

【公報種別】特許法第 17 条の 2 の規定による補正の掲載

【部門区分】第 3 部門第 2 区分

【発行日】平成20年10月16日 (2008.10.16)

【公表番号】特表2008-515959(P2008-515959A)

【公表日】平成20年5月15日 (2008.5.15)

【年通号数】公開・登録公報2008-019

【出願番号】特願2007-536244(P2007-536244)

【国際特許分類】

C 0 7 D 239/88 (2006.01)

A 6 1 K 31/517 (2006.01)

C 0 7 D 403/12 (2006.01)

C 0 7 D 405/12 (2006.01)

C 0 7 D 413/12 (2006.01)

C 0 7 D 417/12 (2006.01)

C 0 7 D 401/12 (2006.01)

C 0 7 D 471/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

C 0 7 D 491/048 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 17/06 (2006.01)

A 6 1 P 35/02 (2006.01)

A 6 1 P 5/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 19/04 (2006.01)

A 6 1 P 13/12 (2006.01)

A 6 1 P 1/16 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

A 6 1 P 13/08 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 19/02 (2006.01)

A 6 1 P 1/04 (2006.01)

A 6 1 P 17/04 (2006.01)

A 6 1 P 11/06 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 37/08 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

A 6 1 P 27/02 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 239/88 C S P

A 6 1 K 31/517

C 0 7 D 403/12

C 0 7 D 405/12

C 0 7 D 413/12

C 0 7 D 417/12

C 0 7 D 401/12

C 0 7 D 471/04 1 0 4 Z

C 0 7 D 471/04 1 1 3

A 6 1 K 31/5377
 C 0 7 D 491/048
 A 6 1 P 9/00
 A 6 1 P 35/00
 A 6 1 P 43/00 1 0 5
 A 6 1 P 17/06
 A 6 1 P 43/00 1 1 1
 A 6 1 P 35/02
 A 6 1 P 5/00
 A 6 1 P 9/10
 A 6 1 P 9/10 1 0 1
 A 6 1 P 19/04
 A 6 1 P 13/12
 A 6 1 P 1/16
 A 6 1 P 11/00
 A 6 1 P 13/08
 A 6 1 P 29/00
 A 6 1 P 29/00 1 0 1
 A 6 1 P 19/02
 A 6 1 P 1/04
 A 6 1 P 17/04
 A 6 1 P 11/06
 A 6 1 P 25/28
 A 6 1 P 37/08
 A 6 1 P 3/10
 A 6 1 P 27/02

【手続補正書】

【提出日】平成20年8月26日(2008.8.26)

【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

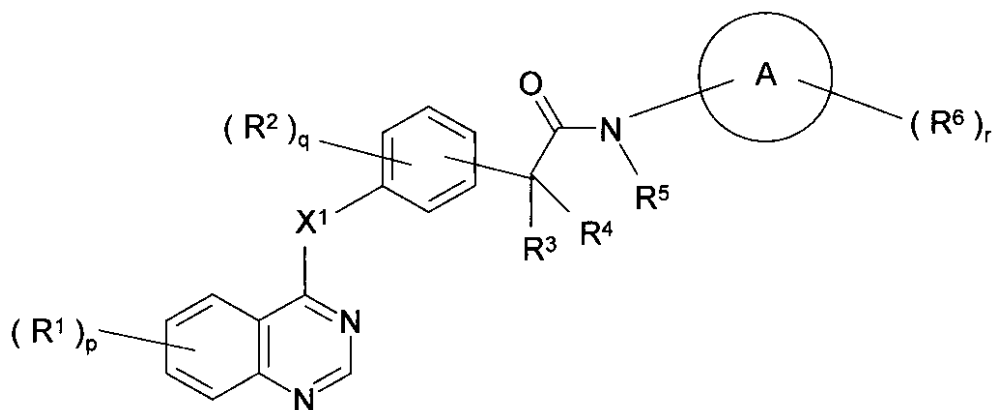
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式I：

【化1】



I

[式中、 X^1 はOであり；]

p は 0、1、2 または 3 であり；

R¹ 基はそれぞれ、同一または異なっているいてもよく、ハロゲン、トリフルオロメチル、シアノ、ヒドロキシ、メルカプト、アミノ、(1-8C)アルキル、(2-8C)アルケニル、(2-8C)アルキニル、(1-6C)アルコキシ、(2-6C)アルケニルオキシ、(2-6C)アルキニルオキシ、(1-6C)アルキルチオ、(1-6C)アルキルスルフィニル、(1-6C)アルキルスルホニル、(1-6C)アルキルアミノおよびジ-[(1-6C)アルキル]アミノ、または式：

Q¹-X²-

の基 {ここでX²は、直接結合であるか、またはO、S、SO、SO₂、N(R⁸)、CO、CON(R⁸)、N(R⁸)CO、OC(R⁸)₂およびN(R⁸)C(R⁸)₂から選択され、ここでR⁸はそれぞれ水素または(1-8C)アルキルであり、Q¹はアリール、アリール-(1-6C)アルキル、(3-8C)シクロアルキル、(3-8C)シクロアルキル-(1-6C)アルキル、(3-8C)シクロアルケニル、(3-8C)シクロアルケニル-(1-6C)アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリール-(1-6C)アルキル、ヘテロサイクリルまたはヘテロサイクリル-(1-6C)アルキルである}から選択され、

ここでR¹置換基内の任意のアリール、(3-8C)シクロアルキル、(3-8C)シクロアルケニル、ヘテロアリールまたはヘテロサイクリル基は、場合によりハロゲン、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、カルバモイル、ウレイド、(1-8C)アルキル、(2-8C)アルケニル、(2-8C)アルキニル、(1-6C)アルコキシ、(2-6C)アルケニルオキシ、(2-6C)アルキニルオキシ、(1-6C)アルキルチオ、(1-6C)アルキルスルフィニル、(1-6C)アルキルスルホニル、(1-6C)アルキルアミノ、ジ-[(1-6C)アルキル]アミノ、(1-6C)アルコキシカルボニル、(2-6C)アルカノイル、(2-6C)アルカノイルオキシ、N-(1-6C)アルキルカルバモイル、N,N-ジ-[(1-6C)アルキル]カルバモイル、(2-6C)アルカノイルアミノ、N-(1-6C)アルキル-(2-6C)アルカノイルアミノ、N-(1-6C)アルキルウレイド、N'-(1-6C)アルキルウレイド、N',N'-ジ-[(1-6C)アルキル]ウレイド、N,N'-ジ-[(1-6C)アルキル]ウレイド、N,N',N'-トリ-[(1-6C)アルキル]ウレイド、N-(1-6C)アルキルスルファモイル、N,N-ジ-[(1-6C)アルキル]スルファモイル、(1-6C)アルカンスルホニルアミノおよびN-(1-6C)アルキル-(1-6C)アルカンスルホニルアミノ、または式：

-X³-R⁹

の基 {ここで、X³は、直接結合であるか、またはOおよびN(R¹⁰)から選択され、ここでR¹⁰は、水素または(1-8C)アルキルであり、R⁹はハロゲン-(1-6C)アルキル、ヒドロキシ-(1-6C)アルキル、メルカプト-(1-6C)アルキル、(1-6C)アルコキシ-(1-6C)アルキル、(1-6C)アルキルチオ-(1-6C)アルキル、(1-6C)アルキルスルフィニル-(1-6C)アルキル、(1-6C)アルキルスルホニル-(1-6C)アルキル、シアノ-(1-6C)アルキル、アミノ-(1-6C)アルキル、(1-6C)アルキルアミノ-(1-6C)アルキル、ジ-[(1-6C)アルキル]アミノ-(1-6C)アルキル、(2-6C)アルカノイルアミノ-(1-6C)アルキル、N-(1-6C)アルキル-(2-6C)アルカノイルアミノ-(1-6C)アルキル、(1-6C)アルコキシカルボニルアミノ-(1-6C)アルキル、ウレイド-(1-6C)アルキル、N-(1-6C)アルキルウレイド-(1-6C)アルキル、N'-(1-6C)アルキルウレイド-(1-6C)アルキル、N',N'-ジ-[(1-6C)アルキル]ウレイド-(1-6C)アルキル、N,N'-ジ-[(1-6C)アルキル]ウレイド-(1-6C)アルキルまたはN,N',N'-トリ-[(1-6C)アルキル]ウレイド-(1-6C)アルキルである}、または式：

-X⁴-Q²

の基 {ここでX⁴は直接結合であるか、またはO、CO及びN(R¹¹)から選択され、ここでR¹¹は、水素または(1-8C)アルキルであり、Q²は、ハロゲン、ヒドロキシ、(1-8C)アルキル及び(1-6C)アルコキシから選択される、同一または異なっているいてもよい1または2個の置換基を場合により保持するアリール、アリール-(1-6C)アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリール-(1-6C)アルキル、ヘテロサイクリルまたはヘテロサイクリル-(1-6C)アルキルである}から選択される、同一または異なっているいてもよい、1、2または3個の置換基を場合により保持する、

ここで、R¹上の置換基内の任意のアリール、ヘテロアリールまたはヘテロサイクリル基は、場合により(1-3C)アルキレンジオキシ基を保持する、

ここでR¹置換基内の任意のヘテロサイクリル基は、場合により1または2個のオキソマ

たはチオキソ置換基を保持する、

ここで R^1 置換基内の任意の CH 、 CH_2 または CH_3 基は、そのそれぞれの CH 、 CH_2 または CH_3 基上に場合により、一つ以上のハロゲンまたは(1-8C)アルキル置換基及び/またはヒドロキシ、メルカプト、アミノ、シアノ、カルボキシ、カルバモイル、ウレイド、(1-6C)アルコキシ、(1-6C)アルキルチオ、(1-6C)アルキルスルフィニル、(1-6C)アルキルスルホニル、(1-6C)アルキルアミノ、ジ-[(1-6C)アルキル]アミノ、(1-6C)アルコキシカルボニル、N-(1-6C)アルキルカルバモイル、N,N-ジ-[(1-6C)アルキル]カルバモイル、(2-6C)アルカノイル、(2-6C)アルカノイルオキシ、(2-6C)アルカノイルアミノ、N-(1-6C)アルキル-(2-6C)アルカノイルアミノ、N-(1-6C)アルキルウレイド、N'-(1-6C)アルキルウレイド、N',N'-ジ-[(1-6C)アルキル]ウレイド、N,N'-ジ-[(1-6C)アルキル]ウレイド、N,N',N'-トリ-[(1-6C)アルキル]ウレイド、N-(1-6C)アルキルスルファモイル、N,N-ジ-[(1-6C)アルキル]スルファモイル、(1-6C)アルカンスルホニルアミノ及びN-(1-6C)アルキル-(1-6C)アルカンスルホニルアミノから選択される置換基を保持する、

ここで R^1 置換基内の任意の(2-6C)アルキレン鎖の隣接する炭素原子は、場合により、O、S、SO、 SO_2 、 $N(R^{12})$ 、CO、 $CH(OR^{12})$ 、 $CON(R^{12})$ 、 $N(R^{12})CO$ 、 $N(R^{12})CON(R^{12})$ 、 $SO_2N(R^{12})$ 、 $N(R^{12})SO_2$ 、 $CH=CH$ 及びC C (式中、 R^{12} は水素または(1-8C)アルキルであるか、挿入された基が $N(R^{12})$ であるとき、 R^{12} は(2-6C)アルカノイルであってもよい)から選択される基を鎖内に挿入することによって隔てられている；

qは0、1または2であり；

R^2 基はそれぞれ、同一または異なってもよく、ハロゲン、トリフルオロメチル、シアノ、ヒドロキシ、アミノ、(1-8C)アルキル、(2-8C)アルケニル、(2-8C)アルキニル、(1-6C)アルコキシ、(1-6C)アルキルアミノ及びジ-[(1-6C)アルキル]アミノから選択され；
 $-C(R^3)(R^4)-CON(R^5)$ 基は(X^1 基に対して)4-位に配置され；

R^3 は水素、メチルまたはエチルであり；

R^4 は水素、メチルまたはエチルであり；

R^5 は、水素、メチルまたはエチルである；

環Aは、6-員の単環式若しくは10-員の二環式アリール環、または酸素、窒素及び硫黄から選択される最大3個の環ヘテロ原子をもつ5-若しくは6-員の単環式若しくは9-若しくは10-員の二環式ヘテロアリール環であり；

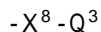
rは0、1、2または3であり；及び

R^6 基はそれぞれ、同一または異なってもよく、ハロゲン、トリフルオロメチル、シアノ、ヒドロキシ、メルカプト、アミノ、カルボキシ、カルバモイル、スルファモイル、ウレイド、(1-8C)アルキル、(2-8C)アルケニル、(2-8C)アルキニル、(1-6C)アルコキシ、(1-6C)アルキルチオ、(1-6C)アルキルスルフィニル、(1-6C)アルキルスルホニル、(1-6C)アルキルアミノ、ジ-[(1-6C)アルキル]アミノ、(1-6C)アルコキシカルボニル、(2-6C)アルカノイル、(2-6C)アルカノイルオキシ、N-(1-6C)アルキルカルバモイル、N,N-ジ-[(1-6C)アルキル]カルバモイル、(2-6C)アルカノイルアミノ、N-(1-6C)アルキル-(2-6C)アルカノイルアミノ、N'-(1-6C)アルキルウレイド、N',N'-ジ-[(1-6C)アルキル]ウレイド、N-(1-6C)アルキルスルファモイル、N,N-ジ-[(1-6C)アルキル]スルファモイル、(1-6C)アルカンスルホニルアミノ及びN-(1-6C)アルキル-(1-6C)アルカンスルホニルアミノ、または式：

$-X^7-R^{17}$

の基(式中、 X^7 は、直接結合であるか、またはO及び $N(R^{18})$ から選択され、ここで R^{18} は水素または(1-8C)アルキルであり、及び R^{17} はハロゲン-(1-6C)アルキル、ヒドロキシ-(1-6C)アルキル、メルカプト-(1-6C)アルキル、(1-6C)アルコキシ-(1-6C)アルキル、(1-6C)アルキルチオ-(1-6C)アルキル、(1-6C)アルキルスルフィニル-(1-6C)アルキル、(1-6C)アルキルスルホニル-(1-6C)アルキル、シアノ-(1-6C)アルキル、アミノ-(1-6C)アルキル、(1-6C)アルキルアミノ-(1-6C)アルキル、ジ-[(1-6C)アルキル]アミノ-(1-6C)アルキル、(2-6C)アルカノイルアミノ-(1-6C)アルキル、N-(1-6C)アルキル-(2-6C)アルカノイルアミノ-(1-6C)アルキル、カルボキシ-(1-6C)アルキル、(1-6C)アルコキシカルボニル-(1-6C)アル

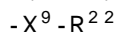
キル、カルバモイル-(1-6C)アルキル、N-(1-6C)アルキルカルバモイル-(1-6C)アルキル、N,N-ジ-[(1-6C)アルキル]カルバモイル-(1-6C)アルキル、スルファモイル-(1-6C)アルキル、N-(1-6C)アルキルスルファモイル-(1-6C)アルキル、N,N-ジ-[(1-6C)アルキル]スルファモイル-(1-6C)アルキル、ウレイド-(1-6C)アルキル、N-(1-6C)アルキルウレイド-(1-6C)アルキル、N'-[(1-6C)アルキル]ウレイド-(1-6C)アルキル、N',N'-ジ-[(1-6C)アルキル]ウレイド-(1-6C)アルキル、N,N'-ジ-[(1-6C)アルキル]ウレイド-(1-6C)アルキル、N,N'-トリ-[(1-6C)アルキル]ウレイド-(1-6C)アルキル、(1-6C)アルカンスルホニルアミノ-(1-6C)アルキルまたはN-(1-6C)アルキル-(1-6C)アルカンスルホニルアミノ-(1-6C)アルキルである }、または式：



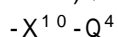
の基 { 式中、 X^8 は直接結合であるか、またはO、S、SO、 SO_2 、 $N(R^{19})$ 、CO、 $CH(OR^{19})$ 、CON(R^{19})、 $N(R^{19})CO$ 、 $N(R^{19})CON(R^{19})$ 、 $SO_2N(R^{19})$ 、 $N(R^{19})SO_2$ 、 $C(R^{19})_2O$ 、 $C(R^{19})_2S$ 及び $C(R^{19})_2N(R^{19})$ から選択され、ここで R^{19} はそれぞれ水素または(1-8C)アルキルであり、及び Q^3 はアリール、アリール-(1-6C)アルキル、(3-8C)シクロアルキル、(3-8C)シクロアルケニル、(1-6C)アルキル、(3-8C)シクロアルケニル、(3-8C)シクロアルケニル-(1-6C)アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリール-(1-6C)アルキル、ヘテロサイクリルまたはヘテロサイクリル-(1-6C)アルキルから選択される } から選択されるか、

あるいは2個の R^6 基は一緒になって、環A上の隣接する位置に橋架する、 $OC(R^{20})_2O$ 、 $OC(R^{20})_2C(R^{20})_2O$ 、 $OC(R^{20})_2C(R^{20})_2$ 、 $C(R^{20})_2OC(R^{20})_2$ 、 $C(R^{20})_2C(R^{20})_2C(R^{20})_2$ 、 $C(R^{20})_2C(R^{20})_2C(R^{20})_2$ 、 $OC(R^{20})_2N(R^{21})$ 、 $N(R^{21})C(R^{20})_2N(R^{21})$ 、 $N(R^{21})C(R^{20})_2C(R^{20})_2$ 、 $N(R^{21})C(R^{20})_2C(R^{20})_2C(R^{20})_2$ 、 $OC(R^{20})_2C(R^{20})_2N(R^{21})$ 、 $C(R^{20})_2N(R^{21})C(R^{20})_2$ 、CO.N(R^{20}) $C(R^{20})_2$ 、 $N(R^{20})CO.C(R^{20})_2$ 、 $N(R^{21})C(R^{20})_2CO$ 、CO.N(R^{20})CO、 $N(R^{21})N(R^{20})CO$ 、 $N(R^{20})CO.N(R^{20})$ 、O.CO.N(R^{20})、O.CO.C(R^{20}) $_2$ 及びCO. $OC(R^{20})_2$ (ここでそれぞれの R^{20} は水素、(1-8C)アルキル、(2-8C)アルケニルまたは(2-8C)アルキニルであり、ここで R^{21} は水素、(1-8C)アルキル、(2-8C)アルケニル、(2-8C)アルキニルまたは(2-6C)アルカノイルである) から選択される二価の基を形成する、

ここで R^6 基内の任意のアリール、(3-8C)シクロアルキル、(3-8C)シクロアルケニル、ヘテロアリールまたはヘテロサイクリル基は、場合により、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、カルバモイル、ウレイド、(1-8C)アルキル、(2-8C)アルケニル、(2-8C)アルキニル、(1-6C)アルコキシ、(2-6C)アルケニルオキシ、(2-6C)アルキニルオキシ、(1-6C)アルキルチオ、(1-6C)アルキルスルフィニル、(1-6C)アルキルスルホニル、(1-6C)アルキルアミノ、ジ-[(1-6C)アルキル]アミノ、(1-6C)アルコキシカルボニル、(2-6C)アルカノイル、(2-6C)アルカノイルオキシ、N-(1-6C)アルキルカルバモイル、N,N-ジ-[(1-6C)アルキル]カルバモイル、(2-6C)アルカノイルアミノ、N-(1-6C)アルキル-(2-6C)アルカノイルアミノ、N'-[(1-6C)アルキル]ウレイド、N',N'-ジ-[(1-6C)アルキル]ウレイド、N-(1-6C)アルキルウレイド、N,N'-ジ-[(1-6C)アルキル]ウレイド、N,N',N'-トリ-[(1-6C)アルキル]ウレイド、N-(1-6C)アルキルスルファモイル、N,N-ジ-[(1-6C)アルキル]スルファモイル、(1-6C)アルカンスルホニルアミノ及びN-(1-6C)アルキル-(1-6C)アルカンスルホニルアミノ、または式：



の基 { 式中、 X^9 は直接結合であるか、またはO及び $N(R^{23})$ から選択され、ここで R^{23} は水素または(1-8C)アルキルであり、 R^{22} はハロゲノ-(1-6C)アルキル、ヒドロキシ-(1-6C)アルキル、メルカプト-(1-6C)アルキル、(1-6C)アルコキシ-(1-6C)アルキル、(1-6C)アルキルチオ-(1-6C)アルキル、(1-6C)アルキルスルフィニル-(1-6C)アルキル、(1-6C)アルキルスルホニル-(1-6C)アルキル、シアノ-(1-6C)アルキル、アミノ-(1-6C)アルキル、(1-6C)アルキルアミノ-(1-6C)アルキル、ジ-[(1-6C)アルキル]アミノ-(1-6C)アルキル、(2-6C)アルカノイルアミノ-(1-6C)アルキルまたはN-(1-6C)アルキル-(2-6C)アルカノイルアミノ-(1-6C)アルキルである }、または式：



の基 { 式中、 X^{10} は、直接結合であるか、またはO、CO及び $N(R^{24})$ から選択され、ここで R^{24}

⁴は水素または(1-8C)アルキルであり、Q⁴は、ハロゲン、ヒドロキシ、(1-8C)アルキル及び(1-6C)アルコキシから選択される、同一または異なってもよい、1または2個の置換基を場合により保持するアリール、アリール-(1-6C)アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリール-(1-6C)アルキル、ヘテロサイクリルまたはヘテロサイクリル-(1-6C)アルキルである}から選択される、同一または異なってもよい、1、2または3個の置換基を保持する、

ここでR⁶基内の任意のアリール、ヘテロアリールまたはヘテロサイクリル基は、場合により(1-3C)アルキレンジオキシ基を保持する、

ここでR⁶基内の任意のヘテロサイクリル基は、場合により1または2個のオキソまたはチオキソ置換基を保持する、

ここでR⁶基内の任意のCH、CH₂またはCH₃基は、場合によりそれぞれのCH、CH₂またはCH₃基上に一つ以上のハロゲンまたは(1-8C)アルキル置換基及び/またはヒドロキシ、メルカプト、アミノ、シアノ、カルボキシ、カルバモイル、ウレイド、(2-8C)アルケニル、(2-8C)アルキニル、(1-6C)アルコキシ、(1-6C)アルキルチオ、(1-6C)アルキルスルフィニル、(1-6C)アルキルスルホニル、(1-6C)アルキルアミノ、ジ-[(1-6C)アルキル]アミノ、(1-6C)アルコキシカルボニル、N-(1-6C)アルキルカルバモイル、N,N-ジ-[(1-6C)アルキル]カルバモイル、(2-6C)アルカノイル、(2-6C)アルカノイルオキシ、(2-6C)アルカノイルアミノ、N-(1-6C)アルキル-(2-6C)アルカノイルアミノ、N'-[(1-6C)アルキル]ウレイド、N',N'-ジ-[(1-6C)アルキル]ウレイド、N-(1-6C)アルキルウレイド、N,N'-ジ-[(1-6C)アルキル]ウレイド、N,N',N'-トリ-[(1-6C)アルキル]ウレイド、N-(1-6C)アルキルスルファモイル、N-(1-6C)アルキルスルファモイル、N,N-ジ-[(1-6C)アルキル]スルファモイル、(1-6C)アルカンスルホニルアミノ及びN-(1-6C)アルキル-(1-6C)アルカンスルホニルアミノから選択される置換基を保持する、

及びここで、R⁶基内の任意の(2-6C)アルキレン鎖の隣接炭素原子は、O、S、SO、SO₂、N(R²⁵)、N(R²⁵)CO、CON(R²⁵)、N(R²⁵)CON(R²⁵)、CO、CH(OR²⁵)、N(R²⁵)SO₂、SO₂N(R²⁵)、C₂H₃及びC₂C(式中、R²⁵は水素または(1-8C)アルキルであるか、挿入された基がN(R²⁵)であるとき、R²⁵は(2-6C)アルカノイルであってもよい)から選択される基が鎖の中に挿入されることによって場合により隔てられている；

そして、ここで、R¹若しくはR⁶基内のQ基(Q¹~Q⁴)について、Q基がアリールであるとき、R¹若しくはR⁶基内のQ基(Q¹~Q⁴)の任意の一つは、または任意のQ基内のアリール基は、フェニルであり；Q基がヘテロアリールであるとき、R¹若しくはR⁶基内のQ基(Q¹~Q⁴)の任意の一つは、または任意のQ基内のヘテロアリール基は、芳香族5-若しくは6-員の単環式環または、酸素、窒素及び硫黄から選択される5個以下のヘテロ原子をもつ9-若しくは10-員の二環式環であり；Q基がヘテロサイクリルであるとき、R¹若しくはR⁶基内のQ基(Q¹~Q⁴)内の任意の一つは、または任意のQ基内のヘテロサイクリル基は、酸素、窒素及び硫黄から選択される5個以下のヘテロ原子をもつ非-芳香族飽和または部分飽和3~10-員の単環式または二環式環である]のキナゾリン誘導体またはその医薬的に許容可能な塩、溶媒和物若しくはプロドラッグ。

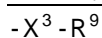
【請求項2】

X¹がOであり；

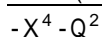
pが1、2または3であり；そして、R¹基はそれぞれ、同一または異なってもよく、ハロゲン、トリフルオロメチル、シアノ、ヒドロキシ、アミノ、(1-8C)アルキル、(2-8C)アルケニル、(2-8C)アルキニル、(1-6C)アルコキシ、(2-6C)アルケニルオキシ、(2-6C)アルキニルオキシ、(1-6C)アルキルアミノ及びジ-[(1-6C)アルキル]アミノ、または式：
Q¹-X²-

の基{式中、X²は直接結合であるか、またはO、N(R⁸)、CON(R⁸)、N(R⁸)CO及びOC(R⁸)₂から選択され、ここでR⁸は水素または(1-8C)アルキルであり、Q¹はアリール、アリール-(1-6C)アルキル、(3-8C)シクロアルキル-(1-6C)アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリール-(1-6C)アルキル、ヘテロサイクリルまたはヘテロサイクリル-(1-6C)アルキルである}から選択され、

R^1 上の置換基内の任意のアリール、(3-8C)シクロアルキル、ヘテロアリールまたはヘテロサイクリル基は、場合により、ハロゲン、トリフルオロメチル、ヒドロキシ、アミノ、カルバモイル、(1-8C)アルキル、(2-8C)アルケニル、(2-8C)アルキニル、(1-6C)アルコキシ、(1-6C)アルキルスルホニル、(1-6C)アルキルアミノ、ジ-[(1-6C)アルキル]アミノ、(2-6C)アルカノイル、N-(1-6C)アルキルカルバモイル、N,N-ジ-[(1-6C)アルキル]カルバモイル、(2-6C)アルカノイルアミノ及びN-(1-6C)アルキル-(2-6C)アルカノイルアミノ、または式：



の基 { 式中、 X^3 は直接結合であるか、O及びN(R^{10})から選択され、ここで R^{10} は水素または(1-8C)アルキルであり、 R^9 はハロゲン-(1-6C)アルキル、ヒドロキシ-(1-6C)アルキル、(1-6C)アルコキシ-(1-6C)アルキル、(1-6C)アルキルスルホニル-(1-6C)アルキル、シアノ-(1-6C)アルキル、アミノ-(1-6C)アルキル、(1-6C)アルキルアミノ-(1-6C)アルキル、ジ-[(1-6C)アルキル]アミノ-(1-6C)アルキル、(2-6C)アルカノイルアミノ-(1-6C)アルキルまたはN-(1-6C)アルキル-(2-6C)アルカノイルアミノ-(1-6C)アルキルである }、または式：



の基 { 式中、 X^4 は直接結合であるか、O、CO及びN(R^{11})から選択され、ここで R^{11} は水素または(1-8C)アルキルであり、 Q^2 は、ハロゲン、(1-8C)アルキル及び(1-6C)アルコキシから選択される、同一または異なっているもよい、1または2個の置換基を場合により保持するヘテロサイクリルまたはヘテロサイクリル-(1-6C)アルキルである } から選択される、同一または異なっているもよい、1、2または3個の置換基を場合により保持し、

ここで R^1 上の置換基内の任意のヘテロサイクリル基は、場合により(1-3C)アルキレンジオキシ基を保持し、

ここで R^1 上の置換基内の任意のヘテロサイクリル基は、場合により1または2個のオキソ置換基を保持し、

ここで R^1 置換基内の任意のCH、CH₂またはCH₃基は、それぞれのCH、CH₂またはCH₃基に、一つ以上のハロゲンまたは(1-8C)アルキル基及び/または、ヒドロキシ、アミノ、シアノ、カルボキシ、カルバモイル、ウレイド、(1-6C)アルコキシ、(1-6C)アルキルチオ、(1-6C)アルキルスルフィニル、(1-6C)アルキルスルホニル、(1-6C)アルキルアミノ、ジ-[(1-6C)アルキル]アミノ、(1-6C)アルコキシカルボニル、N-(1-6C)アルキルカルバモイル、N,N-ジ-[(1-6C)アルキル]カルバモイル、(2-6C)アルカノイル、(2-6C)アルカノイルアミノ、N-(1-6C)アルキル-(2-6C)アルカノイルアミノ、N-(1-6C)アルキルスルファモイル、N,N-ジ-[(1-6C)アルキル]スルファモイル、(1-6C)アルカンスルホニルアミノ及びN-(1-6C)アルキル-(1-6C)アルカンスルホニルアミノから選択される置換基を場合により保持する、

ここで R^1 置換基内の任意の(2-6C)アルキレン鎖の隣接炭素原子は、場合により、O、N(R^{12})、CON(R^{12})、N(R^{12})CO、CH=CH及びC-C (式中、 R^{12} は水素または(1-8C)アルキルであるか、または挿入された基がN(R^{12})であるとき、 R^{12} は、(2-6C)アルカノイルであってもよい) から選択される基を鎖内に挿入することによって、隔てられている；

qは0、1または2であり；

R^2 基はそれぞれ、同一または異なっているもよく、ハロゲン、トリフルオロメチル、シアノ、ヒドロキシ、アミノ、(1-8C)アルキル、(2-8C)アルケニル、(2-8C)アルキニル、(1-6C)アルコキシ、(1-6C)アルキルアミノ及びジ-[(1-6C)アルキル]アミノから選択され；

-C(R^3)(R^4)-CON(R^5)基が(X^1 基に対して)4-位に配置され；

R^3 は水素、メチルまたはエチルであり；

R^4 は水素、メチルまたはエチルであり；

R^5 は、水素、メチルまたはエチルであり；

環Aは、6-員の単環式若しくは10-員の二環式アリール環、または酸素、窒素及び硫黄から選択される最大3個の環ヘテロ原子をもつ5-若しくは6-員の単環式若しくは9-若しくは10-員の二環式ヘテロアリール環であり；

rは1、2または3であり、及び R^6 基はそれぞれ、同一または異なっているもよく、ハロゲン、トリフルオロメチル、シアノ、ヒドロキシ、アミノ、(1-8C)アルキル、(2-8C)ア

ルケニル、(2-8C)アルキニル、(1-6C)アルコキシ、(1-6C)アルキルアミノ、ジ-[(1-6C)アルキル]アミノ、(2-6C)アルカノイルアミノ及びN-(1-6C)アルキル-(2-6C)アルカノイルアミノから選択される；または、

r は 1、2 または 3 であり、且つ一つの R^6 基は、式：

$-X^7-R^{17}$

の基 { 式中、 X^7 は直接結合であるか、O 及び N(R^{18}) から選択され、ここで R^{18} は水素または (1-8C) アルキルであり、 R^{17} はヒドロキシ-(1-6C) アルキル、(1-6C) アルコキシ-(1-6C) アルキル、アミノ-(1-6C) アルキル、(1-6C) アルキルアミノ-(1-6C) アルキル、ジ-[(1-6C) アルキル]アミノ-(1-6C) アルキル、アリール、アリール-(1-6C) アルキル、(3-8C) シクロアルキル、(3-8C) シクロアルキル-(1-6C) アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリール-(1-6C) アルキル、ヘテロサイクリルまたはヘテロサイクリル-(1-6C) アルキルであり、但し、 X^7 が O または N(R^{18}) であるとき、 X^7 と、 R^{17} 基の任意のヘテロ原子との間に少なくとも 2 個の炭素原子がある } であり、

且つ、存在する他のいずれもの R^6 基は、ハロゲノ、トリフルオロメチル、シアノ、ヒドロキシ、アミノ、(1-8C) アルキル、(1-6C) アルコキシ、(1-6C) アルキルアミノ、ジ-[(1-6C) アルキル]アミノ、(2-6C) アルカノイルアミノ及び N-(1-6C) アルキル-(2-6C) アルカノイルアミノから選択される、

ここで R^6 基内の任意のアリール、(3-8C) シクロアルキル、ヘテロアリールまたはヘテロサイクリル基は、ハロゲノ、トリフルオロメチル、ヒドロキシ、アミノ、(1-8C) アルキル、(1-6C) アルコキシ、(1-6C) アルキルアミノ、ジ-[(1-6C) アルキル]アミノ、ヒドロキシ-(1-6C) アルキル、アミノ-(1-6C) アルキル、(1-6C) アルキルアミノ-(1-6C) アルキル及びジ-[(1-6C) アルキル]アミノ-(1-6C) アルキルから選択される、同一または異なっているいてもよい、1 または 2 個の置換基を場合により保持する、または、

二つの R^6 基は、一緒になって、 $OC(R^{20})_2O$ 、 $OC(R^{20})_2C(R^{20})_2$ 、 $C(R^{20})_2OC(R^{20})_2$ 、 $OC(R^{20})_2N(R^{21})$ 、 $N(R^{21})C(R^{20})_2N(R^{21})$ 、 $N(R^{21})C(R^{20})_2C(R^{20})_2$ 及び $C(R^{20})_2N(R^{21})C(R^{20})_2$ (ここで R^{20} 及び R^{21} はそれぞれ水素、(1-8C) アルキル、(2-8C) アルケニルまたは (2-8C) アルキニルである) から選択される、環 A 上の隣接する環の位置を橋架けする二価の基を形成する；

及びここで、 Q^1 基がアリールであるとき、 R^1 基内の Q^1 基は、または Q^1 基内のアリール基は、フェニルであり； Q^1 基がヘテロアリールであるとき、 R^1 基内の Q^1 基は、または Q^1 基内のヘテロアリール基は、芳香族 5-若しくは 6-員の単環式環または、酸素、窒素及び硫黄から選択される 5 個以下のヘテロ原子をもつ 9-若しくは 10-員の二環式環であり； Q 基がヘテロサイクリルであるとき、 R^1 基内の Q 基 (Q^1 及び Q^2) 中の任意の一つ、または任意の Q 基内のヘテロサイクリル基は、酸素、窒素及び硫黄から選択される 5 個以下のヘテロ原子をもつ非-芳香族飽和または部分飽和 3 ~ 10-員の単環式または二環式環である、

請求項 1 に記載の式 I のキナゾリン誘導体、またはその医薬的に許容可能な塩、溶媒和物若しくはプロドラッグ。

【請求項 3】

R^1 置換基が、キナゾリン環の 5-、6-または 7-位にのみ配置できる、請求項 1 に記載の式 I のキナゾリン誘導体。

【請求項 4】

環 A が、6-員の単環式アリール環または酸素、窒素及び硫黄から選択される最大 3 個の環ヘテロ原子をもつ 5-若しくは 6-員の単環式ヘテロアリール環である、請求項 1 に記載の式 I のキナゾリン誘導体。

【請求項 5】

環 A がフェニル環である、請求項 1 に記載の式 I のキナゾリン誘導体。

【請求項 6】

環 A が最大 3 個の窒素ヘテロ原子をもつ 6-員の単環式ヘテロアリール環である、請求項 1 に記載の式 I のキナゾリン誘導体。

【請求項 7】

環Aが酸素、窒素及び硫黄から選択される最大3個のヘテロ原子をもつ5-員の単環式ヘテロアリール環である、請求項1に記載の式Iのキナゾリン誘導体。

【請求項8】

環Aが5-員環であり、且つ一つまたは二つの R^6 基が存在し、一つの R^6 基は($CON(R^5)$ 基に対して)3-位に配置される、請求項1に記載の式Iのキナゾリン誘導体。

【請求項9】

環Aがフリル、ピロリル、チエニル、オキサゾリル、イソキサゾリル、イミダゾリル、ピラゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル及びトリアゾリルから選択される5-員環であり、且つ一つまたは二つの R^6 基が存在し、一つの R^6 基は($CON(R^5)$ 基に対して)3-位に配置される、請求項1に記載の式Iのキナゾリン誘導体。

【請求項10】

環Aがフリル、ピロリル、チエニル、オキサゾリル、イソキサゾリル、イミダゾリル、ピラゾリル、及びチアゾリルから選択される5-員環であり、且つ一つまたは二つの R^6 基が存在し、一つの R^6 基は($CON(R^5)$ 基に対して)3-位に配置される請求項1に記載の式Iのキナゾリン誘導体。

【請求項11】

r が1、2または3であり、 R^6 基はそれぞれ、同一または異なっていてもよく、ハロゲン、トリフルオロメチル、シアノ、ヒドロキシ、アミノ、(1-8C)アルキル、(2-8C)アルケニル、(2-8C)アルキニル、(1-6C)アルコキシ、(1-6C)アルキルアミノ、ジ-[(1-6C)アルキル]アミノ、(2-6C)アルカノイルアミノ及びN-(1-6C)アルキル-(2-6C)アルカノイルアミノから選択される、請求項1に記載の式Iのキナゾリン誘導体。

【請求項12】

式中、 X^1 が0であり；

p は2であり、且つ前記第一の R^1 基は6-メトキシ基であり、第二の R^1 基は、7-位に配置され、メトキシ、エトキシ、2-メトキシエトキシ、3-メトキシプロポキシ、2-メチルスルホニルエトキシ、3-メチルスルホニルプロポキシ、2-(2-メトキシエトキシ)エトキシ、2-ピロリジン-1-イルエトキシ、3-ピロリジン-1-イルプロポキシ、2-[(3RS,4SR)-3,4-メチレンジオキシピロリジン-1-イル]エトキシ、3-[(3RS,4SR)-3,4-メチレンジオキシピロリジン-1-イル]プロポキシ、2-モルホリノエトキシ、3-モルホリノプロポキシ、2-(1,1-ジオキソテトラヒドロ-4H-1,4-チアジン-4-イル)エトキシ、3-(1,1-ジオキソテトラヒドロ-4H-1,4-チアジン-4-イル)プロポキシ、2-ピペリジノエトキシ、3-ピペリジノプロポキシ、2-ピペリジン-3-イルエトキシ、2-(N-メチルピペリジン-3-イル)エトキシ、3-ピペリジン-3-イルプロポキシ、3-(N-メチルピペリジン-3-イル)プロポキシ、2-ピペリジン-4-イルエトキシ、2-(N-メチルピペリジン-4-イル)エトキシ、3-ピペリジン-4-イルプロポキシ、3-(N-メチルピペリジン-4-イル)プロポキシ、2-(1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-1-イル)エトキシ、3-(1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-1-イル)プロポキシ、2-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)エトキシ、3-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)プロポキシ、2-ピペラジン-1-イルエトキシ、3-ピペラジン-1-イルプロポキシ、4-ピペラジン-1-イルブトキシ、2-(4-メチルピペラジン-1-イル)エトキシ、3-(4-メチルピペラジン-1-イル)プロポキシ、4-(4-メチルピペラジン-1-イル)ブトキシ、2-(4-アリルピペラジン-1-イル)エトキシ、3-(4-アリルピペラジン-1-イル)プロポキシ、2-(4-プロブ-2-イニルピペラジン-1-イル)エトキシ、3-(4-プロブ-2-イニルピペラジン-1-イル)プロポキシ、2-(4-メチルスルホニルピペラジン-1-イル)エトキシ、3-(4-メチルスルホニルピペラジン-1-イル)プロポキシ、2-(4-アセチルピペラジン-1-イル)エトキシ、3-(4-アセチルピペラジン-1-イル)プロポキシ、4-(4-アセチルピペラジン-1-イル)ブトキシ、2-(4-イソブチリルピペラジン-1-イル)エトキシ、3-(4-イソブチリルピペラジン-1-イル)プロポキシ、4-(4-イソブチリルピペラジン-1-イル)ブトキシ、2-[4-(2-フルオロエチル)ピペラジン-1-イル]エトキシ、3-[4-(2-フルオロエチル)ピペラジン-1-イル]プロポキシ、2-[4-(2,2,2-トリフルオロエチル)ピペラジン-1-イル]エトキシ、3-[4-(2,2,2-トリフルオロエチル)ピペラジン-1-イル]プロポキシ、2-(4-シアノメチルピペラジン-1-イル)エトキシ、3-(4-シアノメチルピペラジ

ン-1-イル)プロボキシ、2-[2-(4-メチルピペラジン-1-イル)エトキシ]エトキシ、2-(4-ピリジルオキシ)エトキシ、3-ピリジルメトキシ及び2-シアノピリド-4-イルメトキシから選択され；

q は 0 であり；

前記-C(R³)(R⁴)-CON(R⁵)基は(X¹基に対して)4-位に配置される；

R³、R⁴及びR⁵はそれぞれ水素であり；

環Aはフェニルまたはピリジル環であり；及び

r は 1 または 2 であり、一つのR⁶は(CON(R⁵)基に対して)3-位または4-位に配置され、及びR⁶基はそれぞれ、同一でも異なってもよく、フルオロ、クロロ、トリフルオロメチル、ヒドロキシ、アミノ、メチル、メトキシ、メチルアミノ及びジメチルアミノから選択されるか、

または第一のR⁶基は、(CON(R⁵)基に対して)3-位または4-位に配置され、且つヒドロキシメチル、1-ヒドロキシエチル、2-ヒドロキシエチル、シアノメチル、1-シアノエチル、2-シアノエチル、アミノメチル、1-アミノエチル、2-アミノエチル、メチルアミノメチル、1-メチルアミノエチル、2-メチルアミノエチル、ジメチルアミノメチル、1-ジメチルアミノエチル、2-ジメチルアミノエチル、ピロリジニルメチル、モルホリニルメチル、ピペリジニルメチル及びピペラジニルメチルから選択され、

及びR⁶基内の任意のヘテロサイクリル基は、場合によりフルオロ、クロロ、トリフルオロメチル、ヒドロキシ、アミノ、メチル、メトキシ、メチルアミノ及びジメチルアミノから選択される置換基を保持する、

及び存在する任意の第二のR⁶基は、フルオロ、クロロ、トリフルオロメチル、シアノ、ヒドロキシ、アミノ、メチル、メトキシ、メチルアミノ及びジメチルアミノから選択される、請求項 1 に記載の式 I のキナゾリン誘導体またはその医薬的に許容可能な塩、溶媒和物若しくはプロドラッグ。

【請求項 1 3】

式中、X¹は0であり；

p は 2 であり、且つR¹基は、同一または異なってもよく、6-及び7-位に配置され、メトキシ、エトキシ、プロボキシ、2-ヒドロキシエトキシ、3-ヒドロキシプロボキシ、2-メトキシエトキシ、3-メトキシプロボキシ、2-メチルスルホニルエトキシ、3-メチルスルホニルプロボキシ及び2-(2-メトキシエトキシ)エトキシから選択される；

q は 0 であるか、q は 1 であり、且つ前記R²基はフルオロ、クロロ、メチルまたはメトキシであり；

前記-C(R³)(R⁴)-CON(R⁵)基は、(X¹基に対して)4-位に配置される；

R³、R⁴及びR⁵はそれぞれ水素であり；

環Aはフェニルである；及び

r は 1 または 2 であり、且つ第一のR⁶基は、(CON(R⁵)基に対して)3-位に配置され、ヒドロキシメチル、アミノメチル、メチルアミノメチル、エチルアミノメチル、プロピルアミノメチル、イソプロピルアミノメチル、シクロプロピルアミノメチル、ジメチルアミノメチル、ジエチルアミノメチル、N-エチル-N-メチルアミノメチル、N-シクロプロピル-N-メチルアミノメチル、2-フリルメチルアミノメチル、ピロリルメチルアミノメチル、ピリジルメチルアミノメチル、アゼチジニルメチル、ピロリジニルメチル、モルホリニルメチル、ピペリジニルメチル、ホモピペリジニルメチル、ピペラジニルメチル及びホモピペラジニルメチルから選択される、

及び存在する任意の第二のR⁶基は、フルオロ、クロロ、メチル、エチル、メトキシ及びエトキシから選択され、

ここでR⁶基内の任意のヘテロサイクリル基は、場合によりメチル、エチルまたはヒドロキシメチル置換基を保持する、請求項 1 に記載の式 I のキナゾリン誘導体またはその医薬的に許容可能な塩、溶媒和物若しくはプロドラッグ。

【請求項 1 4】

式中、X¹は0であり；

pは2であり、且つ前記R¹基は、同一または異なっているとしてもよく、6-及び7-位に配置され、且つメトキシ、エトキシ、プロポキシ、2-ヒドロキシエトキシ、3-ヒドロキシプロポキシ、2-メトキシエトキシ、3-メトキシプロポキシ、2-メチルスルホニルエトキシ、3-メチルスルホニルプロポキシ及び2-(2-メトキシエトキシ)エトキシから選択される；

qは0であるか、qは1であり、且つ前記R²基はフルオロ、クロロ、メチルまたはメトキシである；

前記-C(R³)(R⁴)-CON(R⁵)基は、(X¹基に対して)4-位に配置される；

R³、R⁴及びR⁵はそれぞれ水素である；

環Aはピリジルである；及び

rは0、1または2であり、且つ存在するR⁶基はそれぞれ、フルオロ、クロロ、トリフルオロメチル、シアノ、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、tert-ブチル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、メトキシ、エトキシ、メチルアミノ、エチルアミノ、プロピルアミノ、イソプロピルアミノ、シクロプロピルアミノ、2-ヒドロキシエチルアミノ、2-メトキシエチルアミノ、ジメチルアミノ、N-シクロプロピル-N-メチルアミノ、アセチル、ヒドロキシメチル、アミノメチル、メチルアミノメチル、エチルアミノメチル、プロピルアミノメチル、イソプロピルアミノメチル、シクロプロピルアミノメチル、ジメチルアミノメチル、ジエチルアミノメチル、N-エチル-N-メチルアミノメチル、N-シクロプロピル-N-メチルアミノメチル、ピロリジン-1-イル、ピペリジノ、モルホリノ、ピペラジン-1-イル、ピロリジン-1-イルメチル、モルホリノメチル、ピペリジノメチル及びピペラジン-1-イルメチルから選択される、

及びR⁶基内の任意のヘテロサイクリル基は、場合によりメチルまたはエチル置換基を保持する、請求項1に記載の式Iのキナゾリン誘導体またはその医薬的に許容可能な塩、溶媒和物若しくはプロドラッグ。

【請求項15】

式中、X¹は0であり；

pは2であり、且つ前記R¹基は、同一または異なっているとしてもよく、6-及び7-位に配置され、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、2-ヒドロキシエトキシ、3-ヒドロキシプロポキシ、2-メトキシエトキシ、3-メトキシプロポキシ、2-メチルスルホニルエトキシ、3-メチルスルホニルプロポキシ及び2-(2-メトキシエトキシ)エトキシから選択される；

qは0であるか、qは1であり、且つ前記R²基は、フルオロ、クロロ、メチルまたはメトキシである；

前記-C(R³)(R⁴)-CON(R⁵)基は、(X¹基に対して)4-位に配置される；

R³、R⁴及びR⁵はそれぞれ水素であり；

環Aは、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサゾリル、イソキサゾリル、イミダゾリル及びピラゾリルから選択され；及び

rは0、1または2であり、且つ存在するR⁶基はそれぞれ、フルオロ、クロロ、トリフルオロメチル、シアノ、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、tert-ブチル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、メトキシ、エトキシ、メチルアミノ、エチルアミノ、プロピルアミノ、イソプロピルアミノ、シクロプロピルアミノ、2-ヒドロキシエチルアミノ、2-メトキシエチルアミノ、ジメチルアミノ、N-シクロプロピル-N-メチルアミノ、アセチル、ヒドロキシメチル、アミノメチル、メチルアミノメチル、エチルアミノメチル、プロピルアミノメチル、イソプロピルアミノメチル、シクロプロピルアミノメチル、ジメチルアミノメチル、ジエチルアミノメチル、N-エチル-N-メチルアミノメチル、N-シクロプロピル-N-メチルアミノメチル、ピロリジン-1-イル、ピペリジノ、モルホリノ、ピペラジン-1-イル、ピロリジン-1-イルメチル、モルホリノメチル、ピペリジノメチル及びピペラジン-1-イルメチルから選択され、

及びR⁶基内の任意のヘテロサイクリル基は、場合によりメチルまたはエチル置換基を保持する、請求項1に記載の式Iのキナゾリン誘導体またはその医薬的に許容可能な塩、溶媒和物若しくはプロドラッグ。

【請求項16】

式中、 X^1 は0であり；

pは2であり、且つ前記第一の R^1 基は6-メトキシ基であり、前記第二の R^1 基は7-位に配置され、メトキシ、エトキシ、2-ヒドロキシエトキシ及び2-メトキシエトキシから選択される；

qは0であるか、qは1であり、且つ前記 R^2 基はフルオロである；

前記-C(R^3)(R^4)-CON(R^5)基は、(X^1 基に対して)4-位に配置される；

R^3 、 R^4 及び R^5 はそれぞれ水素であり；

環Aは、2-チアゾリル、2-オキサゾリル、3-イソキサゾリル、5-イソキサゾリル、2-イミダゾリル、3-ピラゾリルまたは4-ピラゾリルである；及び

rは0、1または2であり、且つ存在する R^6 基はそれぞれフルオロ、クロロ、シアノ、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、tert-ブチル、シクロプロピル、メトキシ、エトキシ及びアセチルから選択される、請求項1に記載の式Iのキナゾリン誘導体またはその医薬的に許容可能な塩、溶媒和物若しくはプロドラッグ。

【請求項17】

N-(6-ジメチルアミノピリジン-2-イル)-2-[4-(6,7-ジメトキシキナゾリン-4-イルオキシ)フェニル]アセトアミド、

N-(6-ジメチルアミノピリジン-2-イル)-2-{4-[6-メトキシ-7-(2-メトキシエトキシ)キナゾリン-4-イルオキシ]フェニル}アセトアミド、

N-(5-ジメチルアミノピリジン-2-イル)-2-[4-(6,7-ジメトキシキナゾリン-4-イルオキシ)フェニル]アセトアミド、

N-(5-ジメチルアミノピリジン-2-イル)-2-[4-(7-エトキシ-6-メトキシキナゾリン-4-イルオキシ)フェニル]アセトアミド、

N-(5-ジメチルアミノピリジン-2-イル)-2-{4-[6-メトキシ-7-(2-メトキシエトキシ)キナゾリン-4-イルオキシ]フェニル}アセトアミド、

N-(5-ジメチルアミノピリジン-2-イル)-2-{4-[6,7-ジ-(2-メトキシエトキシ)キナゾリン-4-イルオキシ]フェニル}アセトアミド、

N-(5-ジメチルアミノピリジン-2-イル)-2-{4-[7-(2-ヒドロキシエトキシ)-6-メトキシキナゾリン-4-イルオキシ]フェニル}アセトアミド、

N-(5-ジメチルアミノピリジン-2-イル)-2-{3-フルオロ-4-[7-(2-ヒドロキシエトキシ)-6-メトキシキナゾリン-4-イルオキシ]フェニル}アセトアミド、

N-(4-ジメチルアミノピリジン-2-イル)-2-[4-(6,7-ジメトキシキナゾリン-4-イルオキシ)フェニル]アセトアミド、

N-(4-ジメチルアミノピリジン-2-イル)-2-{4-[6-メトキシ-7-(2-メトキシエトキシ)キナゾリン-4-イルオキシ]フェニル}アセトアミド、

N-(4-ジメチルアミノピリジン-2-イル)-2-{4-[6,7-ジ-(2-メトキシエトキシ)キナゾリン-4-イルオキシ]フェニル}アセトアミド、

N-(4-ジメチルアミノピリジン-2-イル)-2-[4-(6,7-ジメトキシキナゾリン-4-イルオキシ)-3-フルオロフェニル]アセトアミド、

N-(4-メチルチアゾール-2-イル)-2-[4-(6,7-ジメトキシキナゾリン-4-イルオキシ)フェニル]アセトアミド、

N-(4-メチルチアゾール-2-イル)-2-{4-[6-メトキシ-7-(2-メトキシエトキシ)キナゾリン-4-イルオキシ]フェニル}アセトアミド、

N-(4-メチルチアゾール-2-イル)-2-{4-[7-(2-ヒドロキシエトキシ)-6-メトキシキナゾリン-4-イルオキシ]フェニル}アセトアミド、

N-(5-メチルチアゾール-2-イル)-2-[4-(6,7-ジメトキシキナゾリン-4-イルオキシ)フェニル]アセトアミド、

N-(5-メチルチアゾール-2-イル)-2-[4-(6,7-ジメトキシキナゾリン-4-イルオキシ)-3-フルオロフェニル]アセトアミド、

N-(5-メチルチアゾール-2-イル)-2-{4-[7-(2-ヒドロキシエトキシ)-6-メトキシキナゾリン-4-イルオキシ]フェニル}アセトアミド、

N-(4,5-ジメチルチアゾール-2-イル)-2-{4-[7-(2-ヒドロキシエトキシ)-6-メトキシキナゾリン-4-イルオキシ]フェニル}アセトアミド、

N-(5-メチルイソキサゾール-3-イル)-2-{4-[6-メトキシ-7-(2-メトキシエトキシ)キナゾリン-4-イルオキシ]フェニル}アセトアミド、

N-(1,5-ジメチルピラゾール-3-イル)-2-[4-(6,7-ジメトキシキナゾリン-4-イルオキシ)フェニル]アセトアミド、

N-(1-エチルピラゾール-3-イル)-2-[4-(6,7-ジメトキシキナゾリン-4-イルオキシ)フェニル]アセトアミド、

N-(1-メチルピラゾール-4-イル)-2-[4-(6,7-ジメトキシキナゾリン-4-イルオキシ)フェニル]アセトアミド、

N-(1-エチルピラゾール-4-イル)-2-[4-(6,7-ジメトキシキナゾリン-4-イルオキシ)フェニル]アセトアミド、

N-(1-エチルピラゾール-4-イル)-2-[4-(6,7-ジメトキシキナゾリン-4-イルオキシ)-3-フルオロフェニル]アセトアミド、

N-(1-イソプロピルピラゾール-4-イル)-2-[4-(6,7-ジメトキシキナゾリン-4-イルオキシ)フェニル]アセトアミド、

N-(1-イソプロピルピラゾール-4-イル)-2-[4-(7-エトキシ-6-メトキシキナゾリン-4-イルオキシ)フェニル]アセトアミド、

N-(1-イソプロピルピラゾール-4-イル)-2-{4-[6-メトキシ-7-(2-メトキシエトキシ)キナゾリン-4-イルオキシ]フェニル}アセトアミド及び

N-(1-イソプロピルピラゾール-4-イル)-2-{4-[7-(2-ヒドロキシエトキシ)-6-メトキシキナゾリン-4-イルオキシ]フェニル}アセトアミド

から選択される、請求項 1 に記載の式 I のキナゾリン誘導体またはその医薬的に許容可能な塩、溶媒和物若しくはプロドラッグ。

【請求項 18】

N-(1-エチルピラゾール-4-イル)-2-[4-(6,7-ジメトキシキナゾリン-4-イルオキシ)フェニル]アセトアミド、

N-(1-エチルピラゾール-4-イル)-2-[4-(6,7-ジメトキシキナゾリン-4-イルオキシ)-3-フルオロフェニル]アセトアミド、

N-(1-イソプロピルピラゾール-4-イル)-2-[4-(6,7-ジメトキシキナゾリン-4-イルオキシ)フェニル]アセトアミド、

N-(1-イソプロピルピラゾール-4-イル)-2-[4-(7-エトキシ-6-メトキシキナゾリン-4-イルオキシ)フェニル]アセトアミド、

N-(1-イソプロピルピラゾール-4-イル)-2-{4-[6-メトキシ-7-(2-メトキシエトキシ)キナゾリン-4-イルオキシ]フェニル}アセトアミド及び

N-(1-イソプロピルピラゾール-4-イル)-2-{4-[7-(2-ヒドロキシエトキシ)-6-メトキシキナゾリン-4-イルオキシ]フェニル}アセトアミド

から選択される、請求項 1 に記載の式 I のキナゾリン誘導体またはその医薬的に許容可能な塩、溶媒和物若しくはプロドラッグ。

【請求項 19】

医薬的に許容可能な希釈剤またはキャリアと共同して、請求項 1 に記載の式 I のキナゾリン誘導体、またはその医薬的に許容可能な塩、溶媒和物若しくはプロドラッグを含む医薬組成物。

【請求項 20】

請求項 1 で定義された式 I のキナゾリン誘導体と、以下の：

(i) 医学腫瘍学において使用される他の抗増殖/抗新生物薬及びその組み合わせ

(ii) 細胞増殖抑制薬

(iii) 抗侵害活性薬

(iv) 増殖因子機能の阻害剤

(v) 他の抗血管形成薬

(vi) 血管損傷剤

(vii) アンチセンス治療

(viii) 遺伝子治療アプローチ、及び

(ix) 免疫療法アプローチ

から選択される追加の抗腫瘍剤とを含む、ガンの併用処置のための医薬製品。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0101

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0101】

の1,4-ジヒドロキナゾリン-4-オン{式中、p及びR¹は、必要により全ての官能基を保護した以外には、上記定義の意味のいずれかを有する}は、塩化チオニル、塩化ホスホリルまたは四塩化炭素とトリフェニルホスフィンとの混合物などのハロゲン化剤と反応させ、その後、存在する全ての保護基を除去することができる。

【手続補正3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0400

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0400】

出発物質の製造に関する実施例13の第二段落に記載のものと類似の手順を使用して、7-ニトロ-1,2,3,4-テトラヒドロキノリンを7-アミノ-1,2,3,4-テトラヒドロキノリンに転換した。

[23] ¹H NMR : (DMSO-d₆) 1.75(m, 2H), 2.6(m, 2H), 3.15(m, 2H), 3.35(s, 3H), 3.36(s, 3H), 3.6(s, 2H), 3.75(m, 4H), 4.35(m, 4H), 4.95(s, 2H), 5.7(s, 1H), 6.6(m, 1H), 6.75(m, 2H), 7.4(s, 1H), 7.6(s, 1H), 7.65(s, 1H), 8.1(s, 1H), 8.65(s, 1H), 9.95(s, 1H); マスペクトル : M+H⁺559。