オキシ塩化リンとデエチルアニリンを添加して室温ないし溶媒の還流温度範囲で攪拌反応させて、C-4 位置のケトン基を塩素 (Cl) で置換する。

20

【0049】

また、前記反応式 2 による置換反応から原料物質で使われた前記化学式 4 及び 5 で表示される化合物はそれぞれ公知化合物として、有機合成分野ではよく知られた公知合成法に基づいて製造して使うことができる。例えば前記化学式 4 で表示される化合物は下記の反応式 7 による製造方法によって合成できる。

[反応式 7]



30

【0050】

前記反応式 7 で、 R_2 、 R_3 、 R_4 、及び X はそれぞれ前記化学式 1 で定義したところのようである。前記反応式 7 による置換反応は前記化学式 3 の化合物を有機溶媒かたがた反応物質として過剰使うか反応物として化学量論的に使って別途の有機溶媒を使うことができ、必要によって塩基を使う条件で反応を遂行することもできる。この時、塩基はピリジン又はアルキルアミン類を含む有機塩基、又はアルカリ金属及び土金属塩を含む無機塩基を使うことができる。

【0051】

以上の製造方法から合成した中間体化合物及び最終目的化合物はクロマトグラフィーと再結晶化のような通常的な方法によって分離及び精製されることができる。本発明による化合物は適当な方法、例えば経口、口腔内、舌の下、直腸内、膈内、鼻腔内、局所又は非経口 (静脈内、海面体内、筋肉内、皮下及び管内を含み) の方法で投与されることができる。

40

【0052】

前述したように糖尿及び肥満の治療又は予防を目的に前記化学式 1 で表示される化合物を経口、口腔内又は舌の下に投与する場合、投与量は平均的に体重が 70 kg である大人患者を基準にして一般的に 0.1 ~ 400 mg/日。よって、一般大人患者の場合薬剤学的に許容可能な賦形剤などを使って有効化合物が 0.05 ~ 200 mg 含有されるように精製又

50

はカプセルに製形化して一日に一回又は多くの回にわたって、1回の投与量又は何回の投与量で服用する。

【0053】

非経口投与のための賦形においては、有効化合物は0.01～100mgの量に投与されるのに、実在的に医者はそれぞれの患者に対して患者の年、体重及び患者の特性によって一番適当な投与量を決める。前記のような投与量は平均的な場合を例示したこととして個人的な差によってその投与量が高いか低いことがあって、このようなことは本発明の範囲に属するのである。

【0054】

人に適用するにおいて、前記化学式1で表示される化合物は単独的に投与されることができるが、一般的に投与方式と標準薬剤学的慣行 (standard pharmaceutical practice) を考慮して選択された薬剤学的賦体と混合して投与されることができる。例えば、前記化合物は澱粉又は乳糖を含む精製形態で、又は単独又は賦形剤を含むカプセル又はovules形態で、又は味をつけるか色をたたえるようにする化学薬品を含むエリキシル剤又は乳状液形態で経口、口腔内又は舌の下に投与されることができる。

【0055】

このような液体製剤は懸濁剤 (例えば、メチルセルロース、ウィテブソル (witepsol) のような搬入性グリセリド又はアプリコットカーネルオイル (apricot kernel oil) とPEG-6 エステルの混合物又はPEG-8 とカプリル酸/カプリルグリセリドの混合物のようなグリセリド混合物) のような薬剤学的に許容可能な添加剤と共に製造される。

【0056】

また、非経口的で例えば、静脈内、海面体内、筋肉内、皮下及び管内を通じて注射されることができる。また、非経口投与のためには前記化合物を無菌の水溶液形態として使うのが一番望ましくて、この時前記溶液は血液との同調性を持つために他の物質 (例えば塩 (salt) 又はマンニトール、グルコースのような単糖類) を含むこともできる。

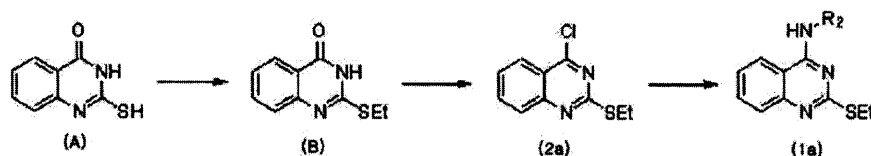
【0057】

従って、本発明は前記化学式1で表示される化合物又は薬剤学的に許容可能なこれらの塩を有効成分にして、ここに薬剤学的に許容可能な希釈剤又は賦形剤が含有されている薬剤学的組成物を含む。

【0058】

本発明は医薬品の用途として前記化学式1で表示される化合物又は薬剤学的に許容可能なこれらの塩又は薬剤学的に許容可能なこれらのプロドラッグを有効成分として含む薬剤学的組成物を提供する。このような本発明は次の実施例及び試験例を通じてより具体的に説明するが、本発明はこれに限定されるのではない。

[実施例1]



実施例1. 2-エチルスルファニル-3H-キナゾリン-4-one (化学式B) の合成。

【0059】

2-メルカプト-3H-キナゾリン-4-one (化学式A; 3g、16.83mmol) をエチルアルコール100mlに溶かした後NaOEt (1.5eQ、9.4ml、25.25mmol) とEtI (1.5eQ、2.02ml、25.25mmol) を室温で添加した。

【0060】

添加された混合物を3時間還流して出発物質が消えれば減圧蒸溜してエチルアルコールを取り除いた。混合物にエチルアセテートを添加して、水で洗った後無水硫酸マグネシウムで水分を取り除いた。有機溶媒を減圧蒸溜した後混合物を管クロマトグラフィー (シリ

カゲル；230～400m e s h）を利用して収率80%の目的化合物（2.78g）を得た。

【0061】

¹H NMR（CDCl₃、300MHz）δ 8.27（d、J=7.8Hz、1H）、7.73（t、J=7.5Hz、1H）、7.71（d、J=7.8Hz、1H）、7.41（t、J=7.5、1H）、3.34（q、J=14.4Hz、2H）、1.49（t、J=7.35Hz、3H）

【0062】

実施例2. 4-塩素-2-エチルスルファニル-キナゾリン（化学式2a）の合成。

2-エチルスルファニル-3H-キナゾリン-4-one（化学式B；1.5g、7.27mmol）に塩化チオニル50mlを0℃でゆっくり加えた。N、N-ジメチルホルムアミドを2～3滴入れて3～4時間還流して出発物質が消えれば減圧蒸溜して塩化チオニルを取り除いた。

【0063】

残余塩化チオニルは炭酸ナトリウム飽和水溶液を利用して洗浄した。混合物をエチルアセテートで抽出して有機層を塩水で洗った後、無水硫酸マグネシウムで水分を取り除いた。有機溶媒を減圧蒸溜した後、混合物を管クロマトグラフィー（シリカゲル；230～400m e s h）を利用して収率79%の目的化合物（1.29g）を得た。

¹H NMR（CDCl₃、300MHz）δ 8.02（d、J=7.8Hz、1H）、7.85（m、2H）、7.56（t、J=7.5Hz、1H）、3.29（q、J=14.4Hz、2H）、1.49（t、J=7.35Hz、3H）

【0064】

実施例3. 4-置換されたアミン-2-エチルスルファニル-キナゾリン（化学式1a）の合成。

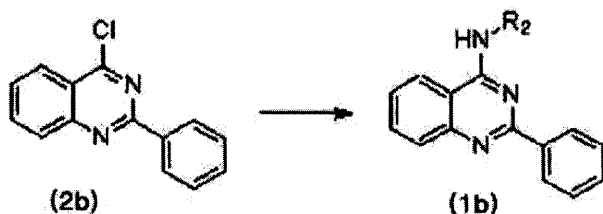
【0065】

THF 40mlに4-塩素-2-エチルスルファニル-キナゾリン（1.0g、4.45mmol）を溶かした後、トリエチルアミン（TEA；3eQ、1.86ml、13.35mmol）とアミン化合物（1.5eQ）を入れて室温で一晩中攪拌した。出発物質が消えれば減圧蒸溜してTHFを取り除いた。減圧蒸溜した混合物を管クロマトグラフィー（シリカゲル；230～400m e s h）を利用して収率90%の目的化合物を得た。

【0066】

次の実施例4はX=NH及びR₁=フェニルギである化合物合成のため一例である。

〔実施例4〕



実施例4. 4-置換されたアミン-2-フェニル-キナゾリン（化学式1b）の合成。

【0067】

THF 30mlに4-塩素-2-フェニル-キナゾリン（化学式2b；0.5g、2.08mmol）を溶かした後TEA（5eQ、1.45ml、10.38mmol）とアミン（1.5eQ）を入れて室温で一晩中攪拌した。

【0068】

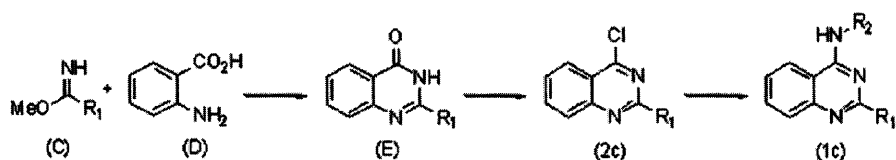
出発物質が消えれば減圧蒸溜してTHFを取り除いた。減圧蒸溜した混合物を管クロマトグラフィー（シリカゲル；230～400m e s h）を利用して収率90%の目的化合物を得た。

【0069】

次の実施例5ないし7はX=NH及びR₁=水素、アルキル又はアリール基の化合物合成のため

めの一実施例である。

[実施例 5]



実施例 5. 2-置換された-3H-キナゾリノ-4-オン (化学式E) の合成 R_1 を含むイミデート化合物 (化学式C; 50mmol) の塩酸塩をメタノール 100ml に溶かした後 NaOMe (1.2eq, 60mmol) とアントラニル酸 (化学式D, 1.0eq, 50mmol) を 0℃ でゆっくり加熱した。添加された混合物を還流温度までゆっくり温度を上げた後、一晩中還流させた。TLC で出発物質が完全に消えることを確認した後、温度を 0℃ に冷却させた。混合物に水 (100ml) を加えた後、生成された結晶を濾過後、乾燥して収率 70% の目的化合物 (35mmol) を得た。

【0070】

実施例 6. 4-クロロ-2-置換された-キナゾリノ (化学式 2c) の合成。

2-置換された-3H-キナゾリノ-4-オン (化学式E; 35mmol) をトルエン 100ml に溶かした後 N、N-ジエチルアニリン (1.5eq, 52.5mmol) とオキシ塩化リン (1.0eq, 35mmol) を添加した。混合物を 80℃ から 3 時間攪拌して出発物質が消えれば 0℃ に冷却した。混合物を 1N-NaOH と 1N-HCl で洗った後、無水硫酸ナトリウムで水分を取り除いた。有機溶媒を減圧蒸溜した後、混合物を管クロマトグラフィー (シリカゲル; 230~400mesh) を利用して収率 98% の目的化合物 (34mmol) を得た。

【0071】

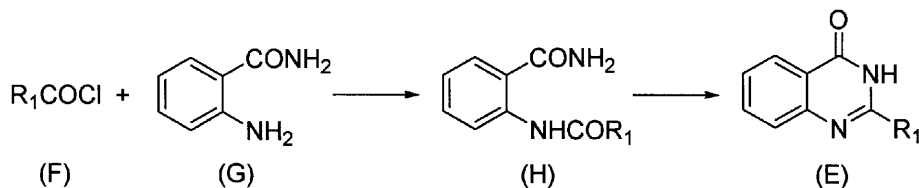
実施例 7. R_2 - (2 - (R_1 -置換された) -キナゾリノ-4-イル) -アミン (化学式 1c) の合成。

4-クロロ-2-置換された-キナゾリノ (化学式 2c; 10mmol) を THF 30ml に溶かした後、トリエチルアミン (2eq, 20mmol) とアミン化合物 (1.5eq, 15mmol) を入れて室温で一晩中攪拌した。出発物質が消えれば減圧蒸溜して THF を取り除いた。クロロホルムを添加した後、炭酸ナトリウム飽和水溶液、塩水で洗った後、無水硫酸ナトリウムで水分を取り除いた。有機溶媒を減圧蒸溜で取り除いた後、混合物を管クロマトグラフィー (シリカゲル; 230~400mesh) を利用して収率 95% の目的化合物 (9.5mmol) を得た。

【0072】

次の実施例 8 ないし 9 は $R_1=H$ 、アルキル又はアリール基の化合物合成のための一実施例である。

[実施例 8]



実施例 8. 2 - (置換された-カルボニル-アミノ) -ベンズアミド (化学式H) の合成。

R_1 を含む塩化アシル (化学式F; 50mmol)、アントラニルアミド (1.0eq、化学式G、50mmol) とトリエチルアミン (1.5eq, 75mmol) を THF に溶かした後、室温で一晩中攪拌した。出発物質が消えれば減圧蒸溜して THF を取り除いた。クロロホルムを添加した後 1N-NaOH と塩水で洗った後、硫酸ナトリウムで水分を取り除いた。有機溶媒を減圧蒸溜した後、ジエチルエテルに結晶化して収率 95% の目的化合物 (48mmol)

）を得た。

【0073】

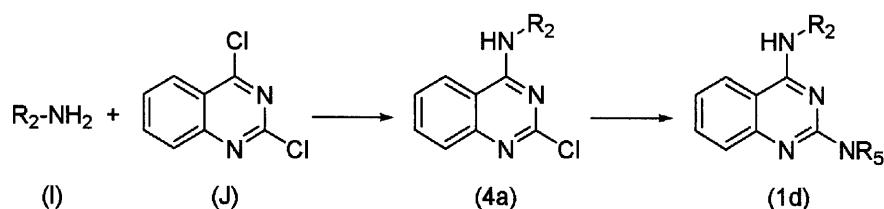
実施例9．2-置換された-3H-キナゾリノ-4-one（化学式E）の合成。

2-（置換された-カルボニル-アミノ）-ベンズアミド（化学式H；45mmol）を2.5N-NaOH60mlに溶かした後、1時間還流させた。出発物質が消えれば0℃に冷却した後、3N-HClで中和させた。生成された結晶を濾過を通じて取った後乾燥して収率95%の目的化合物（43mmol）を得た。得た目的化合物（化学式E）は前記実施例6と7の方法を通じてX=NH及びR1=H、アルキル又はアリール基の化合物合成に利用することができる。

【0074】

次の実施例10ないし11はX=NH及びR1=アミンである化合物合成のための一実施例である。

〔実施例10〕



実施例10．（2-クロロ-キナゾリノ-4-イル）-置換された-アミン（化学式4a）の合成
THF30mlに2、4-ジクロロ-キナゾリノ（化学式J；10mmol）を溶かした後、トリエチルアミン（1.2eq、12mmol）とR₂に置換されたアミン化合物（化学式I、1.05eq、10.5mmol）を入れて室温で3時間攪拌した。出発物質が消えれば減圧蒸留して有機溶媒を取り除いた。エチルアセテートを添加した後、炭酸ナトリウム飽和水溶液、塩水で洗った後、無水黄酸ナトリウムで水分を取り除いた。有機溶媒は減圧蒸留して取り除いた後混合物をジエチルエーテルに結晶化して収率100%の目的化合物（10mmol）を得た。

【0075】

実施例11．（2-（R₅-置換されたアミン）-キナゾリノ-4-イル）-R₁-置換された-アミン（1d）の合成

（2-クロロ-キナゾリノ-4-イル）-置換された-アミン（化学式4a；1.5mmol）とR₅に置換されたアミン（3eq、4.5mmol）をエチルアルコール15mlに溶かした後、一晚中還流攪拌した。TLCで出発物質が完全に消えたことを確認した後、有機溶媒を減圧蒸留で取り除いた。

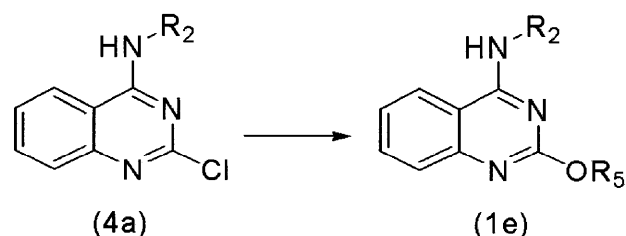
【0076】

混合物にエチルアセテートを添加した後炭酸ナトリウム飽和水溶液と塩水で洗った後、無水硫酸ナトリウムで水分を取り除いた。有機溶媒を減圧蒸留で取り除いた後混合物を管クロマトグラフィー（シリカゲル；230～400mesh）を利用して収率95%の目的化合物（1.4mmol）を得た。

【0077】

次の実施例12はX=NH及びR₁=アルコキシである化合物合成のための一実施例である。

〔実施例12〕



10

20

30

40

50

実施例 12. (2-(R₅-置換されたアルコキシ)-キナゾリノ-4-イル)-R₁-置換された-アミン (1d) の合成 (2-クロロ-キナゾリノ-4-イル)-置換された-アミン (化学式 4a; 1.5mmol) をエチルアルコール 15ml に溶かした後 NaOEt (2eq, 3.0mmol) を 0℃ で添加した。

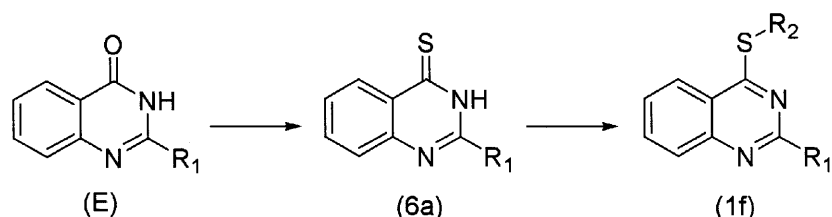
【0078】

添加された混合物を室温で 3 時間攪拌して出発物質が消えれば減圧蒸溜してエチルアルコールを取り除いた。混合物にエチルアセテートを添加して水で洗った後、硫酸ナトリウムで水分を取り除いた。有機溶媒を減圧蒸溜した後、混合物を管クロマトグラフィー (シリカゲル; 230~400mesh) を利用して収率 85% の目的化合物 (1.3mmol) を得た。

【0079】

次の実施例 13 ないし 14 は X=S である化合物合成のための一実施例である。

[実施例 13]



実施例 13. 2-置換された-3H-キナゾリノ-4-チオン (化学式 6a) の合成。

トルエン 9ml に 2-置換された-3H-キナゾリノ-4-one (化学式 E; 3mmol) と Lawesson's 試薬 (0.5eq, 1.5mmol) を溶かした後 1 時間還流攪拌した。出発物質が消えれば有機溶媒を減圧蒸溜した後、混合物を管クロマトグラフィー (シリカゲル; 230~400mesh) を利用して収率 95% の目的化合物 (2.9mmol) を得た。

【0080】

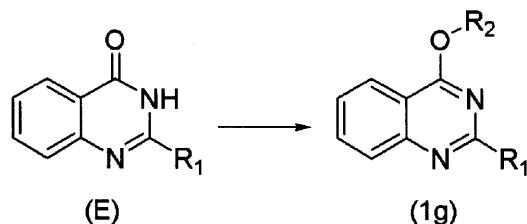
実施例 14. 2-(R₁-置換された)-4-(R₂-スルファニル)-キナゾリノ (化学式 1f) の合成。

2-置換された-3H-キナゾリノ-4-チオン (化学式 6a, 2mmol) と炭酸カリウム (1.5eq, 3mmol) を N, N-ジメチルホルムアミド 8ml に溶かした後 R₂-置換された臭素化合物 (1.2eq, 2.4mmol) を室温で添加した。1 時間攪拌して出発物質が消えれば混合物をエチルアセテートで希薄した後水と塩水で洗った後、無水硫酸ナトリウムで水分を取り除いた。有機溶媒を減圧蒸溜した後混合物を管クロマトグラフィー (シリカゲル; 230~400mesh) を利用して収率 95% の目的化合物 (1.9mmol) を得た。

【0081】

次の実施例 15 は X=O である化合物合成のための一実施例である。

[実施例 15]



実施例 15. 2-(R₁-置換された)-4-(R₂-置換された-オキシ)-キナゾリノ (化学式 1g) の合成。

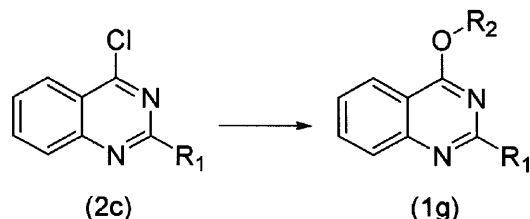
2-置換された-3H-キナゾリノ-4-one (化学式 E; 3mmol) と炭酸カリウム (1.0eq, 3mmol) を N, N-ジメチルホルムアミド 9ml に溶かした後 R₂-置換されたブローム化合物 (1.5eq, 4.5mmol) を室温で添加した。一晩中室温で攪拌して、出発物質が消えれば混合物をエチルアセテートで希薄した後水と塩水で洗った後、無水硫酸ナトリウム

ムで水分を取り除いた。有機溶媒を減圧蒸溜した後、混合物を管クロマトグラフィー（シリカゲル；230～400mesh）を利用して収率45%の目的化合物（1.4mmol）を得た。

【0082】

次の実施例16はX=Oである化合物合成のための一実施例である。

[実施例16]



10

実施例16. 2-（R₁-置換された）-4-（R₂-置換された-オキシ）-キナゾリノ（化学式1g）の合成。

R₂-置換されたアルコール化合物（1.2eq、24mmol）とナトリウムヒドライド（1.2eq、24mmol）のN、N-ジメチルホルムアミド60ml溶液を0℃で作った後4-クロロ-2-置換された-キナゾリノ（化学式2c；20mmol）を添加した。一晩中室温で攪拌した後、混合物をエチルアセテートで希薄した後、水と塩水で洗った後無水硫酸ナトリウムで水分を取り除いた。

20

【0083】

有機溶媒を減圧蒸溜した後混合物を管クロマトグラフィー（シリカゲル；230～400mesh）を利用して収率46%の目的化合物（9.2mmol）を得た。

【0084】

当業者ならば前記実施例1ないし4に例示された製造方法に基づいて本発明による前記化学式1で表示される化合物を易しく合成することができる。本発明で合成したいいくつかの化合物を例示すれば次のようである。

【0085】

化合物番号1. 2-[2-（2-フェニル-キナゾリン-4-イルアミノ）-エトキシ]-エチルアルコール

30

¹H NMR（CDCl₃、300MHz）δ 8.56（m、2H）、7.91（d、J=8.1Hz、1H）、7.70（m、2H）、7.50（m、3H）、7.37（t、J=7.5Hz、1H）、6.40（m、1H）、4.00（m、2H）、3.82（m、4H）、3.64（m、2H）、2.83（brs、1H）

化合物番号2. イソプロピル-（2-トリクロロメチル-キナゾリン-4-イル）-アミン

化合物番号3. シクロプロピル-（2-トリクロロメチル-キナゾリン-4-イル）-アミン

化合物番号4. （2-ピペリジン-1-イルエチル）-（2-トリクロロメチル-キナゾリン-4-イル）-アミン

化合物番号5. （1-フェニル-エチル）-（2-トリクロロメチル-キナゾリン-4-イル）-アミン

40

化合物番号6. （4-フェニル-ブチル）-（2-トリクロロメチル-キナゾリン-4-イル）-アミン

化合物番号7. プロピル-（2-トリクロロメチル-キナゾリン-4-イル）-アミン

化合物番号8. （2-エチルスルファニル-キナゾリン-4-イル）-イソプロピル-アミン

化合物番号9. （2-エチルスルファニル-キナゾリン-4-イル）-（3-フルオロベンジル）-アミン

¹H NMR（CDCl₃、300MHz）δ 7.68（m、3H）、7.30（m、2H）、7.15（d、J=7.5Hz、1H）、7.05（d、J=7.5Hz、1H）、6.95（t、J=7.5Hz、1H）、6.24（s、1H）、4.85（d、J=5.4Hz、2H）、3.15（q、J=14.4Hz、2H）、1.37（t、J=7.35Hz、3H）

50

化合物番号 10. (2-エチルスルファニル-キナゾリン-4-イル)-[2-(3-フルオロフェニル)-エチル]-アミン

化合物番号 11. (2-エチルスルファニル-キナゾリン-4-イル)-(2-モルホリン-4-イル-エチル)-アミン

化合物番号 12. (2-エチルスルファニル-キナゾリン-4-イル)-[2-(3-トリフルオロメチル-フェニル)エチル]-アミン

化合物番号 13. (6-ニトロ-キナゾリン-4-イル)-フェニル-アミン

化合物番号 14. (6,7-ジエトキシ-キナゾリン-4-イル)-ナフタリン-1-イルメチル-アミン

化合物番号 15. (6,7-ジエトキシ-キナゾリン-4-イル)-(3-モルホリン-4-イル-プロピル)-アミン 10

化合物番号 16. アリル-(6,7-ジエトキシ-キナゾリン-4-イル)-アミン

化合物番号 17. (6,7-ジエトキシ-キナゾリン-4-イル)-(2-ピリジン-2-イル-エチル)-アミン

化合物番号 18. (4-塩素-ベンジル)-(6,7-ジエトキシ-キナゾリン-4-イル)-アミン

化合物番号 19. ブチル-(2-エチルスルファニル-キナゾリン-4-イル)-アミン

化合物番号 20. Sec-ブチル-(2-エチルスルファニル-キナゾリン-4-イル)-アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 7.86 (d, $J=7.5\text{ Hz}$, 1H), 7.61 (m, 2H), 7.30 (d, $J=7.5\text{ Hz}$, 1H), 6.57 (s, 1H), 4.42 (m, 1H), 3.23 (q, $J=14.4\text{ Hz}$, 2H), 1.74 (m, 2H), 1.47-1.22 (m, 6H), 1.00 (t, $J=7.35\text{ Hz}$, 3H) 20

化合物番号 21. (2-エチルスルファニル-キナゾリン-4-イル)-イソブチルアミン

化合物番号 22. ベンジル-(2-エチルスルファニル-キナゾリン-4-イル)-アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 7.65 (m, 3H), 7.34 (m, 6H), 6.01 (s, 1H), 4.86 (d, $J=5.4\text{ Hz}$, 2H), 3.65 (q, $J=14.4\text{ Hz}$, 2H), 1.40 (t, $J=7.35\text{ Hz}$, 3H)

化合物番号 23. (2-エチルスルファニル-キナゾリン-4-イル)-(1-フェニル-エチル)-アミン 30

化合物番号 24. (2-エチルスルファニル-キナゾリン-4-イル)-(3-メトキシ-ベンジル)-アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 7.66 (m, 3H), 7.29 (m, 2H), 6.95 (m, 2H), 6.88 (m, 1H), 6.02 (s, 1H), 4.82 (d, $J=5.5\text{ Hz}$, 2H), 3.80 (s, 3H), 3.20 (q, $J=14.4\text{ Hz}$, 2H), 1.40 (t, $J=7.35\text{ Hz}$, 3H)

化合物番号 25. (2-エチルスルファニル-キナゾリン-4-イル)-(4-メトキシ-ベンジル)-アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 7.62 (m, 3H), 7.33 (m, 3H), 6.90 (d, $J=8.4\text{ Hz}$, 2H), 4.78 (d, $J=5.7\text{ Hz}$, 2H), 3.81 (s, 3H), 3.23 (q, $J=14.4\text{ Hz}$, 2H), 1.43 (t, $J=7.36\text{ Hz}$, 3H) 40

化合物番号 26. (2-エチルスルファニル-キナゾリン-4-イル)-(3-トリフルオロメチル-ベンジル)-アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 7.92 (d, $J=8.3\text{ Hz}$, 1H), 7.63 (m, 4H), 7.55 (m, 2H), 7.46 (m, 2H), 7.33 (m, 1H), 4.94 (d, $J=5.4\text{ Hz}$, 2H), 3.12 (q, $J=14.4\text{ Hz}$, 2H), 1.30 (t, $J=7.35\text{ Hz}$, 3H)

化合物番号 27. シクロヘキシル-(2-エチルスルファニル-キナゾリン-4-イル)-アミン

化合物番号 28. シクロヘキシル-(2-エチルスルファニル-キナゾリン-4-イル)-ア 50

ミン

化合物番号 29. (2-エチルスルファニル-キナゾリン-4-イル)-フェネチル-アミン
 $^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 7.66 (m, 2H)、7.45 (d, $J=8.2$ Hz, 1H)、7.33 (m, 6H)、5.84 (bRS, 1H)、3.91 (Q, $J=12.6$ Hz, 2H)、3.26 (Q, $J=14.4$ Hz, 2H)、3.03 (t, $J=6.9$ Hz, 2H)、1.47 (t, $J=7.36$ Hz, 3H)

化合物番号 30. (2-エチルスルファニル-キナゾリン-4-イル)-(4-フェニル-ブチル)-アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 7.61 (m, 3H)、7.30 (m, 3H)、7.20 (m, 3H)、5.74 (bRS, 1H)、3.68 (m, 2H)、3.23 (Q, $J=14.4$ Hz, 2H)、2.69 (m, 2H)、1.76 (m, 4H)、1.44 (t, $J=7.36$ Hz, 3H)

10

化合物番号 31. (2-エチルスルファニル-キナゾリン-4-イル)-プロピル-アミン

化合物番号 32. (2-エチルスルファニル-キナゾリン-4-イル)-(3-フェニル-プロピル)-アミン

化合物番号 33. (2-エチルスルファニル-キナゾリン-4-イル)-(3-イソプロポキシプロピル)-アミン

化合物番号 34. (2-エチルスルファニル-キナゾリン-4-イル)-(2-メトキシ-エチル)-アミン

化合物番号 35. (2-エチルスルファニル-キナゾリン-4-イル)-ナフタリン-1-イルメチル-アミン

20

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 8.11 (m, 1H)、7.90 (m, 2H)、7.65 (m, 2H)、7.53 (m, 5H)、7.24 (m, 1H)、5.92 (bRS, 1H)、5.27 (d, $J=4.5$ Hz, 2H)、3.26 (Q, $J=14.4$ Hz, 2H)、1.22 (t, $J=7.4$ Hz, 3H)

化合物番号 36. (2-エチルスルファニル-キナゾリン-4-イル)-(3-モルホリン-4-イル-プロピル)-アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 7.93 (m, 1H)、7.70 (m, 3H)、7.31 (m, 1H)、3.78 (m, 6H)、3.22 (Q, $J=14.4$ Hz, 2H)、2.59 (m, 6H)、1.87 (m, 2H)、1.43 (t, $J=7.41$ Hz, 3H)

30

化合物番号 37. ベンゾ[1,3]ジオキソール-5-イルメチル-(2-エチルスルファニル-キナゾリン-4-イル)-アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 7.66 (m, 3H)、7.31 (m, 1H)、6.80 (m, 3H)、5.97 (s, 2H)、5.90 (bRS, 1H)、4.76 (d, $J=5.1$ Hz, 2H)、3.23 (Q, $J=14.4$ Hz, 2H)、1.44 (t, $J=7.36$ Hz, 3H)

化合物番号 38. (3,5-ジメトキシ-ベンジル)-(2-エチルスルファニル-キナゾリン-4-イル)-アミン

化合物番号 39. (2-エチルスルファニル-キナゾリン-4-イル)-(2-フルオロベンジル)-アミン

40

化合物番号 40. (2-エチルスルファニル-キナゾリン-4-イル)-(1-メトキシメチル-プロピル)-アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 7.65 (m, 3H)、7.32 (m, 1H)、5.96 (d, $J=7.5$ Hz, 1H)、4.48 (d, $J=3.6$ Hz, 1H)、3.60 (m, 2H)、3.41 (s, 3H)、3.20 (Q, $J=14.4$ Hz, 2H)、1.75 (m, 2H)、1.44 (t, $J=7.4$ Hz, 3H)、1.01 (t, $J=7.35$ Hz, 3H)

化合物番号 41. (1-ベンジル-ピペリジン-4-イル)-(2-エチルスルファニル-キナゾリン-4-イル)-アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 7.60 (m, 3H)、7.34 (m, 6H)、5.54 (d, $J=6.9$ Hz, 1H)、4.26 (m, 1H)、3.50 (m, 2H)、3.22 (Q、

50

J=14.4 Hz、2 H)、2.90 (m、2 H)、2.17 (m、4 H)、1.65 (m、2 H)、1.22 (t、J=7.35 Hz、3 H)

化合物番号42. アリル-(2-エチルスルファニル-キナゾリン-4-イル)-アミン

¹H NMR (CDCl₃、300 MHz) δ 7.66 (m、3 H)、7.33 (m、1 H)、6.03 (m、1 H)、5.79 (bRS、1 H)、5.29 (m、2 H)、4.31 (t、J=5.5 Hz、2 H)、3.23 (Q、J=14.5 Hz、2 H)、1.44 (t、J=7.35 Hz、3 H)

化合物番号43. (2-エチルスルファニル-キナゾリン-4-イル)-ヘキサデシル-アミン

化合物番号44. (2-エチルスルファニル-キナゾリン-4-イル)-(2-ピペリジン-1-イル-エチル)-アミン 10

化合物番号45. (2-エチルスルファニル-キナゾリン-4-イル)-(2-ピロリジン-1-イル-エチル)-アミン

化合物番号46. (2-エチルスルファニル-キナゾリン-4-イル)-(2-ピリジン-2-イル-エチル)-アミン

化合物番号47. 2-(2-エチルスルファニル-キナゾリン-4-イルアミノ)-エチルアルコール

¹H NMR (DMSO-d₆、300 MHz) δ 8.33 (m、1 H)、8.14 (d、J=8.2 Hz、1 H)、7.67 (t、J=7.5 Hz、1 H)、7.48 (d、J=8.1 Hz、1 H)、7.36 (t、J=7.6 Hz、1 H)、4.81 (bRS、1 H)、3.60 (m、4 H)、3.13 (Q、J=14.4 Hz、2 H)、1.32 (t、J=7.35 Hz、3 H) 20

化合物番号48. (2-エチルスルファニル-キナゾリン-4-イル)-[3-(2-メチル-ピペリジン-1-イル)-プロピル]-アミン

化合物番号49. (2-塩素-6-フルオロベンジル)-(2-エチルスルファニル-キナゾリン-4-イル)-アミン

¹H NMR (CDCl₃、300 MHz) δ 7.64 (m、3 H)、7.25 (m、3 H)、7.05 (m、1 H)、6.00 (bRS、1 H)、5.06 (d、J=5.6 Hz、2 H)、3.28 (Q、J=14.4 Hz、2 H)、1.46 (t、J=7.35 Hz、3 H)

化合物番号50. 2-[2-(2-エチルスルファニル-キナゾリン-4-イルアミノ)-エトキシ]-エチルアルコール 30

¹H NMR (CDCl₃、300 MHz) δ 7.60 (m、3 H)、7.27 (m、1 H)、6.50 (bRS、1 H)、3.85 (m、4 H)、3.78 (m、2 H)、3.65 (m、2 H)、3.20 (Q、J=14.4 Hz、2 H)、1.42 (t、J=7.35 Hz、3 H)

化合物番号51. シクロヘキシル-(2-フェニル-キナゾリン-4-イル)-アミン

¹H NMR (CDCl₃、300 MHz) δ 8.58 (m、4 H)、7.93 (m、1 H)、7.72 (m、2 H)、7.50 (m、4 H)、5.58 (d、J=7.2 Hz、1 H)、4.43 (m、1 H)、2.27 (m、2 H)、1.85 (m、3 H)、1.54 (m、2 H)、1.34 (m、3 H)

化合物番号52. (4-フェニル-ブチル)-(2-フェニル-キナゾリン-4-イル)-アミン 40

化合物番号53. (5-フェニル-ペンチル)-(2-フェニル-キナゾリン-4-イル)-アミン

化合物番号54. (4-メチル-ベンジル)-(2-フェニル-キナゾリン-4-イル)-アミン

化合物番号55. イソブチル-(2-フェニル-キナゾリン-4-イル)-アミン

化合物番号56. ブチル-(2-フェニル-キナゾリン-4-イル)-アミン

化合物番号57. ナフタリン-1-イルメチル-(2-フェニル-キナゾリン-4-イル)-アミン

化合物番号58. (2-フェニル-キナゾリン-4-イル)-ピリジン-2-イルメチル-アミン 50

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 8.61 (m, 3H)、7.91 (t, $J=8.2$ Hz、1H)、7.72 (t, $J=8.2$ Hz、1H)、7.52 (m, 6H)、7.28 (m, 1H)、5.07 (d, $J=4.5$ Hz、2H)

化合物番号 59. (1-フェニル-キナゾリン-4-イル)-チオフェニル-2-イルメチル-アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 8.66 (m, 2H)、7.96 (d, $J=8.1$ Hz、1H)、7.69 (m, 2H)、7.53 (m, 3H)、7.41 (m, 1H)、7.24 (t, $J=7.4$ Hz、1H)、7.13 (t, $J=7.4$ Hz、1H)、7.00 (t, $J=7.3$ Hz、1H)、6.09 (d, $J=5.1$ Hz、1H)、5.17 (d, $J=5.4$ Hz、2H)、

化合物番号 60. イソプロピル-(2-フェニル-キナゾリン-4-イル)-アミン

化合物番号 61. (2-フェニル-キナゾリン-4-イル)-プロピル-アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 8.60 (m, 1H)、7.94 (d, $J=8.2$ Hz、1H)、7.70 (m, 2H)、7.41 (m, 4H)、5.78 (t, $J=5.4$ Hz、1H)、3.76 (Q, $J=13.2$ Hz、2H)、1.80 (Q, $J=14.4$ Hz、2H)、1.08 (t, $J=8.4$ Hz、3H)

化合物番号 62. (3-イソプロポキシプロピル)-(2-フェニル-キナゾリン-4-イル)-アミン

化合物番号 63. (3-フルオロベンジル)-(2-フェニル-キナゾリン-4-イル)-アミン

化合物番号 64. (2-フェニル-キナゾリン-4-イル)-[2-(3-トリフルオロメチル-フェニル)-エチル]-アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 8.64 (m, 2H)、7.95 (d, $J=8.3$ Hz、1H)、7.74 (t, $J=7.4$ Hz、1H)、7.50 (m, 4H)、7.40 (t, $J=6.6$ Hz、1H)、7.30 (m, 1H)、7.03 (m, 3H)、5.85 (t, $J=5.4$ Hz、1H)、4.03 (Q, $J=13.2$ Hz、2H)、3.10 (t, $J=7.9$ Hz、2H)

化合物番号 65. ベンゾ[1,3]ジオキソール-5-イルメチル-(2-フェニル-キナゾリン-4-イル)-アミン

化合物番号 66. (2-フェニル-キナゾリン-4-イル)-(3-トリフルオロメチル-ベンジル)-アミン

化合物番号 67. (2-メトキシ-エチル)-(2-フェニル-キナゾリン-4-イル)-アミン

化合物番号 68. フェネチル-(2-フェニル-キナゾリン-4-イル)-アミン

化合物番号 69. フェニル-(2-フェニル-キナゾリン-4-イル)-アミン

$^1\text{H NMR}$ (DMSO , 300 MHz) δ 11.56 (bRS, 1H)、8.92 (d, $J=8.2$ Hz、1H)、8.35 (m, 3H)、8.09 (t, $J=7.4$ Hz、1H)、7.83 (m, 3H)、7.60 (m, 5H)、7.38 (d, $J=8.4$ Hz、1H)

化合物番号 70. (4-メトキシ-フェニル)-(2-フェニル-キナゾリン-4-イル)-アミン

化合物番号 71. (2-フェニル-キナゾリン-4-イル)-O-トルリル-アミン

化合物番号 72. (4-イソプロピル-フェニル)-(2-フェニル-キナゾリン-4-イル)-アミン

$^1\text{H NMR}$ (DMSO , 300 MHz) δ 11.45 (bRS, 1H)、8.90 (d, $J=8.2$ Hz、1H)、8.35 (m, 3H)、8.08 (t, $J=7.4$ Hz、1H)、7.80 (m, 3H)、7.68 (m, 3H)、7.41 (d, $J=8.4$ Hz、1H)

化合物番号 73. (2,4-ジメチル-フェニル)-(2-フェニル-キナゾリン-4-イル)-アミン

$^1\text{H NMR}$ (DMSO , 300 MHz) δ 11.41 (bRS, 1H)、8.82 (d, $J=8.2$ Hz、1H)、8.33 (d, $J=8.2$ Hz、1H)、8.18 (m, 3H)、7.83 (t, $J=7.4$ Hz、1H)、7.65 (m, 3H)、7.38 (d, $J=8.1$ Hz、1H)、7.19 (m, 3H)、2.37 (S, 3H)、2.27 (S, 3H)

10

20

30

40

50

化合物番号 74. (2-フェニル-キナゾリン-4-イル) - (4-ウンデシル-フェニル) - アミン

化合物番号 75. (4-エチル-フェニル) - (2-フェニル-キナゾリン-4-イル) - アミン

化合物番号 76. (4-フルオロフェニル) - (2-フェニル-キナゾリン-4-イル) - アミン

$^1\text{H NMR}$ (DMSO、300 MHz) δ 11.42 (bRS、1H)、8.90 (d、 $J=8.2\text{ Hz}$ 、1H)、8.34 (m、3H)、8.09 (t、 $J=7.4\text{ Hz}$ 、1H)、7.86 (m、3H)、7.68 (m、3H)、7.40 (m、2H)

化合物番号 77. (2-メトキシ-フェニル) - (2-フェニル-キナゾリン-4-イル) - アミン 10

化合物番号 78. (2-フェニル-キナゾリン-4-イル) - (2、4、6-トリメチル-フェニル) - アミン

$^1\text{H NMR}$ (DMSO、300 MHz) δ 11.39 (bRS、1H)、8.83 (d、 $J=8.2\text{ Hz}$ 、1H)、8.27 (t、 $J=7.4\text{ Hz}$ 、1H)、8.11 (m、3H)、7.85 (t、 $J=7.5\text{ Hz}$ 、1H)、7.67 (t、 $J=7.5\text{ Hz}$ 、1H)、7.60 (m、2H)、7.07 (s、2H)、2.33 (s、3H)、2.18 (s、6H)

化合物番号 79. (4-ブチル-フェニル) - (2-フェニル-キナゾリン-4-イル) - アミン

化合物番号 80. (2-フェノキシ-フェニル) - (2-フェニル-キナゾリン-4-イル) - アミン 20

$^1\text{H NMR}$ (DMSO、300 MHz) δ 11.62 (bRS、1H)、8.69 (d、 $J=8.2\text{ Hz}$ 、1H)、8.28 (m、3H)、8.09 (t、 $J=7.5\text{ Hz}$ 、1H)、7.79 (t、 $J=7.5\text{ Hz}$ 、1H)、7.68 (m、3H)、7.34 (d、 $J=7.8\text{ Hz}$ 、1H)、7.16 (d、 $J=7.8\text{ Hz}$ 、1H)、7.12 (m、3H)、6.90 (m、3H)

化合物番号 81. (3-フェノキシ-フェニル) - (2-フェニル-キナゾリン-4-イル) - アミン

化合物番号 82. (4-フェノキシ-フェニル) - (2-フェニル-キナゾリン-4-イル) - アミン 30

化合物番号 83. (3-ブロモフェニル) - (2-フェニル-キナゾリン-4-イル) - アミン

化合物番号 84. 2-メトキシ-5-(2-フェニル-キナゾリン-4-イルアミノ)フェノール

$^1\text{H NMR}$ (DMSO、300 MHz) δ 11.29 (bRS、1H)、9.45 (bRS、1H)、8.82 (d、 $J=8.2\text{ Hz}$ 、1H)、8.36 (m、2H)、8.25 (d、 $J=8.1\text{ Hz}$ 、1H)、8.06 (t、 $J=7.4\text{ Hz}$ 、1H)、7.79 (t、 $J=7.4\text{ Hz}$ 、1H)、7.64 (m、3H)、7.33 (s、1H)、7.25 (d、 $J=8.7\text{ Hz}$ 、1H)、7.05 (d、 $J=8.7\text{ Hz}$ 、1H)、3.83 (s、3H)

化合物番号 85. 5-(2-フェニル-キナゾリン-4-イルアミノ) - ペンタン-1-ol 40

化合物番号 86. ベンジル - (2-フェニル-キナゾリン-4-イル) - アミン

化合物番号 87. (1-フェニル-エチル) - (2-フェニル-キナゾリン-4-イル) - アミン

化合物番号 88. (4-クロロベンジル) - (2-フェニル-キナゾリン-4-イル) - アミン

化合物番号 89. (3、4-ジクロロベンジル) - (2-フェニル-キナゾリン-4-イル) - アミン

化合物番号 90. (3-メトキシ-ベンジル) - (2-フェニル-キナゾリン-4-イル) - アミン

化合物番号 91. (2-メトキシ-ベンジル) - (2-フェニル-キナゾリン-4-イル) - ア 50

ミン

化合物番号 92. (3, 5-ジメトキシ-ベンジル) - (2-フェニル-キナゾリン-4-イル) - アミン

化合物番号 93. (2, 3-ジメトキシ-ベンジル) - (2-フェニル-キナゾリン-4-イル) - アミン

化合物番号 94. (2-フルオロベンジル) - (2-フェニル-キナゾリン-4-イル) - アミン

化合物番号 95. シクロヘキシル - (2-フェニル-キナゾリン-4-イル) - アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 8.61 (m, 2H), 7.93 (d, $J=8.1\text{ Hz}$, 1H), 7.72 (m, 2H), 7.50 (m, 4H), 5.67 (d, $J=6.3\text{ Hz}$, 1H), 4.80 (q, $J=13.5\text{ Hz}$, 1H), 2.31 (m, 2H), 1.80 (m, 4H), 1.65 (m, 2H)

10

化合物番号 96. Sec-ブチル - (2-フェニル-キナゾリン-4-イル) - アミン

化合物番号 97. アリル - (2-フェニル-キナゾリン-4-イル) - アミン

化合物番号 98. (2-フェニル-キナゾリン-4-イル) - (2-トリフルオロメチル-ベンジル) - アミン

化合物番号 99. ヘキサデシル - (2-フェニル-キナゾリン-4-イル) - アミン

化合物番号 100. (2-フェニル-キナゾリン-4-イル) - (2-ピロリジン-1-イル-エチル) - アミン

化合物番号 101. (2-フェニル-キナゾリン-4-イル) - (2-ピペリジン-1-イル-エチル) - アミン

20

化合物番号 102. (2-フェニル-キナゾリン-4-イル) - (2-ピリジン-2-イル-エチル) - アミン

化合物番号 103. [2-(3-フルオロ-フェニル)-エチル] - (2-フェニル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 8.59 (dd, $J_1=7.8\text{ Hz}$, $J_2=1.8\text{ Hz}$, 2H), 7.93 (d, $J=8.1\text{ Hz}$, 1H), 7.72 (t, $J=7.5\text{ Hz}$, 1H), 7.47 (m, 7H), 6.99 (m, 3H), 5.76 (brs, 1H), 4.06 (m, 2H), 3.12 (t, $J=7.2\text{ Hz}$, 2H)

化合物番号 104. (1-メトキシメチル-プロピル) - (2-フェニル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

30

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 8.56 (t, $J=3.8\text{ Hz}$, 2H), 7.96 (d, $J=8.3\text{ Hz}$, 1H), 7.72 (m, 2H), 7.49-7.39 (m, 5H), 6.06 (d, $J=7.2\text{ Hz}$, 1H), 4.72 (t, $J=3.8\text{ Hz}$, 1H), 3.65 (m, 2H), 3.43 (s, 1H), 1.84 (m, 2H), 1.06 (t, $J=7.4\text{ Hz}$, 3H)

化合物番号 105. (1-ベンジル-ピペリジノ-4-イル) - (2-フェニル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 8.54 (t, $J=6.7\text{ Hz}$, 2H), 7.92 (d, $J=8.3\text{ Hz}$, 1H), 7.69 (m, 2H), 7.50-2.27 (m, 8H), 5.59 (d, $J=7.1\text{ Hz}$, 1H), 4.46 (m, 1H), 3.61 (s, 2H), 2.95 (m, 2H), 2.68 (s, 1H), 2.30 (m, 4H), 1.70 (m, 2H)

化合物番号 106. (2-モルポリン-4-イル-エチル) - (2-フェニル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

40

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 8.56 (t, $J=6.2\text{ Hz}$, 2H), 7.92 (d, $J=8.5\text{ Hz}$, 2H), 7.71 (m, 2H), 7.49-7.26 (m, 4H), 6.56 (s, 1H), 3.86-3.74 (m, 6H), 2.73 (t, $J=5.9\text{ Hz}$, 2H), 3.76 (m, 4H)

化合物番号 107. [2-(3, 4-ジメトキシ-フェニル)-エチル] - (2-フェニル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 8.60 (t, $J=5.2\text{ Hz}$, 2H), 7.93 (d, $J=8.3\text{ Hz}$, 1H), 7.69 (t, $J=7.5\text{ Hz}$, 1H), 7.57 (t, $J=8.1\text{ Hz}$, 1H), 7.50 (m, 3H), 7.36 (t, $J=3.6\text{ Hz}$, 1H), 6.84 (m, 3H), 5.96 (s, 1H), 4.12 (m, 2H), 3.87 (s, 3H), 3.81 (s, 3H), 3.03 (t, $J=6.7\text{ Hz}$, 2H)

化合物番号 108. (2, 4-ジクロロ-ベンジル) - (2-フェニル-キナゾルリノ-4-イル)

50

) -アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 8.53 (m, 2H)、7.93 (d, J=8.1Hz、1H)、7.74 (t、J=7.7Hz、2H)、7.47 (m, 6H)、7.17 (dd、J₁=8.4Hz、J₂=2.0Hz、1H)、6.17 (br, 1H)、5.06 (d, J=6.0Hz、2H)

化合物番号 109. (2-クロロ-ベンジル) - (2-フェニル-キナゾリノ-4-イル) -アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 8.56 (t, J=3.3Hz、2H)、7.95 (d J=8.6Hz、1H)、7.71 (m, 2H)、7.55-7.37 (m, 6H)、7.21 (t, J=3.6Hz、2H)、6.31 (s, 1H)、5.09 (d, J=5.8Hz、2H)

化合物番号 110. シクロプロピル- (2-フェニル-キナゾリノ-4-イル) -アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 8.63 (d, J=7.3Hz、2H)、7.93 (d, J=8.3Hz、2H)、7.70 (m, 2H)、7.49 (m, 3H)、7.37 (t, J=7.5Hz、1H)、6.03 (s, 1H)、3.17 (m, 1H)、0.97 (m, 2H)、0.73 (m, 2H)

化合物番号 111. (2-フェニル-キナゾリノ-4-イル) -ピリジン-3-イルメチル-アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 8.73 (m, 1H)、8.51 (m, 3H)、8.04 (d J=8.2Hz、1H、)、7.94 (d, J=8.2Hz、1H)、7.85 (d, J=7.1Hz、1H)、7.67 (t, J=7.7Hz、1H)、7.47 (m, 3H)、7.37 (m, 1H)、7.26 (m, 2H)、5.03 (d, J=5.1Hz、2H)

化合物番号 112. 2- (2-フェニル-キナゾリノ-4-イルアミノ) -プロパン-1-ol

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 8.49 (m, 2H)、7.93 (t, J=7.8Hz、2H)、7.58 (m、5H)、7.34 (t, J=7.6Hz、1H)、7.71 (t, J=7.7Hz、1H)、3.91 (m, 2H)、1.45 (m, 4H)

化合物番号 113. 2-メトキシ-4- [(2-フェニル-キナゾリノ-4-イルアミノ) -メチル] -フェノール

¹HNM R (MeOD, 300MHz) δ 8.35 (d, J=2.2Hz、2H)、8.02 (m, 1H)、7.80 (m、2H)、7.45 (m, 4H)、7.07 (s, 1H)、6.89 (t, J=8.0Hz、1H)、6.75 (t, J=8.0Hz、1H)、4.85 (s, 2H)、3.72 (s, 3H)

化合物番号 114. (2-フルオロ-エチル) - (2-フェニル-キナゾリノ-4-イル) -アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 8.53 (m, 2H)、7.93 (d, J=8.4Hz、1H)、7.74 (t、J=7.5Hz、2H)、7.50 (m, 4H)、6.03 (brs, 1H)、4.86 (t, J=4.8Hz、1H)、4.70 (t, J=5.1Hz、1H)、4.20 (q, J=5.1Hz、1H)、4.10 (q, J=5.1Hz、1H)

化合物番号 115. (2, 3-ジクロロ-ベンジル) - (2-フェニル-キナゾリノ-4-イル) -アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 8.52 (t, J=3.7Hz、2H)、7.92 (d, J=8.5Hz、1H)、7.72 (t, J=6.6Hz、2H)、7.42 (m, 6H)、7.08 (t, J=7.8Hz、1H)、6.24 (s, 1H)、5.09 (d, J=5.9Hz、2H)

化合物番号 116. (3-ニトロ-ベンジル) - (2-フェニル-キナゾリノ-4-イル) -アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 8.46 (m, 2H)、8.19 (m, 1H)、8.03 (d, J=7.5Hz、1H)、7.91 (d, J=7.9Hz、1H)、7.82 (d, J=7.7Hz、1H)、7.70 (d, J=6.0Hz、1H)、7.42 (m, 5H)、6.54 (s, 1H)、4.96 (d, J=4.4Hz、2H)

化合物番号 117. (1-エチル-ピロリジノ-2-イルメチル) - (2-フェニル-キナゾリノ-4-イル) -アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 8.47 (d, J=5.6Hz、2H)、8.10 (d, J=8.1Hz、1H)、7.94 (s, 1H)、7.84 (d, J=8.3Hz、1H)、7.68 (t, J=7.6Hz、1H)、7.42 (m、4H)、5.97 (s, 1H)、4.08 (m, 2H)、3.58 (m, 2H)、3.01 (t, J=4.7Hz、1H)、2.67 (m, 2H)、2.09-1.91 (m, 4H)、1.19 (m, 3H)

化合物番号 118. (3, 4-ジメトキシ-ベンジル) - (2-フェニル-キナゾリノ-4-イル) -アミン

10

20

30

40

50

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 8.59 (t, J=3.8Hz, 2H), 7.93 (d, J=8.1Hz, 1H), 7.71 (m, 2H), 7.45 (m, 3H), 7.36 (t, J=7.6Hz, 1H), 7.04 (s, 1H), 6.97 (d, J=8.4Hz, 1H), 6.80 (t, J=4.1Hz, 1H), 6.21 (s, 1H), 4.90 (d, J=5.2Hz, 2H), 3.87 (s, 3H), 3.78 (s, 3H)

化合物番号 119. (2-フェニル-キナゾルリノ-4-イル) - (2-p-トルリル-エチル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 8.59 (t, J=3.3Hz, 2H), 7.93 (d, J=8.4Hz, 1H), 7.69 (t, J=7.6Hz, 1H), 7.55 (m, 4H), 7.36 (t, J=7.5Hz, 1H), 7.16 (m, 4H), 5.91 (s, 1H), 4.01 (m, 2H), 3.05 (t, J=6.9Hz, 2H), 2.43 (s, 3H)

化合物番号 120. [2-(3-メトキシ-フェニル)-エチル] - (2-フェニル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

10

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 8.61 (t, J=3.8Hz, 2H), 7.93 (d, J=8.3Hz, 1H), 7.70 (m, 1H), 7.49 (m, 4H), 7.30 (m, 2H), 6.85 (m, 3H), 5.90 (s, 1H), 4.02 (m, 2H), 3.76 (s, 3H), 3.05 (t, J=6.9Hz, 2H)

化合物番号 121. (1-エチル-プロピル) - (2-フェニル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 8.55 (t, J=3.5Hz, 2H), 7.95 (d, J=8.2Hz, 1H), 7.69 (m, 2H), 7.46 (m, 4H), 5.59 (s, 1H), 4.53 (d, J=6.7Hz, 1H), 1.85-1.62 (m, 4H), 1.00 (m, 6H)

化合物番号 122. [2-(2,5-ジメトキシ-フェニル)-エチル] - (2-フェニル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

20

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 8.59 (t, J=3.2Hz, 2H), 7.91 (d, J=8.4Hz, 1H), 7.67 (t, J=7.6Hz, 1H), 7.59 (d, J=8.1Hz, 1H), 7.47 (m, 3H), 7.36 (t, J=7.5Hz, 1H), 6.80 (m, 3H), 6.39 (s, 1H), 3.98 (m, 2H), 3.86 (s, 3H), 3.71 (s, 3H), 3.08 (t, J=6.5Hz, 2H)

化合物番号 123. [2-(4-クロロ-フェニル)-エチル] - (2-フェニル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 8.57 (t, J=3.6Hz, 2H), 7.91 (m, 1H), 7.69 (m, 1H), 7.53 (m, 4H), 7.38 (d, J=6.9Hz, 1H), 7.25 (m, 2H), 7.18 (m, 2H), 5.76 (s, 1H), 4.00 (m, 2H), 3.05 (m, 2H)

30

化合物番号 124. [2-(4-メトキシ-フェニル)-エチル] - (2-フェニル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 8.60 (t, J=3.2Hz, 2H), 7.93 (d, J=8.3Hz, 1H), 7.69 (t, J=7.6Hz, 1H), 7.50 (m, 4H), 7.35 (t, J=7.5Hz, 1H), 7.20 (d, J=8.3Hz, 2H), 6.87 (d, J=8.3Hz, 2H), 5.85 (s, 1H), 4.00 (m, 2H), 3.79 (s, 3H), 3.02 (t, J=6.9Hz, 2H)

化合物番号 125. (1,3-ジメチル-ブチル) - (2-フェニル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 8.58 (t, J=3.8Hz, 2H), 7.93 (d, J=8.5Hz, 1H), 7.69 (m, 2H), 7.48-7.24 (m, 4H), 5.52 (d, J=6.9Hz, 1H), 4.80 (t, J=6.86Hz, 1H), 1.78-1.63 (m, 2H), 1.46 (t, J=6.7Hz, 1H), 1.39 (m, 3H), 0.97 (m, 6H)

40

化合物番号 126. [2-(3-クロロ-フェニル)-エチル] - (2-フェニル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 8.59 (t, J=3.3Hz, 2H), 7.93 (d, J=8.3Hz, 1H), 7.69 (m, 1H), 7.58 (m, 1H), 7.49 (m, 3H), 7.38 (m, 1H), 7.24 (m, 1H), 7.12 (m, 2H), 7.11 (m, 1H), 5.92 (s, 1H), 3.95 (m, 2H), 3.02 (t, J=7.1Hz, 2H)

化合物番号 127. [2-(2,4-ジクロロ-フェニル)-エチル] - (2-フェニル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

50

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 8.57 (t, J=3.6Hz, 2H), 7.92 (d, J=8.2Hz, 1H), 7.70 (m, 1H), 7.59 (d, J=8.1Hz, 1H), 7.47 (m, 2H), 7.37 (m, 2H), 7.18 (m, 2H), 5.81 (s, 1H), 4.04 (m, 2H), 3.23 (, J=6.8Hz, 2H)

化合物番号 128. [2-(3,4-ジフルオロ-フェニル)-エチル]-(2-フェニル-キナゾルリノ-4-イル)-アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 8.50 (t, J=4.0Hz, 2H), 7.93 (d, J=8.6Hz, 1H), 7.72 (m, 2H), 7.41 (m, 4H), 7.22 (t, J=8.8Hz, 1H), 7.07 (m, 2H), 6.11 (s, 1H), 4.91 (d, J=5.5Hz, 2H)

化合物番号 129. (2-フェニル-キナゾルリノ-4-イル)-(3,4,5-トリメトキシ-ベンジル)-アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 8.58 (t, J=3.5Hz, 2H), 7.96 (d, J=8.4Hz, 2H), 7.78 (d, J=8.3Hz, 1H), 7.67 (t, J=7.6Hz, 1H), 7.47 (m, 3H), 7.36 (t, J=7.6Hz, 1H), 6.73 (s, 2H), 6.43 (s, 1H), 4.91 (d, J=5.2Hz, 2H), 3.86 (d, J=6.6Hz, 2H), 3.82 (m, 9H)

化合物番号 130. (3-メチル-ブチル)-(2-フェニル-キナゾルリノ-4-イル)-アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 8.57 (t, J=3.4Hz, 2H), 7.92 (d, J=8.3Hz, 1H), 7.68 (m, 2H), 7.46 (m, 3H), 7.37 (t, J=7.5Hz, 1H), 5.76 (s, 1H), 3.80 (m, 2H), 1.76 (m, 1H), 1.65 (m, 2H), 0.99 (m, 6H)

化合物番号 131. (2-シクロヘキサ-1-エニル-エチル)-(2-フェニル-キナゾルリノ-4-イル)-アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 8.57 (t, J=3.4Hz, 2H), 7.92 (d, J=8.3Hz, 1H), 7.69 (t, J=7.7Hz, 1H), 7.61 (d, J=8.1Hz, 1H), 7.49 (m, 3H), 7.38 (t, J=7.4Hz, 1H), 5.82 (s, 1H), 5.61 (1H), 3.83 (m, 2H), 2.39 (t, J=6.6Hz, 2H), 2.03 (m, 4H), 1.62 (m, 4H)

化合物番号 132. シクロヘキシルメチル-(2-フェニル-キナゾルリノ-4-イル)-アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 8.56 (t, J=3.1Hz, 2H), 7.92 (d, J=8.7Hz, 1H), 7.69 (t, J=6.1Hz, 2H), 7.49 (m, 4H), 5.85 (s, 1H), 3.64 (t, J=6.1Hz, 2H), 1.88-1.70 (m, 6H), 1.29-1.05 (m, 5H)

化合物番号 133. (2,2-ジフェニル-エチル)-(2-フェニル-キナゾルリノ-4-イル)-アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 8.63 (t, J=3.8Hz, 2H), 7.93 (d, J=8.4Hz, 1H), 7.67 (t, J=7.5Hz, 1H), 7.51 (m, 3H), 7.29 (m, 12H), 5.73 (s, 1H), 4.56 (t, J=7.7Hz, 1H), 4.42 (t, J=6.5Hz, 2H)

化合物番号 134. (2,4-ジフルオロベンジル)-(2-フェニル-キナゾルリノ-4-イル)-アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 8.55 (t, J=3.9Hz, 2H), 7.93 (d, J=8.4Hz, 1H), 7.71 (m, 2H), 7.49 (m, 5H), 6.80 (m, 2H), 6.24 (s, 1H), 5.00 (d, J=5.6Hz, 2H)

化合物番号 135. (2,5-ジフルオロベンジル)-(2-フェニル-キナゾルリノ-4-イル)-アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 8.52 (t, J=3.6Hz, 2H), 7.93 (d, J=8.4Hz, 1H), 7.72 (t, J=7.9Hz, 2H), 7.41 (m, 4H), 7.18 (m, 1H), 7.00 (m, 1H), 6.92 (t, J=3.9Hz, 1H), 6.20 (s, 1H), 5.00 (d, J=5.6Hz, 2H)

化合物番号 136. (3,3-ジフェニル-プロピル)-(2-フェニル-キナゾルリノ-4-イル)-アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 8.51 (m, 2H), 7.92 (d, J=8.4Hz, 1H), 7.67 (m, 1H), 7.43 (m, 3H), 7.34-7.20 (m, 12H), 5.73 (s, 1H), 4.09 (t, J=7.7Hz, 1H), 2.53 (m, 2H)

10

20

30

40

50

化合物番号 1 3 7. [2- (4- ブロモ- フェニル) - エチル] - (2- フェニル- キナゾリノ- 4- イル) - アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 8.57 (t, 2.8H z, 2H), 7.92 (d, $J=8.4\text{H z}$, 1H), 7.71 (m, 1H), 7.50 (m, 7H), 7.20 (m, 2H), 5.75 (s, 1H), 3.98 (m, 2H), 3.04 (t, $J=6.7\text{H z}$, 2H)

化合物番号 1 3 8. ブチル- メチル- (2- フェニル- キナゾリノ- 4- イル) - アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 8.55 (dd, $J_1=7.5\text{H z}$, $J_2=1.5\text{H z}$, 2H), 7.99-7.91 (m, 2H), 7.67 (m, 1H), 7.46 (m, 3H), 7.34 (m, 1H), 3.80 (t, $J=7.8\text{H z}$, 2H), 3.41 (s, 3H), 1.86 (m, 2H), 1.43 (m, 2H), 1.00 (t, 3H, $J=7.5\text{H z}$)

化合物番号 1 3 9. (2- フェニル- キナゾリノ- 4- イル) - (4- トリプルオロメチル- ベンジル) - アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 8.50 (m, 2H), 7.96 (d, $J=8.1\text{H z}$, 1H), 7.75 (m, 2H), 7.59 (m, 4H), 7.46 (m, 4H), 6.06 (br, 1H), 5.07 (d, $J=6.0\text{H z}$, 2H)

化合物番号 1 4 0. [2- (2- フルオロ- フェニル) - エチル] - (2- フェニル- キナゾリノ- 4- イル) - アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 8.60 (t, $J=3.5\text{H z}$, 2H), 7.93 (d, $J=8.3\text{H z}$, 1H), 7.69 (, $J=7.6\text{H z}$ t, 1H), 7.60 (d, $J=8.1\text{H z}$, 1H), 7.49 (m, 3H), 7.36 (t, $J=7.5\text{H z}$, 1H), 7.24 (t, $J=7.2\text{H z}$, 2H), 7.06 (t, $J=9.0\text{H z}$, 2H), 4.00 (m, 2H), 3.14 (t, $J=6.7\text{H z}$, 2H)

化合物番号 1 4 1. (2- フェニル- キナゾリノ- 4- イル) - ピリジン- 4- イルメチル- アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 8.51 (m, 2H), 8.42 (t, $J=3.4\text{H z}$, 2H), 8.00 (d, $J=8.4\text{H z}$, 1H), 7.89 (d, $J=8.1\text{H z}$, 1H), 7.71 (t, $J=7.6\text{H z}$, 1H), 7.43 (m, 4H), 7.31 (m, 2H), 4.99 (d, $J=5.5\text{H z}$, 2H)

化合物番号 1 4 2. (2- フェニル- キナゾリノ- 4- イル) - ピリジン- 2- イルメチル- アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 8.60 (m, 2H), 7.91 (m, 2H), 7.69 (m, 3H), 7.43 (m, 5H), 7.25 (m, 1H), 5.00 (d, $J=4.3\text{H z}$, 2H)

化合物番号 1 4 3. (2, 3- ジメチル- シクロヘキシル) - (2- フェニル- キナゾリノ- 4- イル) - アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 8.53 (t, $J=3.5\text{H z}$, 2H), 7.92 (d, $J=8.3\text{H z}$, 1H), 7.69 (m, 2H), 7.41 (m, 4H), 5.76 (m, 1H), 4.56 (m, 1H), 1.94-1.46 (m, 7H), 1.00 (m, 5H), 0.86 (d, $J=7.1\text{H z}$, 1H)

化合物番号 1 4 4. (2, 4- ジメトキシ- ベンジル) - (2- フェニル- キナゾリノ- 4- イル) - アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 8.60 (m, 2H), 7.90 (d, $J=8.4\text{H z}$, 1H), 7.72-7.63 (m, 2H), 7.48 (m, 3H), 7.38 (m, 2H), 6.51 (d, 1H, $J=2.1\text{H z}$), 6.45 (dd, $J_1=8.1\text{H z}$, $J_2=2.4\text{H z}$, 1H), 6.16 (br, 1H), 4.94 (d, $J=5.4\text{H z}$, 2H), 3.90 (s, 3H), 3.79 (s, 3H)

化合物番号 1 4 5. (3- クロロ- ベンジル) - (2- フェニル- キナゾリノ- 4- イル) - アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 8.51 (m, 2H), 7.92 (d, $J=8.8\text{H z}$, 1H), 7.71 (m, 2H), 7.45 (m, 5H), 7.27 (m, 3H), 5.13 (s, 1H), 4.92 (d, $J=5.5\text{H z}$, 2H)

化合物番号 1 4 6. 1- フェニル- 2- (2- フェニル- キナゾリノ- 4- イルアミノ) - エチルアルコール

$^1\text{H NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$, 300 MHz) δ 8.49 (m, 2H), 8.25 (dH, $J=8.3\text{H z}$, 1), 7.74 (m, 2H), 7.50-7.31 (m, 7H), 7.23 (t, $J=7.1\text{H z}$, 1H), 5.62 (d, $J=4.3\text{H z}$, 1H), 5.05 (m, 1H), 4.01-3.90 (m, 2H), 3.57 (m, 1H), 3.28 (m, 2H)

化合物番号 1 4 7. (2, 5- ジメトキシ- ベンジル) - (2- フェニル- キナゾリノ- 4- イル) - アミン

10

20

30

40

50

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 8.60 (dd, J₁=8.1Hz, J₂=2.1Hz, 2H), 7.91 (d, J=8.4Hz, 1H), 7.67 (m, 2H), 7.52-7.36 (m, 4H), 7.10 (d, J=3.0Hz, 1H), 6.85 (d, J=9.0Hz, 1H), 6.78 (dd, J₁=9.0Hz, J₂=3.0Hz, 1H), 6.272 (br, 1H), 4.99 (d, J=6.0Hz, 2H), 3.89 (s, 3H), 3.71 (s, 3H)

化合物番号 148. (4-プロモ-ベンジル) - (2-フェニル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 8.54 (t, J=3.6Hz, 2H), 7.92 (d, J=8.3Hz, 1H), 7.71 (t, J=6.6Hz, 1H), 7.44 (m, 6H), 7.26 (t, J=7.0Hz, 2H), 6.09 (s, 1H), 4.91 (d, J=5.5Hz, 2H)

化合物番号 149. [2- (3, 4-ジクロロ-フェニル) -エチル]- (2-フェニル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 8.57 (m, 2H), 7.94 (d, J=8.4Hz, 1H), 7.74 (m, 1H), 7.59 (d, J=7.8Hz, 1H), 7.55-7.37 (m, 6H), 7.10 (dd, J₁=8.4Hz, J₂=1.8Hz, 1H), 5.75 (br, 1H), 4.03 (q, J=7.2Hz, 2H), 3.08 (t, J=7.2Hz, 2H)

化合物番号 150. 1-[3- (2-フェニル-キナゾルリノ-4-イルアミノ) -プロピル]-ピロリジノ-2-one

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 8.55 (m, 2H), 8.00 (d, J=8.1Hz, 1H), 7.89 (d, J=8.6Hz, 1H), 7.69 (d, J=7.3Hz, 1H), 7.59 (s, 1H), 7.44 (m, 4H), 3.76 (m, 2H), 3.41 (m, 4H), 2.45 (t, J=8.1Hz, 2H), 2.06 (m, 2H), 1.87 (m, 2H)

化合物番号 151. [2- (2-クロロ-フェニル) -エチル]- (2-フェニル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 8.59 (m, 2H), 7.92 (d, J=8.4Hz, 1H), 7.71 (d, J=7.3Hz, 1H), 7.63 (d, J=8.1Hz, 1H), 7.48 (m, 3H), 7.37 (t, J=7.2Hz, 2H), 7.25 (t, J=3.5Hz, 1H), 7.17 (t, J=4.5Hz, 2H), 5.99 (s, 1H), 4.05 (m, 2H), 3.24 (t, J=6.9Hz, 2H)

化合物番号 152. 2-[2- (2-フェニル-キナゾルリノ-4-イルアミノ) -エチル]-フェノール

¹HNM R (DMSO-d₆, 300MHz) δ 9.18 (s, 1H), 8.46 (m, 3H), 8.19 (d, J=8.1Hz, 1H), 7.73 (m, 2H), 7.47 (m, 4H), 7.07 (d, J=8.2Hz, 2H), 6.66 (d, J=8.2Hz, 2H), 4.12 (s, 1H), 3.77 (m, 2H), 2.91 (t, J=7.4Hz, 2H)

化合物番号 153. (3-プロモ-ベンジル) - (2-フェニル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 8.52 (m, 2H), 7.92 (d, J=8.5Hz, 1H), 7.71 (t, J=3.1Hz, 2H), 7.56 (s, 1H), 7.45 (m, 6H), 7.14 (m, 1H), 6.13 (s, 1H), 4.91 (d, J=5.3Hz, 2H)

化合物番号 154. (2, 6-ジメトキシ-ベンジル) - (2-フェニル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 8.70 (m, 2H), 7.92 (d, J=8.4Hz, 1H), 7.84 (m, 2H), 7.51 (m, 3H), 7.46 (m, 1H), 7.23 (m, 1H), 6.58 (d, J=8.4Hz, 2H), 6.38 (s, 1H), 5.13 (d, J=5.3Hz, 2H), 3.88 (s, 6H)

化合物番号 155. (2-プロモ-ベンジル) - (2-フェニル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 8.56 (t, J=3.8Hz, 2H), 7.92 (d, J=8.4Hz, 1H), 7.72 (m, 2H), 7.50 (m, 5H), 7.46 (m, 1H), 7.24 (m, 1H), 6.34 (s, 1H), 5.06 (d, J=5.8Hz, 2H)

化合物番号 156. (3-モルポリン-4-イル-プロピル) - (2-フェニル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 8.55 (m, 2H), 7.89 (d, J=8.3Hz, 1H), 7.78 (d

10

20

30

40

50

、J=8.1Hz、1H)、7.68(m、3H)、7.45(m、3H)、3.81(m、6H)、2.57(m、7H)、1.89(m、2H)

化合物番号157. 2-[ブチル-(2-フェニル-キナゾリノ-4-イル)-アミノ]-エチルアルコール

¹HNM R (CDCl₃、300MHz) δ 8.53(m、2H)、8.18-7.91(m、2H)、7.69(m、1H)、7.45(m、4H)、4.85(t、J=5.2Hz、1H)、4.01(s、2H)、3.67(t、J=8.0Hz、1H)、3.21(t、J=5.2Hz、1H)、2.74(t、J=7.3Hz、1H)、1.95(m、1H)、1.60(m、1H)、1.03-0.87(m、3H)

化合物番号158. [2-(4-メチル-ピペラジン-1-イル)-エチル]-(2-フェニル-キナゾリノ-4-イル)-アミン

¹HNM R (CDCl₃、300MHz) δ 8.51(t、J=3.9Hz、2H)、8.03(s、1H)、7.92(d、J=8.3Hz、1H)、7.84(d、J=8.8Hz、1H)、7.65(t、J=7.6Hz、1H)、7.39(m、4H)、5.84(brs、1H)、3.83(m、2H)、2.98(m、4H)、2.66(m、10H)、2.33(s、3H)、1.05(m、2H)、1.29(m、6H)

化合物番号159. シクロペンチル-メチル-(2-フェニル-キナゾリノ-4-イル)-アミン

¹HNM R (CDCl₃、300MHz) δ 8.84(m、2H)、7.98(t、J=8.1Hz、2H)、7.68(t、J=7.7Hz、1H)、7.47(m、3H)、7.35(t、J=7.6Hz、1H)、4.99(t、J=7.7Hz、1H)、3.26(s、3H)、2.08(m、2H)、1.71(m、6H)

化合物番号160. (2-フェニル-キナゾリノ-4-イル)-(2-ピペラジン-1-イル-エチル)-アミン

¹HNM R (CDCl₃、300MHz) δ 8.54(m、2H)、7.97(m、2H)、7.74(m、1H)、7.46(m、4H)、4.08(m、4H)、3.06(m、4H)

化合物番号161. 0-(4-ニトロ-ベンジル)-N-(2-フェニル-キナゾリノ-4-イル)-ヒドロキシルアミン

¹HNM R (CDCl₃、300MHz) δ 8.21(m、3H)、7.97(m、2H)、7.88(d、J=7.9Hz、1H)、7.57(m、8H)、7.28(m、1H)

化合物番号162. (4-クロロ-フェニル)-(2-フェニル-キナゾリノ-4-イル)-アミン

¹HNM R (DMSO-d₆、300MHz) δ 9.92(s、1H)、8.53(d、J=8.3Hz、1H)、8.41(t、J=3.9Hz、2H)、7.98(d、J=8.8Hz、2H)、7.85(d、J=3.8Hz、2H)、7.62-7.48(m、6H)

化合物番号163. ベンジル-(2-メチル-キナゾリノ-4-イル)-アミン

¹HNM R (DMSO-d₆、300MHz) δ 9.69(s、1H)、8.47(d、J=8.1Hz、1H)、8.20(t、J=7.2Hz、2H)、7.81(d、J=3.6Hz、2H)、7.55(t、J=4.1Hz、1H)、7.46-7.23(m、7H)、2.22(s、3H)

化合物番号164. (3-メトキシ-ベンジル)-(2-メチル-キナゾリノ-4-イル)-アミン

¹HNM R (CDCl₃、300MHz) δ 7.77-7.63(m、3H)、7.35(t、J=7.6Hz、1H)、7.24(t、J=6.3Hz、1H)、6.96(m、2H)、6.82(m、1H)、6.32(s、1H)、4.84(m、2H)、3.74(s、3H)、2.62(s、3H)

化合物番号165. (4-メトキシ-ベンジル)-(2-メチル-キナゾリノ-4-イル)-アミン

¹HNM R (CDCl₃、300MHz) δ 7.74(d、J=8.2Hz、1H)、7.67(m、2H)、7.35(m、3H)、6.86(d、J=8.6Hz、2H)、6.12(s、1H)、4.77(d、J=4.0Hz、2H)、3.78(s、3H)、2.64(s、3H)

化合物番号166. (2-メチル-キナゾリノ-4-イル)-(3-トリクロロメチル-ベンジル)-アミン

¹HNM R (CDCl₃、300MHz) δ 7.82(m、2H)、7.64(m、2H)、7.52(m、1H)、7.35(m、2H)、6.73(s、1H)、4.93(s、2H)、2.63(s、3H)

10

20

30

40

50

化合物番号 167. (2-メチル-キナゾルリノ-4-イル)-フェネチル-アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 7.77 (d, $J=8.3\text{ Hz}$, 1H), 7.60 (m, 2H), 7.33 (m, 3H), 7.24 (m, 3H), 6.12 (br, 1H), 3.94 (m, 2H), 3.01 (t, $J=6.9\text{ Hz}$, 2H), 2.65 (s, 3H)

化合物番号 168. (2-メチル-キナゾルリノ-4-イル)-(4-フェニル-ブチル)-アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 7.70 (m, 3H), 7.36 (t, $J=7.5\text{ Hz}$, 1H), 7.26 (m, 2H), 7.17 (m, 3H), 6.12 (br, 1H), 3.69 (d, $J=5.3\text{ Hz}$, 2H), 2.68 (t, $J=6.8\text{ Hz}$, 2H), 2.62 (s, 3H), 1.75 (t, $J=3.4\text{ Hz}$, 4H)

化合物番号 169. (2-メチル-キナゾルリノ-4-イル)-ナフタリン-1-イルメチル-アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 8.07 (m, 1H), 7.86 (m, 3H), 7.64 (t, $J=7.4\text{ Hz}$, 2H), 7.55-7.42 (m, 4H), 7.24 (m, 2H), 6.22 (brs, 1H), 5.27 (s, 2H), 2.70 (s, 3H)

化合物番号 170. ベンゾ[1,3]ジオキソール-5-イルメチル-(2-メチル-キナゾルリノ-4-イル)-アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 7.74 (m, 3H), 7.35 (t, $J=7.5\text{ Hz}$, 1H), 6.84 (t, $J=6.5\text{ Hz}$, 2H), 6.74 (d, $J=7.8\text{ Hz}$, 1H), 6.24 (br, 1H), 5.92 (s, 2H), 4.76 (d, $J=4.1\text{ Hz}$, 2H), 2.65 (s, 3H)

化合物番号 171. (3-フルオロベンジル)-(2-メチル-キナゾルリノ-4-イル)-アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 7.79 (m, 2H), 7.66 (t, $J=7.7\text{ Hz}$, 1H), 7.37 (t, $J=7.5\text{ Hz}$, 1H), 7.26 (t, $J=3.9\text{ Hz}$, 1H), 7.14 (m, 2H), 6.96 (m, 1H), 6.51 (s, 1H), 4.87 (d, $J=3.3\text{ Hz}$, 2H), 2.63 (s, 3H)

化合物番号 172. [2-(3-フルオロ-フェニル)-エチル]-(2-メチル-キナゾルリノ-4-イル)-アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 7.78 (d, $J=8.5\text{ Hz}$, 1H), 7.65 (t, $J=7.3\text{ Hz}$, 2H), 7.35 (t, $J=7.8\text{ Hz}$, 1H), 7.27 (m, 1H), 6.94 (m, 3H), 6.24 (br, 1H), 3.93 (m, 2H), 3.02 (t, $J=6.99\text{ Hz}$, 2H), 2.65 (s, 3H)

化合物番号 173. 2-[2-(2-メチル-キナゾルリノ-4-イルアミノ)-エトキシ]-エチルアルコール

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 7.83 (d, $J=8.1\text{ Hz}$, 1H), 7.72 (d, $J=10.7\text{ Hz}$, 1H), 7.61 (t, $J=7.1\text{ Hz}$, 1H), 7.30 (t, $J=6.5\text{ Hz}$, 1H), 6.96 (br, 1H), 3.82 (m, 6H), 3.68 (m, 2H), 2.60 (s, 3H)

化合物番号 174. 2-(2-メチル-キナゾルリノ-4-イルアミノ)-エチルアルコール

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 8.27 (d, $J=8.2\text{ Hz}$, 1H), 7.88 (t, $J=7.2\text{ Hz}$, 1H), 7.79 (t, $J=7.5\text{ Hz}$, 1H), 7.51 (m, 1H), 3.93 (m, 4H), 2.70 (s, 3H)

化合物番号 175. ベンジル-(2-イソプロピル-キナゾルリノ-4-イル)-アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 7.82 (d, $J=7.8\text{ Hz}$, 1H), 7.71-7.63 (m, 2H), 7.45-7.26 (m, 6H), 5.88 (br, 1H), 4.90 (d, $J=5.4\text{ Hz}$, 2H), 3.12 (m, 1H), 1.37 (d, $J=6.6\text{ Hz}$, 6H)

化合物番号 176. (2-イソプロピル-キナゾルリノ-4-イル)-(3-メトキシ-ベンジル)-アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 7.82 (d, $J=8.4\text{ Hz}$, 1H), 7.75 (m, 1H), 7.66 (m, 1H), 7.38 (t, $J=7.9\text{ Hz}$, 1H), 7.25 (t, $J=7.7\text{ Hz}$, 1H), 7.00 (m, 2H), 6.80 (m, 1H), 4.88 (d, $J=5.0\text{ Hz}$, 2H), 3.77 (s, 3H), 3.13 (m, 1H), 1.37 (d, $J=6.8\text{ Hz}$, 6H)

化合物番号 177. (2-イソプロピル-キナゾルリノ-4-イル)-(4-メトキシ-ベンジル)-アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 7.82 (d, $J=8.1\text{ Hz}$, 1H), 7.70-7.61 (m, 2H), 7.

10

20

30

40

50

35 (m, 3H)、6.89 (d, J=8.7 Hz、2H)、5.86 (br, 1H)、4.83 (d, J=5.4 Hz、2H)、3.81 (s, 3H)、3.14 (m, 1H)、1.38 (d, J=6.6 Hz、6H)

化合物番号 178. (2-イソプロピル-キナゾリノ-4-イル) - (3-トリクロロメチル-ベンジル) - アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 、300 MHz) δ 7.87 (m, 2H)、7.66 (m, 3H)、7.51 (d, J=7.8 Hz、1H)、7.39 (m, 2H)、4.96 (d, J=5.0 Hz、2H)、3.17 (m, 1H)、1.33 (d, J=6.8 Hz、6H)

化合物番号 179. (2-イソプロピル-キナゾリノ-4-イル) - フェネチル - アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 、300 MHz) δ 7.82 (d, J=8.1 Hz、1H)、7.67 (m, 1H)、7.55 (d, J=7.8 Hz、1H)、7.38-7.21 (m, 6H)、5.84 (br, 1H)、3.95 (q, J=6.9 Hz、2H)、3.16 (m, 1H)、3.05 (t, J=6.9 Hz、2H)、1.40 (d, J=6.9 Hz、6H)

10

化合物番号 180. (2-イソプロピル-キナゾリノ-4-イル) - (4-フェニル-ブチル) - アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 、300 MHz) δ 7.83 (d, J=7.9 Hz、1H)、7.75 (d, J=7.7 Hz、1H)、7.65 (t, J=7.6 Hz、1H)、7.35 (t, J=7.6 Hz、1H)、7.25 (m, 6H)、3.73 (d, J=5.5 Hz、2H)、3.14 (m, 1H)、2.68 (d, J=6.5 Hz、2H)、1.77 (m, 4H)、1.36 (d, J=6.8 Hz、6H)

化合物番号 181. (2-イソプロピル-キナゾリノ-4-イル) - ナフタリン-1-イルメチル - アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 、300 MHz) δ 8.18 (m, 1H)、7.93-7.81 (m, 3H)、7.68-7.43 (m, 6H)、7.30 (m, 1H)、5.85 (br, 1H)、5.35 (d, J=5.1 Hz、2H)、3.20 (m, 1H)、1.44 (d, J=6.6 Hz、6H)

20

化合物番号 182. ベンゾ[1,3]ジオキソール-5-イルメチル - (2-イソプロピル-キナゾリノ-4-イル) - アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 、300 MHz) δ 7.81 (d, J=7.8 Hz、1H)、7.70-7.63 (m, 2H)、7.66 (m, 1H)、6.94-6.87 (m, 2H)、6.78 (d, 1H, J=7.8 Hz)、5.94 (s, 2H)、5.90 (br, 1H)、4.80 (d, J=5.4 Hz、2H)、3.13 (m, 1H)、1.38 (d, J=6.6 Hz、6H)

化合物番号 183. (3-フルオロベンジル) - (2-イソプロピル-キナゾリノ-4-イル) - アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 、300 MHz) δ 7.82 (t, J=5.6 Hz、1H)、7.67 (t, J=7.7 Hz、1H)、7.37 (t, J=7.5 Hz、1H)、7.28-7.12 (m, 3H)、6.95 (t, J=7.3 Hz、1H)、6.34 (br, 1H)、4.89 (d, J=3.5 Hz、2H)、3.14 (m, 1H)、1.33 (d, J=6.8 Hz、6H)

30

化合物番号 184. [2-(3-フルオロ-フェニル) - エチル] - (2-イソプロピル-キナゾリノ-4-イル) - アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 、300 MHz) δ 7.83 (d, J=8.7 Hz、1H)、7.66 (t, J=7.2 Hz、2H)、7.38-7.23 (m, 2H)、6.89 (m, 3H)、6.32 (br, 1H)、3.94 (m, 1H)、3.17 (t, J=6.8 Hz、1H)、3.06 (m, 1H)、1.39 (d, J=6.8 Hz、6H)

化合物番号 185. 2-[2-(2-イソプロピル-キナゾリノ-4-イルアミノ) - エトキシ] - エチルアルコール

40

$^1\text{H NMR}$ (MeOD 、300 MHz) δ 7.78 (t, J=8.1 Hz、2H)、7.61 (t, J=7.6 Hz、1H)、7.29 (m, 1H)、6.78 (br, 1H)、3.89 (d, J=4.4 Hz、2H)、3.80 (m, 4H)、3.66 (t, J=4.4 Hz、2H)、3.11 (m, 1H)、1.33 (d, J=6.8 Hz、6H)

化合物番号 186. 2-(2-イソプロピル-キナゾリノ-4-イルアミノ) - エチルアルコール

$^1\text{H NMR}$ ($\text{CDCl}_3 + \text{MeOD}$ 、300 MHz) δ 7.85 (d, J=8.2 Hz、1H)、7.64 (m, 2H)、7.31 (m, 1H)、3.78 (m, 4H)、3.02 (m, 1H)、1.27 (d, J=6.8 Hz、6H)

化合物番号 187. ベンジル - (2-tert-ブチル-キナゾリノ-4-イル) - アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 、300 MHz) δ 7.90 (d, J=8.2 Hz、1H)、7.12 (d, J=5.3 Hz、1H)、7.53 (t, J=7.6 Hz、1H)、7.36-7.25 (m, 6H)、6.22 (br, 1H)、4.90 (d, J=

50

5.3H z、2H)、1.44 (s、9H)

化合物番号 188. (2-tert-ブチル-キナゾリノ-4-イル) - (3-メトキシ-ベンジル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃、300MHz) δ 7.88 (d、J=8.1Hz、1H)、7.66 (m、2H)、7.44-7.23 (m、3H、6.99 (d、J=8.0Hz、2H)、6.84 (t、J=4.2Hz、1H)、6.16 (br、1H)、4.87 (d、J=5.3Hz、2H)、3.78 (s、3H)、1.44 (s、9H)

化合物番号 189. (2-tert-ブチル-キナゾリノ-4-イル) - (4-メトキシ-ベンジル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃、300MHz) δ 7.86 (m、1H)、7.64 (m、2H)、7.32 (m、3H)、6.99 (d、J=8.7Hz、1H)、6.86 (d、J=5.6Hz、2H)、6.19 (br、1H)、4.82 (d、J=5.4Hz、2H)、3.80 (s、3H)、1.44 (s、9H)

化合物番号 190. (2-tert-ブチル-キナゾリノ-4-イル) - (3-トリクロロメチル-ベンジル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃、300MHz) δ 7.91 (d、J=8.3Hz、1H)、7.79-7.61 (m、4H)、7.53 (d、J=7.9Hz、1H)、7.46-7.34 (m、2H)、6.21 (br、1H)、4.95 (d、J=5.3Hz、2H)、1.45 (s、9H)

化合物番号 191. (2-tert-ブチル-キナゾリノ-4-イル) - フェネチル-アミン

¹HNM R (CDCl₃、300MHz) δ 7.85 (d、J=8.4Hz、1H)、7.66 (t、J=7.5Hz、1H)、7.53 (d、J=7.8Hz、1H)、7.31 (m、6H)、5.72 (brs、1H)、3.93 (q、J=6.9Hz、2H)、3.05 (t、J=7.2Hz、2H)、1.48 (s、9H)

化合物番号 192. (2-tert-ブチル-キナゾリノ-4-イル) - (4-フェニル-ブチル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃、300MHz) δ 7.87 (d、J=8.3Hz、1H)、7.65 (m、2H)、7.37-7.25 (m、3H)、7.19 (m、3H)、5.98 (br、1H)、3.71 (d、J=5.66Hz、2H)、2.68 (d、J=6.5Hz、2H)、1.44 (m、4H)、1.44 (s、9H)

化合物番号 193. (2-tert-ブチル-キナゾリノ-4-イル) - ナフタリン-1-イルメチル-アミン

¹HNM R (CDCl₃、300MHz) δ 8.20 (d、J=9.4Hz、1H)、7.89 (m、3H)、7.61 (m、3H)、7.50 (m、3H)、6.10 (br、1H)、5.35 (d、J=5.1Hz、2H)、1.52 (s、9H)

化合物番号 194. ベンゾ[1,3]ジオキソール-5-イルメチル- (2-tert-ブチル-キナゾリノ-4-イル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃、300MHz) δ 7.89 (d、J=8.3Hz、1H)、7.66 (m、2H)、7.34 (t、J=7.5Hz、1H)、6.91 (m、2H)、6.76 (d、J=7.9Hz、1H)、6.21 (br、1H)、5.93 (s、2H)、4.80 (d、J=6.2Hz、2H)、1.44 (s、9H)

化合物番号 195. (2-tert-ブチル-キナゾリノ-4-イル) - (3-フルオロベンジル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃、300MHz) δ 7.89 (d、J=8.3Hz、1H)、7.69 (m、2H)、7.35 (m、1H)、7.28 (m、1H)、7.14 (m、2H)、6.94 (d、J=5.4Hz、1H)、6.24 (br、1H)、4.99 (d、J=6.2Hz、2H)、1.45 (s、9H)

化合物番号 196. (2-tert-ブチル-キナゾリノ-4-イル) - [2- (3-フルオロ-フェニル) - エチル] - アミン

¹HNM R (CDCl₃、300MHz) δ 7.89 (d、J=8.3Hz、1H)、7.68 (m、2H)、7.33 (m、1H)、7.25 (m、1H)、6.98 (m、2H)、6.01 (br、1H)、3.93 (m、2H)、3.06 (t、J=2.6Hz、2H)、1.45 (s、9H)

化合物番号 197. 2-[2- (2-tert-ブチル-キナゾリノ-4-イルアミノ) - エトキシ] - エチルアルコール

¹HNM R (CDCl₃、300MHz) δ 7.85 (d、J=8.3Hz、1H)、7.71 (d、J=8.2Hz、1H)、7.63 (t、J=7.8Hz、1H)、7.33 (t、J=7.5Hz、1H)、6.33 (br、1H)、3.90 (d、J=4.1Hz、2H)、3.80 (t、J=4.6Hz、4H)、3.65 (t、J=4.6Hz、2H)、1.44 (s、9H)

10

20

30

40

50

化合物番号 198. 2-(2-tert-ブチル-キナゾリノ-4-イルアミノ)-エチルアルコール

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 7.83 (d, $J=8.0\text{ Hz}$, 1H), 7.69 (t, $J=7.6\text{ Hz}$, 2H), 7.38 (t, $J=7.6\text{ Hz}$, 1H), 6.14 (br, 1H), 4.59 (s, 1H), 3.93-3.83 (m, 4H), 1.44 (s, 9H)

化合物番号 199. ベンジル-(2-シクロヘキシル-キナゾリノ-4-イル)-アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 7.83 (d, $J=8.0\text{ Hz}$, 1H), 7.68 (m, 2H), 7.43 (d, $J=7.5\text{ Hz}$, 2H), 7.31 (m, 4H), 6.26 (br, 1H), 4.90 (d, $J=5.2\text{ Hz}$, 2H), 2.82 (t, $J=11.5\text{ Hz}$, 1H), 1.97 (m, 2H), 1.73 (m, 5H), 1.33 (m, 3H)

化合物番号 200. (2-シクロヘキシル-キナゾリノ-4-イル)-(3-メトキシ-ベンジル)-アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 7.84 (d, $J=8.3\text{ Hz}$, 1H), 7.73 (d, $J=8.2\text{ Hz}$, 1H), 7.65 (t, $J=7.3\text{ Hz}$, 1H), 7.34 (t, $J=7.6\text{ Hz}$, 1H), 7.26 (t, $J=7.8\text{ Hz}$, 1H), 7.01 (d, $J=7.3\text{ Hz}$, 2H), 6.84 (t, $J=4.5\text{ Hz}$, 1H), 6.43 (br, 1H), 4.88 (d, $J=6.8\text{ Hz}$, 2H), 3.78 (s, 3H), 2.84 (m, 1H), 2.02 (m, 2H), 1.85-1.66 (m, 5H), 1.48-1.28 (m, 3H)

化合物番号 201. (2-シクロヘキシル-キナゾリノ-4-イル)-(4-メトキシ-ベンジル)-アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 7.84 (d, $J=8.3\text{ Hz}$, 1H), 7.73 (d, $J=8.2\text{ Hz}$, 1H), 7.64 (t, $J=7.4\text{ Hz}$, 1H), 7.36 (m, 3H), 6.87 (d, $J=8.5\text{ Hz}$, 2H), 6.48n (br, 1H), 4.83 (d, $J=6.8\text{ Hz}$, 2H), 3.80 (s, 3H), 2.85 (m, 1H), 2.02 (m, 2H), 2.04-1.69 (m, 5H), 1.49-1.25 (m, 3H)

化合物番号 202. (2-シクロヘキシル-キナゾリノ-4-イル)-(3-トリクロロメチル-ベンジル)-アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 7.83 (m, 2H), 7.78 (m, 1H), 7.64 (m, 2H), 7.53 (m, 1H), 7.40 (m, 2H), 6.67 (br, 1H), 4.93 (d, $J=5.0\text{ Hz}$, 2H), 2.80 (m, 1H), 1.90 (m, 2H), 1.84-1.60 (m, 5H), 1.45-1.25 (m, 3H)

化合物番号 203. (2-シクロヘキシル-キナゾリノ-4-イル)-フェネチル-アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 7.83 (d, $J=8.3\text{ Hz}$, 1H), 7.65 (m, 2H), 7.28 (m, 6H), 6.06 (br, 1H), 3.95 (m, 2H), 3.05 (t, $J=7.0\text{ Hz}$, 2H), 2.83 (m, 1H), 2.04 (m, 2H), 1.88-1.71 (m, 5H), 1.50-1.35 (m, 3H)

化合物番号 204. (2-シクロヘキシル-キナゾリノ-4-イル)-(4-フェニル-ブチル)-アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 7.83 (d, $J=8.3\text{ Hz}$, 1H), 7.69 (m, 2H), 7.37-7.17 (m, 7H), 6.12 (br, 1H), 3.72 (d, $J=5.6\text{ Hz}$, 2H), 2.78 (t, $J=11.1\text{ Hz}$, 1H), 2.70 (t, $J=6.7\text{ Hz}$, 2H), 2.00 (m, 2H), 1.86-1.68 (m, 9H), 1.44-1.28 (m, 3H)

化合物番号 205. (2-シクロヘキシル-キナゾリノ-4-イル)-ナフタリン-1-イルメチル-アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 8.20 (d, $J=9.4\text{ Hz}$, 1H), 7.87 (m, 3H), 7.62 (m, 3H), 7.50 (m, 3H), 7.30 (m, 1H), 6.34 (br, 1H), 5.35 (d, $J=4.9\text{ Hz}$, 2H), 2.92 (m, 1H), 2.08 (m, 2H), 1.86-1.73 (m, 5H), 1.47-1.25 (m, 3H)

化合物番号 206. ベンゾ[1,3]ジオキソール-5-イルメチル-(2-シクロヘキシル-キナゾリノ-4-イル)-アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 7.83 (d, $J=8.4\text{ Hz}$, 1H), 7.73 (d, $J=8.2\text{ Hz}$, 1H), 7.65 (t, $J=7.5\text{ Hz}$, 2H), 6.91 (m, 2H), 6.76 (d, $J=7.9\text{ Hz}$, 1H), 6.34 (br, 1H), 5.93 (s, 2H), 4.80 (d, $J=5.2\text{ Hz}$, 2H), 2.84 (m, 1H), 2.00 (m, 2H), 1.86-1.68 (m, 5H), 1.48-1.25 (m, 3H)

化合物番号 207. (2-シクロヘキシル-キナゾリノ-4-イル)-(3-フルオロベンジル)-アミン

10

20

30

40

50

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 7.80 (m, 1H)、7.66 (t, J=7.6Hz, 1H)、7.35 (m, 1H)、7.27 (m, 2H)、7.16 (m, 2H)、6.95 (d, J=8.4Hz, 1H)、6.47 (br, 1H)、4.90 (d, J=5.2Hz, 2H)、2.83 (m, 1H)、1.99 (m, 2H)、1.84-1.63 (m, 5H)、1.46-1.25 (m, 3H)

化合物番号 208. (2-シクロヘキシル-キナゾリノ-4-イル) - [2- (3-フルオロ-フェニル) -エチル] -アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 7.83 (d, J=8.3Hz, 1H)、7.65 (t, J=7.7Hz, 2H)、7.30 (m, 2H)、6.99 (m, 3H)、6.15 (br, 1H)、3.94 (m, 2H)、3.05 (t, J=7.1Hz, 2H)、2.83 (m, 1H)、2.00 (m, 2H)、1.88-1.69 (m, 5H)、1.46-1.25 (m, 3H)

10

化合物番号 209. 2-[2- (2-シクロヘキシル-キナゾリノ-4-イルアミノ) -エトキシ] -エチルアルコール

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 7.75 (m, 2H)、7.62 (t, J=7.6Hz, 1H)、7.31 (t, J=7.5Hz, 1H)、6.48 (br, 1H)、3.90 (m, 2H)、3.80 (m, 4H)、3.36 (m, 2H)、2.78 (m, 1H)、1.90 (m, 2H)、1.85-1.62 (m, 5H)、1.47-1.27 (m, 3H)

化合物番号 210. 2- (2-シクロヘキシル-キナゾリノ-4-イルアミノ) -エチルアルコール

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 7.80 (d, J=8.4Hz, 1H)、7.69 (m, 2H)、7.40 (t, J=7.0Hz, 1H)、6.20 (br, 1H)、5.08 (br, 1H)、3.93 (m, 2H)、3.85 (m, 2H)、2.77 (m, 1H)、1.97 (m, 2H)、1.86-1.66 (m, 5H)、1.47-1.25 (m, 3H)

20

化合物番号 211. ベンジル- (2-ベンジル-キナゾリノ-4-イル) -アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 7.82 (d, J=8.4Hz, 1H)、7.71 (m, 2H)、7.47 (m, 2H)、7.29 (m, 9H)、5.94 (br, 1H)、4.82 (d, J=5.5Hz, 2H)、4.19 (s, 2H)

化合物番号 212. (2-ベンジル-キナゾリノ-4-イル) - (3-メトキシ-ベンジル) -アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 7.82 (d, J=8.1Hz, 1H)、7.69 (t, J=6.9Hz, 1H)、7.60 (d, J=8.1Hz, 1H)、7.45 (d, J=7.2Hz, 2H)、7.37 (t, J=7.2Hz, 1H)、7.25 (m, 4H)、6.85 (m, 3H)、5.87 (br, 1H)、4.80 (d, J=5.4Hz, 2H)、4.19 (s, 2H)、3.76 (s, 3H)

30

化合物番号 213. (2-ベンジル-キナゾリノ-4-イル) - (4-メトキシ-ベンジル) -アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 7.81 (d, J=8.4Hz, 1H)、7.67 (t, J=7.7Hz, 1H)、7.59 (d, J=8.1Hz, 1H)、7.46 (d, J=7.3Hz, 2H)、7.35 (t, J=7.6Hz, 1H)、7.23 (m, 5H)、6.83 (d, J=8.5Hz, 2H)、5.87 (br, 1H)、4.74 (d, J=5.3Hz, 2H)、4.20 (s, 2H)、3.80 (s, 3H)

化合物番号 214. (2-ベンジル-キナゾリノ-4-イル) - (3-トリクロロメチル-ベンジル) -アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 7.80 (m, 2H)、7.66 (m, 2H)、7.49 (m, 2H)、7.37 (m, 4H)、7.20 (m, 2H)、6.56 (br, 1H)、4.86 (d, J=6.3Hz, 2H)、4.18 (s, 2H)

40

化合物番号 215. (2-ベンジル-キナゾリノ-4-イル) -フェネチル-アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 7.82 (d, J=8.3Hz, 1H)、7.61 (m, 4H)、7.34-7.17 (m, 6H)、6.12 (br, 1H)、4.21 (s, 2H)、3.88 (m, 2H)、2.94 (t, J=7.2Hz, 2H)

化合物番号 216. (2-ベンジル-キナゾリノ-4-イル) - (4-フェニル-ブチル) -アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 7.81 (d, J=8.3Hz, 1H)、7.63 (t, J=7.8Hz, 2H)、7.46 (d, J=7.3Hz, 2H)、7.33 (m, 5H)、7.24 (m, 4H)、5.98 (br, 1H)、4.18 (s, 2H)、3.62 (d, J=5.7Hz, 2H)、2.64 (t, J=5.1Hz, 2H)、1.69 (m, 2H)

化合物番号 217. (2-ベンジル-キナゾリノ-4-イル) -ナフタリン-1-イルメチル-

50

アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 8.01 (d, J=8.3Hz, 1H)、7.85 (m, 3H)、7.54 (m, 2H)、7.52-7.39 (m, 6H)、7.25 (m, 4H)、6.32 (br, 1H)、5.28 (d, J=5.0Hz, 2H)、4.25 (s, 2H)

化合物番号 218. ベンゾ[1,3]ジオキソール-5-イルメチル-(2-ベンジル-キナゾルリノ-4-イル)-アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 7.82 (d, J=8.4Hz, 1H)、7.68 (m, 1H)、7.61 (d, J=8.1Hz, 1H)、7.46 (d, J=7.2Hz, 2H)、7.36 (m, 1H)、7.25 (m, 2H)、7.18 (m, 1H)、6.81-6.71 (m, 3H)、5.94 (s, 2H)、5.89 (br, 1H)、4.71 (d, J=5.7Hz, 2H)、4.20 (s, 2H)

10

化合物番号 219. (2-ベンジル-キナゾルリノ-4-イル)-(3-フルオロベンジル)-アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 7.83 (d, J=8.0Hz, 1H)、7.69 (t, J=7.3Hz, 2H)、7.40 (m, 3H)、7.23 (m, 4H)、7.03 (m, 3H)、6.15 (br, 1H)、4.81 (d, J=5.7Hz, 2H)、4.18 (s, 2H)

化合物番号 220. (2-ベンジル-キナゾルリノ-4-イル)-[2-(3-フルオロフェニル)-エチル]-アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 7.82 (d, J=8.4Hz, 1H)、7.68 (d, J=7.5Hz, 1H)、7.49 (m, 3H)、7.34 (m, 5H)、6.92 (m, 3H)、5.69 (br, 1H)、4.21 (s, 2H)、3.84 (q, J=6.6Hz, 2H)、2.92 (t, J=7.2Hz, 2H)

20

化合物番号 221. 2-[2-(2-ベンジル-キナゾルリノ-4-イルアミノ)-エトキシ]-エチルアルコール

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 7.80 (d, J=8.4Hz, 1H)、7.66 (d, J=8.4Hz, 2H)、7.45 (d, J=7.2Hz, 2H)、7.36 (d, J=7.7Hz, 1H)、7.28 (m, 3H)、6.12 (br, 1H)、4.17 (s, 2H)、3.78 (m, 6H)、3.59 (t, J=4.5Hz, 2H)、2.13 (brs, 1H)

化合物番号 222. 2-(2-ベンジル-キナゾルリノ-4-イルアミノ)-エチルアルコール

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 7.80 (d, J=8.3Hz, 1H)、7.67 (m, 2H)、7.40 (m, 3H)、7.23 (m, 4H)、6.22 (br, 1H)、4.15 (s, 2H)、3.83 (t, J=4.5Hz, 2H)、3.76 (m, 2H)

30

化合物番号 223. ベンジル-(2-ピリジン-2-イル-キナゾルリノ-4-イル)-アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 8.80 (d, J=3.9Hz, 1H)、8.55 (d, J=7.9Hz, 1H)、8.08 (d, J=8.4Hz, 1H)、7.84 (m, 2H)、7.71 (t, J=7.7Hz, 1H)、7.42 (m, 3H)、7.34 (m, 4H)、6.65 (br, 1H)、4.99 (s, 2H)

化合物番号 224. (3-メトキシベンジル)-(2-ピリジン-2-イル-キナゾルリノ-4-イル)-アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 8.81 (d, J=4.2Hz, 1H)、8.56 (d, J=7.8Hz, 1H)、8.08 (d, J=8.4Hz, 1H)、7.92-7.72 (m, 3H)、7.44 (t, J=7.6Hz, 1H)、7.36 (t, J=6.1Hz, 1H)、7.24 (m, 2H)、7.02 (m, 1H)、6.83 (m, 1H)、6.80 (br, 1H)、4.97 (s, 2H)、3.75 (s, 3H)

40

化合物番号 225. (4-メトキシベンジル)-(2-ピリジン-2-イル-キナゾルリノ-4-イル)-アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 8.82 (d, J=4.2Hz, 1H)、8.59 (d, J=7.9Hz, 1H)、8.08 (d, J=8.3Hz, 1H)、7.84 (m, 2H)、7.71 (t, J=7.3Hz, 1H)、7.43 (m, 4H)、6.86 (d, J=8.6Hz, 2H)、6.61 (br, 1H)、4.93 (s, 2H)、3.78 (s, 3H)

化合物番号 226. (2-ピリジン-2-イル-キナゾルリノ-4-イル)-(3-トリクロロメチルベンジル)-アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 8.78 (d, J=4.4Hz, 1H)、8.44 (d, J=7.9Hz, 1H)、8.04 (m, 2H)、7.74 (m, 1H)、7.65 (m, 2H)、7.48 (m, 1H)、7.44-7.34 (m, 4

50

H)、6.12 (br、1H)、5.03 (s、2H)

化合物番号 2 2 7. フェネチル-(2-ピリジン-2-イル-キナゾルリノ-4-イル)-アミン

¹HNM R (CDCl₃、300MHz) δ 8.84 (d、J=4.0Hz、1H)、8.62 (d、J=7.9Hz、1H)、8.08 (d、J=8.3Hz、1H)、7.86 (t、J=3.8Hz、1H)、7.73 (m、2H)、7.45-7.24 (m、7H)、6.54 (br、1H)、4.07 (t、J=6.7Hz、2H)、3.10 (t、J=7.1Hz、2H)

化合物番号 2 2 8. (4-フェニル-ブチル)-(2-ピリジン-2-イル-キナゾルリノ-4-イル)-アミン

¹HNM R (CDCl₃、300MHz) δ 8.83 (d、J=4.2Hz、1H)、8.55 (d、J=7.9Hz、1H)、8.06 (d、J=8.3Hz、1H)、7.84 (m、2H)、7.71 (t、J=7.5Hz、1H)、7.44 (t、J=7.5Hz、1H)、7.37 (t、J=6.0Hz、1H)、7.28-7.16 (m、5H)、6.44 (br、1H)、3.83 (m、2H)、2.70 (t、J=6.3Hz、2H)、1.81 (m、4H)

化合物番号 2 2 9. ナフタリン-1-イルメチル-(2-ピリジン-2-イル-キナゾルリノ-4-イル)-アミン

¹HNM R (CDCl₃、300MHz) δ 8.83 (d、J=4.0Hz、1H)、8.60 (d、J=7.9Hz、1H)、8.10 (d、J=8.3Hz、1H)、8.05 (m、1H)、7.83 (m、4H)、7.71 (m、1H)、7.63 (m、1H)、7.50-7.36 (m、5H)、6.78 (br、1H)、5.43 (s、2H)

化合物番号 2 3 0. ベンゾ[1,3]ジオキソール-5-イルメチル-(2-ピリジン-2-イル-キナゾルリノ-4-イル)-アミン

¹HNM R (CDCl₃、300MHz) δ 8.83 (d、J=4.1Hz、1H)、8.58 (d、J=8.0Hz、1H)、8.08 (d、J=8.3Hz、1H)、7.84 (m、2H)、7.73 (d、J=7.2Hz、1H)、7.45 (m、1H)、7.36 (m、1H)、6.90 (m、2H)、6.76 (d、J=7.8Hz、1H)、6.61 (br、1H)、5.92 (s、2H)、4.90 (s、2H)

化合物番号 2 3 1. (3-フルオロベンジル)-(2-ピリジン-2-イル-キナゾルリノ-4-イル)-アミン

¹HNM R (CDCl₃、300MHz) δ 8.80 (d、J=4.1Hz、1H)、8.49 (d、J=8.1Hz、1H)、8.05 (m、2H)、7.83 (m、1H)、7.73 (t、J=7.7Hz、1H)、7.47 (m、1H)、7.37 (m、1H)、7.28 (m、2H)、7.18 (m、1H)、6.94 (m、1H)、6.43 (br、1H)、5.00 (s、2H)

化合物番号 2 3 2. [2-(3-フルオロ-フェニル)-エチル]-(2-ピリジン-2-イル-キナゾルリノ-4-イル)-アミン

¹HNM R (CDCl₃、300MHz) δ 8.83 (d、J=4.1Hz、1H)、8.59 (d、J=8.2Hz、1H)、8.07 (d、J=8.3Hz、1H)、7.86 (t、J=7.7Hz、1H)、7.73 (m、2H)、7.39 (m、2H)、7.25 (m、1H)、7.00 (m、3H)、6.45 (br、1H)、4.03 (m、2H)、3.08 (t、J=6.6Hz、2H)

化合物番号 2 3 3. 2-[2-(2-ピリジン-2-イル-キナゾルリノ-4-イルアミノ)-エトキシ]-エチルアルコール

¹HNM R (CDCl₃、300MHz) δ 8.89 (t、J=6.8Hz、2H)、8.46 (d、J=8.0Hz、1H)、8.00 (m、2H)、7.58 (d、J=7.5Hz、2H)、7.41 (t、J=7.2Hz、1H)、6.63 (br、1H)、4.08 (m、4H)、8.83 (m、4H)

化合物番号 2 3 4. 2-(2-ピリジン-2-イル-キナゾルリノ-4-イルアミノ)-エチルアルコール

¹HNM R (CDCl₃、300MHz) δ 8.80 (d、J=4.6Hz、1H)、8.56 (d、J=8.1Hz、1H)、8.01 (d、J=8.3Hz、1H)、7.84 (m、2H)、7.74 (t、J=7.7Hz、1H)、7.40 (m、1H)、7.36 (m、1H)、6.81 (br、1H)、3.97 (m、4H)

化合物番号 2 3 5. ベンジル-(2-ピリジン-3-イル-キナゾルリノ-4-イル)-アミン

¹HNM R (CDCl₃、300MHz) δ 9.72 (s、1H)、8.67 (d、J=4.5Hz、1H)、8.54 (m、1H)、7.96 (d、J=8.3Hz、1H)、7.79 (m、2H)、7.46-7.29 (m、6H)、6.52 (br、1H)、4.99 (d、J=5.4Hz、2H)

化合物番号 2 3 6. (3-メトキシ-ベンジル)-(2-ピリジン-3-イル-キナゾルリノ-4-

10

20

30

40

50

イル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 9.72 (s, 1H)、8.86 (d、J=7.9Hz、1H)、8.68 (d、J=3.8Hz、1H)、8.01 (d、J=8.3Hz、1H)、7.85 (d、J=8.1Hz、1H)、7.83 (m、1H)、7.43 (m、2H)、7.26 (m、1H)、7.01 (t、J=5.9Hz、2H)、6.84 (t、J=4.13Hz、1H)、6.68 (br、1H)、4.97 (d、J=5.4Hz、2H)、3.77 (s、3H)

化合物番号 237. (4-メトキシ-ベンジル) - (2-ピリジン-3-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 9.74 (s、1H)、8.83 (d、J=7.9Hz、1H)、8.66 (d、J=3.6Hz、1H)、7.95 (d、J=8.3Hz、1H)、7.75 (m、2H)、7.38 (m、4H)、6.87 (d、J=8.8Hz、2H)、6.38 (br、1H)、4.90 (d、J=5.4Hz、2H)、3.78 (s、3H)

10

化合物番号 238. (2-ピリジン-3-イル-キナゾルリノ-4-イル) - (3-トリクロロメチル-ベンジル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 9.89 (s、1H)、8.74 (m、2H)、7.96 (d、J=8.3Hz、1H)、7.78 (m、4H)、7.47 (m、4H)、6.39 (br、1H)、5.05 (d、J=5.4Hz、2H)

化合物番号 239. フェネチル- (2-ピリジン-3-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 9.77 (s、1H)、8.85 (s、J=8.0Hz、1H)、7.95 (d、J=8.5Hz、1H)、7.73 (m、1H)、7.41 (m、7H)、6.17 (br、1H)、4.05 (m、2H)、3.10 (t、J=6.9Hz、2H)

化合物番号 240. (4-フェニル-ブチル) - (2-ピリジン-3-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

20

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 9.74 (s、1H)、8.82 (d、J=8.0Hz、1H)、8.68 (d、J=3.9Hz、1H)、7.95 (d、J=8.1Hz、1H)、7.72 (t、J=7.6Hz、2H)、7.41 (m、2H)、7.24 (m、5H)、6.12 (br、1H)、3.80 (t、J=5.9Hz、2H)、2.71 (t、J=6.7Hz、2H)、1.81 (t、J=3.4Hz、4H)

化合物番号 241. ナフタリン-1-イルメチル- (2-ピリジン-3-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 9.82 (s、1H)、8.88 (d、J=7.9Hz、1H)、8.69 (m、1H)、8.12 (m、1H)、7.92 (m、3H)、7.80 (m、1H)、7.61 (m、2H)、7.50 (m、5H)、6.05 (br、1H)、5.43 (d、J=4.8Hz、2H)

化合物番号 242. ベンゾ[1,3]ジオキソール-5-イルメチル- (2-ピリジン-3-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

30

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 9.72 (s、1H)、8.89 (d、J=8.0Hz、1H)、8.69 (d、J=4.5Hz、1H)、8.03 (d、J=8.5Hz、1H)、7.86 (d、J=8.1Hz、1H)、7.73 (t、J=7.3Hz、1H)、7.43 (t、J=6.5Hz、2H)、6.92 (d、J=7.8Hz、2H)、7.77 (d、J=7.7Hz、2H)、5.92 (s、2H)、4.90 (d、J=5.4Hz、2H)

化合物番号 243. (3-フルオロベンジル) - (2-ピリジン-3-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 9.69 (s、1H)、8.81 (d、J=8.0Hz、1H)、8.68 (d、J=3.8Hz、1H)、8.00 (d、J=8.3Hz、1H)、7.87 (d、J=8.1Hz、1H)、7.75 (m、1H)、7.44 (m、2H)、7.29 (m、2H)、7.14 (m、1H)、6.96 (m、1H)、6.72 (br、1H)、5.00 (d、J=5.6Hz、2H)

40

化合物番号 244. [2- (3-フルオロ-フェニル) -エチル]- (2-ピリジン-3-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 9.75 (s、1H)、8.86 (d、J=8.0Hz、1H)、8.69 (d、J=4.1Hz、1H)、7.97 (d、J=8.4Hz、1H)、7.70 (m、2H)、7.43 (m、2H)、7.27 (m、2H)、6.99 (m、3H)、6.28 (br、1H)、4.05 (m、2H)、3.11 (t、J=6.9Hz、2H)

化合物番号 245. 2-[2- (2-ピリジン-3-イル-キナゾルリノ-4-イルアミノ) -エトキシ]-エチルアルコール

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 9.66 (s、1H)、8.73 (d、J=7.2Hz、1H)、8.63 (d

50

、J=2.8H z、1H)、7.86 (d、J=8.3H、1H z)、7.79 (d、J=8.2H z、1H)、7.65 (m、1H)、7.35 (m、2H)、6.81 (br、1H)、3.97 (m、2H)、3.83 (m、4H)、3.67 (m、2H)

化合物番号 2 4 6. 2-(2-ピリジン-3-イル-キナゾルリノ-4-イルアミノ)-エチルアルコール

¹HNM R (CDCl₃、300MH z) δ 9.67 (s、1H)、8.76 (d、J=8.03H z、1H)、8.66 (d、J=3.4H z、1H)、7.94 (t、J=7.7H z、2H)、7.72 (t、J=7.6H z、1H)、7.42 (m、2H)、6.94 (br、1H)、4.00 (m、4H)

化合物番号 2 4 7. ベンジル-(2-ピリジン-4-イル-キナゾルリノ-4-イル)-アミン

¹HNM R (CDCl₃、300MH z) δ 8.74 (m、2H)、8.43 (d、J=5.5H z、2H)、7.98 (d、J=8.3H z、1H)、7.75 (t、J=4.4H z、2H)、7.48 (m、3H)、7.36 (m、3H)、6.21 (br、1H)、5.01 (d、J=5.4H z、2H) 10

化合物番号 2 4 8. (3-メトキシ-ベンジル)-(2-ピリジン-4-イル-キナゾルリノ-4-イル)-アミン

¹HNM R (CDCl₃、300MH z) δ 8.73 (d、J=5.0H z、2H)、8.43 (d、J=5.5H z、2H)、9.98 (d、J=8.2H z、1H)、7.77 (t、J=7.7H z、2H)、7.49 (d、J=7.2H z、1H)、7.26 (m、2H)、6.84 (m、1H)、6.35 (br、1H)、4.98 (d、J=5.3H z、2H)

化合物番号 2 4 9. (4-メトキシ-ベンジル)-(2-ピリジン-4-イル-キナゾルリノ-4-イル)-アミン

¹HNM R (CDCl₃、300MH z) δ 8.74 (d、J=5.5H z、2H)、8.46 (d、J=5.5H z、2H)、7.98 (d、J=8.2H z、1H)、7.76 (t、J=7.6H z、2H)、7.47 (t、J=7.6H z、1H)、7.38 (d、J=8.5H z、2H)、6.90 (d、J=8.5H z、2H)、6.29 (br、1H)、4.93 (d、J=5.4H z、2H)、3.80 (s、3H) 20

化合物番号 2 5 0. (2-ピリジン-4-イル-キナゾルリノ-4-イル)-(3-トリクロロメチル-ベンジル)-アミン

¹HNM R (CDCl₃、300MH z) δ 8.72 (m、2H)、8.40 (d、J=4.71H z、2H)、8.02 (d、J=8.3H z、1H)、7.84 (m、2H)、7.75 (m、1H)、7.65 (m、1H)、7.52 (m、3H)、6.57 (br、1H)、5.02 (d、J=5.3H z、2H)

化合物番号 2 5 1. フェネチル-(2-ピリジン-4-イル-キナゾルリノ-4-イル)-アミン

¹HNM R (CDCl₃、300MH z) δ 8.74 (d、J=5.5H z、2H)、8.45 (d、J=5.5H z、2H)、7.96 (d、J=8.3H z、1H)、7.76 (t、J=7.4H z、1H)、7.67 (dH、J=8.2H z、1)、7.46 (d、J=7.2H z、1H)、7.33 (m、5H)、6.09 (br、1H)、4.06 (m、2H)、3.11 (t、J=6.9H z、2H) 30

化合物番号 2 5 2. (4-フェニル-ブチル)-(2-ピリジン-4-イル-キナゾルリノ-4-イル)-アミン

¹HNM R (300MH z、CDCl₃、300MH z) δ 8.76 (d、J=5.4H z、2H)、8.42 (d、J=5.5H z、2H)、7.97 (d、J=8.3H z、1H)、7.75 (t、J=7.5H z、2H)、7.47 (t、J=7.5H z、1H)、7.25 (m、6H)、6.10 (br、1H)、3.82 (d、J=5.6H z、2H)、2.73 (t、J=6.6H z、2H)、1.84 (m、4H)

化合物番号 2 5 3. ナフタリン-1-イルメチル-(2-ピリジン-4-イル-キナゾルリノ-4-イル)-アミン 40

¹HNM R (CDCl₃、300MH z) δ 8.76 (d、J=5.4H z、2H)、8.46 (d、J=5.3H z、2H)、8.12 (d、J=8.4H z、1H)、7.95 (m、3H)、7.77 (m、1H)、7.62 (t、J=5.8H z、2H)、7.50 (m、4H)、5.99 (br、1H)、5.44 (d、J=4.9H z、2H)

化合物番号 2 5 4. ベンゾ[1,3]ジオキソール-5-イルメチル-(2-ピリジン-4-イル-キナゾルリノ-4-イル)-アミン

¹HNM R (CDCl₃、300MH z) δ 8.74 (d、J=5.4H z、2H)、8.40 (d、J=6.06H z、2H)、7.96 (d、J=8.4H z、1H)、7.76 (m、2H)、7.48 (t、J=7.6H z、1H)、6.92 (d、J=7.97H z、2H)、6.80 (d、J=7.7H z、1H)、6.07 (br、1H)、5.96 (s、2H)、4.91 (d、J=5.3H z、2H) 50

化合物番号 2 5 5. (3-フルオロベンジル) - (2-ピリジン-4-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 8.74 (d, $J=5.4\text{ Hz}$, 2H), 8.38 (d, $J=5.1\text{ Hz}$, 2H), 7.98 (d, $J=8.4\text{ Hz}$, 1H), 7.79 (t, $J=7.8\text{ Hz}$, 2H), 7.51 (t, $J=3.9\text{ Hz}$, 1H), 7.35 (t, $J=3.9\text{ Hz}$, 1H), 7.25 (m, 1H), 7.17 (m, 1H), 7.01 (m, 1H), 6.24 (br, 1H), 5.01 (d, $J=5.5\text{ Hz}$, 2H)

化合物番号 2 5 6. [2- (3-フルオロ-フェニル) - エチル] - (2-ピリジン-4-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 8.76 (d, $J=5.5\text{ Hz}$, 2H), 8.44 (d, $J=5.3\text{ Hz}$, 2H), 7.98 (d, $J=8.4\text{ Hz}$, 1H), 7.67 (d, $J=8.0\text{ Hz}$, 1H), 7.48 (d, $J=7.3\text{ Hz}$, 1H), 7.28 (m, 1H), 7.03 (m, 3H), 6.14 (br, 1H), 4.05 (m, 2H), 3.11 (t, $J=6.9\text{ Hz}$, 2H)

10

化合物番号 2 5 7. 2-[2- (2-ピリジン-4-イル-キナゾルリノ-4-イルアミノ) - エトキシ] - エチルアルコール

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 8.72 (d, $J=4.8\text{ Hz}$, 2H), 8.36 (d, $J=5.8\text{ Hz}$, 2H), 7.92 (d, $J=8.3\text{ Hz}$, 1H), 7.83 (d, $J=8.2\text{ Hz}$, 1H), 7.73 (t, $J=7.6\text{ Hz}$, 1H), 7.45 (t, $J=7.6\text{ Hz}$, 1H), 6.64 (br, 1H), 4.02 (m, 2H), 3.81 (m, 4H), 3.69 (m, 2H)

化合物番号 2 5 8. 2- (2-ピリジン-4-イル-キナゾルリノ-4-イルアミノ) - エチルアルコール

20

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 8.71 (d, $J=4.8\text{ Hz}$, 2H), 8.35 (d, $J=5.5\text{ Hz}$, 2H), 8.13 (d, $J=8.4\text{ Hz}$, 1H), 7.90 (d, $J=8.2\text{ Hz}$, 1H), 7.73 (t, $J=8.3\text{ Hz}$, 1H), 7.47 (t, $J=7.6\text{ Hz}$, 1H), 7.18 (br, 1H), 3.99 (m, 4H)

化合物番号 2 5 9. ベンジル-[2- (4-クロロ-フェニル) - キナゾルリノ-4-イル] - アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 8.52 (d, $J=8.6\text{ Hz}$, 2H), 7.92 (d, $J=8.2\text{ Hz}$, 1H), 7.71 (m, 2H), 7.40 (m, 8H), 5.97 (br, 1H), 5.00 (d, $J=5.5\text{ Hz}$, 2H)

化合物番号 2 6 0. [2- (4-クロロ-フェニル) - キナゾルリノ-4-イル] - (3-メトキシベンジル) - アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 8.52 (d, $J=8.5\text{ Hz}$, 2H), 7.92 (d, $J=8.3\text{ Hz}$, 1H), 7.72 (m, 2H), 7.42 (m, 3H), 7.28 (m, 1H), 7.03 (d, $J=8.0\text{ Hz}$, 2H), 6.87 (t, $J=4.2\text{ Hz}$, 1H), 5.98 (br, 1H), 4.98 (d, $J=5.5\text{ Hz}$, 2H), 3.78 (s, 3H)

30

化合物番号 2 6 1. [2- (4-クロロ-フェニル) - キナゾルリノ-4-イル] - (4-メトキシベンジル) - アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 8.53 (d, $J=8.5\text{ Hz}$, 2H), 7.96 (d, $J=8.55\text{ Hz}$, 1H), 7.72 (m, 2H), 7.38 (m, 5H), 6.90 (d, $J=8.6\text{ Hz}$, 2H), 4.92 (d, $J=5.3\text{ Hz}$, 2H), 3.80 (s, 3H)

化合物番号 2 6 2. [2- (4-クロロ-フェニル) - キナゾルリノ-4-イル] - (3-トリクロロメチル-ベンジル) - アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 8.45 (d, $J=8.6\text{ Hz}$, 2H), 7.95 (d, $J=8.5\text{ Hz}$, 1H), 7.75 (m, 3H), 7.65 (d, $J=7.7\text{ Hz}$, 1H), 7.56 (d, $J=7.7\text{ Hz}$, 1H), 7.45 (m, 4H), 6.12 (br, 1H), 5.05 (d, $J=5.5\text{ Hz}$, 2H)

40

化合物番号 2 6 3. [2- (4-クロロ-フェニル) - キナゾルリノ-4-イル] - フェネチル-アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 8.54 (d, $J=8.4\text{ Hz}$, 2H), 7.94 (d, $J=8.5\text{ Hz}$, 1H), 7.70 (t, $J=7.5\text{ Hz}$, 1H), 7.60 (d, $J=8.1\text{ Hz}$, 1H), 7.46 (d, $J=8.6\text{ Hz}$, 2H), 7.35 (m, 6H), 6.04 (br, 1H), 4.05 (m, 2H), 3.10 (t, $J=7.0\text{ Hz}$, 2H)

化合物番号 2 6 4. [2- (4-クロロ-フェニル) - キナゾルリノ-4-イル] - (4-フェニルブチル) - アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 8.50 (d, $J=8.5\text{ Hz}$, 2H), 7.93 (d, $J=8.6\text{ Hz}$, 1

50

H)、7.70 (m、2H)、7.41 (m、3H)、7.25 (m、5H)、6.09 (br、1H)、3.80 (d、J=5.5 Hz、2H)、2.72 (m、2H)、1.82 (m、4H)

化合物番号 265. [2-(4-クロロ-フェニル)-キナゾリノ-4-イル]-ナフタリン-1-イルメチル-アミン

¹H NMR (CDCl₃、300 MHz) δ 8.58 (d、J=8.5 Hz、2H)、8.17 (m、1H)、7.91 (m、3H)、7.63 (m、1H)、7.51 (m、7H)、7.36 (m、1H)、5.87 (br、1H)、5.42 (d、J=4.8 Hz、2H)

化合物番号 266. ベンゾ[1,3]ジオキソール-5-イルメチル-[2-(4-クロロ-フェニル)-キナゾリノ-4-イル]-アミン

¹H NMR (CDCl₃、300 MHz) δ 8.52 (d、J=8.6 Hz、2H)、7.92 (d、J=8.3 Hz、1H)、7.71 (m、2H)、7.43 (m、3H)、6.93 (d、J=11.4 Hz、2H)、6.80 (d、J=10.2 Hz、1H)、5.95 (s、2H)、5.94 (br、1H)、4.89 (d、J=4.9 Hz、2H) 10

化合物番号 267. [2-(4-クロロ-フェニル)-キナゾリノ-4-イル]-(3-フルオロベンジル)-アミン

¹H NMR (CDCl₃、300 MHz) δ 8.48 (d、J=8.5 Hz、2H)、7.92 (d、J=8.5 Hz、1H)、7.74 (m、2H)、7.77 (m、3H)、7.23 (m、3H)、7.00 (m、1H)、6.07 (br、1H)、4.98 (d、J=5.5 Hz、2H)

化合物番号 268. [2-(4-クロロ-フェニル)-キナゾリノ-4-イル]-[2-(3-フルオロ-フェニル)-エチル]-アミン

¹H NMR (CDCl₃、300 MHz) δ 8.52 (d、J=8.6 Hz、2H)、7.94 (d、J=8.6 Hz、1H)、7.72 (d、J=7.2 Hz、1H)、7.63 (d、J=8.1 Hz、1H)、7.43 (m、3H)、7.28 (m、1H)、7.02 (m、3H)、6.08 (br、1H)、4.03 (m、2H)、3.10 (t、J=7.0 Hz、2H) 20

化合物番号 269. 2-{2-[2-(4-クロロ-フェニル)-キナゾリノ-4-イルアミノ]-エトキシ}-エチルアルコール

¹H NMR (CDCl₃、300 MHz) δ 8.47 (d、J=8.4 Hz、2H)、7.90 (d、J=8.3 Hz、1H)、7.72 (m、2H)、7.41 (m、3H)、6.52 (br、1H)、4.00 (m、2H)、3.81 (m、4H)、3.67 (m、2H)

化合物番号 270. 2-[2-(4-クロロ-フェニル)-キナゾリノ-4-イルアミノ]-エチルアルコール

¹H NMR (CDCl₃、300 MHz) δ 8.46 (d、J=8.5 Hz、2H)、7.90 (d、J=8.4 Hz、1H)、7.75 (m、2H)、7.46 (m、3H)、6.21 (br、1H)、3.00 (m、4H) 30

化合物番号 271. (2,4-ジメトキシ-ベンジル)-(2-イソプロピル-キナゾリノ-4-イル)-アミン

¹H NMR (CDCl₃、300 MHz) δ 7.83 (d、J=8.1 Hz、1H)、7.68-7.60 (m、2H)、7.38-7.33 (m、2H)、6.50-6.42 (m、2H)、6.24 (br、1H)、4.83 (d、J=5.7 Hz、2H)、3.88 (s、3H)、3.80 (s、3H)、3.17 (m、1H)、1.40 (d、J=6.9 Hz、6H)

化合物番号 272. (2-ベンジル-キナゾリノ-4-イル)-(2,4-ジメトキシ-ベンジル)-アミン

¹H NMR (CDCl₃、300 MHz) δ 7.77 (d、J=8.4 Hz、1H)、7.64 (t、J=7.7 Hz、1H)、7.56 (d、J=8.1 Hz、1H)、7.48 (d、J=6.9 Hz、2H)、7.30 (m、4H)、7.09 (d、J=8.4 Hz、1H)、6.45 (d、J=2.4 Hz、1H)、6.32 (dd、J₁=8.4 Hz、J₂=2.4 Hz、1H)、6.17 (br、1H)、4.73 (d、J=6.0 Hz、2H)、4.20 (s、2H)、3.85 (s、3H)、3.78 (s、3H) 40

化合物番号 273. 4-(2,4-ジメトキシ-ベンジルオキシ)-2-フェニル-キナゾリノ

¹H NMR (CDCl₃、300 MHz) δ 8.63 (m、2H)、8.17 (d、1H、J=7.8 Hz)、7.98 (d、J=8.1 Hz、1H)、7.79 (m、1H)、7.53 (m、5H)、6.53 (m、2H)、5.75 (s、2H)、3.87 (s、3H)、3.83 (s、3H)

化合物番号 274. 4-(2,4-ジメトキシ-ベンジルスルファニル)-2-フェニル-キナゾリノ

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 8.68 (dd, J1=7.5Hz, J2=2.1Hz, 2H), 8.05 (d, J=8.4Hz, 1H), 7.98 (d, J=8.4Hz, 1H), 7.80 (t, J=7.5Hz, 1H), 7.45 (m, 5H), 6.50 (d, J=2.4Hz, 1H), 6.41 (dd, J1=8.4Hz, J2=2.3Hz, 1H), 4.80 (s, 2H), 3.88 (s, 3H), 3.78 (s, 3H)

化合物番号 275. (2-メトキシ-ベンジル) - (2-ピロリジノ-1-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 7.48-7.38 (m, 4H), 7.26 (m, 1H), 6.99 (m, 1H), 6.92 (m, 2H), 6.02 (br, 1H), 4.82 (d, J=5.7Hz, 2H), 3.91 (s, 3H), 3.70 (t, J=6.6Hz, 4H), 1.98 (m, 4H)

化合物番号 278. (2-メトキシ-ベンジル) - (2-ピペラジノ-1-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン 10

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 7.50-7.46 (m, 4H), 7.30-7.26 (m, 1H), 7.00 (t, J=7.5Hz, 1H), 6.92 (m, 2H), 5.96 (br, 1H), 4.80 (d, J=5.4Hz, 2H), 3.91 (s, 7H), 1.62 (m, 6H)

化合物番号 277. (2-メトキシ-ベンジル) - (2-モルボリン-4-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 7.53-7.44 (m, 3H), 7.36-7.26 (m, 2H), 7.06 (td, J1=6.6Hz, J2=1.5Hz, 1H), 6.93 (m, 2H), 6.04 (br, 1H), 4.80 (d, J=5.7Hz, 2H), 3.90 (m, 7H), 3.79 (m, 4H)

化合物番号 278. (2-メトキシ-ベンジル) - [2-(4-メチル-ピペラジン-1-イル) - キナゾルリノ-4-イル] - アミン 20

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 7.52-7.43 (m, 3H), 7.36 (d, J=7.5Hz, 1H), 7.28 (m, 1H), 7.04 (t, J=8.1Hz, 1H), 6.93 (m, 2H), 6.01 (br, 1H), 4.80 (d, J=5.4Hz, 2H), 3.97 (t, J=4.8Hz, 4H), 3.91 (s, 3H), 2.50 (t, J=4.8Hz, 4H), 2.35 (s, 3H)

化合物番号 279. (3-メトキシ-ベンジル) - (2-ピロリジノ-1-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 7.50-7.44 (m, 3H), 7.27 (m, 1H), 7.03-6.96 (m, 3H), 6.83 (dd, J1=8.4Hz, J2=2.4Hz, 1H), 5.73 (br, 1H), 4.80 (d, J=5.1Hz, 2H), 3.80 (s, 3H), 3.67 (t, J=6.6Hz, 4H), 1.96 (m, 4H) 30

化合物番号 280. (3-メトキシ-ベンジル) - (2-ピペラジノ-1-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 7.52-7.43 (m, 3H), 7.27 (m, 1H), 7.04-6.96 (m, 1H), 6.84 (dd, J1=8.1Hz, J2=2.1Hz, 1H), 5.69 (br, 1H), 4.77 (d, J=5.4Hz, 2H), 3.87 (m, 4H), 3.80 (s, 3H), 1.62 (m, 6H)

化合物番号 281. (3-メトキシ-ベンジル) - (2-モルボリン-4-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 7.57-7.47 (m, 3H), 7.28 (m, 1H), 7.08 (t, J=7.8Hz, 1H), 7.00-6.94 (m, 2H), 6.85 (dd, J1=8.4Hz, J2=2.4Hz, 1H), 5.76 (br, 1H), 4.77 (d, J=5.4Hz, 2H), 3.89 (m, 4H), 3.80-3.75 (m, 7H) 40

化合物番号 282. (3-メトキシ-ベンジル) - [2-(4-メチル-ピペラジン-1-イル) - キナゾルリノ-4-イル] - アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 7.54-7.45 (m, 3H), 7.27 (m, 1H), 7.05 (m, 1H), 6.97 (m, 2H), 6.84 (dd, J1=8.4Hz, J2=2.1Hz, 1H), 5.74 (br, 1H), 4.77 (d, J=5.4Hz, 2H), 3.93 (t, J=4.8Hz, 4H), 3.80 (s, 3H), 2.47 (t, J=4.8Hz, 4H), 2.34 (s, 3H)

化合物番号 283. (4-メトキシ-ベンジル) - (2-ピロリジノ-1-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 7.49 (d, J=3.6Hz, 2H), 7.44 (d, J=8.1Hz, 1H), 7.33 (d, J=8.7Hz, 2H), 6.99 (m, 1H), 6.88 (d, J=8.7Hz, 2H), 5.68 (50

br、1H)、4.75 (d、J=5.4Hz、2H)、3.81 (s、3H)、3.68 (t、J=6.9Hz、4H)、1.96 (m、4H)

化合物番号 284. (4-メトキシ-ベンジル) - (2-ピペラジノ-1-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃、300MHz) δ 7.51-7.41 (m、3H)、7.33 (d、J=8.7Hz、2H)、7.00 (m、1H)、6.89 (d、J=8.4Hz、2H)、5.62 (br、1H)、4.73 (d、J=5.4Hz、2H)、3.88 (m、4H)、3.81 (s、3H)、1.27 (m、6H)

化合物番号 285. (4-メトキシ-ベンジル) - (2-モルボリン-4-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃、300MHz) δ 7.53-7.44 (m、3H)、7.32 (d、J=8.7Hz、2H)、7.06 (m、1H)、6.89 (d、J=8.7Hz、2H)、5.69 (br、1H)、4.72 (d、J=5.1Hz、2H)、3.88 (m、4H)、3.81 (s、3H)、3.77 (m、4H)

化合物番号 286. (4-メトキシ-ベンジル) - [2-(4-メチル-ピペラジン-1-イル)-キナゾルリノ-4-イル]-アミン

¹HNM R (CDCl₃、300MHz) δ 7.54-7.42 (m、3H)、7.33 (d、J=8.7Hz、2H)、7.03 (m、1H)、6.89 (d、J=8.7Hz、2H)、5.65 (br、1H)、4.73 (d、J=5.4Hz、2H)、3.95 (t、J=4.8Hz、4H)、3.81 (s、3H)、2.48 (t、J=4.8Hz、4H)、2.34 (s、3H)

化合物番号 287. (2、3-ジメトキシ-ベンジル) - (2-ピロリジノ-1-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃、300MHz) δ 7.47 (m、3H)、7.00 (m、3H)、6.88 (dd、J₁=5.4Hz、J₂=3.6Hz、1H)、6.01 (br、1H)、4.84 (d、J=6.0Hz、2H)、3.92 (s、3H)、3.88 (s、3H)、3.69 (t、4H)、1.97 (m、4H)

化合物番号 288. (2、3-ジメトキシ-ベンジル) - (2-ピペラジノ-1-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃、300MHz) δ 7.50-7.41 (m、3H)、7.00 (m、3H)、6.88 (dd、J₁=7.2Hz、J₂=2.7Hz、1H)、5.97 (br、1H)、4.82 (d、J=5.7Hz、2H)、3.92 (s、3H)、3.88 (s、7H)、1.65 (m、6H)

化合物番号 289. (2、3-ジメトキシ-ベンジル) - (2-モルボリン-4-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃、300MHz) δ 7.51-7.44 (m、3H)、7.08-6.94 (m、3H)、6.89 (dd、J₁=8.1Hz、J₂=1.5Hz、1H)、6.05 (br、1H)、4.81 (d、J=5.7Hz、2H)、3.93-3.89 (m、10H)、3.79 (t、J=4.8Hz、4H)

化合物番号 290. (2、3-ジメトキシ-ベンジル) - [2-(4-メチル-ピペラジン-1-イル)-キナゾルリノ-4-イル]-アミン

¹HNM R (CDCl₃、300MHz) δ 7.49-7.44 (m、3H)、7.05-6.96 (m、3H)、6.89 (dd、J₁=7.5Hz、J₂=1.5Hz、1H)、6.00 (br、1H)、4.82 (d、J=5.7Hz、2H)、3.96 (t、J=4.8Hz、4H)、3.92 (s、3H)、3.89 (s、3H)、2.50 (t、J=4.8Hz、4H)、2.35 (s、3H)

化合物番号 291. (2、4-ジメトキシ-ベンジル) - (2-ピロリジノ-1-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃、300MHz) δ 7.46 (d、J=3.9Hz、2H)、7.42 (d、J=8.1Hz、1H)、7.31 (d、J=8.4Hz、1H)、6.98 (s、1H)、6.49 (d、J=2.4Hz、1H)、6.44 (dd、J₁=8.1Hz、J₂=2.4Hz、1H)、5.94 (br、1H)、4.74 (d、J=6.0Hz、2H)、3.87 (s、3H)、3.80 (s、3H)、3.71 (t、J=6.6Hz、4H)、1.98 (m、4H)

化合物番号 292. (2、4-ジメトキシ-ベンジル) - (2-ピペラジノ-1-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃、300MHz) δ 7.49-7.39 (m、3H)、7.27 (m、1H)、6.99 (t、J=6.6Hz、1H)、6.49 (d、J=2.4Hz、1H)、6.44 (dd、J₁=8.1Hz、J₂=2.1Hz、1H)、5.88 (br、1H)、4.72 (d、J=5.4Hz、2H)、3.97 (m、4H)、3.87 (s、3H)、3.80

10

20

30

40

50

(s、3H)、1.66 (m、6H)

化合物番号 293. (2、4-ジメトキシ-ベンジル) - (2-モルボリン-4-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃、300MHz) δ 7.53-7.43 (m、3H)、7.26 (m、2H)、7.05 (m、1H)、6.50 (d、J=2.1Hz、1H)、6.45 (dd、J₁=8.1Hz、J₂=2.1Hz、1H)、5.94 (br、1H)、4.72 (d、J=5.7Hz、2H)、3.94-3.78 (m、14H)

化合物番号 294. (2、4-ジメトキシ-ベンジル) - [2- (4-メチル-ピペラジン-1-イル) - キナゾルリノ-4-イル] - アミン

¹HNM R (CDCl₃、300MHz) δ 7.50 (m、2H)、7.43 (d、1H、J=8.1Hz)、7.26 (m、1H)、7.06 (m、1H)、6.50 (d、J=2.1Hz、1H)、6.45 (dd、J₁=8.1Hz、J₂=2.1Hz、1H)、6.00 (br、1H)、4.72 (d、J=5.4Hz、2H)、4.01 (m、4H)、3.87 (s、3H)、3.81 (s、3H)、2.54 (t、J=4.8Hz、4H)、2.37 (s、3H)

化合物番号 295. (2、5-ジメトキシ-ベンジル) - (2-ピロリジノ-1-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃、300MHz) δ 7.45 (m、3H)、6.99 (m、2H)、6.79 (m、2H)、6.02 (brs、1H)、4.79 (d、J=5.7Hz、2H)、3.86 (s、3H)、3.75 (s、3H)、3.71 (brt、J=6.8Hz、4H)、1.97 (brt、J=6.8Hz、4H)

化合物番号 296. (2、5-ジメトキシ-ベンジル) - (2-ピペラジノ-1-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃、300MHz) δ 7.44 (m、3H)、6.97 (m、2H)、6.79 (m、2H)、5.99 (brs、1H)、4.77 (d、J=5.7Hz、2H)、3.91 (brs、4H)、3.87 (s、3H)、3.75 (s、3H)、1.65 (brs、6H)

化合物番号 297. (2、5-ジメトキシ-ベンジル) - (2-モルボリン-4-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃、300MHz) δ 7.48 (m、3H)、7.06 (brt、J=7.5Hz、1H)、6.94 (d、J=2.7Hz、1H)、6.80 (m、2H)、6.05 (brs、1H)、4.76 (d、J=5.7Hz、2H)、3.92 (m、4H)、3.90 (s、3H)、3.79 (m、4H)、3.75 (s、3H)

化合物番号 298. (2、5-ジメトキシ-ベンジル) - [2- (4-メチル-ピペラジン-1-イル) - キナゾルリノ-4-イル] - アミン

¹HNM R (CDCl₃、300MHz) δ 7.46 (m、3H)、7.06 (brt、J=7.8Hz、1H)、6.95 (d、J=3.0Hz、1H)、6.80 (m、2H)、6.02 (brs、1H)、4.77 (d、J=5.7Hz、2H)、3.97 (brt、J=5.8Hz、4H)、3.86 (s、3H)、3.75 (s、3H)、2.50 (brt、J=5.8Hz、4H)、2.35 (s、3H)

化合物番号 299. (3、4-ジメトキシ-ベンジル) - (2-ピロリジノ-1-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃、300MHz) δ 7.49 (d、J=3.9Hz、2H)、7.46 (d、J=8.4Hz、1H)、7.00 (m、3H)、6.84 (m、1H)、5.71 (brs、1H)、4.75 (d、J=5.4Hz、2H)、3.89 (s、3H)、3.86 (s、3H)、3.69 (brt、J=6.6Hz、4H)、1.97 (brt、J=6.6Hz、4H)

化合物番号 300. (3、4-ジメトキシ-ベンジル) - (2-ピペラジノ-1-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃、300MHz) δ 7.45 (m、3H)、6.99 (m、3H)、6.85 (d、J=8.4Hz、1H)、5.64 (brs、1H)、4.73 (d、J=5.7Hz、2H)、3.89 (m、10H)、1.65 (m、6H)

化合物番号 301. (3、4-ジメトキシ-ベンジル) - (2-モルボリン-4-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃、300MHz) δ 7.52 (m、3H)、7.08 (t、J=7.8Hz、1H)、6.94 (m、2H)、6.85 (d、J=8.4Hz、1H)、5.71 (brs、1H)、4.72 (d、J=4.8Hz、2H)、3.91 (m、4H)、3.89 (s、3H)、3.86 (s、3H)、3.78 (m、4H)

化合物番号 302. (3、4-ジメトキシ-ベンジル) - [2- (4-メチル-ピペラジン-1-イル

10

20

30

40

50

) - キナゾルリノ-4-イル]-アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 7.49 (m, 3H)、7.05 (t, J=7.8Hz、1H)、6.95 (m、2H)、6.84 (m, 1H)、5.66 (brs, 1H)、4.73 (d, J=5.4Hz、2H)、3.96 (brt, J=5.0Hz、4H)、3.89 (s, 3H)、3.86 (s, 3H)、2.49 (brvt, J=5.0Hz、4H)、2.35 (s, 3H)

化合物番号 303. (3, 5-ジメトキシ-ベンジル) - (2-ピロリジノ-1-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 7.50 (m, 3H)、7.01 (m, 1H)、6.56 (d, J=1.8Hz、2H)、6.39 (brt, J=2.3Hz、1H)、5.82 (brs, 1H)、4.75 (d, J=5.4Hz、2H)、3.77 (s, 6H)、3.67 (brt, J=6.6Hz、4H)、1.95 (brt, J=6.6Hz、4H)

10

化合物番号 304. (3, 5-ジメトキシ-ベンジル) - (2-ピペラジノ-1-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 7.46 (m, 3H)、7.02 (t, J=8.1Hz、1H)、6.56 (brd, J=2.4Hz、2H)、6.40 (brt, J=1.8Hz、1H)、5.71 (brs, 1H)、4.73 (d, J=5.4Hz、2H)、3.88 (m, 4H)、3.78 (s, 6H)、1.62 (s, 6H)

化合物番号 305. (3, 5-ジメトキシ-ベンジル) - (2-モルポリン-4-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 7.52 (m, 3H)、7.09 (brt, J=7.8Hz、1H)、6.55 (brd, J=2.1Hz、2H)、6.40 (brt, J=2.1Hz、1H)、5.75 (brs, 1H)、4.73 (d, J=5.4Hz、2H)、3.91 (m, 4H)、3.78 (m, 10H)

20

化合物番号 306. (3, 5-ジメトキシ-ベンジル) - [2-(4-メチル-ピペラジン-1-イル) - キナゾルリノ-4-イル]-アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 7.50 (m, 3H)、7.06 (t, J=7.8Hz、1H)、6.56 (d, J=2.4Hz、2H)、6.40 (brt, J=2.1Hz、1H)、5.72 (brs, 1H)、4.73 (d, J=5.4Hz、2H)、3.94 (brt, J=4.2Hz、4H)、3.78 (s, 6H)、2.48 (brt, J=5.0Hz、4H)、2.34 (s, 3H)

化合物番号 307. ベンゾ[1, 3]ジオキソール-5-イルメチル- (2-ピロリジノ-1-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 7.48 (brd, J=3.9Hz、2H)、7.45 (d, J=8.1Hz、1H)、6.99 (quartet, J=4.1Hz、1H)、6.92 (s, 1H)、6.86 (d, J=7.8Hz、1H)、6.76 (d, J=7.8Hz、1H)、5.95 (s, 2H)、5.70 (brs, 1H)、4.72 (d, J=5.7Hz、2H)、3.68 (brt, J=6.6Hz、4H)、1.97 (m, 4H)

30

化合物番号 308. ベンゾ[1, 3]ジオキソール-5-イルメチル- (2-ピペラジノ-1-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 7.48 (m, 3H)、7.03 (m, 1H)、6.85 (m, 3H)、5.95 (s, 2H)、5.64 (brs, 1H)、4.69 (t, J=5.4Hz、2H)、3.89 (m, 4H)、1.64 (m, 6H)

化合物番号 309. ベンゾ[1, 3]ジオキソール-5-イルメチル- (2-モルポリン-4-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 7.51 (m, 3H)、7.07 (t, J=7.4Hz、1H)、6.89 (s、1H)、6.85 (d, J=7.8Hz、1H)、6.78 (d, J=7.8Hz、1H)、5.96 (s, 2H)、5.69 (brs, 1H)、4.70 (d, J=5.4Hz、2H)、3.89 (m, 4H)、3.78 (m, 4H)

40

化合物番号 310. ベンゾ[1, 3]ジオキソール-5-イルメチル-[2-(4-メチル-ピペラジン-1-イル) - キナゾルリノ-4-イル]-アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 7.48 (m, 3H)、7.05 (t, J=8.1Hz、1H)、6.89 (s、1H)、6.85 (d, J=7.8Hz、1H)、6.78 (d, J=7.8Hz、1H)、5.96 (s, 2H)、5.68 (brs, 1H)、4.70 (d, J=5.4Hz、2H)、3.95 (brt, J=4.8Hz、4H)、2.48 (brt, J=4.8Hz、4H)、2.35 (s, 3H)

化合物番号 311. (2-ピロリジノ-1-イル-キナゾルリノ-4-イル) - (3, 4, 5-トリメトキシ-ベンジル) - アミン

50

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 7.57 (brt, J=7.8Hz, 2H)、7.48 (t, J=7.7Hz, 1H)、7.02 (t, J=8.0Hz, 1H)、6.66 (s, 2H)、6.11 (brs, 1H)、4.74 (d, J=5.4Hz, 2H)、3.84 (s, 9H)、3.71 (brt, J=6.2Hz, 4H)、1.98 (brt, J=6.9Hz, 4H)

化合物番号 3 1 2. (2-ピペラジノ-1-イル-キナゾルリノ-4-イル) - (3, 4, 5-トリメトキシ-ベンジル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 7.50 (m, 3H)、7.03 (brt, J=8.0Hz, 1H)、6.65 (s, 2H)、5.71 (brs, 1H)、4.72 (d, J=5.1Hz, 2H)、3.91 (m, 4H)、3.84 (s, 9H)、1.65 (m, 6H)

化合物番号 3 1 3. (2-モルポリン-4-イル-キナゾルリノ-4-イル) - (3, 4, 5-トリメトキシ-ベンジル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 7.53 (m, 3H)、7.11 (brt, J=8.4Hz, 1H)、6.63 (s, 2H)、5.74 (brs, 1H)、4.72 (d, J=5.4Hz, 2H)、3.85 (m, 16H)

化合物番号 3 1 4. [2- (4-メチル-ピペラジン-1-イル) - キナゾルリノ-4-イル] - (3, 4, 5-トリメトキシ-ベンジル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 7.53 (m, 3H)、7.06 (m, 1H)、6.64 (s, 2H)、5.77 (brs, 1H)、4.72 (d, J=5.1Hz, 2H)、3.97 (brt, J=4.5Hz, 4H)、3.85 (s, 9H)、2.50 (brt, J=5.0Hz, 4H)、2.36 (s, 3H)

化合物番号 3 1 5. (2-ピロリジノ-1-イル-キナゾルリノ-4-イル) - (2, 4, 6-トリメトキシ-ベンジル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 7.46 (m, 2H)、7.38 (d, J=8.1Hz, 1H)、6.98 (m, 1H)、6.17 (s, 2H)、5.84 (brs, 1H)、4.81 (d, J=5.1Hz, 2H)、3.85 (s, 6H)、3.83 (s, 3H)、3.74 (brt, J=6.5Hz, 4H)、1.98 (m, 4H)

化合物番号 3 1 6. (2-ピペラジノ-1-イル-キナゾルリノ-4-イル) - (2, 4, 6-トリメトキシ-ベンジル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 7.41 (m, 3H)、6.98 (m, 1H)、6.16 (s, 2H)、5.86 (brs, 1H)、4.80 (d, J=5.1Hz, 2H)、3.97 (m, 4H)、3.85 (s, 6H)、3.83 (s, 3H)、1.65 (m, 6H)

化合物番号 3 1 7. (2-モルポリン-4-イル-キナゾルリノ-4-イル) - (2, 4, 6-トリメトキシ-ベンジル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 7.47 (m, 3H)、7.02 (m, 1H)、6.17 (s, 2H)、5.93 (brs, 1H)、4.79 (d, J=5.1Hz, 2H)、3.99 (m, 4H)、3.86 (m, 13H)

化合物番号 3 1 8. [2- (4-メチル-ピペラジン-1-イル) - キナゾルリノ-4-イル] - (2, 4, 6-トリメトキシ-ベンジル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 7.45 (m, 3H)、6.98 (m, 1H)、6.16 (s, 2H)、5.91 (brs, 1H)、4.80 (d, J=5.1Hz, 2H)、4.01 (brt, J=4.7Hz, 4H)、3.83 (s, 6H)、3.79 (s, 3H)、2.52 (brt, J=5.0Hz, 4H)、2.04 (s, 3H)

化合物番号 3 1 9. (2, 4-ジメトキシ-ベンジル) - (2-エトキシ-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 7.60 (m, 2H)、7.52 (d, J=8.1Hz, 1H)、7.23 (m, 2H)、6.48 (m, 2H)、6.11 (brs, 1H)、4.78 (d, J=5.4Hz, 2H)、4.51 (quartet, J=7.2Hz, 2H)、3.88 (s, 3H)、3.81 (s, 3H)、1.47 (t, J=7.2Hz, 3H)

化合物番号 3 2 0. ベンゾ[1, 3]ジオキソール-5-イルメチル- (2-エトキシ-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 7.63 (m, 3H)、7.24 (m, 1H)、6.82 (m, 3H)、5.96 (s, 2H)、5.79 (brs, 1H)、4.75 (d, J=5.4Hz, 2H)、4.50 (quartet, J=7.2Hz, 2H)、1.46 (t, J=7.2Hz, 3H)

化合物番号 3 2 1. (2-イソプロピル-キナゾルリノ-4-イル) - (2-メトキシ-ベンジル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 8.01 (d, J=8.1Hz, 1H)、7.81 (d, J=8.1Hz, 1

10

20

30

40

50

H)、7.69 (t、J=7.3Hz、1H)、7.43 (t、J=7.4Hz、2H)、7.31 (m、1H)、6.93 (t、J=7.0Hz、2H)、4.95 (d、J=5.8Hz、2H)、3.93 (s、3H)、3.31 (m、1H)、1.41 (d、J=6.8Hz、6H)

化合物番号 3 2 2. (2、3-ジメトキシ-ベンジル) - (2-イソプロピル-キナゾリノ-4-イル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃、300MHz) δ 7.97 (d、J=8.2Hz、1H)、7.82 (d、J=8.3Hz、1H)、7.69 (t、J=7.3Hz、1H)、7.41 (t、J=7.6Hz、1H)、7.03 (m、2H)、6.89 (m、1H)、4.96 (d、J=5.8Hz、2H)、3.96 (s、3H)、3.89 (3、3H)、3.30 (t、J=7.1Hz、1H)、1.79 (d、J=6.8Hz、6H)

化合物番号 3 2 3. (3、5-ジメトキシ-ベンジル) - (2-イソプロピル-キナゾリノ-4-イル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃、300MHz) δ 8.21 (d、J=6.3Hz、1H)、8.02 (d、J=8.4Hz、1H)、7.63 (t、J=7.7Hz、1H)、7.37 (t、J=7.5Hz、1H)、6.65 (d、J=2.1Hz、2H)、6.36 (d、J=2.0Hz、1H)、4.90 (d、J=5.5Hz、2H)、3.75 (s、6H)、3.34 (t、J=7.0Hz、1H)、1.38 (d、J=6.7Hz、6H)

化合物番号 3 2 4. (3、4-ジメトキシ-ベンジル) - (2-イソプロピル-キナゾリノ-4-イル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃、300MHz) δ 8.17 (d、J=6.2Hz、1H)、7.97 (d、J=8.5Hz、1H)、7.62 (t、J=7.7Hz、1H)、7.34 (t、J=7.5Hz、1H)、7.12 (s、1H)、7.05 (d、J=8.1Hz、1H)、6.82 (d、J=8.2Hz、1H)、4.90 (d、J=5.5Hz、2H)、3.86 (s、6H)、3.33 (t、J=7.1Hz、1H)、1.40 (d、J=6.7Hz、6H)

化合物番号 3 2 5. (2-イソプロピル-キナゾリノ-4-イル) - (3、4、5-トリメトキシ-ベンジル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃、300MHz) δ 8.22 (d、J=6.2Hz、1H)、8.00 (d、J=8.5Hz、1H)、7.64 (t、J=7.7Hz、1H)、7.36 (t、J=7.4Hz、1H)、6.79 (s、2H)、4.90 (d、J=5.5Hz、2H)、3.84 (s、9H)、3.34 (t、J=7.2Hz、1H)、1.39 (d、J=6.7Hz、6H)

化合物番号 3 2 6. (2、5-ジメトキシ-ベンジル) - (2-イソプロピル-キナゾリノ-4-イル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃、300MHz) δ 8.06 (d、J=8.1Hz、1H)、7.86 (d、J=8.0Hz、1H)、7.70 (t、J=7.3Hz、1H)、7.43 (t、J=7.4Hz、1H)、7.01 (s、1H)、6.80 (m、2H)、4.93 (d、J=5.6Hz、2H)、3.89 (s、3H)、3.75 (s、3H)、3.36 (t、J=7.4Hz、1H)、1.40 (d、J=6.9Hz、6H)

化合物番号 3 2 7. (2-イソプロピル-キナゾリノ-4-イル) - (2、4、6-トリメトキシ-ベンジル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃、300MHz) δ 8.09 (d、J=8.0Hz、1H)、7.73 (d、J=8.1Hz、1H)、7.65 (t、J=7.2Hz、1H)、7.41 (t、J=7.3Hz、1H)、6.31 (br、1H)、6.18 (s、2H)、4.97 (d、J=5.3Hz、2H)、3.88 (s、9H)、3.34 (t、J=7.3Hz、1H)、1.42 (d、J=6.5Hz、6H)

化合物番号 3 2 8. (2-ベンジル-キナゾリノ-4-イル) - (2-メトキシ-ベンジル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃、300MHz) δ 7.78 (d、J=8.1Hz、1H)、7.65 (m、1H)、7.58 (d、J=8.1Hz、1H)、7.37-7.18 (m、6H)、6.87 (d、J=8.4Hz、1H)、6.83 (t、J=7.2Hz、1H)、6.21 (br、1H)、4.81 (d、J=5.7Hz、2H)、4.20 (s、2H)、3.88 (s、3H)

化合物番号 3 2 9. (2-ベンジル-キナゾリノ-4-イル) - (2、3-ジメトキシ-ベンジル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃、300MHz) δ 7.78 (d、J=8.1Hz、1H)、7.67 (dd、J₁=6.7Hz、J₂=0.9Hz、1H)、7.60 (d、J=8.4Hz、1H)、7.46 (d、J=6.9Hz、2H)、7.36-7.17 (m、4H)、6.93 (t、J=8.1Hz、1H)、6.83 (m、2H)、6.22 (br、1H)、4.83 (d

10

20

30

40

50

、J=5.7H z、2H)、4.20 (s、2H)、3.90 (s、3H)、3.86 (s、3H)

化合物番号 3 3 0. (2-ベンジル-キナゾルリノ-4-イル) - (3、5-ジメトキシ-ベンジル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃、300M H z) δ 7.89 (t、J=9.0H z、2H)、7.62 (t、J=7.7H z、1H)、7.48 (d、J=7.1H z、2H)、7.31 (m、4H)、6.55 (d、J=1.9H z、2H)、6.37 (s、1H)、4.81 (d、J=5.3H z、2H)、4.22 (s、2H)、3.73 (s、6H)

化合物番号 3 3 1. (2-ベンジル-キナゾルリノ-4-イル) - (3、4-ジメトキシ-ベンジル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃、300M H z) δ 8.11 (d、J=6.1H z、1H)、7.91 (d、J=8.2H z、1H)、7.52 (m、3H)、7.23 (m、4H)、7.02 (s、1H)、6.92 (m、1H)、6.75 (d、J=8.2H z、1H)、4.83 (d、J=5.2H z、2H)、4.27 (s、2H)、3.86 (s、3H)、3.69 (s、3H)

化合物番号 3 3 2. (2-ベンジル-キナゾルリノ-4-イル) - (3、4、5-トリメトキシ-ベンジル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃、300M H z) δ 8.03 (d、J=7.6H z、1H)、7.91 (d、J=8.4H z、1H)、7.61 (t、J=7.7H z、1H)、7.50 (d、J=6.8H z、2H)、7.32 (t、J=7.6H z、1H)、7.23 (m、3H)、6.66 (s、2H)、4.81 (d、J=5.2H z、2H)、4.25 (s、2H)、3.86 (s、9H)

化合物番号 3 3 3. (2-ベンジル-キナゾルリノ-4-イル) - (2、4-ジメトキシ-ベンジル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃、300M H z) δ 7.95 (d、J=8.1H z、1H)、7.68 (m、2H)、7.54 (m、2H)、7.40-7.24 (m、4H)、7.10 (d、J=8.3H z、1H)、6.45 (d、J=2.23H z、1H)、6.35 (m、1H)、4.79 (d、J=5.5H z、2H)、4.28 (s、2H)、3.86 (s、3H)、3.81 (s、3H)

化合物番号 3 3 4. (2-ベンジル-キナゾルリノ-4-イル) - (2、5-ジメトキシ-ベンジル) - アミン

¹HNM R CDCl₃、300M H z) δ 8.26 (d、J=8.3H z、1H)、8.13 (d、J=8.2H z、1H)、7.61 (m、3H)、7.40 (t、J=7.7H z、1H)、7.24 (m、4H)、7.79 (m、3H)、4.94 (d、J=5.4H z、2H)、4.38 (s、2H)、3.85 (s、3H)、3.68 (s、3H)

化合物番号 3 3 5. (2-ベンジル-キナゾルリノ-4-イル) - (2、4、6-トリメトキシ-ベンジル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃、300M H z) δ 8.12 (d、J=8.1H z、1H)、7.63 (m、4H)、7.35 (m、4H)、6.17 (s、2H)、4.96 (d、J=5.4H z、2H)、4.40 (s、2H)、3.85 (s、9H)

化合物番号 3 3 6. (2-フェニル-キナゾルリノ-4-イル) - (3、4、5-トリメトキシ-ベンジル) - アミン

化合物番号 3 3 7. (2-フェニル-キナゾルリノ-4-イル) - (2、4、6-トリメトキシ-ベンジル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃、300M H z) δ 8.76 (d、J=5.4H z、2H)、7.69 (m、2H)、7.54 (m、3H)、7.41 (t、J=7.6H z、1H)、7.28 (s、1H)、6.19 (s、2H)、5.00 (d、2H、J=5.1H z)、3.90 (s、9H)

化合物番号 3 3 8. (2-フラノ-2-イル-キナゾルリノ-4-イル) - (2-メトキシ-ベンジル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃、300M H z) δ 8.01 (d、J=8.4H z、1H)、7.70 (m、3H)、7.48 (d、J=6.6H z、2H)、7.39 (t、J=7.5H z、1H)、7.29 (d、J=7.8H z、1H)、6.95 (t、J=7.4H z、2H)、6.60 (m、1H)、6.87 (br、1H)、4.97 (d、J=5.3H z、2H)、3.93 (s、3H)

化合物番号 3 3 9. (2-フラノ-2-イル-キナゾルリノ-4-イル) - (3-メトキシ-ベンジル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃、300M H z) δ 8.01 (d、J=8.4H z、1H)、7.78 (d、J=8.1H z、1H)、7.67 (m、2H)、7.42 (m、2H)、7.27 (m、2H)、6.87 (d、J=2.0H z、1H)、6.5

10

20

30

40

50

8 (m, 1H)、6.50 (br, 1H)、4.94 (d, J=5.2 Hz、2H)、3.80 (s, 3H)

化合物番号 340. (2-フラノ-2-イル-キナゾルリノ-4-イル) - (4-メトキシ-ベンジル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300 MHz) δ 8.01 (d, J=8.3 Hz、1H)、7.77 (d, J=8.1 Hz、1H)、7.67 (t, J=7.2 Hz、2H)、7.41 (m, 4H)、6.90 (d, J=8.6 Hz、2H)、6.59 (m, 1H)、6.50 (br, 1H)、4.89 (d, J=5.5 Hz、2H)、3.82 (s, 3H)

化合物番号 341. ベンゾ[1,3]ジオキソール-5-イルメチル- (2-フラノ-2-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300 MHz) δ 7.99 (d, J=8.3 Hz、1H)、7.78 (d, J=8.1 Hz、1H)、7.65 (m, 2H)、7.41 (t, J=5.6 Hz、2H)、6.94 (t, J=7.6 Hz、2H)、6.78 (d, J=7.9 Hz、1H)、6.57 (m, 1H)、6.41 (br, 1H)、5.95 (s, 2H)、4.85 (d, J=5.4 Hz、2H)

10

化合物番号 342. (2,3-ジメトキシ-ベンジル) - (2-フラノ-2-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300 MHz) δ 8.02 (d, J=8.2 Hz、1H)、7.71 (m, 3H)、7.52 (d, J=2.3 Hz、1H)、7.39 (m, 1H)、7.07 (t, J=4.9 Hz、2H)、6.90 (m, 1H)、6.67 (br, 1H)、6.60 (m, 1H)、4.49 (d, J=5.5 Hz、2H)

化合物番号 343. (3,5-ジメトキシ-ベンジル) - (2-フラノ-2-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300 MHz) δ 8.02 (d, J=8.3 Hz、1H)、7.84 (d, J=8.2 Hz、1H)、7.68 (m, 2H)、7.45 (d, J=3.1 Hz、1H)、7.38 (m, 1H)、6.65 (m, 2H)、6.64 (br, 1H)、6.57 (m, 1H)、6.40 (t, J=2.1 Hz、1H)、4.90 (d, J=5.3 Hz、2H)、3.77 (s, 6H)

20

化合物番号 344. (3,4-ジメトキシ-ベンジル) - (2-フラノ-2-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300 MHz) δ 8.00 (d, J=8.3 Hz、1H)、7.79 (d, J=8.1 Hz、1H)、7.66 (t, J=2.3 Hz、2H)、7.47 (d, J=3.2 Hz、1H)、7.36 (m, 1H)、7.09 (s, 1H)、7.01 (m, 1H)、6.86 (d, J=8.2 Hz、1H)、6.59 (m, 1H)、6.46 (br, 1H)、4.99 (d, J=5.3 Hz、2H)、3.88 (s, 3H)、3.85 (s, 3H)

化合物番号 345. (2-フラノ-2-イル-キナゾルリノ-4-イル) - (3,4,5-トリメトキシ-ベンジル) - アミン

30

¹HNM R (CDCl₃, 300 MHz) δ 8.01 (d, J=8.3 Hz、1H)、7.86 (d, J=8.3 Hz、1H)、7.65 (t, J=6.2 Hz、2H)、7.54 (d, J=3.1 Hz、1H)、7.34 (t, J=7.5 Hz、1H)、6.80 (br, 1H)、6.77 (s, 2H)、6.60 (m, 1H)、4.99 (d, J=5.4 Hz、2H)、3.87 (s, 9H)

化合物番号 346. (2,4-ジメトキシ-ベンジル) - (2-フラノ-2-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300 MHz) δ 8.01 (d, J=8.2 Hz、1H)、7.69 (m, 3H)、7.51 (d, J=4.6 Hz、1H)、7.38 (t, J=7.4 Hz、2H)、6.60 (m, 1H)、6.48 (m, 3H)、4.88 (d, J=5.4 Hz、2H)、3.89 (s, 3H)、3.81 (s, 3H)

40

化合物番号 347. (2,5-ジメトキシ-ベンジル) - (2-フラノ-2-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300 MHz) δ 8.01 (d, J=8.3 Hz、1H)、7.70 (m, 3H)、7.50 (d, J=2.9 Hz、1H)、7.41 (d, J=7.3 Hz、1H)、7.10 (d, J=2.8 Hz、1H)、6.84 (m, 2H)、6.58 (m, 1H)、4.94 (d, J=5.4 Hz、2H)、3.89 (s, 3H)、3.74 (s, 3H)

化合物番号 348. (2-フラノ-2-イル-キナゾルリノ-4-イル) - (2,4,6-トリメトキシ-ベンジル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300 MHz) δ 8.01 (d, J=8.2 Hz、1H)、7.67 (m, 4H)、7.37 (t, J=7.5 Hz、1H)、6.60 (m, 1H)、6.21 (br, 1H)、6.17 (s, 2H)、4.96 (d, J=5.4 Hz、2H)、3.87 (s, 9H)

50

化合物番号 349. (2-メトキシ-ベンジル) - (2-チオフェニル-2-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 8.21 (d, $J=3.3\text{ Hz}$, 1H), 7.91 (d, $J=8.3\text{ Hz}$, 1H), 7.68 (m, 2H), 7.52 (m, 2H), 7.37 (t, $J=7.6\text{ Hz}$, 2H), 7.29 (d, $J=7.7\text{ Hz}$, 1H), 7.19 (t, $J=4.2\text{ Hz}$, 1H), 6.95 (t, $J=7.7\text{ Hz}$, 2H), 6.49 (br, 1H), 4.98 (d, $J=5.3\text{ Hz}$, 2H), 3.95 (s, 3H)

化合物番号 350. (3-メトキシ-ベンジル) - (2-チオフェニル-2-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 8.17 (d, $J=3.2\text{ Hz}$, 1H), 7.91 (d, $J=8.3\text{ Hz}$, 1H), 7.71 (m, 2H), 7.47 (m, 1H), 7.37 (m, 1H), 7.28 (m, 1H), 7.16 (m, 1H), 7.06 (d, $J=7.4\text{ Hz}$, 2H), 6.84 (m, 1H), 6.30 (br, 1H), 4.94 (d, $J=5.5\text{ Hz}$, 2H), 3.79 (s, 3H)

10

化合物番号 351. (4-メトキシ-ベンジル) - (2-チオフェニル-2-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 8.17 (d, $J=3.1\text{ Hz}$, 1H), 7.90 (d, $J=8.5\text{ Hz}$, 1H), 7.70 (m, 2H), 7.46 (m, 3H), 7.36 (m, 1H), 7.17 (t, $J=4.3\text{ Hz}$, 1H), 6.91 (d, $J=8.5\text{ Hz}$, 2H), 6.23 (br, 1H), 4.90 (d, $J=5.3\text{ Hz}$, 2H), 3.82 (s, 3H)

化合物番号 352. ベンゾ[1,3]ジオキソール-5-イルメチル- (2-チオフェニル-2-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 8.10 (d, $J=3.1\text{ Hz}$, 1H), 7.88 (d, $J=8.5\text{ Hz}$, 1H), 7.69 (m, 2H), 7.46 (t, $J=2.5\text{ Hz}$, 1H), 7.38 (m, 1H), 7.17 (m, 1H), 6.96 (t, $J=7.5\text{ Hz}$, 2H), 6.80 (d, $J=7.9\text{ Hz}$, 1H), 6.11 (br, 1H), 5.96 (s, 2H), 4.87 (d, $J=5.3\text{ Hz}$, 2H)

20

化合物番号 353. (2,3-ジメトキシ-ベンジル) - (2-チオフェニル-2-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 8.21 (d, $J=3.2\text{ Hz}$, 1H), 7.91 (d, $J=8.2\text{ Hz}$, 1H), 7.69 (m, 2H), 7.49 (d, $J=4.8\text{ Hz}$, 1H), 7.36 (m, 1H), 7.17 (m, 2H), 7.04 (m, 1H), 6.90 (d, $J=7.2\text{ Hz}$, 1H), 6.45 (br, 1H), 5.00 (d, $J=5.4\text{ Hz}$, 2H), 3.98 (s, 3H), 3.90 (s, 3H)

化合物番号 354. (3,5-ジメトキシ-ベンジル) - (2-チオフェニル-2-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

30

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 8.20 (d, $J=3.3\text{ Hz}$, 1H), 7.92 (d, $J=8.4\text{ Hz}$, 1H), 7.76 (d, $J=10.9\text{ Hz}$, 1H), 7.68 (t, $J=7.7\text{ Hz}$, 1H), 7.48 (d, $J=4.9\text{ Hz}$, 1H), 7.36 (t, $J=7.6\text{ Hz}$, 1H), 7.16 (m, 1H), 6.66 (s, 2H), 6.41 (s, 1H), 4.90 (d, $J=5.4\text{ Hz}$, 2H), 3.78 (s, 3H)

化合物番号 355. (3,4-ジメトキシ-ベンジル) - (2-チオフェニル-2-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 8.19 (d, $J=3.0\text{ Hz}$, 1H), 7.91 (d, $J=8.5\text{ Hz}$, 1H), 7.67 (m, 2H), 7.49 (t, $J=2.5\text{ Hz}$, 1H), 7.35 (m, 1H), 7.17 (m, 1H), 7.09 (m, 1H), 7.01 (m, 1H), 6.85 (d, $J=8.1\text{ Hz}$, 1H), 6.38 (br, 1H), 4.89 (d, $J=5.3\text{ Hz}$, 2H), 3.88 (s, 3H), 3.84 (s, 3H)

40

化合物番号 356. (2-チオフェニル-2-イル-キナゾルリノ-4-イル) - (3,4,5-トリメトキシ-ベンジル) - アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 8.19 (d, $J=3.1\text{ Hz}$, 1H), 7.91 (d, $J=8.4\text{ Hz}$, 1H), 7.79 (d, $J=8.1\text{ Hz}$, 1H), 7.68 (t, $J=7.6\text{ Hz}$, 1H), 7.48 (d, $J=5.0\text{ Hz}$, 1H), 7.36 (t, $J=7.6\text{ Hz}$, 1H), 7.17 (t, $J=4.3\text{ Hz}$, 1H), 6.75 (s, 2H), 6.43 (br, 1H), 4.88 (d, $J=5.4\text{ Hz}$, 2H), 3.85 (s, 9H)

化合物番号 357. (2,4-ジメトキシ-ベンジル) - (2-チオフェニル-2-イル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 8.23 (d, $J=3.0\text{ Hz}$, 1H), 7.91 (d, $J=8.2\text{ Hz}$, 1

50

H)、7.65 (m、2H)、7.48 (t、J=7.6 Hz、2H)、7.38 (d、J=7.9 Hz、1H)、7.19 (m、1H)、6.48 (m、3H)、4.90 (d、J=5.4 Hz、2H)、3.93 (s、3H)、3.80 (s、3H)

化合物番号 358. (2,5-ジメトキシ-ベンジル)-(2-チオフェニル-2-イル-キナゾルリノ-4-イル)-アミン

¹H NMR (CDCl₃、300 MHz) δ 8.22 (d、J=3.1 Hz、1H)、7.91 (d、J=8.5 Hz、1H)、7.69 (m、2H)、7.49 (t、J=3.5 Hz、1H)、7.37 (m、1H)、7.18 (m、2H)、6.81 (t、J=4.8 Hz、2H)、6.52 (br、1H)、4.95 (d、J=5.3 Hz、2H)、3.90 (s、3H)、3.74 (s、3H)

化合物番号 359. (2-チオフェニル-2-イル-キナゾルリノ-4-イル)-(2,4,6-トリメトキシ-ベンジル)-アミン

¹H NMR (CDCl₃、300 MHz) δ 8.28 (d、J=3.2 Hz、1H)、7.93 (d、J=8.4 Hz、1H)、7.65 (m、2H)、7.49 (d、J=4.8 Hz、1H)、7.35 (t、J=7.6 Hz、1H)、7.19 (t、J=4.3 Hz、1H)、6.20 (br、1H)、6.18 (s、2H)、5.00 (d、J=5.3 Hz、2H)、3.88 (s、9H)

化合物番号 360. (2-メトキシ-ベンジル)-[2-(メトキシ-フェニル-メチル)-キナゾルリノ-4-イル]-アミン

¹H NMR (CDCl₃、300 MHz) δ 7.90 (d、J=8.4 Hz、1H)、7.68-7.55 (m、4H)、7.38-7.20 (m、6H)、6.85 (m、2H)、6.24 (br、1H)、5.41 (s、1H)、4.84 (d、J=6.0 Hz、2H)、3.87 (s、3H)、3.50 (s、3H)

化合物番号 361. (3-メトキシ-ベンジル)-[2-(メトキシ-フェニル-メチル)-キナゾルリノ-4-イル]-アミン

¹H NMR (CDCl₃、300 MHz) δ 7.95 (d、J=8.3 Hz、1H)、7.75 (d、J=8.1 Hz、1H)、7.64 (m、3H)、7.28 (m、5H)、6.94 (s、2H)、6.83 (d、J=8.1 Hz、1H)、6.59 (br、1H)、5.42 (s、1H)、4.83 (d、J=4.9 Hz、2H)、3.76 (s、3H)、3.49 (s、3H)

化合物番号 362. (4-メトキシ-ベンジル)-[2-(メトキシ-フェニル-メチル)-キナゾルリノ-4-イル]-アミン

¹H NMR (CDCl₃、300 MHz) δ 7.93 (d、J=8.4 Hz、1H)、7.70-7.57 (m、4H)、7.39-7.22 (m、6H)、6.81 (d、J=8.4 Hz、2H)、5.89 (br、1H)、5.42 (s、1H)、4.76 (d、J=5.4 Hz、2H)、3.79 (s、3H)、3.50 (s、3H)

化合物番号 363. ベンゾ[1,3]ジオキソール-5-イルメチル-[2-(メトキシ-フェニル-メチル)-キナゾルリノ-4-イル]-アミン

¹H NMR (CDCl₃、300 MHz) δ 7.95 (d、J=8.3 Hz、1H)、7.81 (d、J=8.1 Hz、1H)、7.64 (m、2H)、7.35 (m、5H)、6.83 (m、2H)、6.70 (d、J=7.9 Hz、1H)、5.93 (s、2H)、5.46 (s、1H)、4.76 (d、J=5.1 Hz、2H)、3.51 (s、3H)

化合物番号 364. (2,3-ジメトキシ-ベンジル)-[2-(メトキシ-フェニル-メチル)-キナゾルリノ-4-イル]-アミン

¹H NMR (CDCl₃、300 MHz) δ 8.00 (d、J=8.3 Hz、1H)、7.69 (m、3H)、7.32 (m、5H)、6.89 (m、3H)、5.50 (s、1H)、4.90 (d、J=5.2 Hz、2H)、3.93 (s、3H)、3.88 (s、3H)、3.51 (s、3H)

化合物番号 365. (3,5-ジメトキシ-ベンジル)-[2-(メトキシ-フェニル-メチル)-キナゾルリノ-4-イル]-アミン

¹H NMR (CDCl₃、300 MHz) δ 7.95 (d、J=8.3 Hz、1H)、7.77 (d、1H、J=8.1 Hz)、7.65 (m、3H)、7.31 (m、5H)、6.60 (br、1H)、6.55 (s、2H)、6.39 (d、J=2.0 Hz、1H)、5.44 (s、1H)、4.81 (d、J=5.1 Hz、2H)、3.75 (s、6H)、3.49 (s、3H)

化合物番号 366. (3,4-ジメトキシ-ベンジル)-[2-(メトキシ-フェニル-メチル)-キナゾルリノ-4-イル]-アミン

¹H NMR (CDCl₃、300 MHz) δ 7.94 (d、J=8.4 Hz、1H)、7.78 (d、J=8.1 Hz、1H)、7.68 (d、J=6.9 Hz、2H)、7.58 (t、J=7.6 Hz、1H)、7.33 (m、5H)、6.96 (

10

20

30

40

50

s、1H)、6.91 (t、J=4.1Hz、1H)、5.45 (s、1H)、4.80 (d、J=5.2Hz、2H)、3.88 (s、3H)、3.80 (s、3H)、3.50 (s、3H)

化合物番号 367. [2-(メトキシ-フェニル-メチル)-キナゾルリノ-4-イル]- (3、4、5-トリメトキシ-ベンジル)-アミン

¹HNM R (CDCl₃、300MHz) δ 7.95 (d、J=8.3Hz、1H)、7.83 (d、J=8.2Hz、1H)、7.63 (m、3H)、7.30 (m、5H)、6.75 (br、1H)、6.64 (s、2H)、5.45 (s、1H)、4.80 (d、J=5.2Hz、2H)、3.78 (s、9H)、3.48 (s、3H)

化合物番号 368. (2、4-ジメトキシ-ベンジル)-[2-(メトキシ-フェニル-メチル)-キナゾルリノ-4-イル]-アミン

¹HNM R (CDCl₃、300MHz) δ 7.97 (d、J=8.3Hz、1H)、7.67 (m、4H)、7.33 (m、5H)、7.18 (d、J=8.3Hz、1H)、6.48 (br、1H)、6.45 (s、1H)、6.35 (m、1H)、5.50 (s、1H)、4.79 (d、J=5.1Hz、2H)、8.85 (s、3H)、3.79 (s、3H)、3.52 (s、3H) 10

化合物番号 369. (2、5-ジメトキシ-ベンジル)-[2-(メトキシ-フェニル-メチル)-キナゾルリノ-4-イル]-アミン

¹HNM R (CDCl₃、300MHz) δ 7.96 (d、J=8.3Hz、1H)、7.66 (m、4H)、7.34 (m、5H)、6.97 (s、1H)、6.80 (t、J=3.8Hz、1H)、6.54 (br、1H)、5.47 (s、1H)、4.86 (d、J=5.0Hz、2H)、3.86 (s、3H)、3.72 (s、3H)、3.50 (s、3H)

化合物番号 370. [2-(メトキシ-フェニル-メチル)-キナゾルリノ-4-イル]- (2、4、6-トリメトキシ-ベンジル)-アミン 20

¹HNM R (CDCl₃、300MHz) δ 7.89 (d、J=8.1Hz、1H)、7.75 (dd、J₁=8.4Hz、J₂=1.2Hz、2H)、7.63 (td、J₁=6.9Hz、J₂=1.2Hz、1H)、7.51 (d、J=7.2Hz、1H)、7.35-7.21 (m、4H)、6.16 (s、2H)、5.98 (br、1H)、5.43 (s、1H)、4.87 (d、J=5.4Hz、2H)、3.82 (s、3H)、3.80 (s、6H)、3.52 (s、3H)

化合物番号 371. (2-メトキシ-ベンジル)-[2-(1-フェニル-エチル)-キナゾルリノ-4-イル]-アミン

¹HNM R (CDCl₃、300MHz) δ 7.85 (d、J=8.6Hz、1H)、7.64 (m、2H)、7.56 (d、J=7.4Hz、2H)、7.30 (m、6H)、6.90 (t、J=7.9Hz、2H)、6.55 (br、1H)、4.90 (d、J=5.4Hz、2H)、4.40 (d、J=7.0Hz、1H)、3.92 (s、3H)、1.79 (d、J=7.1Hz、3H) 30

化合物番号 372. (3-メトキシ-ベンジル)-[2-(1-フェニル-エチル)-キナゾルリノ-4-イル]-アミン

¹HNM R (CDCl₃、300MHz) δ 7.85 (d、J=8.6Hz、1H)、7.74 (d、J=8.1Hz、1H)、7.63 (m、1H)、7.51 (d、J=7.2Hz、2H)、7.25 (m、5H)、6.97 (d、J=7.9Hz、2H)、6.86 (d、J=2.0Hz、1H)、4.88 (d、J=5.4Hz、2H)、4.36 (m、1H)、3.77 (s、3H)、1.75 (d、J=7.1Hz、3H)

化合物番号 373. (4-メトキシ-ベンジル)-[2-(1-フェニル-エチル)-キナゾルリノ-4-イル]-アミン

¹HNM R (CDCl₃、300MHz) δ 7.84 (d、J=8.5Hz、1H)、7.73 (d、J=8.1Hz、1H)、7.62 (t、J=7.6Hz、1H)、7.53 (d、J=7.6Hz、2H)、7.27 (m、6H)、6.85 (d、J=7.6Hz、2H)、6.38 (br、1H)、4.81 (d、J=5.5Hz、2H)、4.40 (m、1H)、3.81 (s、3H)、1.78 (d、J=7.3Hz、3H) 40

化合物番号 374. ベンゾ[1、3]ジオキソール-5-イルメチル-[2-(1-フェニル-エチル)-キナゾルリノ-4-イル]-アミン

¹HNM R (CDCl₃、300MHz) δ 7.85 (d、J=8.4Hz、1H)、7.75 (d、J=8.5Hz、1H)、7.63 (m、1H)、5.52 (d、J=7.5Hz、2H)、7.28 (m、4H)、6.85 (t、J=6.7Hz、2H)、6.73 (d、J=7.8Hz、1H)、6.49 (br、1H)、5.94 (s、2H)、4.78 (d、J=5.4Hz、2H)、4.40 (m、1H)、1.78 (d、J=7.2Hz、3H)

化合物番号 375. (2、3-ジメトキシ-ベンジル)-[2-(1-フェニル-エチル)-キナゾルリノ-4-イル]-アミン 50

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 7.85 (d, J=8.0Hz, 1H)、7.65 (m, 2H)、7.55 (d, J=7.5Hz, 2H)、7.28 (m, 5H)、6.91 (m, 3H)、6.54 (br, 1H)、4.91 (d, J=5.4Hz, 2H)、4.41 (m, 1H)、3.94 (s, 3H)、3.89 (s, 3H)、1.78 (d, J=7.4Hz, 3H)

化合物番号 376. (3, 5-ジメトキシ-ベンジル) - [2- (1-フェニル-エチル) - キナゾルリノ-4-イル] - アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 7.84 (d, J=8.3Hz, 1H)、7.74 (d, J=8.1Hz, 1H)、7.63 (m, 1H)、7.52 (d, J=7.3Hz, 2H)、7.24 (m, 4H)、6.56 (s, 2H)、6.41 (s, 1H)、4.48 (d, J=5.3Hz, 2H)、4.38 (m, 1H)、3.75 (s, 6H)、1.78 (d, J=7.1Hz, 3H)

10

化合物番号 377. (3, 4-ジメトキシ-ベンジル) - [2- (1-フェニル-エチル) - キナゾルリノ-4-イル] - アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 7.83 (d, J=8.3Hz, 1H)、7.75 (d, J=8.2Hz, 1H)、7.62 (d, J=7.4Hz, 1H)、7.53 (d, J=7.2Hz, 2H)、7.25 (m, 5H)、6.94 (d, J=5.6Hz, 2H)、6.82 (d, J=8.6Hz, 1H)、6.32 (br, 1H)、4.84 (d, J=5.4Hz, 2H)、4.38 (m, 1H)、3.89 (s, 3H)、3.79 (s, 3H)、1.78 (d, J=7.1Hz, 3H)

化合物番号 378. [2- (1-フェニル-エチル) - キナゾルリノ-4-イル] - (3, 4, 5-トリメトキシ-ベンジル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 7.82 (t, J=9.2Hz, 2H)、7.54 (m, 2H)、7.27 (m, 5H)、6.65 (s, 2H)、4.86 (d, J=5.4Hz, 2H)、4.40 (m, 1H)、3.79 (s, 9H)、1.78 (d, J=7.1Hz, 3H)

20

化合物番号 379. (2, 4-ジメトキシ-ベンジル) - [2- (1-フェニル-エチル) - キナゾルリノ-4-イル] - アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 7.85 (d, J=8.4Hz, 1H)、7.60 (m, 4H)、7.32 (m, 3H)、7.21 (t, J=6.9Hz, 2H)、6.48 (d, J=2.0Hz, 1H)、6.39 (br, 1H)、6.36 (d, J=8.1Hz, 1H)、4.48 (d, J=5.3Hz, 2H)、4.40 (m, 1H)、3.88 (s, 3H)、3.82 (s, 3H)、1.80 (d, J=7.1Hz, 3H)

化合物番号 380. (2, 5-ジメトキシ-ベンジル) - [2- (1-フェニル-エチル) - キナゾルリノ-4-イル] - アミン

30

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 7.83 (d, J=8.2Hz, 1H)、7.63 (m, 2H)、7.56 (d, J=7.4Hz, 2H)、7.35 (m, 1H)、7.28 (m, 2H)、7.19 (d, J=7.3Hz, 1H)、6.98 (d, J=2.8Hz, 1H)、6.82 (m, 2H)、6.28 (br, 1H)、4.88 (d, J=5.4Hz, 2H)、4.38 (m, 2H)、3.88 (s, 3H)、3.79 (s, 3H)、1.79 (d, J=7.1Hz, 3H)

化合物番号 381. [2- (1-フェニル-エチル) - キナゾルリノ-4-イル] - (2, 4, 6-トリメトキシ-ベンジル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 7.76 (d, J=8.4Hz, 1H)、7.64-7.50 (m, 4H)、7.31-7.24 (m, 3H)、7.16 (t, J=7.2Hz, 1H)、6.17 (s, 2H)、6.03 (br, 1H)、5.02-4.83 (m, 2H)、4.31 (q, J=7.2Hz, 1H)、3.83 (s, 9H)、1.80 (d, J=7.2Hz, 3H)

40

化合物番号 382. (2-シクロプロピル-キナゾルリノ-4-イル) - (2-メトキシ-ベンジル) - アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 7.75 (d, J=8.0Hz, 1H)、7.62 (m, 2H)、7.35 (m, 3H)、6.93 (m, 2H)、6.32 (br, 1H)、4.81 (d, J=5.4Hz, 2H)、3.98 (s, 3H)、2.19 (m, 1H)、1.25 (m, 2H)、1.01 (m, 2H)

化合物番号 383. (2-シクロプロピル-キナゾルリノ-4-イル) - (3-メトキシ-ベンジル) - アミン ¹HNM R (CDCl₃, 300MHz) δ 7.77-7.61 (m, 3H)、7.35-7.24 (m, 2H)、6.94 (m, 2H)、6.84 (dd, J₁=8.4Hz, J₂=2.7Hz, 1H)、5.93 (br, 1H)、4.78 (d, J=5.7Hz, 2H)、3.79 (s, 3H)、2.17 (m, 1H)、1.17 (m, 2H)、0.95 (m, 2H)

化合物番号 384. (2-シクロプロピル-キナゾルリノ-4-イル) - (4-メトキシ-ベンジ

50

ル) - アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 7.78 (d, $J=7.9\text{ Hz}$, 1H)、7.70 (m, 2H)、7.35 (m, 3H)、6.90 (d, $J=7.8\text{ Hz}$, 2H)、5.98 (br, 1H)、4.74 (d, $J=5.4\text{ Hz}$, 2H)、3.82 (s, 3H)、2.20 (m, 1H)、1.21 (m, 2H)、1.01 (m, 2H)

化合物番号 385. ベンゾ[1, 3]ジオキソール-5-イルメチル-(2-シクロプロピル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 7.76 (d, $J=8.0\text{ Hz}$, 1H)、7.66 (m, 2H)、7.43 (m, 1H)、6.84 (m, 3H)、5.96 (s, 2H)、4.71 (d, $J=5.4\text{ Hz}$, 2H)、2.19 (m, 1H)、1.20 (m, 2H)、1.01 (m, 2H)

化合物番号 386. (2-シクロプロピル-キナゾルリノ-4-イル) - (2, 3-ジメトキシ-ベンジル) - アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 7.74 (d, $J=7.9\text{ Hz}$, 1H)、7.64 (m, 2H)、7.32 (d, $J=8.4\text{ Hz}$, 1H)、6.99 (m, 2H)、6.89 (m, 1H)、6.32 (br, 1H)、4.83 (d, $J=5.4\text{ Hz}$, 2H)、3.94 (s, 3H)、3.89 (s, 3H)、2.18 (m, 1H)、1.22 (m, 2H)、1.01 (m, 2H)

化合物番号 387. (2-シクロプロピル-キナゾルリノ-4-イル) - (3, 5-ジメトキシ-ベンジル) - アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 7.76 (d, $J=7.8\text{ Hz}$, 1H)、7.66 (m, 2H)、7.35 (m, 1H)、6.54 (s, 2H)、6.39 (s, 1H)、6.23 (br, 1H)、4.74 (d, $J=5.4\text{ Hz}$, 2H)、3.79 (s, 6H)、2.18 (m, 1H)、1.19 (m, 2H)、0.99 (m, 2H)

化合物番号 388. (2-シクロプロピル-キナゾルリノ-4-イル) - (3, 4-ジメトキシ-ベンジル) - アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 7.76 (d, $J=7.8\text{ Hz}$, 1H)、7.67 (t, $J=7.4\text{ Hz}$, 2H)、7.31 (t, $J=3.8\text{ Hz}$, 1H)、6.94 (d, $J=5.0\text{ Hz}$, 2H)、6.84 (t, $J=4.3\text{ Hz}$, 1H)、6.07 (br, 1H)、4.74 (d, $J=5.4\text{ Hz}$, 2H)、3.89 (s, 3H)、3.87 (s, 3H)、2.20 (m, 1H)、1.22 (m, 2H)、1.00 (m, 2H)

化合物番号 389. (2-シクロプロピル-キナゾルリノ-4-イル) - (3, 4, 5-トリメトキシ-ベンジル) - アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 7.77-7.64 (m, 3H)、7.33 (t, $J=7.2\text{ Hz}$, 1H)、6.61 (s, 1H)、6.00 (br, 1H)、4.72 (d, $J=5.4\text{ Hz}$, 2H)、3.84 (s, 9H)、2.19 (m, 1H)、1.19 (m, 2H)、0.98 (m, 2H)

化合物番号 390. (2-シクロプロピル-キナゾルリノ-4-イル) - (2, 4-ジメトキシ-ベンジル) - アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 7.73 (d, $J=8.3\text{ Hz}$, 1H)、7.62 (m, 2H)、7.32 (d, $J=9.3\text{ Hz}$, 2H)、6.48 (m, 2H)、6.14 (br, 1H)、4.73 (d, $J=5.4\text{ Hz}$, 2H)、3.89 (s, 3H)、3.81 (s, 3H)、2.19 (m, 1H)、1.25 (m, 2H)、1.01 (m, 2H)

化合物番号 391. (2-シクロプロピル-キナゾルリノ-4-イル) - (2, 5-ジメトキシ-ベンジル) - アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 7.74 (d, $J=8.5\text{ Hz}$, 1H)、7.63 (m, 2H)、7.33 (t, $J=7.5\text{ Hz}$, 1H)、6.98 (d, $J=2.1\text{ Hz}$, 1H)、6.81 (m, 2H)、6.25 (br, 1H)、3.88 (s, 3H)、3.78 (s, 3H)、2.18 (m, 1H)、1.25 (m, 2H)、1.01 (m, 2H)

化合物番号 392. (2-シクロプロピル-キナゾルリノ-4-イル) - (2, 4, 6-トリメトキシ-ベンジル) - アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 7.73 (d, $J=8.3\text{ Hz}$, 1H)、7.64 (m, 1H)、7.53 (d, $J=6.2\text{ Hz}$, 1H)、7.29 (m, 1H)、2.17 (s, 2H)、6.06 (br, 1H)、4.82 (d, $J=5.3\text{ Hz}$, 2H)、3.87 (s, 6H)、3.84 (s, 3H)、2.18 (m, 1H)、1.30 (m, 2H)、1.00 (m, 2H)

化合物番号 393. (2-メトキシ-ベンジル) - (2-プロピル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 7.78 (d, $J=8.2\text{ Hz}$, 1H)、7.68 (m, 2H)、7.44 (d

10

20

30

40

50

、J=7.3Hz、1H)、7.38(d、J=7.0Hz、1H)、7.34(m、1H)、6.95(t、J=7.8Hz、2H)、6.24(br、1H)、4.91(d、J=5.7Hz、2H)、3.93(s、3H)、2.87(t、J=7.7Hz、2H)、1.93(m、2H)、1.04(t、J=7.4Hz、3H)

化合物番号394.(3-メトキシ-ベンジル)-(2-プロピル-キナゾリノ-4-イル)-アミン

¹HNM R (CDCl₃、300MHz) δ 7.80(d、J=8.4Hz、1H)、7.68(m、2H)、7.35(m、2H)、6.99(m、2H)、6.85(m、1H)、5.83(brs、1H)、4.86(d、J=5.1Hz、2H)、3.80(s、3H)、2.86(t、J=7.7Hz、2H)、1.90(sixtet、J=7.5Hz、2H)、1.02(t、J=7.4Hz、3H)

化合物番号395.(4-メトキシ-ベンジル)-(2-プロピル-キナゾリノ-4-イル)-アミン

¹HNM R (CDCl₃、300MHz) δ 7.79(d、J=8.4Hz、1H)、7.65(m、2H)、7.38(m、3H)、6.88(d、J=8.4Hz、2H)、5.81(brs、1H)、4.80(d、J=5.1Hz、2H)、3.81(s、3H)、2.86(t、J=7.8Hz、2H)、1.91(sixtet、J=7.5Hz、2H)、1.03(t、J=7.5Hz、3H)

化合物番号396.ベンゾ[1,3]ジオキソール-5-イルメチル-(2-プロピル-キナゾリノ-4-イル)-アミン

¹HNM R (CDCl₃、300MHz) δ 7.80(d、J=7.8Hz、1H)、7.68(m、2H)、7.37(t、J=7.5Hz、1H)、6.89(m、2H)、6.78(d、J=7.8Hz、1H)、5.95(s、2H)、5.80(brs、1H)、4.78(d、J=5.4Hz、2H)、2.86(t、J=7.8Hz、2H)、1.91(sixtet、J=7.5Hz、2H)、1.03(t、J=7.5Hz、3H)

化合物番号397.(2、3-ジメトキシ-ベンジル)-(2-プロピル-キナゾリノ-4-イル)-アミン

¹HNM R (CDCl₃、300MHz) δ 7.76(d、J=8.4Hz、1H)、7.64(m、2H)、7.37(t、J=7.2Hz、1H)、7.03(d、J=4.8Hz、2H)、6.88(t、J=4.8Hz、1H)、6.17(brs、1H)、4.90(d、J=5.7Hz、2H)、3.94(s、3H)、3.89(s、3H)、2.86(t、J=7.8Hz、2H)、1.91(sixtet、J=7.5Hz、2H)、1.03(t、J=7.5Hz、3H)

化合物番号398.(3、5-ジメトキシ-ベンジル)-(2-プロピル-キナゾリノ-4-イル)-アミン

¹HNM R (CDCl₃、300MHz) δ 7.80(d、J=8.1Hz、1H)、7.70(m、2H)、7.38(t、J=7.2Hz、1H)、6.57(d、J=2.1Hz、2H)、6.41(m、1H)、5.83(brs、1H)、6.82(d、J=5.4Hz、2H)、3.78(s、6H)、2.86(t、J=7.8Hz、2H)、1.91(sixtet、J=7.5Hz、2H)、1.03(t、J=7.5Hz、3H)

化合物番号399.(3、4-ジメトキシ-ベンジル)-(2-プロピル-キナゾリノ-4-イル)-アミン

¹HNM R (CDCl₃、300MHz) δ 7.80(d、J=8.1Hz、1H)、7.69(m、2H)、7.37(t、J=7.5Hz、1H)、6.97(d、J=7.2Hz、2H)、6.85(d、J=8.4Hz、1H)、5.81(brs、1H)、4.81(d、J=5.4Hz、2H)、3.88(s、3H)、3.86(s、3H)、2.86(t、J=7.8Hz、2H)、1.91(sixtet、J=7.5Hz、2H)、1.03(t、J=7.5Hz、3H)

化合物番号400.(2-プロピル-キナゾリノ-4-イル)-(3、4、5-トリメトキシ-ベンジル)-アミン

¹HNM R (CDCl₃、300MHz) δ 7.81(d、J=8.3Hz、3H)、7.71(m、2H)、4.40(m、1H)、6.68(s、2H)、6.07(br、1H)、4.82(d、J=5.5Hz、2H)、3.86(s、9H)、2.88(t、J=7.7Hz、2H)、1.94(m、2H)、1.03(t、J=7.4Hz、2H)

化合物番号401.(2、4-ジメトキシ-ベンジル)-(2-プロピル-キナゾリノ-4-イル)-アミン

¹HNM R (CDCl₃、300MHz) δ 7.78(d、J=8.5Hz、1H)、7.64(m、2H)、7.36(m、2H)、7.47(m、2H)、6.14(br、1H)、4.82(d、J=5.4Hz、2H)、3.90(s、3H)、3.82(s、3H)、2.87(t、J=7.8Hz、2H)、1.96(m、2H)、1.05(t、J=7.3Hz、2H)

10

20

30

40

50

化合物番号 4 0 2 . (2, 5-ジメトキシ-ベンジル) - (2-プロピル-キナゾルリノ-4-イル) - アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 7.78 (d, $J=8.1\text{ Hz}$, 1H), 7.66 (m, 2H), 7.37 (m, 1H), 7.05 (s, 1H), 6.82 (m, 2H), 6.29 (br, 1H), 4.87 (d, $J=5.4\text{ Hz}$, 2H), 3.88 (s, 3H), 3.76 (s, 3H), 2.86 (t, $J=7.6\text{ Hz}$, 2H), 1.95 (m, 2H), 1.05 (t, $J=7.5\text{ Hz}$, 2H)

化合物番号 4 0 3 . (2-プロピル-キナゾルリノ-4-イル) - (2, 4, 6-トリメトキシ-ベンジル) - アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 7.76 (d, $J=8.3\text{ Hz}$, 1H), 7.60 (m, 2H), 7.35 (m, 1H), 6.18 (s, 2H), 5.98 (br, 1H), 4.88 (d, $J=5.4\text{ Hz}$, 2H), 3.87 (s, 6H), 3.85 (s, 3H), 2.88 (t, $J=7.5\text{ Hz}$, 2H), 1.98 (m, 2H), 1.07 (t, $J=7.4\text{ Hz}$, 2H)

10

化合物番号 4 0 4 . (2-メトキシ-ベンジル) - キナゾルリノ-4-イル-アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 8.74 (s, 1H), 7.88 (d, $J=8.2\text{ Hz}$, 1H), 7.70 (m, 2H), 7.47 (m, 2H), 7.32 (m, 1H), 6.97 (d, $J=7.8\text{ Hz}$, 2H), 6.25 (br, 1H), 4.88 (d, $J=5.5\text{ Hz}$, 2H), 3.93 (s, 3H)

化合物番号 4 0 5 . (3-メトキシ-ベンジル) - キナゾルリノ-4-イル-アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 8.73 (s, 1H), 7.86 (d, $J=8.3\text{ Hz}$, 1H), 7.73 (t, $J=9.0\text{ Hz}$, 2H), 7.47 (m, 1H), 7.31 (m, 1H), 6.99 (t, $J=7.4\text{ Hz}$, 2H), 6.87 (d, $J=8.1\text{ Hz}$, 1H), 6.01 (br, 1H), 4.87 (d, $J=5.4\text{ Hz}$, 2H), 3.82 (s, 3H)

20

化合物番号 4 0 6 . (4-メトキシ-ベンジル) - キナゾルリノ-4-イル-アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 8.71 (s, 1H), 7.85 (d, $J=8.1\text{ Hz}$, 1H), 7.71 (m, 2H), 7.45 (t, $J=7.5\text{ Hz}$, 1H), 7.34 (d, $J=8.7\text{ Hz}$, 2H), 6.90 (d, $J=8.7\text{ Hz}$, 1H), 5.88 (brs, 1H), 4.80 (d, $J=5.1\text{ Hz}$, 2H), 3.82 (s, 3H)

化合物番号 4 0 7 . ベンゾ[1, 3]ジオキソール-5-イルメチル-キナゾルリノ-4-イル-アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 8.72 (s, 1H), 7.88 (d, $J=8.4\text{ Hz}$, 1H), 7.40 (m, 2H), 7.48 (d, $J=7.2\text{ Hz}$, 1H), 6.90 (m, 2H), 6.81 (d, $J=7.4\text{ Hz}$, 1H), 5.98 (s, 2H), 5.96 (br, 1H), 4.78 (d, $J=5.4\text{ Hz}$, 2H)

化合物番号 4 0 8 . (2, 3-ジメトキシ-ベンジル) - キナゾルリノ-4-イル-アミン

30

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 8.70 (s, 1H), 7.73 (m, 3H), 7.43 (m, 1H), 7.04 (m, 2H), 6.93 (m, 1H), 6.32 (br, 1H), 4.89 (d, $J=5.4\text{ Hz}$, 2H), 3.95 (s, 3H), 3.90 (s, 3H)

化合物番号 4 0 9 . (3, 5-ジメトキシ-ベンジル) - キナゾルリノ-4-イル-アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 8.71 (s, 1H), 7.87 (d, $J=8.4\text{ Hz}$, 1H), 7.73 (m, 2H), 7.47 (t, $J=7.2\text{ Hz}$, 1H), 6.40 (d, $J=2.4\text{ Hz}$, 2H), 6.41 (t, $J=2.1\text{ Hz}$, 1H), 5.93 (brs, 1H), 4.81 (d, $J=5.1\text{ Hz}$, 2H), 3.79 (s, 6H)

化合物番号 4 1 0 . (3, 4-ジメトキシ-ベンジル) - キナゾルリノ-4-イル-アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 8.73 (s, 1H), 7.87 (d, $J=8.2\text{ Hz}$, 1H), 7.75 (t, $J=7.4\text{ Hz}$, 2H), 7.47 (t, $J=7.6\text{ Hz}$, 1H), 6.97 (d, $J=7.8\text{ Hz}$, 2H), 6.86 (d, $J=8.0\text{ Hz}$, 1H), 6.08 (br, 1H), 4.81 (d, $J=5.2\text{ Hz}$, 2H), 3.89 (s, 3H), 3.87 (s, 3H)

40

化合物番号 4 1 1 . キナゾルリノ-4-イル- (3, 4, 5-トリメトキシ-ベンジル) - アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 8.73 (s, 1H), 7.84 (m, 1H), 7.78 (m, 1H), 7.50 (m, 1H), 6.63 (d, $J=7.8\text{ Hz}$, 2H), 6.23 (br, 1H), 4.80 (d, $J=5.3\text{ Hz}$, 2H), 3.85 (s, 9H)

化合物番号 4 1 2 . (2, 4-ジメトキシ-ベンジル) - キナゾルリノ-4-イル-アミン

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) δ 8.70 (s, 1H), 7.83 (d, $J=8.3\text{ Hz}$, 1H), 7.72 (m, 2H), 7.44 (t, $J=7.6\text{ Hz}$, 1H), 7.32 (d, $J=8.2\text{ Hz}$, 1H), 6.48 (m, 2H), 6.26 (br, 1H), 4.80 (d, $J=5.4\text{ Hz}$, 2H), 3.89 (s, 3H), 3.82 (s, 3H)

50

化合物番号 4 1 3 . (2, 5-ジメトキシ-ベンジル) -キナゾルリノ-4-イル-アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MH z) δ 8.69 (s, 1H)、7.84 (d、J=8.4H z、1H)、7.69 (m、2H)、7.44 (t、J=7.2H z、1H)、6.99 (d、J=3.0H z、1H)、6.83 (m、2H)、6.29 (brs、1H)、4.85 (d、J=5.4H z、2H)、3.88 (s、3H)、3.76 (s、3H)

化合物番号 4 1 4 . キナゾルリノ-4-イル- (2, 4, 6-トリメトキシ-ベンジル) -アミン

¹HNM R (CDCl₃, 300MH z) δ 8.72 (s、1H)、7.81 (d、J=8.1H z、1H)、7.69 (t、J=7.5H z、1H)、7.60 (d、J=8.1H z、1H)、7.40 (t、J=7.5H z、1H)、6.19 (s、2H)、6.03 (brs、1H)、4.83 (d、J=5.1H z、2H)、3.86 (s、6H)、3.84 (s、3H)

化合物番号 4 1 5 .4-ベンジルオキシ-2-イソプロピル-キナゾルリノ

10

¹HNM R (CDCl₃, 300MH z) δ 8.16 (d、J=8.1H z、1H)、7.87 (s、J=8.4H z、1H)、7.77 (m、1H)、7.54 (d、J=7.5H z、2H)、7.49-7.34 (m、4H)、5.66 (s、2H)、3.22 (m、1H)、1.40 (d、J=6.9H z、6H)

化合物番号 4 1 6 .4-ベンジルスルファニル-2-イソプロピル-キナゾルリノ

¹HNM R (CDCl₃, 300MH z) δ 8.01 (d、J=8.4H z、1H)、7.89 (d、J=8.4H z、1H)、7.78 (m、1H)、7.48 (m、3H)、7.35-7.23 (m、3H)、4.67 (s、2H)、3.29 (m、1H)、1.43 (d、J=6.9MH z、6H)

【0086】

一方、本発明による前記化学式 1 で表示される化合物は目的によって多くの形態で製剤化が可能である。次は本発明による前記化学式 1 で表示される化合物を活性成分として含有させたいいくつかの製剤化方法を例示したことで本発明がここに限定されるのではない。

20

【0087】

製造例 1 : 精製の製造

本発明の化合物を利用して次のような造成で経口投与用精製を湿式料粒法及び乾式料粒法を利用して製造した。

【0088】

[造成]

有効化合物 200mg、硬質無水珪酸 10mg、ステアリン酸塩マグネシウム 2mg、微細結晶セルロース 50mg、澱粉グリコール酸ナトリウム 25mg、とうもろこし澱粉 113mg、無水エタノール適量。

30

【0089】

製造例 2 : 軟膏剤の製造

本発明の化合物を利用して次のような造成で軟膏剤を製造した。

【0090】

[造成]

有効化合物 5g、セチルパルミテート 20g、セタノール 40g、ステアリルアルコール 40g、ミリスチンイソプロピル 80g、モノステアリン酸ソルビタン 20g、ポリソルベート 60g、パラオキシ安息香酸プロピル 1g、パラオキシ安息香酸メチル 1g、リン酸及び錠剤水適量。

【0091】

40

製造例 3 : 注射剤の製造

本発明の化合物を利用して次のような造成で注射剤を製造した。

【0092】

[造成]

有効化合物 100mg、マンニトール 180mg、リン酸一水素ナトリウム 25mg、注射用水 2974mg。

【0093】

実験例 1 . 葡萄糖吸収度分析

筋肉細胞である C 2 C 1 2 細胞を 10% 子牛血清 (bovine calf serum) が入っている DME M (Dulbecco's modified Eagle's medium) 培地で細胞を養った。細胞の密度が約 85 ~

50

90%ほどになれば1%子牛血清培養液で切り替えた後6日間細胞分化を誘導させた。

【0094】

完全に分化された細胞を5mMの葡萄糖が含まれたクレブスリンガ緩衝液（Krebs-Ringer buffer、KRB）で3時間培養した後、候補物質を10 μ M濃度になるように添加して30分間放置して置いて後0.2 μ Ci 2-デオキシグルコースを添加して20分間放置して置いた。

【0095】

KRB緩衝液を取り除いた後、冷たいPBSで三回細胞を洗滌した後、0.5N NaOHを使って細胞を溶解させて放射線計測器を利用して係数率（cpm）を測定した。

【0096】

下記の表2-1～表2-3から確認されるところのように、C2C12細胞に本発明による化学式1で表示される化合物を処理した場合対照群に比べて葡萄糖の吸収が最大2.8倍まで増加することを確認した。

[表2-1]

化合物No.	葡萄糖吸収度	化合物.No.	葡萄糖吸収度	化合物.No.	葡萄糖吸収度
1	1.7	41	1.1	81	0.9
2	1.3	42	1.1	82	1.2
3	1.2	43	1.1	83	0.7
4	1.2	44	1.3	84	1.0
5	0.9	45	1.1	85	1.0
6	1.4	46	1.1	86	1.4
7	1.5	47	0.9	87	1.0
8	1.2	48	1.0	88	1.1
9	2.0	49	1.8	89	1.4
10	1.5	50	1.2	90	1.4
11	1.0	51	1.0	91	1.2
12	0.8	52	1.3	92	1.4
13	0.7	53	1.2	93	1.1
14	1.2	54	1.2	94	1.3
15	0.8	55	1.2	95	1.2
16	1.3	56	1.1	96	1.3
17	1.2	57	1.0	97	1.0
18	1.0	58	1.4	98	1.2
19	1.4	59	1.2	99	1.4
20	1.9	60	1.0	100	1.4
21	1.2	61	1.9	101	1.5
22	2.6	62	1.1	102	1.2
23	0.8	63	1.1	103	2.2
24	2.8	64	1.2	104	1.0
25	2.6	65	1.4	105	1.2
26	1.7	66	1.3	106	1.8
27	1.0	67	0.9	107	0.4
28	1.1	68	1.3	108	2.2
29	1.6	69	1.0	109	1.3
30	1.8	70	1.0	110	2.0
31	1.1	71	1.0	111	2.4
32	1.1	72	1.1	112	1.9
33	1.2	73	1.0	113	2.1
34	1.3	74	0.9	114	2.2
35	1.9	75	1.3	115	2.3
36	1.4	76	1.0	116	2.5
37	2.2	77	1.4	117	1.4
38	1.5	78	1.4	118	2.1
39	0.9	79	1.1	119	2.6
40	1.2	80	1.0	120	1.4

10

20

30

40

50

[表 2 - 2]

化合物. No.	葡萄糖吸収度	化合物. No.	葡萄糖吸収度	化合物. No.	葡萄糖吸収度
121	2. 4	161	1. 1	201	1. 7
122	1. 3	162	1. 3	202	1. 4
123	2. 1	163	2. 5	203	2. 0
124	1. 4	164	3. 4	204	1. 2
125	2. 8	165	2. 5	205	1. 3
126	2. 1	166	2. 8	206	1. 4
127	1. 4	167	3. 2	207	2. 0
128	2. 3	168	3. 6	208	2. 0
129	1. 3	169	2. 5	209	1. 1
130	2. 2	170	2. 4	210	0. 9
131	2. 3	171	2. 2	211	1. 3
132	1. 3	172	2. 6	212	2. 0
133	2. 1	173	1. 3	213	1. 4
134	2. 6	174	1. 2	214	2. 0
135	2. 6	175	2. 7	215	2. 2
136	1. 3	176	2. 4	216	2. 6
137	2. 4	177	2. 8	217	1. 2
138	2. 4	178	4. 2	218	2. 0
139	2. 5	179	2. 9	219	2. 3
140	2. 7	180	4. 1	220	2. 5
141	2. 1	181	3. 1	221	1. 5
142	1. 4	182	3. 1	222	1. 2
143	2. 3	183	3. 3	223	1. 7
144	1. 3	184	3. 2	224	1. 1
145	2. 2	185	1. 4	225	1. 3
146	2. 3	186	1. 0	226	1. 9
147	1. 3	187	2. 4	227	1. 6
148	2. 1	188	1. 0	228	2. 1
149	2. 6	189	1. 3	229	1. 9
150	2. 6	190	1. 2	230	1. 7
151	1. 3	191	2. 4	231	1. 2
152	2. 4	192	2. 1	232	1. 2
153	2. 4	193	1. 3	233	1. 4
154	2. 5	194	1. 4	234	1. 1
155	2. 7	195	1. 2	235	1. 2
156	1. 1	196	2. 1	236	1. 2
157	2. 0	197	1. 3	237	0. 9
158	2. 0	198	1. 4	238	1. 0
159	2. 6	199	2. 1	239	0. 5
160	2. 5	200	2. 7	240	1. 0

10

20

30

[表 2 - 3]

40

化合物. No.	葡萄糖吸収度	化合物. No.	葡萄糖吸収度	化合物. No.	葡萄糖吸収度
241	1.2	293	0.6	364	1.3
242	0.9	296	0.9	368	1.1
243	1.4	298	0.6	369	1.1
244	0.4	299	0.8	370	1.3
245	1.2	300	0.9	371	1.2
246	1.2	301	0.8	372	1.1
247	1.3	302	0.7	373	1.1
248	1.4	303	1.0	374	1.1
249	0.9	304	0.8	375	1.1
250	1.3	305	0.8	376	1.1
251	0.6	306	0.8	377	1.1
252	0.9	307	0.8	378	0.9
253	1.3	308	0.8	379	1.1
254	1.4	309	0.8	380	1.0
255	1.3	310	0.9	381	1.2
256	0.6	321	1.2	382	1.2
257	1.4	322	1.4	383	1.4
258	1.3	323	1.1	384	1.2
259	1.4	324	1.3	387	1.2
260	1.4	325	1.2	388	1.2
261	1.1	326	1.2	389	1.3
262	1.1	327	1.3	390	1.1
263	1.1	328	1.4	391	1.2
264	1.1	329	1.8	392	1.1
265	1.1	330	1.2	394	1.3
266	1.1	331	1.2	395	1.2
267	1.0	332	1.1	396	1.3
268	1.1	333	1.2	397	1.3
269	1.2	334	1.1	398	1.4
270	1.1	335	1.1	399	1.2
271	0.8	336	1.3	404	2.1
272	0.4	337	1.3	405	2.2
273	0.7	341	0.8	406	2.1
274	0.8	343	1.3	407	1.5
275	0.8	345	1.3	408	1.6
276	0.8	353	1.2	409	1.6
283	1.0	355	1.2	411	1.2
285	0.8	360	1.4	412	1.7
288	0.8	361	1.3	413	1.2
291	0.8	362	1.2	414	1.5
292	0.7	363	1.3		

10

20

30

40

50

【0097】

実験例2. ウェスタンブロット (Western blot) を利用したAMPK酵素の活性測定

C2C12細胞培養及び分化は前記実験例1と等しい条件で遂行して候補物質の処理条件も等しく行った。(50分間10μM処理)。この後培養液を取り除いて細胞をPBS溶液で二回洗滌した後lysis緩衝液(50mMトリスHCl、pH7.4、1%NP-40、0.25%デオキシコール酸ナトリウム、150mMNaCl、1mMEDTA、1mMPMSF、1mMナトリウムオルソバナデイト(sodium o-vanadate)、1mMNaF、1μg/mlアプロティニン(apronitin)、1μg/mlロイペプティン(leu-peptin)、1μg/mlペプスタチン(pepstatin))を使って蛋白質抽出物を得た。

【0098】

AMPKの活性度はAMPKの基質であるアセチルCoAカルボキシラーゼのセリン79残基のリン酸化程度とAMPK活性化時必須に連れられるアルファサブユニットのトレオニン172残基のリン酸化程度をウェスタンブロット(Western blot)分析を通じて間接的に測定した。蛋白質の決まった定量を確認するためにERK(extracellular signal regulated prot

ein kinase) の量をウェスタンブロットで確認した。

【0099】

下記の表3-1～表3-2はウェスタンブロット (Western blot) で確認した結果を現わしたことで、トレオニン172残基のリン酸化程度が3倍以上増加した結果に対しては“strong”で表記したし、トレオニン172残基のリン酸化程度が1ないし3倍増加した結果に対しては“mild”で表記したし、トレオニン172残基のリン酸化程度が1倍未満増加した結果に対しては“weak”で表記した。

[表3-1]

化合物. No.	AMPK酵素活性	化合物. No.	AMPK酵素活性	化合物. No.	AMPK酵素活性
1	6.0 ^a	116	2.0 (strong)	178	5.7 (strong)
2	4.2 ^a	118	2.0 (strong)	179	3.8 (strong)
3	3.3 ^a	119	2.3 (strong)	180	3.9 (strong)
4	3.5 ^a	121	2.2 (strong)	181	3.1 (strong)
5	4.7 ^a	123	2.3 (strong)	182	2.9 (strong)
6	4.7 ^a	125	1.8 (strong)	183	2.6 (strong)
7	4.4 ^a	126	2.0 (strong)	184	1.9 (strong)
8	3.0 ^a	128	1.7 (strong)	187	0.7 (mild)
9	5.5 ^a	130	1.8 (strong)	191	5.2 (strong)
10	5.3 ^a	131	1.8 (strong)	192	6.5 (strong)
11	3.2 ^a	133	1.3 (mild)	196	4.8 (strong)
12	4.0 ^a	134	1.8 (strong)	199	2.3 (strong)
13	4.2 ^a	135	2.0 (strong)	200	1.5 (strong)
14	3.6 ^a	137	3.1 (strong)	201	2.8 (strong)
15	2.3 ^a	138	2.9 (strong)	203	3.9 (strong)
16	3.1 ^a	139	2.1 (strong)	226	4.3 (strong)
17	2.2 ^a	140	3.1 (strong)	227	4.9 (strong)
18	6.0 ^a	142	1.4 (mild)	228	7.9 (strong)
20	weak	143	2.4 (strong)	229	4.7 (strong)
22	strong	144	2.1 (strong)	230	4.9 (strong)
24	strong	145	2.7 (strong)	271	2.4
25	strong	147	1.8 (strong)	272	3.4
26	mild	148	1.7 (strong)	273	1.5
29	mild	149	2.5 (strong)	274	1.9
30	mild	151	1.8 (strong)	275	2.1
35	strong	153	1.3 (mild)	276	1.9
37	strong	155	1.3 (mild)	277	1.3
49	mild	163	2.8 (strong)	278	1.2
61	weak	164	1.6 (mild)	279	1.3
101	weak	165	5.2 (strong)	280	1.2
103	2.6 (strong)	166	3.8 (strong)	281	0.9
106	1.3 (mild)	167	6.7 (strong)	282	0.9
108	2.2 (strong)	168	8.4 (strong)	283	1.1
109	1.9 (strong)	169	6.6 (strong)	284	1.4
110	1.6 (strong)	170	8.8 (strong)	285	1.6
111	1.8 (strong)	171	6.6 (strong)	286	1.0
112	1.7 (strong)	172	4.4 (strong)	287	1.2
113	2.1 (strong)	175	4.8 (strong)	288	1.7
114	2.0 (strong)	176	4.4 (strong)	289	1.5
115	2.3 (strong)	177	5.5 (strong)	290	1.0

[表3-2]

化合物. No.	AMPK酵素活性	化合物. No.	AMPK酵素活性	化合物. No.	AMPK酵素活性
291	1.5	330	1.7	380	1.9
292	1.2	342	1.0	381	4.0
293	0.1	343	0.8	382	2.2
294	0.4	344	0.4	383	2.2
295	0.2	345	1.1	384	2.0
296	1.0	346	0.8	385	2.8
297	0.8	347	1.2	386	1.3
298	0.7	348	1.6	387	1.5
299	0.6	349	2.1	388	2.8
300	1.0	350	0.6	389	2.2
301	0.9	351	0.7	390	3.8
302	1.2	352	0.5	391	7.1
303	1.0	353	0.8	392	2.7
304	1.4	354	0.6	393	1.0
305	2.1	355	1.1	394	4.5
306	1.7	356	1.4	395	7.0
307	2.0	357	0.7	396	7.3
308	2.2	358	0.8	397	6.5
309	1.3	359	0.9	398	7.8
310	1.6	360	2.2	399	4.9
311	0.2	361	2.1	400	0.4
312	0.3	362	2.6	401	1.4
313	0.1	363	1.4	402	0.5
314	0.2	364	1.2	403	1.3
315	0.4	365	1.1	404	1.9
316	1.2	366	1.6	405	2.7
317	0.3	367	2.2	406	1.5
318	0.5	368	5.9	407	1.3
319	1.5	369	4.5	408	3.5
320	0.9	370	7.7	409	3.3
321	0.9	371	2.8	410	1.1
322	1.9	372	6.3	411	1.8
323	1.2	373	2.1	412	8.4
324	2.3	374	1.9	413	1.7
325	2.2	375	5.2	414	2.9
326	2.9	376	1.1	415	1.1
327	4.4	377	2.3	416	0.7
328	3.8	378	4.7		
329	4.2	379	6.1		
*セリン79残基のリン酸化程度をウェスタンブロット(Western blot)分析した結果。 セリン79残基とトレオニン172残基のリン酸化程度をウェスタンブロット (Western blot)分析した結果					

10

20

30

【0100】

前記表3-1～表3-2と添付図面1と図2aないし図2gから確認できるように、本発明による前記化学式1で表示される化合物を筋肉細胞で処理すればAMPK酵素の活性が増加することを確認した。

40

【0101】

実験例3. モデル動物であるdb/dbマウスで糖尿／肥満予防及び治療効果。

8～9週になったdb/db系統の雄マウス(C57BL/Ks)を実験に使った。0.5%カルボキシメチルセルロース(CMC)溶液の陰性対照群、0.5%カルボキシメチルセルロース(CMC)に溶かした陽性対照群(Rosiglitazone)及び試験薬物は毎日午後に経口あるいは腹腔投与して、血糖測定はしばしば静脈を切開して3～4日間隔で午後に日程時間に投与直前に血糖測定器で測定した。動物の体重と飼料量は毎日薬物投与直前に測定した。

【0102】

10日間投与及び血糖測定と体重測定が終わった後、血液を採取して血清を分離して肝機能、心の心臓機能及び脂質検査のためのBiochemicalparameterなどを測定する。

50

【0103】

図3a及び3b、図4a及び4b、図5a、5b及び5c、そして図6a、6b及び6cに示したように、本発明による前記化学式1で表示される化合物を腹腔又は経口投与を通じて実験群と対照群の血糖と体重を測定して分析した結果、対照群に比べて実験群が血糖及び体重が減少するので糖尿及び肥満の予防及び治療に効果があることを観察した。

【0104】

実験例4. モデル動物であるob/obマウスで糖尿/肥満予防及び治療効果。

実験例4-1

陰性6週齢のob/obマウスをHarlanから受けて飼料と水を自由に取りようにしてSK内の動物室で一週間順化させた。以後体重を測定して(0day)各グループの平均重さが一定になるように動物を分類した。実験群は対照群(Control)、養成対照群(sibutramine)、各薬物群で分けたし、投与用量は陽性対照群15mg/kg、各薬物群は200mg/kg/10mlの薬物を製造してインシュリン注射器を利用して腹腔投与した。また、投与は午後5時に毎日1回ずつ4週間投与した。対照群は0.5%カルボキシメキルセルロース(CMC)のみをkg/10ml投与した。

【0105】

4週間投与しながら体重を測定したし、対照群グループの体重と薬物投与群グループの体重差(g)と、最初薬物投与した日(0day)の体重から増加する体重の%を計算して薬物が現わす体重増加抑制を対照群グループと比べることで薬効を評価した。また、飼料摂取量を測定して飼料摂取抑制効果を観察した。

【0106】

実験例4-2

実験例1で効果を見せた薬物に対して経口投与を通じる効果試験を実施した。実験群分配、投与用量及び投与期間などは実験例3-1と等しくて、ただ投与方法だ強制経口投与を実施した。図7a及び7b、図8a及び8b、そして図9で分かるように、本発明による前記化学式1で表示される化合物を腹腔又は経口投与を通じて実験群と対照群の血糖又は体重を測定して分析した結果、対照群に比べて実験群が血糖及び体重が減少したことで糖尿及び肥満の予防及び治療に効果があることを観察した。

【発明の効果】

【0107】

前述したように、本発明による血糖低下と体重減少効果が卓越な多くの化合物は糖尿病及び肥満治療剤で有効に使うことができる。

【図面の簡単な説明】

【0108】

【図1】本発明による化合物をセリン79残基のリン酸化程度をウェスタンブロット(western blot)分析した結果。

【図2a】本発明による化合物をセリン79残基とトレオニン172残基のリン酸化程度をウェスタンブロット(western blot)分析した結果。

【図2b】本発明による化合物をセリン79残基とトレオニン172残基のリン酸化程度をウェスタンブロット(western blot)分析した結果。

【図2c】本発明による化合物をセリン79残基とトレオニン172残基のリン酸化程度をウェスタンブロット(western blot)分析した結果。

【図2d】本発明による化合物をセリン79残基とトレオニン172残基のリン酸化程度をウェスタンブロット(western blot)分析した結果。

【図2e】本発明による化合物をセリン79残基とトレオニン172残基のリン酸化程度をウェスタンブロット(western blot)分析した結果。

【図2f】本発明による化合物をセリン79残基とトレオニン172残基のリン酸化程度をウェスタンブロット(western blot)分析した結果。

【図2g】本発明による化合物をセリン79残基とトレオニン172残基のリン酸化程度をウェスタンブロット(western blot)分析した結果。

【図 3 a】本発明による化合物をdb/dbマウスに腹腔投与するによる血糖変化を示したグラフ。

【図 3 b】本発明による化合物をdb/dbマウスに腹腔投与するによる血糖変化を示したグラフ。

【図 4 a】本発明による化合物をdb/dbマウスに腹腔投与するによる体重変化を示したグラフ。

【図 4 b】本発明による化合物をdb/dbマウスに腹腔投与するによる体重変化を示したグラフ。

【図 5 a】本発明による化合物をdb/dbマウスに経口投与するによる血糖変化を示したグラフ。

10

【図 5 b】本発明による化合物をdb/dbマウスに経口投与するによる血糖変化を示したグラフ。

【図 5 c】本発明による化合物をdb/dbマウスに経口投与するによる血糖変化を示したグラフ。

【図 6 a】本発明による化合物をdb/dbマウスに経口投与するによる体重変化を示したグラフ。

【図 6 b】本発明による化合物をdb/dbマウスに経口投与するによる体重変化を示したグラフ。

【図 6 c】本発明による化合物をdb/dbマウスに経口投与するによる体重変化を示したグラフ。

20

【図 7 a】本発明による化合物をob/obマウスに腹腔投与することによる体重変化を示したグラフ。

【図 7 b】本発明による化合物をob/obマウスに腹腔投与することによる体重変化を示したグラフ。

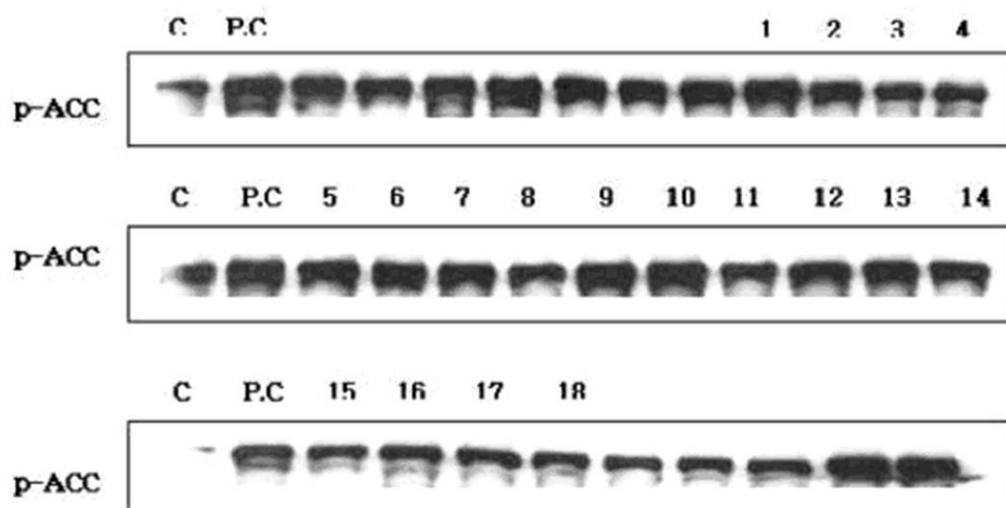
【図 8 a】本発明による化合物をob/obマウスに腹腔投与するによる血糖変化を示したグラフ。

【図 8 b】本発明による化合物をob/obマウスに腹腔投与するによる血糖変化を示したグラフ。

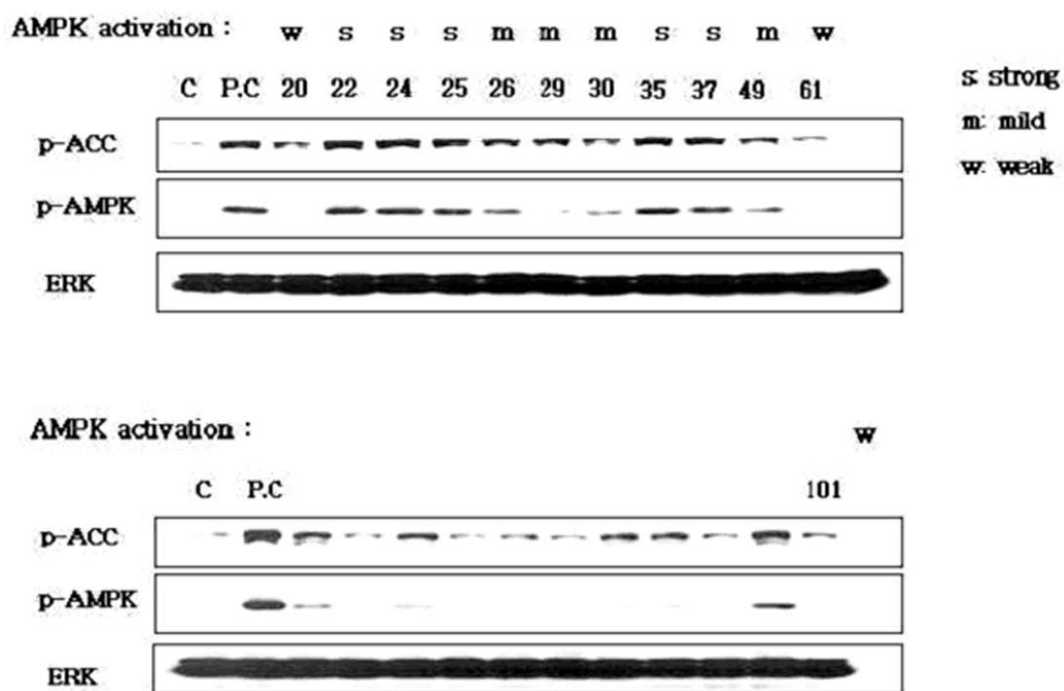
【図 9】本発明による化合物をob/obマウスに経口投与するによる体重変化を示したグラフ。

30

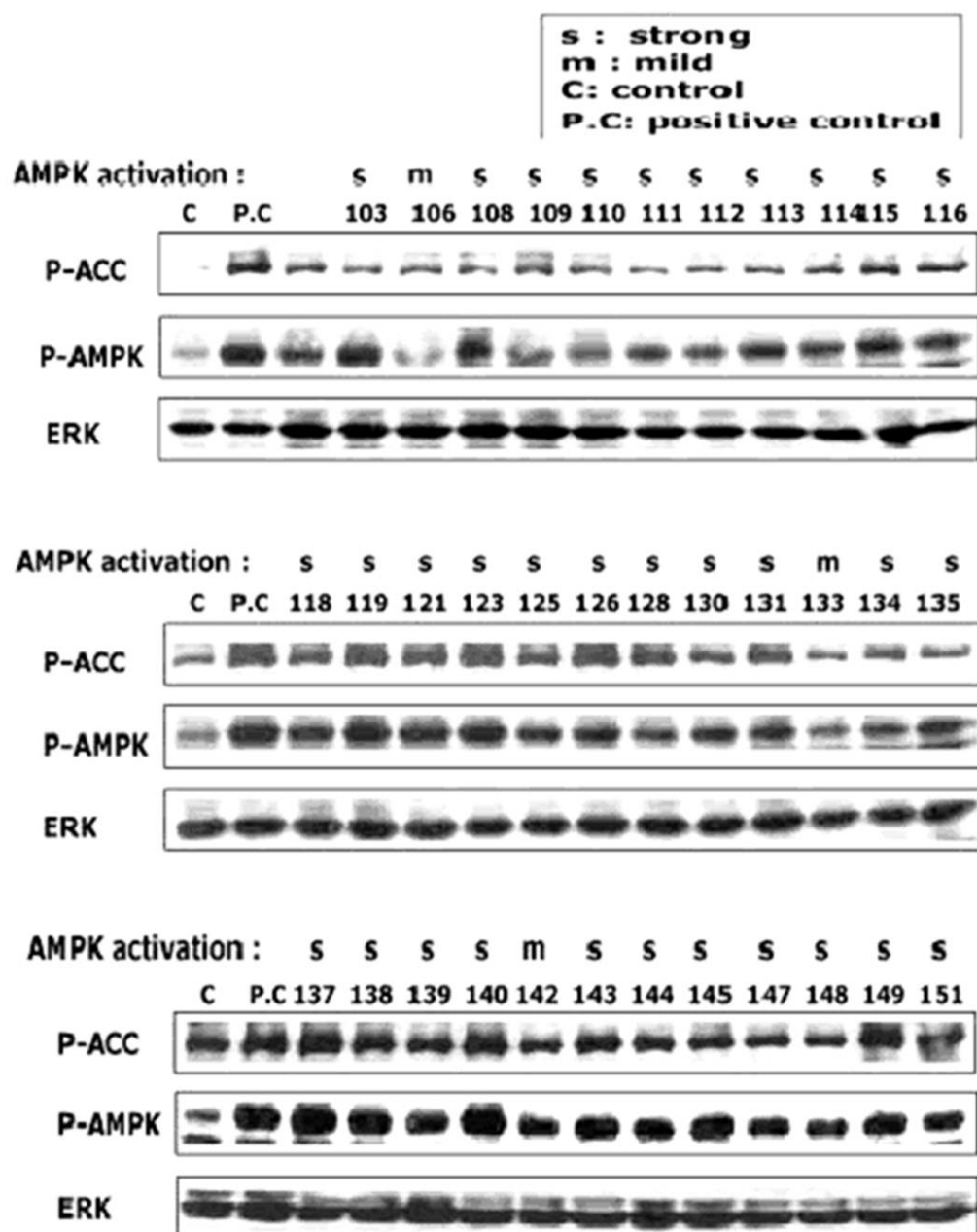
【図 1】



【図 2 a】



【図 2 b】

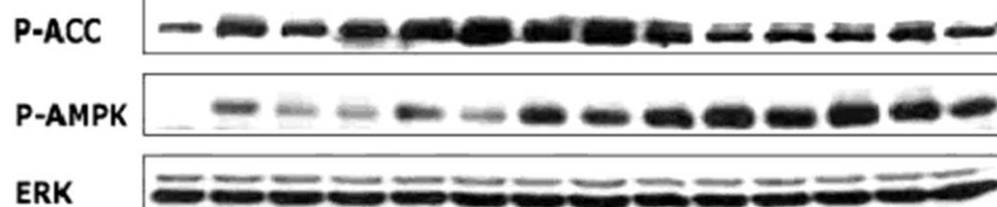


【図 2 c】

s : strong
m : mild
C: control
P.C: positive control

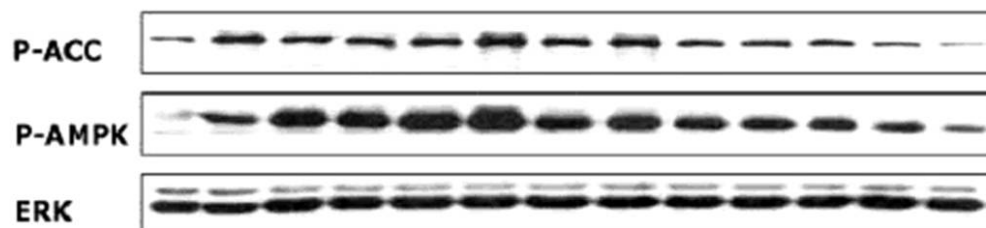
AMPK activation : m m s m s s s s s s s s

C P.C 153 155 163 164 165 166 167 168 169 170 171 172



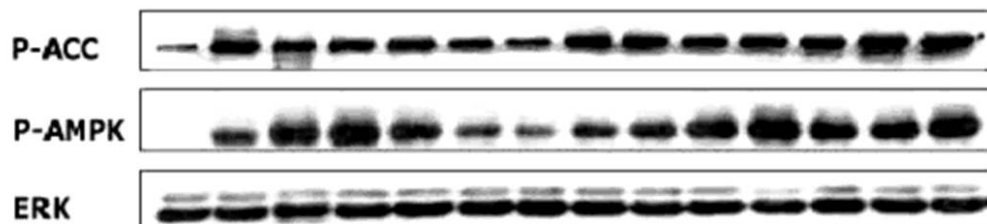
AMPK activation : s s s s s s s s s s s m

C P.C 175 176 177 178 179 180 181 182 183 184 187

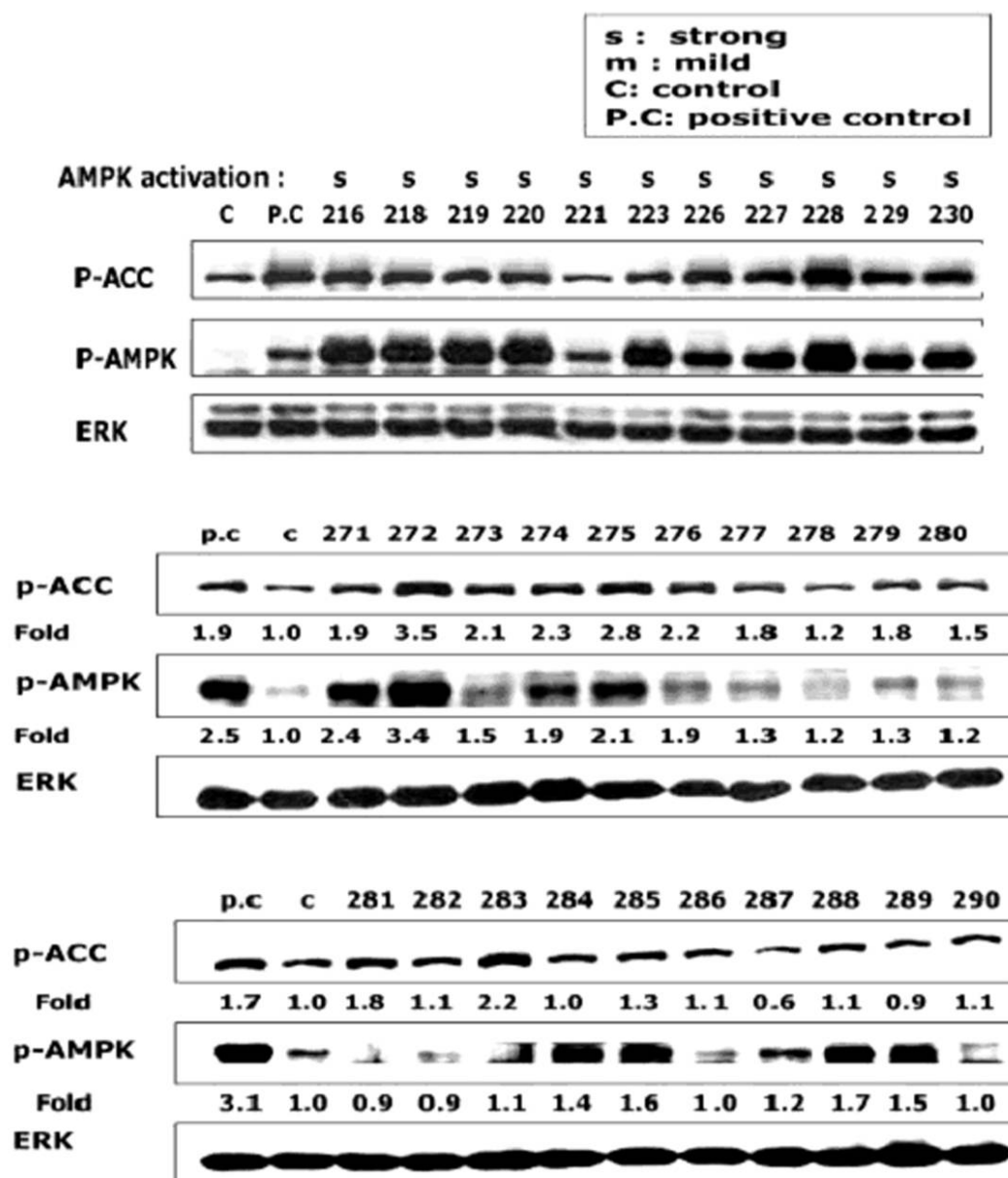


AMPK activation : s s s s s s s s s s s s

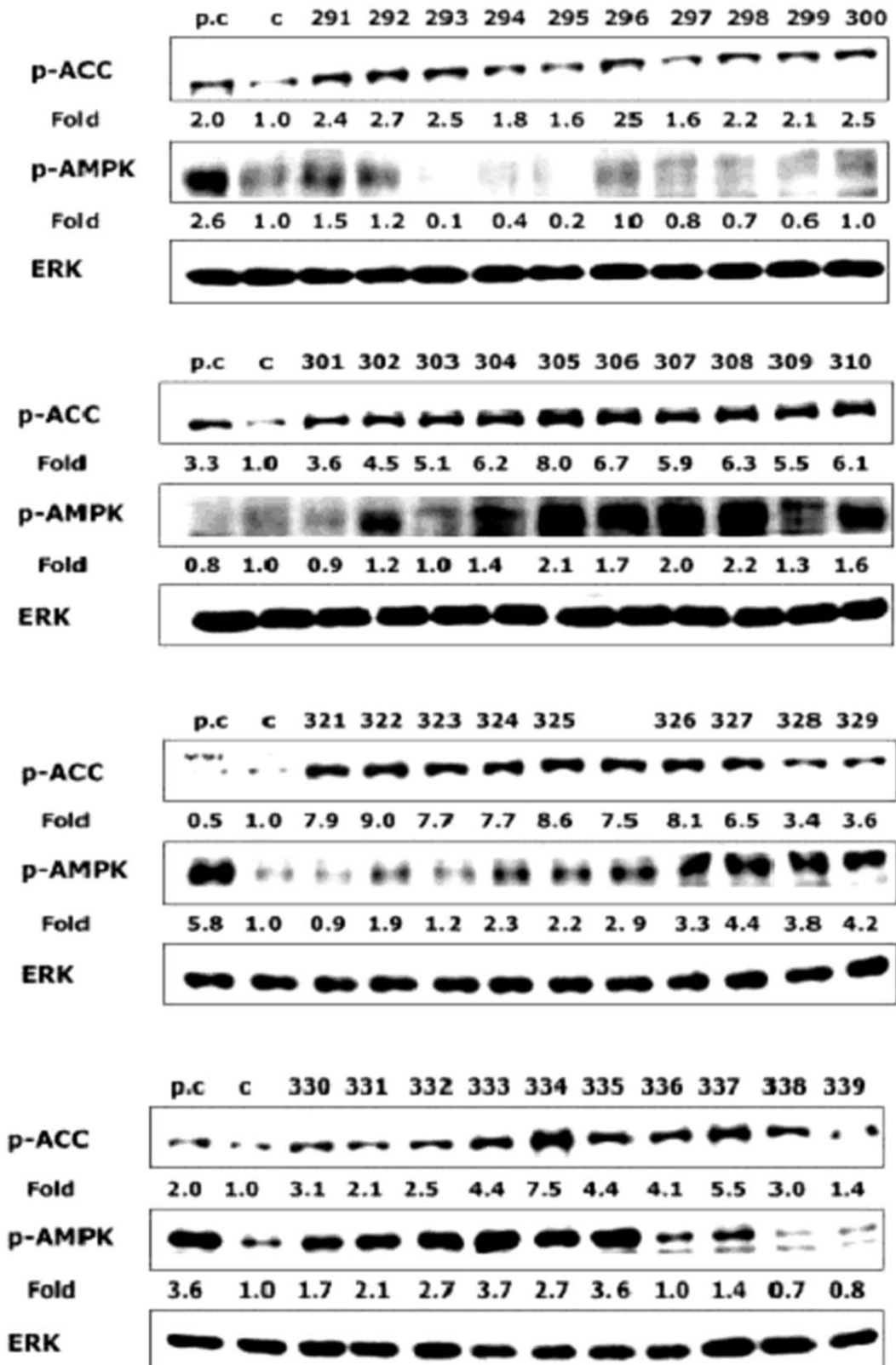
C P.C 191 192 196 199 200 201 203 207 208 212 214 215



【図 2 d】



【図 2 e】



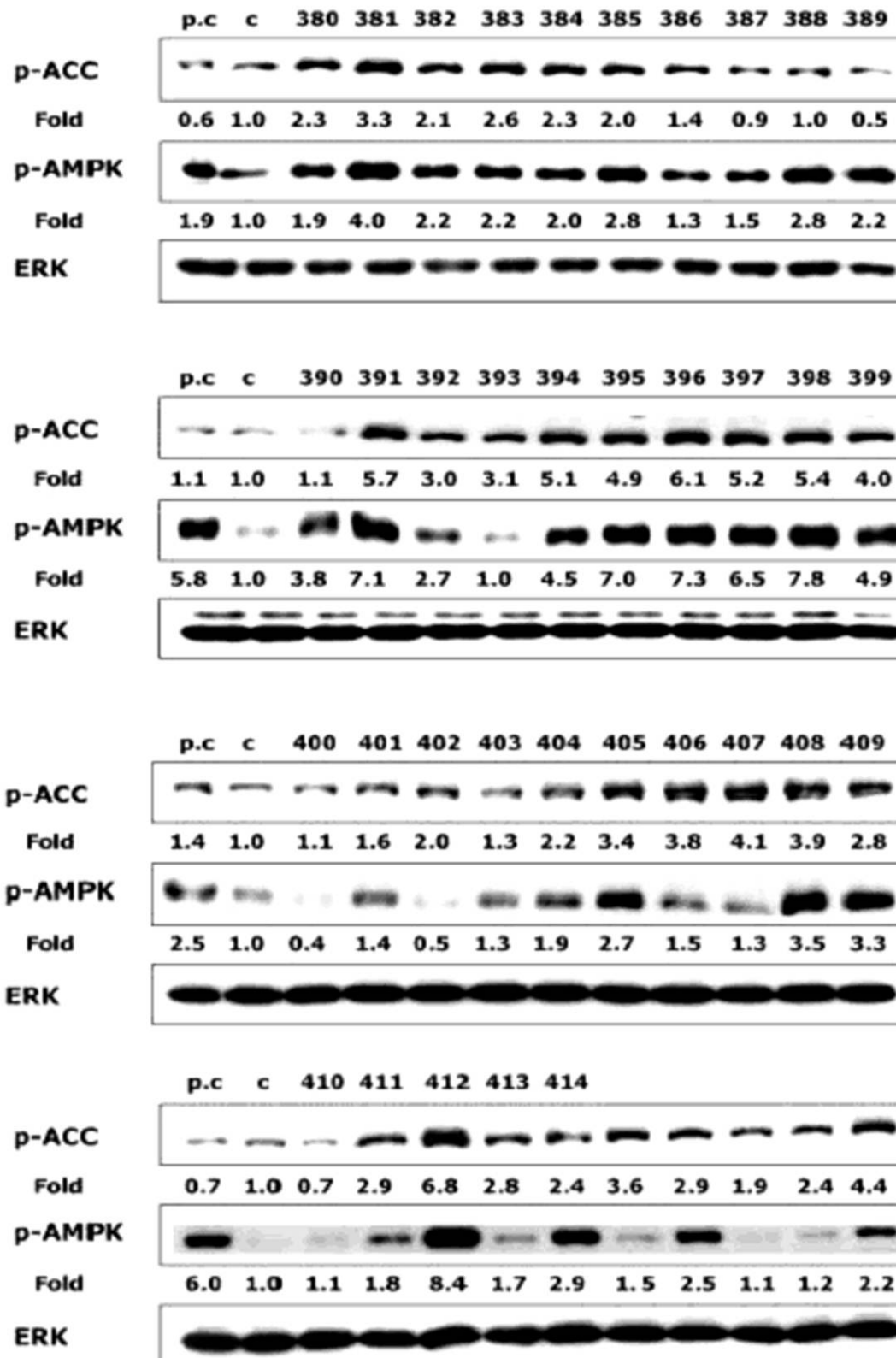
	p.c	c	340	341	342	343	344	345	346	347	348	349
p-ACC												
Fold	2.3	1.0	2.5	4.3	2.5	4.1	1.1	3.5	3.3	2.2	2.6	1.2
p-AMPK												
Fold	3.0	1.0	0.9	1.2	1.0	0.8	0.4	1.1	0.8	1.2	1.6	2.1
ERK												

	p.c	c	350	351	352	353	354	355	356	357	358	359
p-ACC												
Fold	3.2	1.0	1.7	1.2	2.5	3.7	2.7	3.8	2.3	2.7	2.3	1.7
p-AMPK												
Fold	3.0	1.0	0.6	0.7	0.5	0.8	0.6	1.1	1.4	0.7	0.8	0.9
ERK												

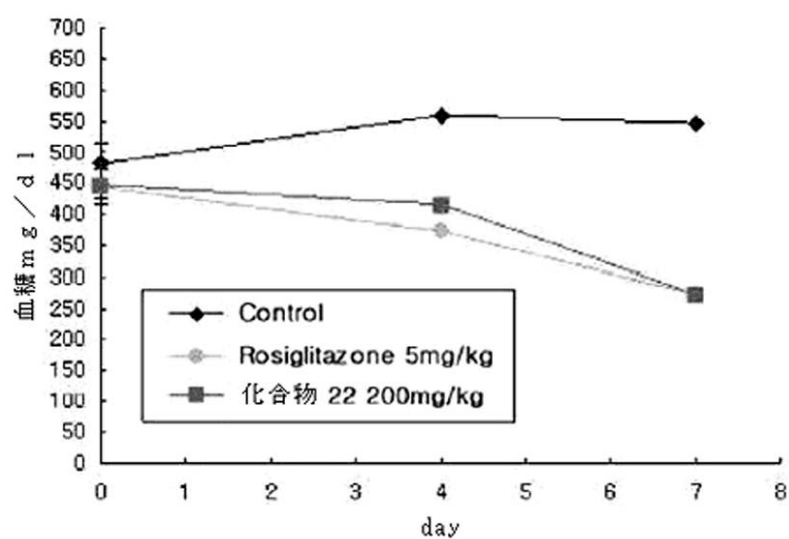
	p.c	c	360	361	362	363	364	365	366	367	368	369
p-ACC												
Fold	1.3	1.0	4.5	3.6	2.9	5.0	4.3	3.0	3.2	2.8	3.1	2.0
p-AMPK												
Fold	4.0	1.0	2.2	2.1	2.6	1.4	1.2	1.1	1.6	2.2	5.9	4.5
ERK												

	p.c	c	370	371	372	373	374	375	376	377	378	379
p-ACC												
Fold	1.7	1.0	4.4	2.4	7.7	5.9	5.3	7.0	4.8	6.6	7.7	6.9
p-AMPK												
Fold	4.5	1.0	7.7	2.8	6.3	2.1	1.9	5.2	1.1	2.3	4.7	6.1
ERK												

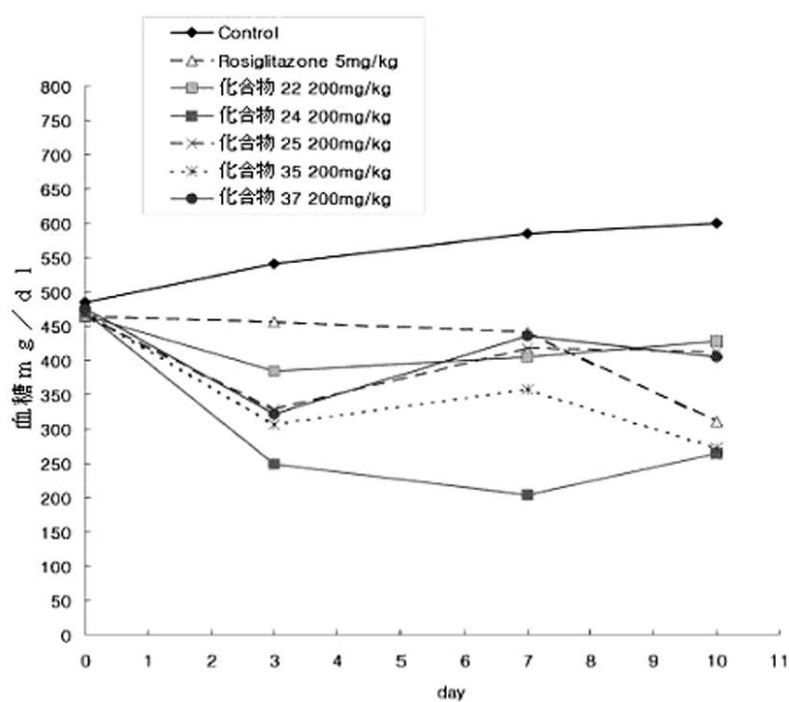
【図 2 g】



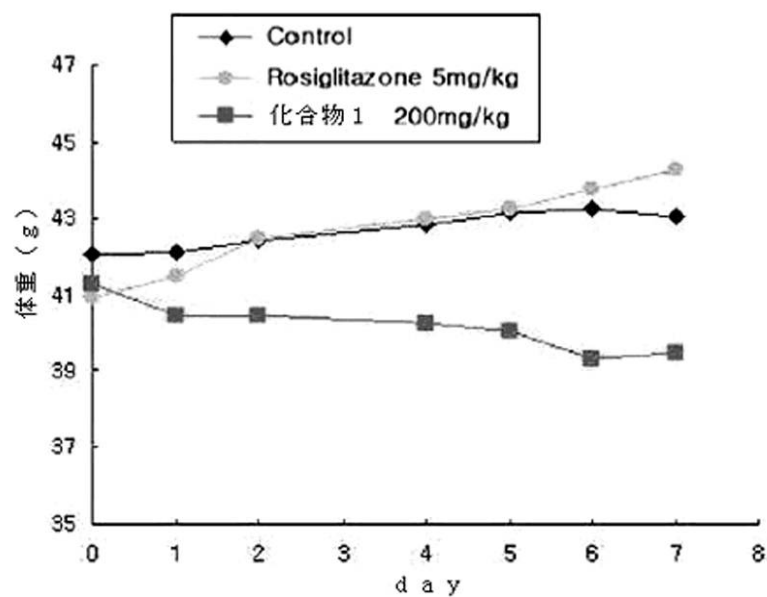
【図 3 a】



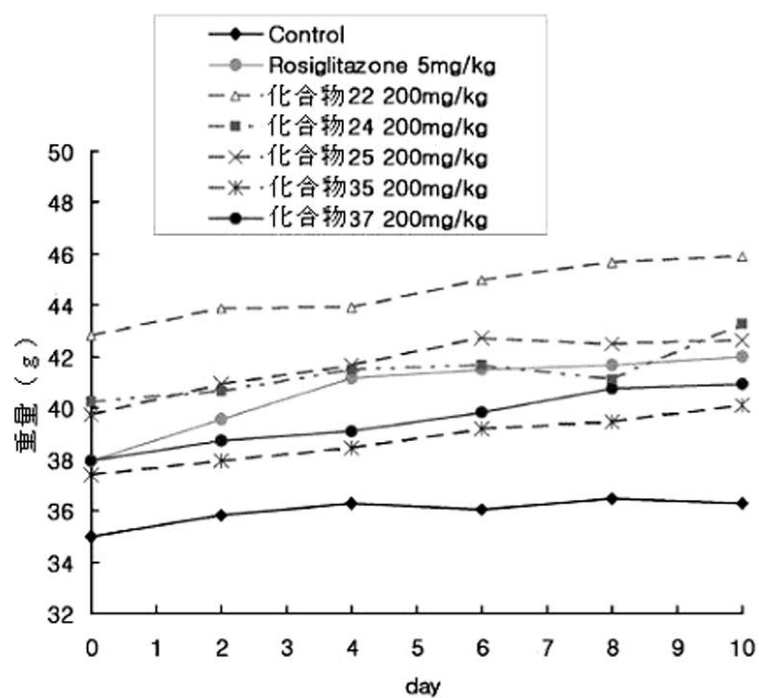
【図 3 b】



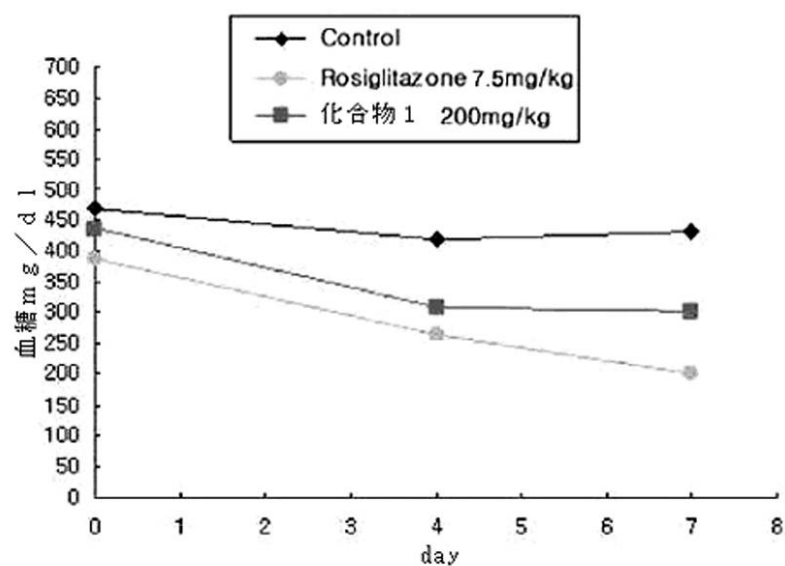
【図 4 a】



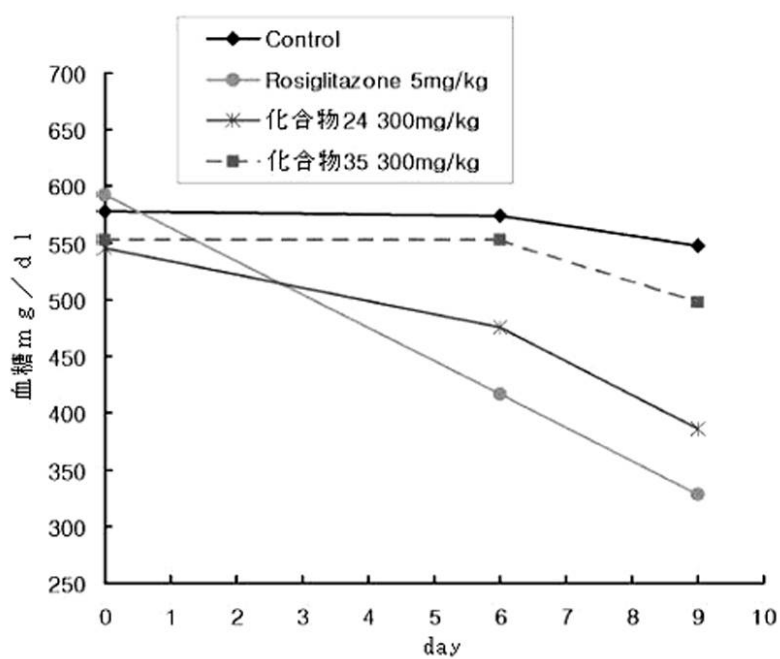
【図 4 b】



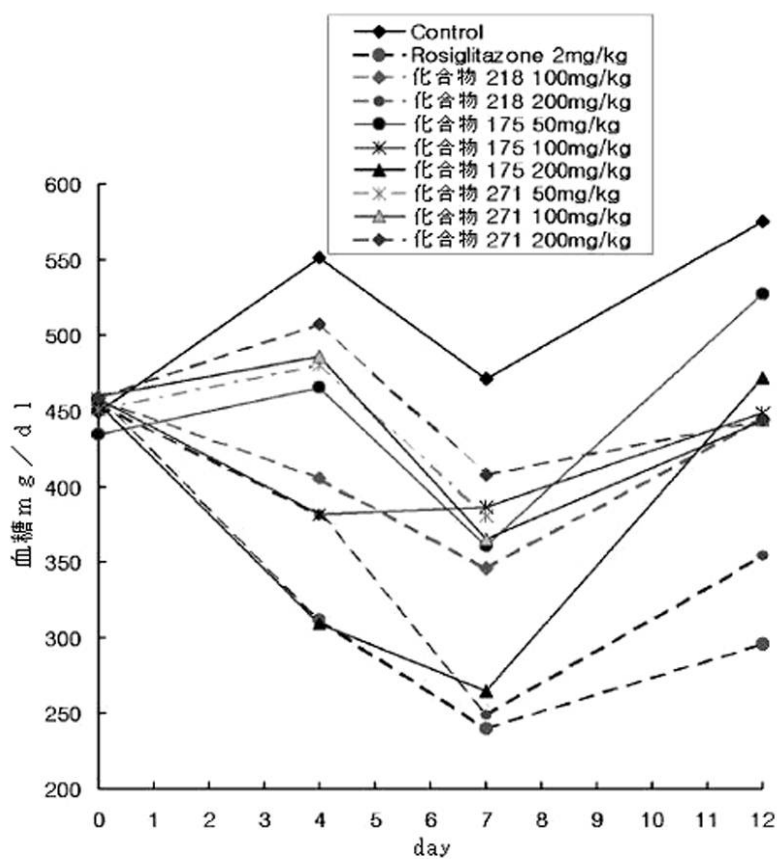
【図 5 a】



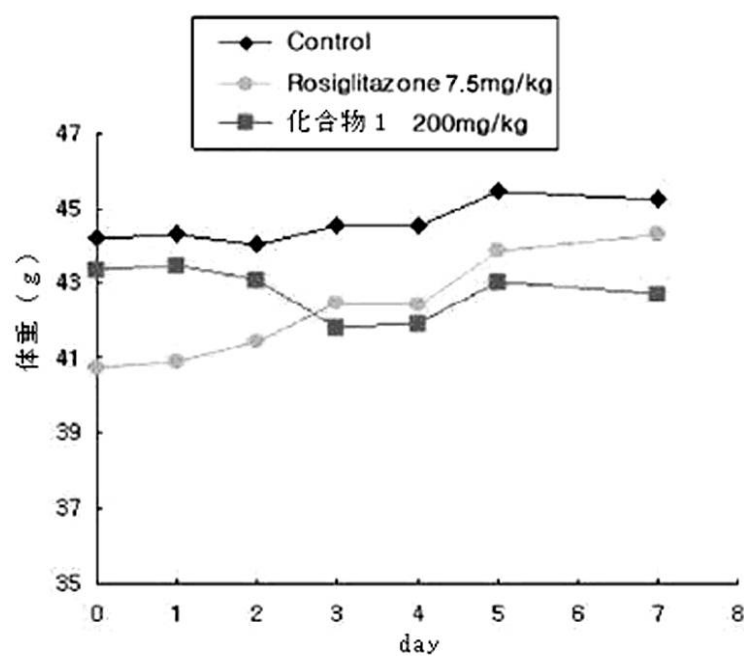
【図 5 b】



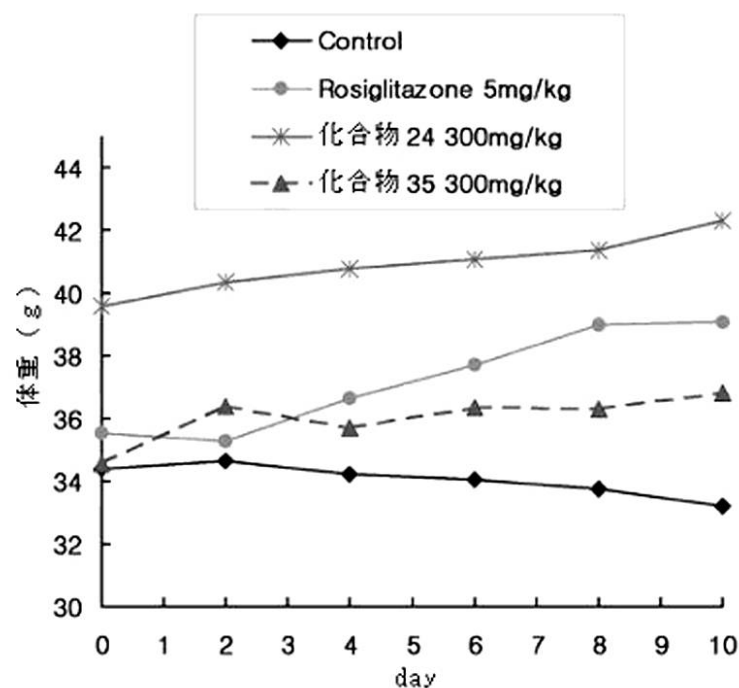
【図 5 c】



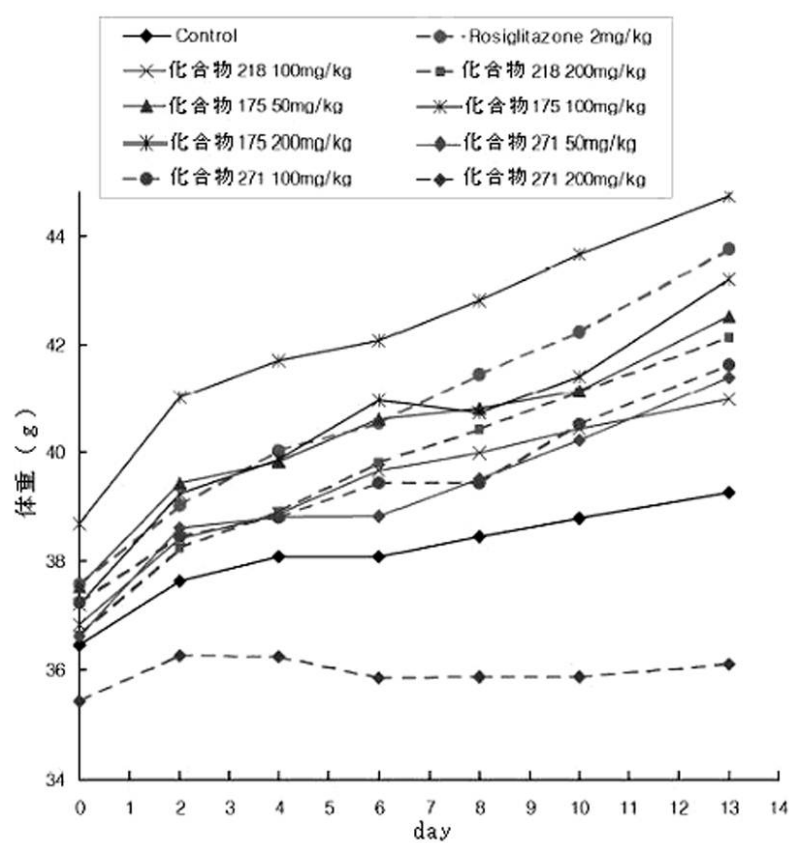
【図 6 a】



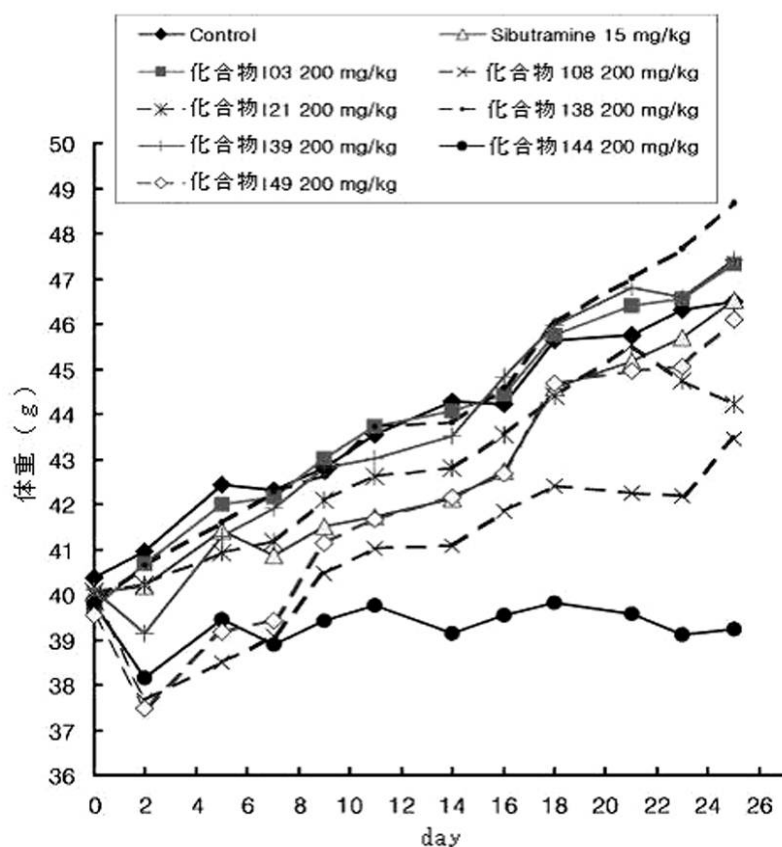
【図 6 b】



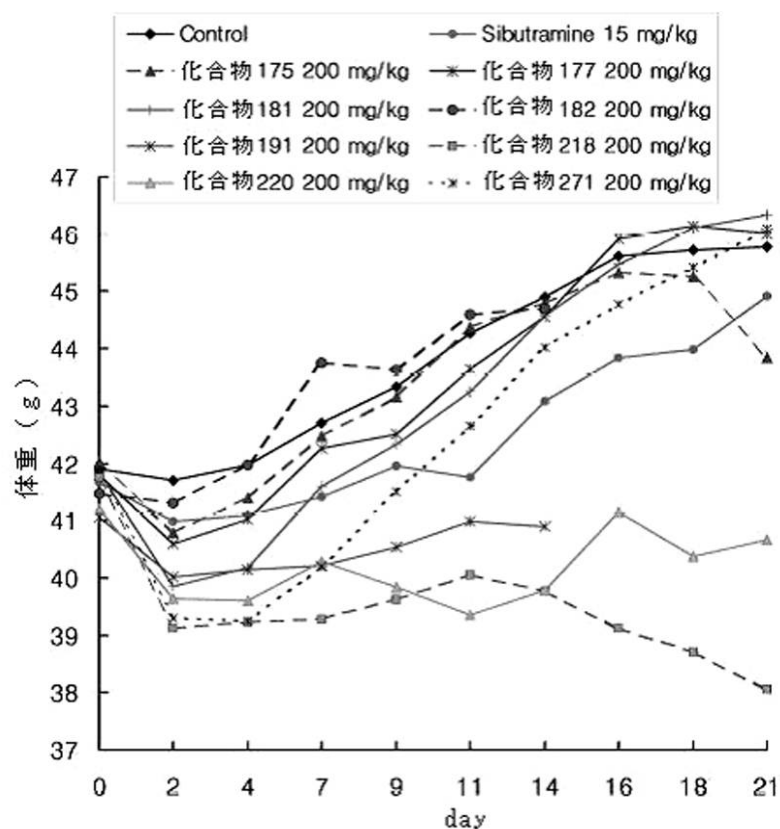
【図 6 c】



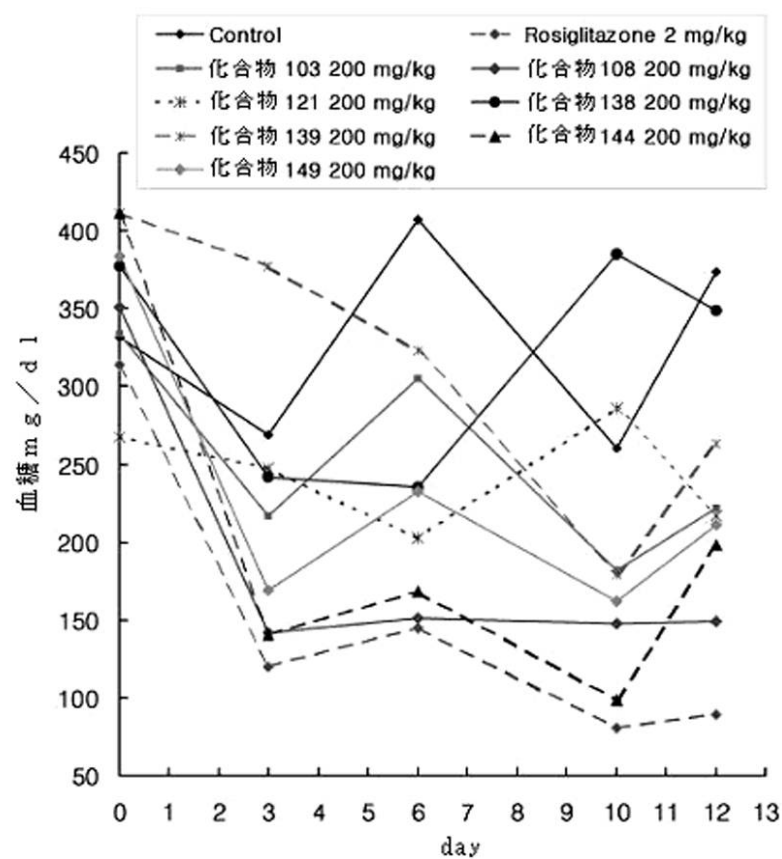
【図 7 a】



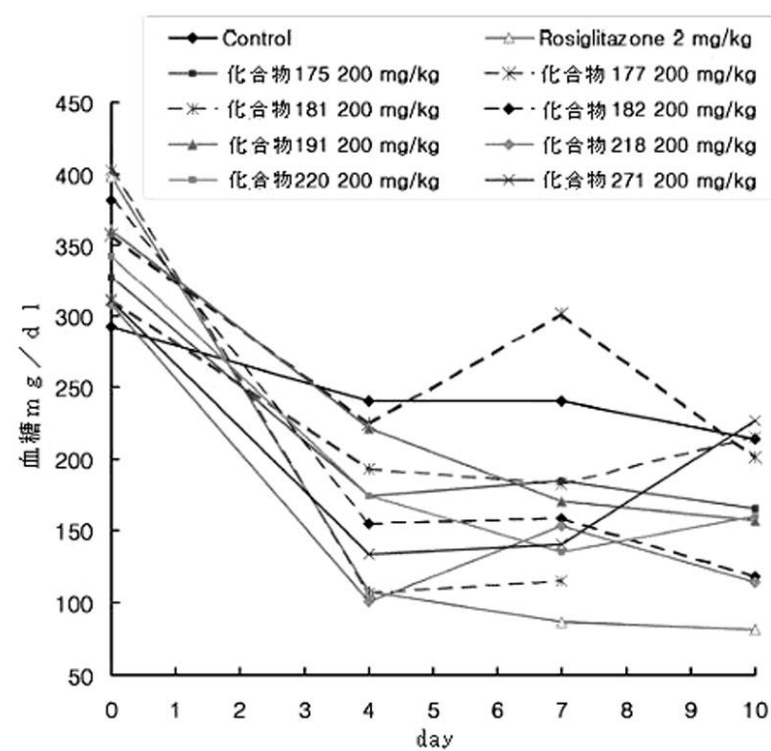
【図 7 b】



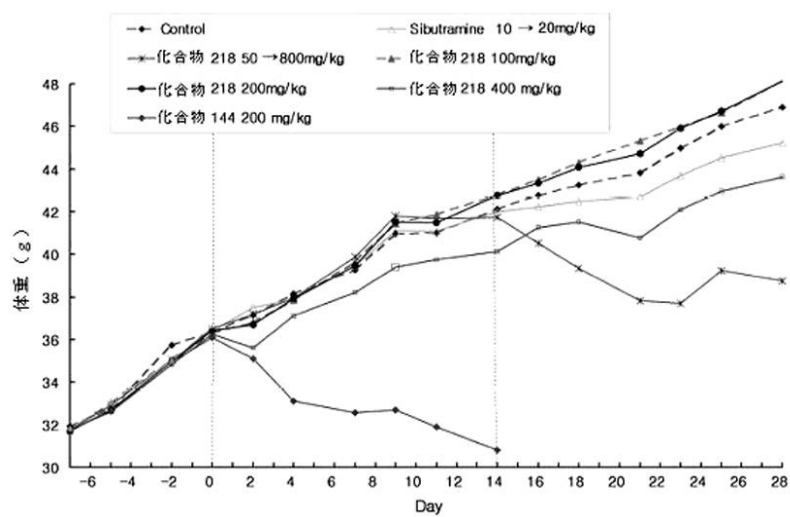
【図 8 a】



【図 8 b】



【図 9】



【国際調査報告】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT		International application No. PCT/KR2005/004664
A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER		
<i>C07D 239/94(2006.01); A61K 31/517(2006.01); A61P 3/04(2006.01); A61P 3/10(2006.01)</i>		
According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC		
B. FIELDS SEARCHED		
Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) IPC8 as above		
Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched Korean patents and applications for inventions since 1975		
Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used) STN(Registry), eKIPASS [quinazoline AND (obesity OR diabetes)]		
C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	WO 2004/087680 A1 (TAISHO PHARMACEUTICAL CO., LTD.) 14 Oct. 2004 See the formula (I) and abstract.	1 - 7
A	WO 00/10981 A1 (HUGHES INSTITUTE) 2 Mar. 2000 See the formula I and abstract.	1 - 7
A	WO 00/12497 A2 (SCIOS INC.) 9 Mar. 2000 See the whole document.	1 - 7
A	WO 98/13354 A1 (ZENECA LIMITED) 2 Apr. 1998 See the whole document.	1 - 7
☐ Further documents are listed in the continuation of Box C. ☒ See patent family annex.		
* Special categories of cited documents: "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance "E" earlier application or patent but published on or after the international filing date "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of citation or other special reason (as specified) "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed "T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention "X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone "Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art "&" document member of the same patent family		
Date of the actual completion of the international search 17 MARCH 2006 (17.03.2006)		Date of mailing of the international search report 17 MARCH 2006 (17.03.2006)
Name and mailing address of the ISA/KR  Korean Intellectual Property Office 920 Dunsan-dong, Seo-gu, Daejeon 302-701, Republic of Korea Facsimile No. 82-42-472-7140		Authorized officer LEE, Mi Jeong Telephone No. 82-42-481-5601 

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No.

PCT/KR2005/004664

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 2004/087680 A1	14.10.2004	EP 1611109 A1	04.01.2006
WO 00/10981 A1	02.03.2000	US 20030149045 A1	07.08.2003
		JP 2002523403 T2	30.07.2002
		EP 1510212 A1	02.03.2005
		CA 2342503 AA	02.03.2000
WO 00/12497 A2	09.03.2000	US 20050220784 A1	06.10.2005
		JP 2002523502 T2	30.07.2002
		EP 1107959 A2	20.06.2001
		CN 1333757 A	30.01.2002
		CA 2342250 AA	09.03.2000
WO 98/13354 A1	02.04.1998	US 20050239777 A1	27.10.2005
		JP 2004002406 A2	08.01.2004
		EP 0929530 A1	21.07.1999
		CN 1231662 A	13.10.1999
		CA 2263319 AA	02.04.1998

フロントページの続き

(51)Int.Cl.	F I	テーマコード (参考)
C 0 7 D 405/12 (2006.01)	C 0 7 D 405/12	
C 0 7 D 401/04 (2006.01)	C 0 7 D 401/04	
A 6 1 P 3/10 (2006.01)	A 6 1 P 3/10	
A 6 1 P 3/04 (2006.01)	A 6 1 P 3/04	
A 6 1 P 43/00 (2006.01)	A 6 1 P 43/00	1 1 1

(81)指定国 AP(BW,GH,GM,KE,LS,MW,MZ,NA,SD,SL,SZ,TZ,UG,ZM,ZW),EA(AM,AZ,BY,KG,KZ,MD,RU,TJ,TM),EP(AT,BE,BG,CH,CY,CZ,DE,DK,EE,ES,FI,FR,GB,GR,HU,IE,IS,IT,LT,LU,LV,MC,NL,PL,PT,RO,SE,SI,SK,TR),OA(BF,BJ,CF,CG,CI,CM,GA,GN,GQ,GW,ML,MR,NE,SN,TD,TG),AE,AG,AL,AM,AT,AU,AZ,BA,BB,BG,BR,BW,BY,BZ,CA,CH,CN,CO,CR,CU,CZ,DE,DK,DM,DZ,EC,EE,EG,ES,FI,GB,GD,GE,GH,GM,HR,HU,ID,IL,IN,IS,JP,KE,KG,KM,KN,KP,KZ,LC,LK,LR,LS,LT,LU,LV,LY,MA,MD,MG,MK,MN,MW,MX,MZ,NA,NG,NI,NO,NZ,OM,PG,PH,PL,PT,RO,RU,SC,SD,SE,SG,SK,SL,SM,SY,TJ,TM,TN,TR,TT,TZ,UA,UG,US,UZ,VC,VN,YU,ZA,ZM,ZW

(71)出願人 507222251
 リードゼネクス インコーポレイテッド
 LEADGENEX INC.
 大韓民国 306-230 デジョン テドック シニルトン 1687-2 ダサングァン 102
 102 Dasangwan, 1687-2 Sinil-dong, Daedeok-gu,
 Daejeon 306-230 Korea

(71)出願人 507222343
 キョンヒ産学協力団
 INDUSTRY ACADEMIC COOPERATION FOUNDATION OF
 KYUNGHEE UNIVERSITY
 大韓民国 ギョンギド ヨンインシ ギフンウップ ソチョンリ 1
 1 Seocheon-li Giheung-eup, Yongin-si, Gyeonggi-do Korea

(74)代理人 100089196
 弁理士 梶 良之

(74)代理人 100104226
 弁理士 須原 誠

(72)発明者 イ ナンギユ
 大韓民国 ギョンギド スウォンシ チャンアング チョンチョンドン 333 ジュゴン エーピーティー 123-108

(72)発明者 イ ジュンウオン
 大韓民国 ギョンギド クンボシ クワンジョンドン セジョン エーピーティー 638-1404

(72)発明者 イ ソックホ
 大韓民国 ギョンギド スウォンシ ヨントング ヨントン 1ードン チョンミョン メウルズゴン エーピーティー 404-904

(72)発明者 イン グアンジ
 大韓民国 ギョンギド アンサンシ サドン 1343 ヒュンダイ エーピーティー 406-1202

(72)発明者 ハン ヘヨン
 大韓民国 ソウル クワナック ボンチョン 1ードン 661-25204

(72)発明者 キム テゴン
 大韓民国 ギョンギド スウォンシ チャンアング ジョンザドン リサーチ インスティテュー

ト オブ エスケー ケミカルズ カンパニー リミテッド

- (72)発明者 キム ヨンヒョック
大韓民国 ギョンギド スウォンシ チャンアング ユルジョンドン 433-120 104
- (72)発明者 グアック ウィゾン
大韓民国 ソウル ソチョグ バンポ 4ドン ハンシン ソレ エーピーティー 3-803
- (72)発明者 キム サンウン
大韓民国 デジョン ユソング チョンミンドン エキスポ エーピーティー 401-510
- (72)発明者 ハ ブホン
大韓民国 ソウル ヨンサング トンブ イチョンドン ガンチョン エーピーティー 105-502
- (72)発明者 キム オンギョム
大韓民国 デジョン ユソング チョンミンドン チョング ナレ エーピーティー 104-1101
- (72)発明者 イ ジョンギユウ
大韓民国 デジョン ユソング ソンガンドン ソンガン チョンソル エーピーティー 308-1102
- (72)発明者 ユ チュンヨル
大韓民国 デジョン ユソング ノウンドン 520-1 ヨルメ エーピーティー 811-1702
- (72)発明者 イ デヨン
大韓民国 デグ スソング メホドン メホ チョング ハイツ 101-1201
- Fターム(参考) 4C063 AA01 BB01 BB09 CC31 CC81 DD03 DD10 DD12 DD31 EE01
4C086 AA01 AA02 AA03 BC46 BC50 BC73 GA02 GA07 GA08 GA12
MA01 MA04 MA17 MA28 MA41 MA52 MA63 MA66 NA14 ZA70
ZC19 ZC35