

【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23年5月26日(2011.5.26)

【公表番号】特表2010-521487(P2010-521487A)

【公表日】平成22年6月24日(2010.6.24)

【年通号数】公開・登録公報2010-025

【出願番号】特願2009-553783(P2009-553783)

【国際特許分類】

C 0 7 D 239/84 (2006.01)

A 6 1 K 31/517 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

C 0 7 D 403/12 (2006.01)

C 0 7 D 401/12 (2006.01)

C 0 7 D 401/14 (2006.01)

C 0 7 D 413/14 (2006.01)

C 0 7 D 403/04 (2006.01)

C 0 7 D 417/12 (2006.01)

C 0 7 D 409/04 (2006.01)

C 0 7 D 405/04 (2006.01)

C 0 7 D 413/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/553 (2006.01)

C 0 7 D 405/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/55 (2006.01)

C 0 7 D 413/04 (2006.01)

C 0 7 D 451/04 (2006.01)

C 0 7 D 487/08 (2006.01)

C 0 7 D 409/12 (2006.01)

C 0 7 D 487/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/519 (2006.01)

C 0 7 D 471/04 (2006.01)

C 0 7 D 239/70 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 239/84 C S P

A 6 1 K 31/517

A 6 1 K 31/5377

C 0 7 D 403/12

C 0 7 D 401/12

C 0 7 D 401/14

C 0 7 D 413/14

C 0 7 D 403/04

C 0 7 D 417/12

C 0 7 D 409/04

C 0 7 D 405/04

C 0 7 D 413/12

A 6 1 K 31/553

C 0 7 D 405/12

A 6 1 K 31/55

C 0 7 D 413/04
 C 0 7 D 451/04
 C 0 7 D 487/08
 C 0 7 D 409/12
 C 0 7 D 487/04 1 4 0
 A 6 1 K 31/519
 C 0 7 D 471/04 1 1 8 Z
 C 0 7 D 239/70
 A 6 1 P 43/00 1 1 1
 A 6 1 P 35/00

【手続補正書】

【提出日】平成23年3月7日(2011.3.7)

【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

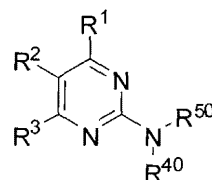
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I



I

の化合物又はその単一の異性体であって、ここで、該化合物は場合によってはその薬学的に許容可能な塩、水和物、溶媒和物又は組合せであり、ここで、

R^1 は、アルキル、シクロアルキル、フェニル、ヘテロアリール、又はヘテロシクロアルキルであり、ここで、シクロアルキル、フェニル、ヘテロアリール、及びヘテロシクロアルキルは一、二、又は三の R^6 で置換されていてもよく；

R^2 及び R^3 は、それらが結合するピリミジニルと共に、アルキル、アルコキシ、ハロ、ヒドロキシ、ヘテロシクロアルキルアルキルオキシ、ヘテロシクロアルキル、及びアルキルで置換されたヘテロシクロアルキルから独立して選択される一又は二の基で 5 位、6 位、7 位及び 8 位が置換されていてもよいキナゾリニルを形成し；あるいは

R^2 及び R^3 は、それらが結合するピリミジニルと共に、アルキル、アルコキシ、ハロ、ヒドロキシ、ヘテロシクロアルキルアルキルオキシ、ヘテロシクロアルキル、及びアルキルで置換されたヘテロシクロアルキルから独立して選択される一又は二の基で 5 位、6 位、7 位及び 8 位の炭素原子がそれぞれ置換されていてもよいピリド [3, 2-d] ピリミジニル、ピリド [4, 3-d] ピリミジニル、ピリド [3, 4-d] ピリミジニル、又はピリド [2, 3-d] ピリミジニルを形成し；あるいは

R^2 及び R^3 は、それらが結合するピリミジニルと共に 6, 7 - ジヒドロ - 5 H - シクロペンタ [d] ピリミジニル、5, 6, 7, 8 - テトラヒドロキナゾリニル、又は 6, 7, 8, 9 - テトラヒドロ - 5 H - シクロヘプタ [d] ピリミジニルを形成し；あるいは

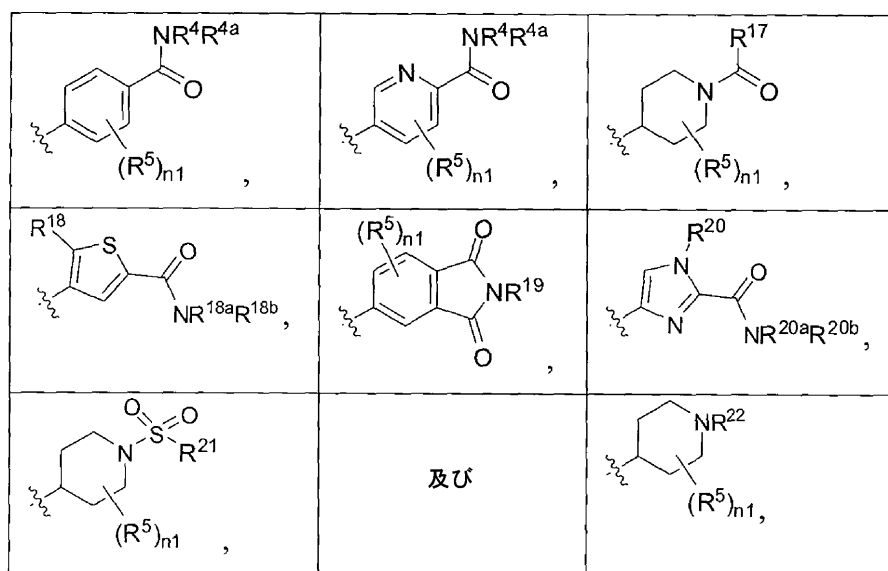
R^2 及び R^3 は、それらが結合するピリミジニルと共に、アルキル、アルコキシカルボニル、ベンジルオキシカルボニル、及び置換されていてもよいフェニルアルキルから独立して選択される一又は二の基で 5 位、6 位、7 位及び 8 位がそれぞれ置換されていてもよ

い 5, 6, 7, 8 - テトラヒドロピリド [3, 2 - d] ピリミジニル、5, 6, 7, 8 - テトラヒドロピリド [4, 3 - d] ピリミジニル、5, 6, 7, 8 - テトラヒドロピリド [3, 4 - d] ピリミジニル、又は 5, 6, 7, 8 - テトラヒドロピリド [2, 3 - d] ピリミジニルを形成し；

R⁶ が存在する場合、各 R⁶ は、アルキル、アルコキシ、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ハロ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ハロフェニル、アミノカルボニル、アルキルアミノカルボニル、ジアルキルアミノカルボニル、ヒドロキシアルキル、アルコキシカルボニル、アミノアルキル、アルキルアミノアルキル、ジアルキルアミノアルキル、アミノアルキルアミノ、アルキルアミノアルキルアミノ、ジアルキルアミノアルキルアミノ、アルキルオキシアルキルアミノ、ヘテロシクロアルキル、及びヘテロシクロアルキルアルキルから独立して選択され、ここで、ヘテロシクロアルキルは、単独で又はヘテロシクロアルキルアルキルの一部として、アルキル又はアルコキシカルボニルで置換されていてもよく；

R⁴⁰ は水素又はアルキルであり；

R⁵⁰ は



から選択され；

n¹ は 0、1、又は 2 であり；

R⁵ が存在する場合、各 R⁵ は、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ハロ、ニトロ、ヘテロシクロアルキル、ヘテロシクロアルキルアミノ、又はヘテロシクロアルキルアルキルオキシから独立して選択され、ここで、各ヘテロシクロアルキルは、単独で又は R⁵ 中の他の基の一部として、アルキル又はアルコキシカルボニルで独立して置換されていてもよく；

R^{4a} は水素又はアルキルであり；

R⁴ は、一の R⁸ で置換され更に一又は二の R^{8a} で置換されたヘテロアリールであり；R⁴ は一の R²⁹ で置換され更に一又は二の R^{9a} で置換されたフェニルであり；R⁴ は、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、アミノ、アルキルアミノ、及びジアルキルアミノから独立して選択される一又は二の基で置換されていてもよいシクロアルキルであり；あるいは R⁴ は、アルキル又はアルコキシカルボニルで置換されていてもよいヘテロシクロアルキルであり；

R¹⁷ はシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル（アルキル及びアルコキシカルボニルから選択される一又は二の基で置換されていてもよい）、フェニルアルキルアミノ、フェニルアルキル、又はフェニルであり；ここで、各フェニルは、単独で又は R¹⁷ 中の基の一部として、一、二、又は三の R^{9a} で置換され；

R¹⁸ は水素、ハロ、又はアルキルであり；

$R^{1\ 8\ a}$ は水素又はアルキルであり；

$R^{1\ 8\ b}$ は一、二、又は三の $R^{8\ a}$ で置換されたヘテロアリールであるか、あるいは $R^{1\ 8\ b}$ は一、二、又は三の $R^{9\ a}$ で置換されたフェニルであり；

$R^{1\ 9}$ は一、二、又は三の $R^{9\ a}$ で置換されたフェニルであるか、あるいは $R^{1\ 9}$ は一、二、又は三の $R^{8\ a}$ で置換されたヘテロアリールであり；

$R^{2\ 0}$ は水素、アルキル、アルキルカルボニル、アルキルスルホニル、又はアルコキシカルボニルであり；

$R^{2\ 0\ a}$ は水素又はアルキルであり；

$R^{2\ 0\ b}$ は一、二、又は三の $R^{8\ a}$ で置換されたヘテロアリールであるか、あるいは $R^{2\ 0\ b}$ は一、二、又は三の $R^{9\ a}$ で置換されたフェニルであり；

$R^{2\ 1}$ は、一、二、又は三の $R^{9\ a}$ で置換されたフェニルであるか、あるいは $R^{2\ 1}$ は一、二、又は三の $R^{8\ a}$ で置換されたヘテロアリールであり；あるいは $R^{2\ 1}$ はアルキル又はアルコキシカルボニルで置換されていてもよいヘテロシクロアルキルであり；

$R^{2\ 2}$ は、一、二、又は三の $R^{9\ a}$ で置換されたフェニルであるか、あるいは $R^{2\ 2}$ は一、二、又は三の $R^{8\ a}$ で置換されたヘテロアリールであり；

各 R^8 は、アルキル、シクロアルキル、フェニルアルキルオキシアルキル、又は $R^{9\ b}$ から独立して選択され；

各 $R^{8\ a}$ は独立して水素、ハロ、又は R^8 であり；

各 $R^{9\ a}$ は独立して水素、 $R^{9\ b}$ 、又は $R^{9\ c}$ であり；

$R^{2\ 9}$ は $R^{9\ b}$ 又は $R^{9\ c}$ であり；但し、 R^1 がヘテロシクロアルキルであるとき、 R^1 が未置換フェニルであるとき、及び R^1 が、アルキル、ハロ、アルコキシ、ヒドロキシアルキル、アミノアルキル、及びアルコキシカルボニルから独立して選択される一、二、又は三の R^6 で置換されたフェニルであるとき、 $R^{2\ 9}$ は $R^{9\ b}$ であり；

各 $R^{9\ b}$ は、 $R^{9\ b}$ が存在するとき、独立してアミノ；アルキルアミノ；ジアルキルアミノ；置換されていてもよいヘテロシクロアルキル；置換されていてもよいヘテロシクロアルキルアルキルオキシ；アミノアルキルオキシ；アルキルアミノアルキルオキシ；ジアルキルアミノアルキルオキシ；置換されていてもよいヘテロアリール；シアノ； $-C(O)R^{1\ 4}$ ； $-CR^{1\ 4\ a}(=NR^{1\ 4\ b})$ ； $-C(=NR^{2\ 4})R^{2\ 4\ a}$ ； $-S(O)_2NR^{1\ 3}R^{1\ 3\ a}$ ； $-NR^{2\ 3}C(O)R^{2\ 3\ a}$ ； $-C(O)NR^{1\ 2}R^{1\ 2\ a}$ 、又は一又は二の $R^{1\ 1}$ で置換されたアルキルであり；

各 $R^{9\ c}$ は、 $R^{9\ c}$ が存在するとき、独立してアルキル、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、ハロ、ヒドロキシ、アルコキシ、シアノ、ニトロ、又はフェニルカルボニルであり；

各 $R^{1\ 1}$ は、ヒドロキシ、 $-NR^{1\ 5}R^{1\ 5\ a}$ 、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいヘテロシクロアルキル、及び置換されていてもよいシクロアルキルから独立して選択され；

$R^{1\ 2}$ は水素又はアルキルであり； $R^{1\ 2\ a}$ は水素、ヒドロキシ、アルコキシ、アルキル、アミノアルキル、アルキルアミノアルキル、ジアルキルアミノアルキル、ヒドロキシアルキル、置換されていてもよいヘテロシクロアルキル、置換されていてもよいヘテロシクロアルキルアルキル、又は置換されていてもよいヘテロアリールであり；あるいは $R^{1\ 2}$ 及び $R^{1\ 2\ a}$ は、それらが結合する窒素と共に、アルキル、ヒドロキシアルキル、ハロアルキル、アルキルカルボニル、アルコキシカルボニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルキルアルキル、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいヘテロアリールアルキル、置換されていてもよいフェニル、及び置換されていてもよいフェニルアルキルから独立して選択される一、二、又は三の基で置換されていてもよいヘテロシクロアルキルを形成し；

$R^{1\ 3}$ は水素又はアルキルであり；

$R^{1\ 3\ a}$ はアルキル、アミノアルキル、アルキルアミノアルキル、又はジアルキルアミノアルキルであり；

各 $R^{1\ 4}$ は、独立して水素、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、置換されていてもよ

いヘテロアリールアルキル、又は置換されていてもよいヘテロシクロアルキルアルキルであり；

各 $R^{1\ 4\ a}$ は水素又はアルキルであり； $R^{1\ 4\ b}$ はアルコキシ、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、又は置換されていてもよいヘテロシクロアルキルであり；

$R^{1\ 5}$ は水素、アルキル、アルコキシアルキル、ヒドロキシアルキル、又はハロアルキルであり；

$R^{1\ 5\ a}$ は水素、アルキル、アルコキシアルキル、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、カルボキシアルキル、アミノカルボニルアルキル、アルキルアミノカルボニルアルキル、ジアルキルアミノカルボニルアルキル、置換されていてもよいシクロアルキル、又は置換されていてもよいフェニルアルキルであり；

$R^{2\ 3}$ は水素又はアルキルであり；

$R^{2\ 3\ a}$ は水素、アルキル、アミノアルキル、アルキルアミノアルキル、ジアルキルアミノアルキル、又は置換されていてもよいヘテロシクロアルキルアルキルであり；

$R^{2\ 4}$ は水素又はアルキル、ヒドロキシ、又はアルコキシであり； $R^{2\ 4\ a}$ はヒドロキシ、アルコキシ、アミノ、アルキルアミノ、又はジアルキルアミノである化合物。

【請求項 2】

N - [2 - メチル - 5 - (モルホリン - 4 - イルメチル) フェニル] - 4 - [(4 - フェニルピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 2 - イル) アミノ] ベンズアミド；N - (2 , 6 - ジメチルフェニル) - 4 - [(4 - フェニル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - シクロペンタ [d] ピリミジン - 2 - イル) アミノ] ベンズアミド；又はその単一の異性体から選択される請求項 1 に記載の化合物であって、場合によってはその薬学的に許容可能な塩、水和物、溶媒和物又は組合せである化合物。

【請求項 3】

$R^{4\ 0}$ が水素であり、 R^2 及び R^3 が、それらが結合するピリミジニルと共に、アルキル、アルコキシ、ハロ、及びヒドロキシから独立して選択される一又は二の基で 5 位、6 位、7 位及び 8 位が置換されていてもよいキナゾリニルを形成する請求項 1 に記載の化合物；又はその単一の異性体であって、場合によってはその薬学的に許容可能な塩、水和物、溶媒和物又は組合せである化合物。

【請求項 4】

4-[(6-クロロ-4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]- <i>N</i> -シクロプロピルベンズアミド;
4-[(6-クロロ-4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]- <i>N</i> -[2-(ピロリジン-1-イルメチル)フェニル]ベンズアミド;
4-[(6-クロロ-4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]- <i>N</i> -[2-(モルホリン-4-イルメチル)フェニル]ベンズアミド;
4-[(6-クロロ-4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]- <i>N</i> -(2-モルホリン-4-イルフェニル)ベンズアミド;
4-[(6-クロロ-4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]- <i>N</i> -{3-[(ジメチルアミノ)メチル]フェニル}ベンズアミド;
4-[(6-クロロ-4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]- <i>N</i> -(4-メチルピロリジン-3-イル)ベンズアミド;
<i>N</i> -(2-アミノフェニル)-4-[(6-クロロ-4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
4-[(6-クロロ-4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]- <i>N</i> -{5-[(ジメチルアミノ)メチル]-2-メチルフェニル}ベンズアミド;
4-[(6-クロロ-4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]- <i>N</i> -[2-メチル-5-(モルホリン-4-イルメチル)フェニル]ベンズアミド; 及び

から選択される請求項 3 に記載の化合物又はその単一の異性体であって、場合によってはその薬学的に許容可能な塩、水和物、溶媒和物又は組合せである化合物。

【請求項 5】

R^2 及び R^3 が、それらが結合するピリミジニルと共に、5 位、6 位、7 位、又は 8 位が置換されていないキナゾリニルを形成する請求項 3 に記載の化合物又はその単一の異性体であって、場合によってはその薬学的に許容可能な塩、水和物、溶媒和物又は組合せである化合物。

【請求項 6】

R^1 がアルキルである請求項 5 に記載の化合物又はその単一の異性体であって、場合によってはその薬学的に許容可能な塩、水和物、溶媒和物又は組合せである化合物。

【請求項 7】

R^1 が一、二、又は三の R^6 で置換されていてもよいヘテロアリールである請求項 5 に記載の化合物又はその単一の異性体であって、場合によってはその薬学的に許容可能な塩、水和物、溶媒和物又は組合せである化合物。

【請求項 8】

R^1 が一、二、又は三の R^6 で置換されていてもよいシクロアルキルである請求項 5 に記載の化合物又はその単一の異性体であって、場合によってはその薬学的に許容可能な塩、水和物、溶媒和物又は組合せである化合物。

【請求項 9】

R^1 が一又は二の R^6 で置換されたフェニルであり、ここで、各 R^6 が独立してアミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アミノカルボニル、アルキルアミノカルボニル、ジアルキルアミノカルボニル、ヘテロシクロアルキルアルキル（アルキル又はアルコシカルボニルで置換されていてもよい）、アミノアルキルアミノ、アルキルアミノアルキルアミノ、又はジアルキルアミノアルキルアミノである請求項 5 に記載の化合物又はその単一の異性体であって、場合によってはその薬学的に許容可能な塩、水和物、溶媒和物又は組合せである化合物。

【請求項 10】

R^1 が未置換のフェニルである請求項 5 に記載の化合物又はその単一の異性体であって

、場合によってはその薬学的に許容可能な塩、水和物、溶媒和物又は組合せである化合物。

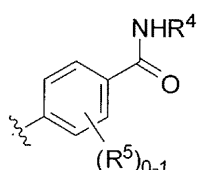
【請求項 1 1】

<i>N</i> -[(3,4-ジクロロフェニル)メチル]-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ピペリジン-1-カルボキサミド;
<i>N</i> -[1-(1 <i>H</i> -ベンズイミダゾール-2-イル)ピペリジン-4-イル]-4-フェニルキナゾリン-2-アミン;
4-フェニル- <i>N</i> -[1-(フェニルカルボニル)ピペリジン-4-イル]キナゾリン-2-アミン;
4-フェニル- <i>N</i> -[1-(フェニルアセチル)ピペリジン-4-イル]キナゾリン-2-アミン;
<i>N</i> -{1-[(2,6-ジクロロフェニル)アセチル]ピペリジン-4-イル}-4-フェニルキナゾリン-2-アミン;
4-フェニル- <i>N</i> -[1-(2-フェニルプロパノイル)ピペリジン-4-イル]キナゾリン-2-アミン;
<i>N</i> -{1-[(3,5-ジメチルイソオキサゾール-4-イル)スルホニル]ピペリジン-4-イル}-4-フェニルキナゾリン-2-アミン;
<i>N</i> -{1-[(2,6-ジクロロフェニル)カルボニル]ピペリジン-4-イル}-4-フェニルキナゾリン-2-アミン;
3-[(4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ピペリジン-1-イル)カルボニル]ピペリジン-1-カルボン酸 1,1-ジメチルエチル;
<i>N</i> -[1-(シクロヘキシルカルボニル)ピペリジン-4-イル]-4-フェニルキナゾリン-2-アミン;
2-(2,6-ジメチルフェニル)-5-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]-1 <i>H</i> -インドール-1,3(2 <i>H</i>)-ジオン;
<i>N</i> -(2,6-ジメチルフェニル)-1-メチル-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]-1 <i>H</i> -イミダゾール-2-カルボキサミド;
5-クロロ- <i>N</i> -(2,6-ジメチルフェニル)-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]チオフェン-2-カルボキサミド;
<i>N</i> -(4-メチルピロリジン-3-イル)-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -{5-[(ジメチルアミノ)メチル]-2-メチルフェニル}-5-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ピリジン-2-カルボキサミド; 及び

から選択される請求項 1 0 に記載の化合物又はその単一の異性体であって、場合によってはその薬学的に許容可能な塩、水和物、溶媒和物又は組合せである化合物。

【請求項 1 2】

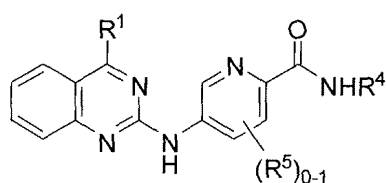
R^{5 0} が



である請求項 5 に記載の化合物又はその単一の異性体であって、場合によってはその薬学的に許容可能な塩、水和物、溶媒和物又は組合せである化合物。

【請求項 1 3】

式 I b



Ib

に従う請求項 1 に記載の化合物又はその単一の異性体であって、場合によってはその薬学的に許容可能な塩、水和物、溶媒和物又は組合せである化合物。

【請求項 1 4】

R⁴ がーの R⁸ で置換されたヘテロアリールである請求項 1 2 又は 1 3 に記載の化合物又はその単一の異性体であって、場合によってはその薬学的に許容可能な塩、水和物、溶媒和物又は組合せである化合物。

【請求項 1 5】

<i>N</i> -(2-メチル-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-7-イル)-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -(5-シクロプロピル-1,3,4-チアジアゾール-2-イル)-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -(2-メチル-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-5-イル)-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -(2,6-ジメチル-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-7-イル)-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -(4-メチル-2,3,4,5-テトラヒドロ-1,4-ベンゾオキサゼピン-7-イル)-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -(3-シクロプロピル-1 <i>H</i> -ピラゾール-5-イル)-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -[2-(2-ヒドロキシエチル)-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-5-イル]-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -(2-{2-[(フェニルメチル)オキシ]エチル}-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-5-イル)-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]- <i>N</i> -(2,3,3-トリメチル-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-7-イル)ベンズアミド; 及び

から選択される請求項 1 4 に記載の化合物又はその単一の異性体であって、場合によってはその薬学的に許容可能な塩、水和物、溶媒和物又は組合せである化合物。

【請求項 1 6】

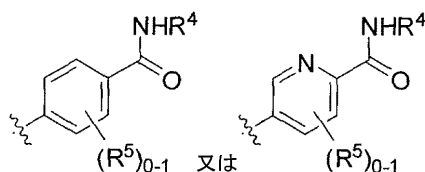
R⁴ がーの R^{2 9} で置換されたフェニルである請求項 1 2 又は 1 3 に記載の化合物又はその単一の異性体であって、場合によってはその薬学的に許容可能な塩、水和物、溶媒和物又は組合せである化合物。

【請求項 1 7】

各 R^{9 a} が独立して水素又はアルキルである請求項 1 6 に記載の化合物又はその単一の異性体であって、場合によってはその薬学的に許容可能な塩、水和物、溶媒和物又は組合せである化合物。

【請求項 1 8】

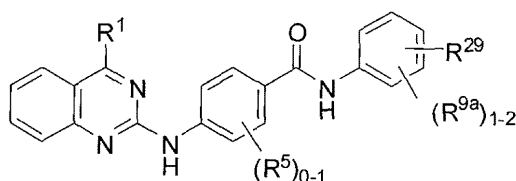
R^1 がアルキル、シクロアルキル、又はヘテロアリールであり、該シクロアルキル及びヘテロアリールが一、二、又は三の R^6 で置換されていてもよく； R^{50} が



であり； R^4 が一の R^{29} で置換され、更に一又は二の R^{9a} で置換されたフェニルであり； R^{29} が R^{9c} であり；各 R^{9a} が独立して水素又は R^{9c} である請求項 5 に記載の化合物又はその単一の異性体であって、場合によってはその薬学的に許容可能な塩、水和物、溶媒和物又は組合せである化合物。

【請求項 19】

式 I c



に従う請求項 1 に記載の化合物又はその単一の異性体であって、場合によってはその薬学的に許容可能な塩、水和物、溶媒和物又は組合せである化合物。

【請求項 20】

<i>N</i> -(2,6-ジメチルフェニル)-4-[[4-(4-[[3-(エチルオキシ)プロピル]アミノ}フェニル)キナゾリン-2-イル]アミノ]ベンズアミド；
4-[(4-シクロプロピルキナゾリン-2-イル)アミノ]- <i>N</i> -(2,6-ジメチルフェニル)ベンズアミド；
<i>N</i> -[2,5-ビス(ヒドロキシメチル)フェニル]-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド；
<i>N</i> -[2-(ヒドロキシメチル)-5-(モルホリン-4-イルメチル)フェニル]-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド；
4-[(4-シクロヘキシルキナゾリン-2-イル)アミノ]- <i>N</i> -(2,6-ジメチルフェニル)ベンズアミド；及び

から選択される請求項 19 に記載の化合物又はその単一の異性体であって、場合によってはその薬学的に許容可能な塩、水和物、溶媒和物又は組合せである化合物。

【請求項 21】

R^1 が、一の R^6 で置換されていてもよいアルキル又はヘテロアリールであり； R^{29} が R^{9c} であり、ここで、 R^{9c} はアルキルであり；各 R^{9a} が独立して水素又は R^{9c} であり、ここで、 R^{9c} はアルキルである請求項 19 に記載の化合物又はその単一の異性体であって、場合によってはその薬学的に許容可能な塩、水和物、溶媒和物又は組合せである化合物。

【請求項 22】

R^1 が一又は二の R^6 で置換されたフェニルであり、各 R^6 は、独立してアルキルアミノアルキル、ジアルキルアミノアルキル、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、

アミノカルボニル、アルキルアミノカルボニル、ジアルキルアミノカルボニル、ヘテロシクロアルキルアルキル（アルキル又はアルコキシカルボニルで置換されていてもよい）、アミノアルキルアミノ、アルキルアミノアルキルアミノ、又はジアルキルアミノアルキルアミノであり； R^{29} が R^{9c} であり、ここで、 R^{9c} はアルキルであり； R^{9a} が水素又は R^{9c} であり、ここで、 R^{9c} はアルキルである請求項19に記載の化合物又はその単一の異性体であって、場合によってはその薬学的に許容可能な塩、水和物、溶媒和物又は組合せである化合物。

【請求項23】

R^1 が未置換のフェニルであり；各 R^{9a} が独立して水素又はアルキルであり； R^{29} が R^{9b} である請求項19に記載の化合物又はその単一の異性体であって、場合によってはその薬学的に許容可能な塩、水和物、溶媒和物又は組合せである化合物。

【請求項24】

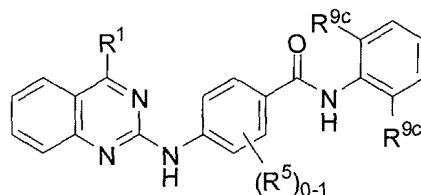
R^{9b} が置換されていてもよいヘテロシクロアルキル、ジアルキルアミノアルキルオキシ、ヘテロシクロアルキルアルキルオキシ、 $-C(O)NR^{12}R^{12a}$ 、 $-S(O)_2NR^{13}R^{13a}$ 、 $-C(O)R^{14}$ 、置換されていてもよいヘテロアリール、 $-NR^{23}C(O)R^{23a}$ 、又は一の R^{11} で置換されたアルキルである請求項22又は23に記載の化合物又はその単一の異性体であって、場合によってはその薬学的に許容可能な塩、水和物、溶媒和物又は組合せである化合物。

【請求項25】

N - { 3 - [(ジメチルアミノ)メチル]フェニル } - 4 - [(4 - フェニルキナゾリン2 - イル)アミノ]ベンズアミド；N - [3 - (モルホリン - 4 - イルメチル)フェニル] - 4 - [(4 - フェニルキナゾリン2 - イル)アミノ]ベンズアミドから選択される請求項24に記載の化合物又はその単一の異性体であって、場合によってはその薬学的に許容可能な塩、水和物、溶媒和物又は組合せである化合物。

【請求項26】

式 I I



（上式中、 R^1 はアルキルであり； R^1 は一又は二のアルキルで置換されていてもよいヘテロアリールであり；あるいは R^1 は一のメチルアミノ、イソプロピルアミノ、イソブチルアミノ、ジメチルアミノ、ジメチルアミノカルボニル、アミノカルボニル、モルホリニルメチル、4 - メチルピペラジニルメチル、又はジメチルアミノメチルで置換されたフェニルである）に従う請求項1に記載の化合物又はその単一の異性体であって、場合によってはその薬学的に許容可能な塩、水和物、溶媒和物又は組合せである化合物。

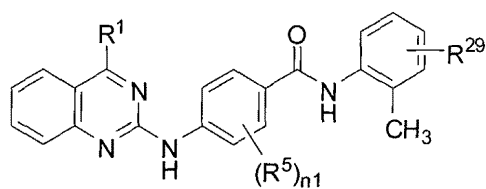
【請求項27】

<i>N</i> -(2,6-ジメチルフェニル)-4-[[4-(1-メチルエチル)キナゾリン-2-イル]アミノ}ベンズアミド;
<i>N</i> -(2,6-ジメチルフェニル)-4-[[4-(1 <i>H</i> -ピラゾール-4-イル)キナゾリン-2-イル]アミノ}ベンズアミド;
<i>N</i> -(2,6-ジメチルフェニル)-4-[(4-フラン-3-イルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
4-({4-[4-(ジメチルアミノ)フェニル]キナゾリン-2-イル}アミノ)- <i>N</i> -(2,6-ジメチルフェニル)ベンズアミド;
3-[2-[(4-[(2,6-ジメチルフェニル)アミノ]カルボニル}フェニル)アミノ]キナゾリン-4-イル}- <i>N,N</i> -ジメチルベンズアミド;
4-({4-[4-(アミノカルボニル)フェニル]キナゾリン-2-イル}アミノ)- <i>N</i> -(2,6-ジメチルフェニル)ベンズアミド;
<i>N</i> -(2,6-ジメチルフェニル)-4-({4-[3-(モルホリン-4-イルメチル)フェニル]キナゾリン-2-イル}アミノ)ベンズアミド;
4-[[4-(3,5-ジメチルイソオキサゾール-4-イル)キナゾリン-2-イル]アミノ}- <i>N</i> -(2,6-ジメチルフェニル)ベンズアミド;
<i>N</i> -(2,6-ジメチルフェニル)-4-[(4-{3-[(4-メチルピペラジン-1-イル)メチル]フェニル}キナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
4-[(4-{3-[(ジメチルアミノ)メチル]フェニル}キナゾリン-2-イル)アミノ]- <i>N</i> -(2,6-ジメチルフェニル)ベンズアミド;
<i>N</i> -(2,6-ジメチルフェニル)-4-({4-[4-(モルホリン-4-イルメチル)フェニル]キナゾリン-2-イル}アミノ)ベンズアミド;
<i>N</i> -(2,6-ジメチルフェニル)-4-[(4-{4-[(4-メチルピペラジン-1-イル)メチル]フェニル}キナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
4-[(4-{4-[(ジメチルアミノ)メチル]フェニル}キナゾリン-2-イル)アミノ]- <i>N</i> -(2,6-ジメチルフェニル)ベンズアミド;
<i>N</i> -(2,6-ジメチルフェニル)-4-({4-[4-(メチルアミノ)フェニル]キナゾリン-2-イル}アミノ)ベンズアミド;
<i>N</i> -(2,6-ジメチルフェニル)-4-[(4-{4-[(2-メチルプロピル)アミノ]フェニル}キナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -(2,6-ジメチルフェニル)-4-[(4-{4-[(1-メチルエチル)アミノ]フェニル}キナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -(2,6-ジメチルフェニル)-4-[[4-(1-メチル-1 <i>H</i> -ピラゾール-4-イル)キナゾリン-2-イル]アミノ}ベンズアミド;
<i>N</i> -(2,6-ジメチルフェニル)-4-[[4-(1 <i>H</i> -インドール-5-イル)キナゾリン-2-イル]アミノ}ベンズアミド;
<i>N</i> -(2,6-ジメチルフェニル)-4-[(4-メチルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド; 及び

から選択される請求項 26 に記載の化合物又はその単一の異性体であって、場合によってはその薬学的に許容可能な塩、水和物、溶媒和物又は組合せである化合物。

【請求項 28】

式 I I I



III

に従う請求項 1 に記載の化合物又はその単一の異性体であって、場合によってはその薬学的に許容可能な塩、水和物、溶媒和物又は組合せである化合物。

【請求項 29】

<i>N</i> -{5-[(ジメチルアミノ)メチル]-2-メチルフェニル}-4-[[4-(4-フルオロフェニル)キナゾリン-2-イル]アミノ}ベンズアミド;
<i>N</i> -{5-[(ジメチルアミノ)メチル]-2-メチルフェニル}-4-[[4-(2-フルオロフェニル)キナゾリン-2-イル]アミノ}ベンズアミド;
4-[[4-(3-ブロモフェニル)キナゾリン-2-イル]アミノ]- <i>N</i> -{5-[(ジメチルアミノ)メチル]-2-メチルフェニル}ベンズアミド;
4-[[4-(4-クロロフェニル)キナゾリン-2-イル]アミノ]- <i>N</i> -{5-[(ジメチルアミノ)メチル]-2-メチルフェニル}ベンズアミド;
4-[[4-(2-クロロフェニル)キナゾリン-2-イル]アミノ]- <i>N</i> -{5-[(ジメチルアミノ)メチル]-2-メチルフェニル}ベンズアミド;
<i>N</i> -{5-[(ジメチルアミノ)メチル]-2-メチルフェニル}-4-[[4-(1-メチルエチル)キナゾリン-2-イル]アミノ}ベンズアミド;
4-[[4-(2,6-ジフルオロフェニル)キナゾリン-2-イル]アミノ]- <i>N</i> -{5-[(ジメチルアミノ)メチル]-2-メチルフェニル}ベンズアミド;
4-[[4-(2,4-ジフルオロフェニル)キナゾリン-2-イル]アミノ]- <i>N</i> -{5-[(ジメチルアミノ)メチル]-2-メチルフェニル}ベンズアミド;
4-[[4-(2-ブロモフェニル)キナゾリン-2-イル]アミノ]- <i>N</i> -{5-[(ジメチルアミノ)メチル]-2-メチルフェニル}ベンズアミド;
4-[[4-(2'-ブロモビフェニル-2-イル)キナゾリン-2-イル]アミノ]- <i>N</i> -{5-[(ジメチルアミノ)メチル]-2-メチルフェニル}ベンズアミド;
4-[[4-(3-クロロフェニル)キナゾリン-2-イル]アミノ]- <i>N</i> -{5-[(ジメチルアミノ)メチル]-2-メチルフェニル}ベンズアミド;
4-[[4-(3,5-ジクロロフェニル)キナゾリン-2-イル]アミノ]- <i>N</i> -{5-[(ジメチルアミノ)メチル]-2-メチルフェニル}ベンズアミド;
4-[[4-(2,3-ジクロロフェニル)キナゾリン-2-イル]アミノ]- <i>N</i> -{5-[(ジメチルアミノ)メチル]-2-メチルフェニル}ベンズアミド;
<i>N</i> -{5-[(ジメチルアミノ)メチル]-2-メチルフェニル}-4-[[4-(1-メチル-1 <i>H</i> -ピロール-2-イル)キナゾリン-2-イル]アミノ}ベンズアミド;
4-[[4-(2,4-ジクロロフェニル)キナゾリン-2-イル]アミノ]- <i>N</i> -{5-[(ジメチルアミノ)メチル]-2-メチルフェニル}ベンズアミド;
4-[[4-(3,4-ジクロロフェニル)キナゾリン-2-イル]アミノ]- <i>N</i> -{5-[(ジメチルアミノ)メチル]-2-メチルフェニル}ベンズアミド;
4-[[4-(2,5-ジクロロフェニル)キナゾリン-2-イル]アミノ]- <i>N</i> -{5-[(ジメチルアミノ)メチル]-2-メチルフェニル}ベンズアミド;
<i>N</i> -{5-[(ジメチルアミノ)メチル]-2-メチルフェニル}-4-[[4-(2-チエニル)キナゾリン-2-イル]アミノ}ベンズアミド;
<i>N</i> -{5-[(ジメチルアミノ)メチル]-2-メチルフェニル}-4-[[4-(4-ピリジン-2-イル)キナゾリン-2-イル]アミノ}ベンズアミド;
4-[[4-(3,5-ジフルオロフェニル)キナゾリン-2-イル]アミノ]- <i>N</i> -{5-[(ジメチルアミノ)メチル]-2-メチルフェニル}ベンズアミド;

4-メチル-3-[(4-{(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ}フェニル)カルボニル)アミノ]安息香酸;
N,4-ジメチル-N-(メチルオキシ)-3-[(4-{(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ}フェニル)カルボニル)アミノ]ベンズアミド;
N-ヒドロキシ-4-メチル-3-[(4-{(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ}フェニル)カルボニル)アミノ]ベンズアミド;
N-(5-アミノ-2-メチルフェニル)-4-{(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ}ベンズアミド;
N-{2-メチル-5-[(E)-(モルホリン-4-イルイミノ)メチル]フェニル}-4-{(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ}ベンズアミド;
N-(5-シアノ-2-メチルフェニル)-4-{(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ}ベンズアミド;
4-{[4-(4-{[3-(ジメチルアミノ)プロピル]アミノ}フェニル)キナゾリン-2-イル]アミノ}-N-(2,6-ジメチルフェニル)ベンズアミド;
4-メチル-3-[(4-{(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ}フェニル)カルボニル)アミノ]-N-1 <i>H</i> -テトラゾール-5-イルベンズアミド;
4-{[4-(4-フルオロフェニル)キナゾリン-2-イル]アミノ}-N-[2-メチル-5-(モルホリン-4-イルメチル)フェニル]ベンズアミド;
N-[2-メチル-5-(モルホリン-4-イルメチル)フェニル]-4-{(4-メチルキナゾリン-2-イル)アミノ}ベンズアミド;
N-[5-{(ジエチルアミノ)(イミノ)メチル}-2-メチルフェニル]-4-{(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ}ベンズアミド;
メチル 4-メチル-3-[(4-{(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ}フェニル)カルボニル)アミノ]ベンゼンカルボキシイミドアート;
4-{(4-エチルキナゾリン-2-イル)アミノ}-N-[2-メチル-5-(モルホリン-4-イルメチル)フェニル]ベンズアミド;
4-{(4-シクロプロピルキナゾリン-2-イル)アミノ}-N-[2-メチル-5-(モルホリン-4-イルメチル)フェニル]ベンズアミド;
4-{[4-(1-メチルエチル)キナゾリン-2-イル]アミノ}-N-[2-メチル-5-(モルホリン-4-イルメチル)フェニル]ベンズアミド;
4-{[4-(1-メチルエチル)キナゾリン-2-イル]アミノ}-N-(2-メチル-5-{[メチル(フェニルメチル)アミノ]メチル}フェニル)ベンズアミド;
N-(2-メチル-5-{[メチル(フェニルメチル)アミノ]メチル}フェニル)-4-{(4-メチルキナゾリン-2-イル)アミノ}ベンズアミド;
4-{(4-エチルキナゾリン-2-イル)アミノ}-N-(2-メチル-5-{[メチル(フェニルメチル)アミノ]メチル}フェニル)ベンズアミド;
N-[5-(アミノメチル)-2-メチルフェニル]-4-{[4-(4-クロロフェニル)キナゾリン-2-イル]アミノ}ベンズアミド;
N-(5-ホルミル-2-メチルフェニル)-4-{(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ}ベンズアミド;
2-フルオロ-N-[2-メチル-5-(モルホリン-4-イルメチル)フェニル]-4-{(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ}ベンズアミド;

3-フルオロ-*N*-[2-メチル-5-(モルホリン-4-イルメチル)フェニル]-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;

2-クロロ-*N*-[2-メチル-5-(モルホリン-4-イルメチル)フェニル]-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;及び

から選択される請求項 28 に記載の化合物又はその単一の異性体であって、場合によってはその薬学的に許容可能な塩、水和物、溶媒和物又は組合せである化合物。

【請求項 30】

R^1 が未置換のフェニルであり; n_1 が 0 であり; $R^{2,9}$ が $R^{9,b}$ であり、ここで、 $R^{9,b}$ は置換されていてもよいヘテロシクロアルキル、ジアルキルアミノアルキルオキシ、ヘテロシクロアルキルアルキルオキシ、 $-C(O)NR^{1,2}R^{1,2,a}$ 、 $-S(O)_2NR^{1,3}R^{1,3,a}$ 、 $-C(O)R^{1,4}$ 、置換されていてもよいヘテロアリール、 $-NR^{2,3}C(O)R^{2,3,a}$ 、又は $R^{1,1}$ で置換されたアルキルであり;

$R^{1,1}$ が、ヒドロキシ、 $-NR^{1,5}R^{1,5,a}$ (ここで、 $R^{1,5}$ は水素、アルキル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、又はヒドロキシアルキルであり、 $R^{1,5,a}$ は水素、アルキル、ハロアルキル、カルボキシアルキル、アミノカルボニルアルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、シクロアルキル、又はフェニルメチルである)、置換されていてもよいヘテロシクロアルキル、又は置換されていてもよいヘテロアリールであり;

$R^{1,2}$ が水素又はアルキルであり、 $R^{1,2,a}$ が水素、アルキル、ジアルキルアミノアルキル、置換されていてもよいヘテロシクロアルキル、置換されていてもよいヘテロシクロアルキルアルキル、又はヒドロキシアルキルであり;あるいは $R^{1,2}$ 及び $R^{1,2,a}$ はそれらが結合する窒素と共に、一のアルキル、ヒドロキシアルキル、シクロアルキルアルキル、置換されていてもよいヘテロアリールアルキル、又はフェニルアルキル(ここで、該フェニル環は一のハロで置換されていてもよい)で置換されていてもよいヘテロシクロアルキルを形成し;

$R^{1,3}$ が水素又はアルキルであり;

$R^{1,3,a}$ が水素、アルキル、又はジアルキルアミノアルキルであり;

$R^{1,4}$ が置換されていてもよいヘテロシクロアルキルアルキル又は置換されていてもよいヘテロアリールアルキルであり;

$R^{2,3}$ が水素又はアルキルであり;

$R^{2,3,a}$ がアミノアルキル、アルキルアミノアルキル、ジアルキルアミノアルキル、又はヘテロシクロアルキルアルキルである請求項 28 に記載の化合物又はその単一の異性体であって、場合によってはその薬学的に許容可能な塩、水和物、溶媒和物又は組合せである化合物。

【請求項 31】

<i>N</i> -{5-[(ジメチルアミノ)メチル]-2-メチルフェニル}-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -[2-メチル-5-(モルホリン-4-イルメチル)フェニル]-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -{2-メチル-5-[(4-メチルピペラジン-1-イル)メチル]フェニル}-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -(5-{[2-(ジメチルアミノ)エチル]オキシ}-2-メチルフェニル)-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -{2-メチル-5-[(3-モルホリン-4-イルプロピル)オキシ]フェニル}-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -(3-{[2-(ジメチルアミノ)エチル]オキシ}-2-メチルフェニル)-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -[2-メチル-5-(ピロリジン-1-イルメチル)フェニル]-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -{3-[(ジメチルアミノ)メチル]-2-メチルフェニル}-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -[2-(ジメチルアミノ)エチル]-4-メチル-3-[(4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]フェニル)カルボニル]アミノ]ベンズアミド;
<i>N,N</i> ,4-トリメチル-3-[(4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]フェニル)カルボニル]アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -[5-([2-(ジメチルアミノ)エチル]アミノ)スルホニル]-2-メチルフェニル]-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -{5-[(ジエチルアミノ)メチル]-2-メチルフェニル}-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -[2-メチル-5-(ピペリジン-1-イルメチル)フェニル]-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -(5-{[シクロヘキシル(メチル)アミノ]メチル}-2-メチルフェニル)-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
4-メチル- <i>N</i> -(3-モルホリン-4-イルプロピル)-3-[(4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]フェニル)カルボニル]アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -[2-メチル-5-(4-メチルピペラジン-1-イル)フェニル]-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
4-メチル- <i>N</i> -(2-モルホリン-4-イルエチル)-3-[(4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]フェニル)カルボニル]アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -[3-(ジメチルアミノ)プロピル]-4-メチル-3-[(4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]フェニル)カルボニル]アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -{5-[(2,6-ジメチルピペリジン-1-イル)メチル]-2-メチルフェニル}-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -{2-メチル-5-[(2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-1-イル)メチル]フェニル}-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;

<i>N</i> -(5-[[4-(シクロプロピルメチル)ピペラジン-1-イル]カルボニル]-2-メチルフェニル)-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -(2-メチル-5-[(4-[(1-メチル-1 <i>H</i> -イミダゾール-2-イル)メチル]ピペラジン-1-イル)カルボニル]フェニル)-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -(5-[[4-(フラン-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]カルボニル]-2-メチルフェニル)-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -(2-メチル-5-[[4-(フェニルメチル)ピペラジン-1-イル]カルボニル]フェニル)-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -(5-[[[(1,1-ジメチルエチル)アミノ]メチル]-2-メチルフェニル]-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -(5-(アゼパン-1-イルメチル)-2-メチルフェニル)-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -(2-メチル-5-[[[(1,1,3,3-テトラメチルブチル)アミノ]メチル]フェニル)-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -(2-メチル-5-[[[(フェニルメチル)アミノ]メチル]フェニル)-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -(5-(3,4-ジヒドロイソキノリン-2(1 <i>H</i>)-イルメチル)-2-メチルフェニル)-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -(2-メチル-5-[[メチル(フェニルメチル)アミノ]メチル]フェニル)-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -(2-メチル-5-[[[(1-メチルエチル)アミノ]メチル]フェニル)-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -(5-[[ビス(1-メチルエチル)アミノ]メチル]-2-メチルフェニル)-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -(5-[[エチル(メチル)アミノ]メチル]-2-メチルフェニル)-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -(5-[[エチル(1-メチルエチル)アミノ]メチル]-2-メチルフェニル)-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -(5-[1-(ジメチルアミノ)エチル]-2-メチルフェニル)-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -(2-メチル-5-(1-モルホリン-4-イルエチル)フェニル)-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -(2-メチル-5-(モルホリン-4-イルアセチル)フェニル)-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -(2-メチル-5-[(2-メチル-1 <i>H</i> -イミダゾール-1-イル)アセチル]フェニル)-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -(2-メチル-5-[[[(2-メチルプロピル)アミノ]メチル]フェニル)-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -(2-メチル-5-[[[(1-フェニルエチル)アミノ]メチル]フェニル)-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -(5-[[[(1,2-ジメチルプロピル)アミノ]メチル]-2-メチルフェニル)-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;

<i>N</i> -{5-[(4-エチルピペラジン-1-イル)カルボニル]-2-メチルフェニル}-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -[2-メチル-5-(ピペラジン-1-イルカルボニル)フェニル]-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -(5-{[4-(2-ヒドロキシエチル)ピペラジン-1-イル]カルボニル}-2-メチルフェニル)-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -(5-{1-[エチル(3,3,3-トリフルオロプロピル)アミノ]エチル}-2-メチルフェニル)-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -(5-{1-[ビス(3,3,3-トリフルオロプロピル)アミノ]エチル}-2-メチルフェニル)-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -(2-メチル-5-[[メチル(1-メチルエチル)アミノ]メチル}フェニル)-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -[5-(3,4-ジヒドロキノリン-1(2 <i>H</i>)-イルメチル)-2-メチルフェニル]-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -(2-メチル-5-[[1-(1-メチルプロピル)アミノ]メチル}フェニル)-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -[5-({4-[(4-フルオロフェニル)メチル]ピペラジン-1-イル}カルボニル)-2-メチルフェニル]-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -(2-メチル-5-[[4-(ピリジン-3-イルメチル)ピペラジン-1-イル]カルボニル}フェニル)-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -(2-メチル-5-[[4-(ピリジン-4-イルメチル)ピペラジン-1-イル]カルボニル}フェニル)-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -[2-メチル-5-(1 <i>H</i> -ピラゾール-5-イル)フェニル]-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -{5-[(シクロプロピルアミノ)メチル]-2-メチルフェニル}-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -{5-[(<i>N,N</i> -ジメチルグリシル)アミノ]-2-メチルフェニル}-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
1-({4-メチル-3-[(4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]フェニル}カルボニル)アミノ]フェニル}メチル)アゼチジン-3-カルボン酸;
<i>N</i> -(5-[[2-(ヒドロキシエチル)アミノ]メチル]-2-メチルフェニル)-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -(5-[[2-(ヒドロキシエチル)(メチル)アミノ]メチル]-2-メチルフェニル)-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
4-メチル- <i>N</i> -(8-メチル-8-アザビシクロ[3.2.1]オクタ-3-イル)-3-[(4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]フェニル}カルボニル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -(1,1-ジメチル-2-モルホリン-4-イルエチル)-4-メチル-3-[(4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]フェニル}カルボニル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -(2-ヒドロキシエチル)-4-メチル-3-[(4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]フェニル}カルボニル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -[5-(2,5-ジアザビシクロ[2.2.1]ヘプタ-2-イルカルボニル)-2-メチルフェニル]-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;

<i>N</i> -{5-[(エチルアミノ)メチル]-2-メチルフェニル}-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -{2-メチル-5-[(プロピルアミノ)メチル]フェニル}-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -[2-メチル-5-(1 <i>H</i> -テトラゾール-5-イル)フェニル]-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -[2-メチル-5-(1 <i>H</i> -1,2,4-トリアゾール-5-イル)フェニル]-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -(5-{[(1,3-ジメチルブチル)アミノ]メチル}-2-メチルフェニル)-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -[2-メチル-3-(モルホリン-4-イルメチル)フェニル]-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -[5-({2-ヒドロキシ-1-(ヒドロキシメチル)エチル}アミノ)メチル]-2-メチルフェニル]-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -[2-メチル-5-({2-(メチルオキシ)エチル}アミノ)メチル]フェニル]-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -(5-{[(2-ヒドロキシ-1,1-ジメチルエチル)アミノ]メチル}-2-メチルフェニル)-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -{5-[(4-アセチルピペラジン-1-イル)メチル]-2-メチルフェニル}-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -(5-{[4-(2,2-ジメチルプロパノイル)ピペラジン-1-イル]メチル}-2-メチルフェニル)-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -(5-{[ビス(2-ヒドロキシエチル)アミノ]メチル}-2-メチルフェニル)-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -[5-({ビス[2-(メチルオキシ)エチル]アミノ)メチル]-2-メチルフェニル]-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -(5-{[4-(シクロペンチルカルボニル)ピペラジン-1-イル]メチル}-2-メチルフェニル)-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -(2-メチル-5-{[4-(フェニルカルボニル)ピペラジン-1-イル]メチル}フェニル)-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -[2-メチル-5-({4-[(メチルオキシ)アセチル]ピペラジン-1-イル}メチル)フェニル]-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -[2-メチル-5-(1 <i>H</i> -ピラゾール-4-イル)フェニル]-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -[2-メチル-5-(2-メチル-2 <i>H</i> -テトラゾール-5-イル)フェニル]-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -[2-メチル-4-(1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル)フェニル]-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -(5-{[エチル(2,2,2-トリフルオロエチル)アミノ]メチル}-2-メチルフェニル)-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -[5-(7-アザビシクロ[2.2.1]ヘプタ-7-イルメチル)-2-メチルフェニル]-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;

<i>N</i> -(5-[[エチル(2-ヒドロキシエチル)アミノ]メチル]-2-メチルフェニル)-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -[5-(アミノメチル)-2-メチルフェニル]-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -{4-[(ジメチルアミノ)メチル]-2-メチルフェニル}-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -[2-メチル-5-(1-メチル-1 <i>H</i> -テトラゾール-5-イル)フェニル]-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -(4-[[エチル(1-メチルエチル)アミノ]メチル]-2-メチルフェニル)-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -(2-メチル-4-[[メチル(フェニルメチル)アミノ]メチル]フェニル)-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -{2-メチル-5-[(メチルアミノ)メチル]フェニル}-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -{4-[(ジエチルアミノ)メチル]-2-メチルフェニル}-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -[2-メチル-4-(モルホリン-4-イルメチル)フェニル]-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -(5-[[4-(シクロプロピルカルボニル)ピペラジン-1-イル]メチル]-2-メチルフェニル)-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -[4-(1 <i>H</i> -イミダゾール-1-イル)-2-メチルフェニル]-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -{3-[(ジエチルアミノ)メチル]-2-メチルフェニル}-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -[3-(アゼパン-1-イルメチル)-2-メチルフェニル]-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -{2-メチル-5-[(モルホリン-4-イルアセチル)アミノ]フェニル}-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -{2-メチル-5-[(2-モルホリン-4-イルエチル)オキシ]フェニル}-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
4-メチル-3-[(4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]フェニル)カルボニル]アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -{5-[(8 <i>aR</i>)-ヘキサヒドロピロロ[1,2- <i>a</i>]ピラジン-2(1 <i>H</i>)-イルカルボニル]-2-メチルフェニル}-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -{5-[(8 <i>aS</i>)-ヘキサヒドロピロロ[1,2- <i>a</i>]ピラジン-2(1 <i>H</i>)-イルカルボニル]-2-メチルフェニル}-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -(4-[[2-ヒドロキシエチル]アミノ]メチル)-2-メチルフェニル)-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -(4-[[エチル(2-ヒドロキシエチル)アミノ]メチル]-2-メチルフェニル)-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -[5-(1 <i>H</i> -イミダゾール-1-イル)-2-メチルフェニル]-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;

<i>N</i> -{2-メチル-5-[(2-メチルアラニル)アミノ]フェニル}-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -{5-[(<i>N,N</i> -ジエチルグリシル)アミノ]-2-メチルフェニル}-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -(5-{[(シクロプロピル(メチル)アミノ)メチル]-2-メチルフェニル}-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -[5-(ヒドロキシメチル)-2-メチルフェニル]-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -{5-[(シクロペンチルアミノ)メチル]-2-メチルフェニル}-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド; 及び

から選択される請求項 30 に記載の化合物又はその単一の異性体であって、場合によってはその薬学的に許容可能な塩、水和物、溶媒和物又は組合せである化合物。

【請求項 32】

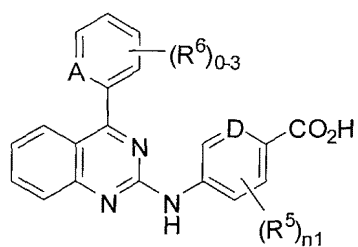
<i>N</i> -(2-メチル-5-ニトロフェニル)-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]- <i>N</i> -(1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-7-イル)ベンズアミド;
<i>N</i> -(2,6-ジメチルフェニル)-4-[[4-(1-メチルピペリジン-4-イル)キナゾリン-2-イル]アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -[2-メチル-5-(モルホリン-4-イルメチル)フェニル]-4-[(4-モルホリン-4-イルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -(2,6-ジメチルフェニル)-4-[(4-モルホリン-4-イルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -(2,6-ジメチルフェニル)-4-[(4-フェニルピリド[2,3- <i>d</i>]ピリミジン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -(2,6-ジメチルフェニル)-4-[(4-フェニル-5,6,7,8-テトラヒドロピリド[3,4- <i>d</i>]ピリミジン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -(2,6-ジメチルフェニル)-4-[[4-フェニル-7-(フェニルメチル)-5,6,7,8-テトラヒドロピリド[3,4- <i>d</i>]ピリミジン-2-イル]アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -(2,6-ジメチルフェニル)-4-[[4-フェニル-6-(フェニルメチル)-5,6,7,8-テトラヒドロピリド[4,3- <i>d</i>]ピリミジン-2-イル]アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -(2,6-ジメチルフェニル)-4-[(4-フェニル-5,6,7,8-テトラヒドロピリド[4,3- <i>d</i>]ピリミジン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -(2,6-ジメチルフェニル)-2-(4-メチルピペラジン-1-イル)-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -(2,6-ジメチルフェニル)-2-[(1-メチルピペリジン-4-イル)アミノ]-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -(2,6-ジメチルフェニル)-2-[(2-モルホリン-4-イルエチル)オキシ]-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -(2,6-ジメチルフェニル)-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]-2-[(2-ピロリジン-1-イルエチル)オキシ]ベンズアミド;
<i>N</i> -(2,6-ジメチルフェニル)-3-[(2-モルホリン-4-イルエチル)オキシ]-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -(2,6-ジメチルフェニル)-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]-3-[(2-ピロリジン-1-イルエチル)オキシ]ベンズアミド;
<i>N</i> -(2,6-ジメチルフェニル)-4-[(7-[(3-モルホリン-4-イルプロピル)オキシ]-4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド; 及び

から選択される化合物又はその単一の異性体であって、場合によってはその薬学的に許容可能な塩、水和物、溶媒和物又は組合せである化合物。

【請求項 33】

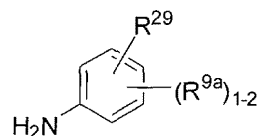
請求項 1 から 32 の何れかに記載の化合物の製造方法であって、

a . 式 8 の中間体、又はその塩、水和物、溶媒和物又は組合せ :



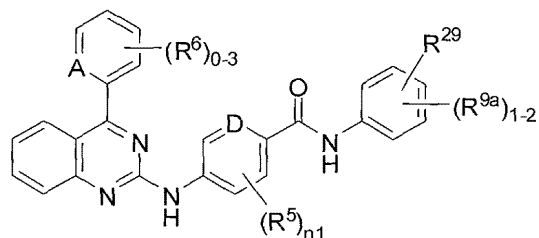
8

(該式中、A及びDはCH又はNである)を、式9



9

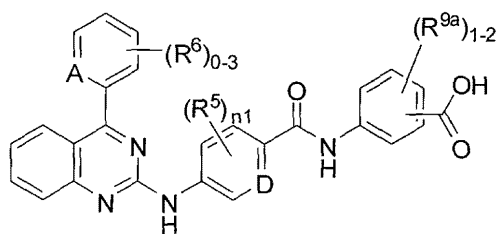
の中間体と反応させて、式XI:



XI

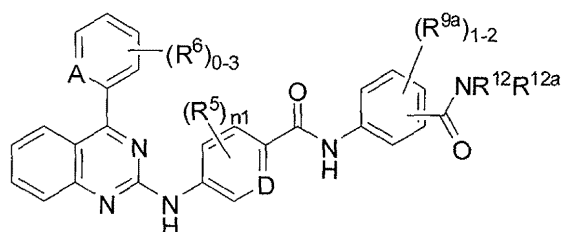
の化合物を得、場合によっては個々の異性体を分離し；場合によっては R^6 、 R^{29} 、及び R^{9a} 基の何れかを変更し；場合によってはその薬学的に許容可能な塩、水和物、溶媒和物又は組合せを形成し；又は

b. 式11の中間体、又はその塩、水和物、溶媒和物又は組合せ：



11

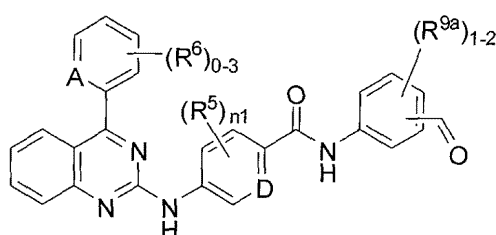
(該式中、A及びDは独立してCH又はNである)を、式NHR¹²R^{12a}の中間体と反応させて、式8f



8f

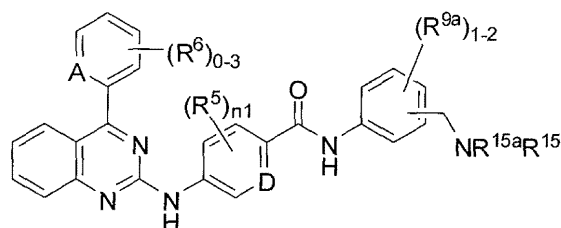
の化合物を得、場合によっては個々の異性体を分離し；場合によっては R^6 、 R^{9a} 、及び R^{12b} 基の何れかを変更し；場合によってはその薬学的に許容可能な塩、水和物、溶媒和物又は組合せを形成し；又は

c．式 13 の中間体、又はその塩、水和物、溶媒和物又は組合せ：



13

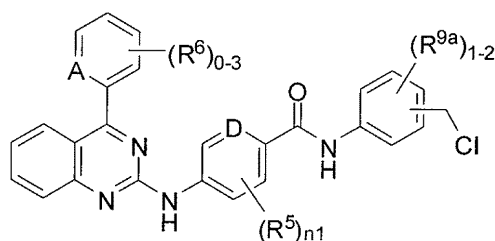
(該式中、A 及び D は独立して CH 又は N である) を、式 $NHR^{15}R^{15a}$ の中間体と反応させて、式 XII



XII

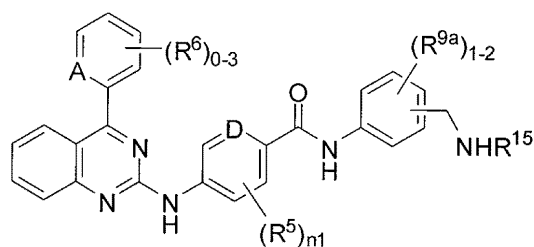
の化合物を得、場合によっては個々の異性体を分離し；場合によっては R^6 、 R^{9a} 、及び R^{15} 基の何れかを変更し；場合によってはその薬学的に許容可能な塩、水和物、溶媒和物又は組合せを形成し；又は

d．式 15a の中間体、又はその塩、水和物、溶媒和物又は組合せ：



15a

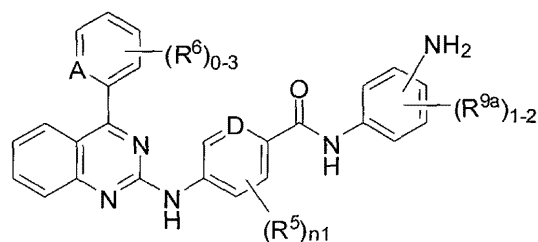
(該式中、A 及び D は独立して CH 又は N である) を、式 NH_2R^{15} の中間体と反応させて、式 XII I



XIII

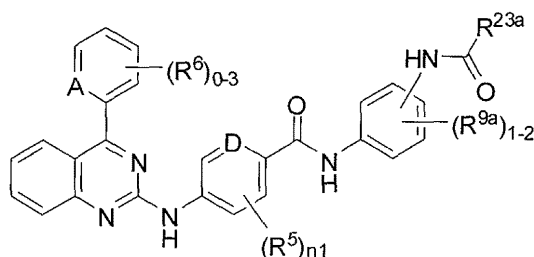
の化合物を得、場合によっては個々の異性体を分離し；場合によっては R^6 、 R^{9a} 、及び R^{15} 基の何れかを変更し；場合によってはその薬学的に許容可能な塩、水和物、溶媒和物又は組合せを形成し；又は

e. 式 23 の中間体、又はその塩、水和物、溶媒和物又は組合せ：



23

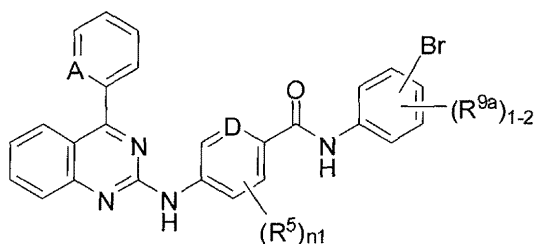
(該式中、A 及び D は独立して CH 又は N である) を、式 $R^{23a}C(O)OH$ 又は $R^{23a}C(O)Cl$ の中間体と反応させて、式 XIV



XIV

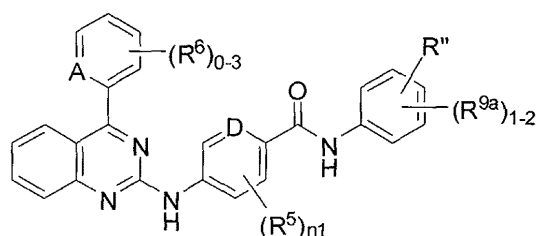
の化合物を得、場合によっては個々の異性体を分離し；場合によっては R^6 、 R^{9a} 、及び R^{23a} 基の何れかを変更し；場合によってはその薬学的に許容可能な塩、水和物、溶媒和物又は組合せを形成し；又は

f. 式 26 の中間体、又はその塩、水和物、溶媒和物又は組合せ：



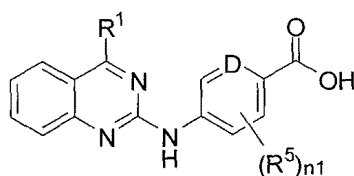
26

(該式中、A 及び D は独立して CH 又は N である) を、式 $R''B(OH)_2$ (該式中、 R'' は置換されていてもよいヘテロアリールである) の中間体と反応させて、式 XV：

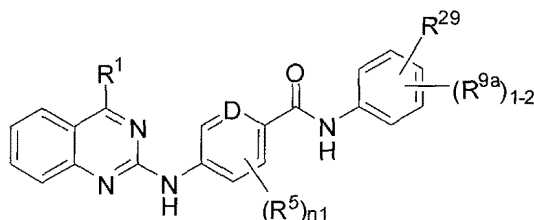
**XV**

の化合物を得、場合によっては個々の異性体を分離し；場合によっては R^6 、 R^{9a} 、及び R'' 基の何れかを変更し；場合によってはその薬学的に許容可能な塩、水和物、溶媒和物又は組合せを形成し；又は

g. 式 31 の中間体、又はその塩、水和物、溶媒和物又は組合せ

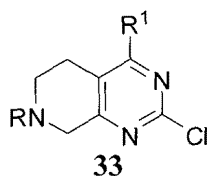
**31**

(該式中、 R^1 はシクロアルキルであり、D は CH 又は N である) を、上述の式 9 の中間体と反応させて、式 XVI

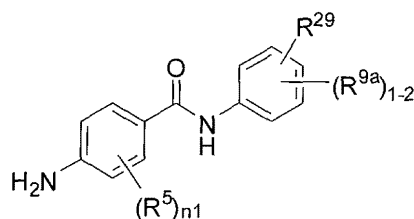
**XVI**

(該式中、 R^{29} 及び R^{9a} は式 I の化合物に対して発明の概要において定義された通りである) の本発明の化合物を得；場合によっては個々の異性体を分離し；場合によっては R^6 、 R^1 、 R^{9a} 、及び R^{29} 基の何れかを変更し；場合によってはその薬学的に許容可能な塩、水和物、溶媒和物又は組合せを形成し；又は

h. 式 33 の中間体、又はその塩、水和物、溶媒和物又は組合せ

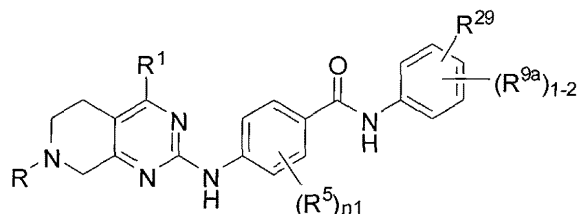
**33**

(該式中、 R^1 はフェニル又はヘテロアリールであり、その各々がー、二、又は三の R^6 で置換されていてもよく、R はアルキル、アルコキシカルボニル、ベンジルオキシカルボニル、及び置換されていてもよいフェニルアルキルである) を、式 34



34

(該式中、 R^{29} 及び R^{9a} は式 I の化合物に対して発明の概要において定義された通りである) の中間体又はその塩、水和物、溶媒和物又は組合せと反応させて、式 XVIIa



XVIIa

の本発明の化合物を得、場合によっては個々の異性体を分離し；場合によっては R 、 R^6 、 R^1 、 R^{9a} 、及び R^{29} 基の何れかを変更し；場合によってはその薬学的に許容可能な塩、水和物、溶媒和物又は組合せを形成する、ことを含む方法。

【請求項 34】

請求項 1 から 32 の何れか一項に記載の化合物又はその単一の異性体であって、場合によってはその薬学的に許容可能な塩、水和物、溶媒和物又は組合せである化合物、及び薬学的に許容可能な担体、賦形剤、又は希釈剤を含有する組成物。

【請求項 35】

ヘッジホッグ経路のタンパク質によって媒介される疾患を治療する方法であって、該疾患を有する患者に、治療的有効量の請求項 1 から 32 の何れか一項に記載の化合物又はその単一の異性体であって、場合によってはその薬学的に許容可能な塩、水和物、溶媒和物又は組合せである化合物、及び薬学的に許容可能な担体、賦形剤、又は希釈剤を投与することを含む方法。

【請求項 36】

疾患が増殖性疾患である請求項 35 に記載の方法。

【請求項 37】

疾患が癌である請求項 35 に記載の方法。

【請求項 38】

癌が、基底細胞癌、髄芽細胞腫、横紋筋肉腫、膵臓癌、乳癌、髄膜腫、膠芽細胞腫、メラノーマ、胃癌、食道癌、胆道癌、前立腺癌、小細胞肺癌、非小細胞肺癌、グリア細胞癌、多発性骨髄腫、慢性骨髄性白血病、精巣癌、卵巣癌、及び大腸癌から選択される請求項 37 に記載の方法。

【請求項 39】

癌が、胃癌である請求項 37 に記載の方法。

【請求項 40】

癌が、食道癌である請求項 37 に記載の方法。

【請求項 41】

癌が、多発性骨髄腫である請求項 37 に記載の方法。

【請求項 42】

癌が、小細胞肺癌である請求項 3 7 に記載の方法。

【請求項 4 3】

癌が、慢性骨髄性白血病である請求項 3 7 に記載の方法。

【請求項 4 4】

薬学的に許容可能な塩、水和物、溶媒和物又はその組み合わせであってもよい、N - [2 - メチル - 5 - (モルフォリン - 4 - イルメチル) フェニル] - 4 - [(4 - フェニルキナゾリン - 2 - イル) アミノ] ベンズアミドと名前を付けた請求項 3 1 に記載の化合物。

【請求項 4 5】

薬学的に許容可能な塩、水和物、溶媒和物又はその組み合わせであってもよい、N - { 5 - [(ジメチルアミノ) メチル] - 2 - メチルフェニル } - 4 - [(4 - フェニルキナゾリン - 2 - イル) アミノ] ベンズアミドと名前を付けた請求項 3 1 に記載の化合物。

【請求項 4 6】

薬学的に許容可能な塩、水和物、溶媒和物又はその組み合わせであってもよい、N - { 2 - メチル - 5 - [(メチルアミノ) メチル] フェニル } - 4 - [(4 - フェニルキナゾリン - 2 - イル) アミノ] ベンズアミドと名前を付けた請求項 3 1 に記載の化合物。

【請求項 4 7】

薬学的に許容可能な塩、水和物、溶媒和物又はその組み合わせであってもよい、4 - { [4 - (4 - クロロフェニル) キナゾリン - 2 - イル] アミノ } - N - { 5 - [(ジメチルアミノ) メチル] - 2 - メチルフェニル } ベンズアミドと名前を付けた請求項 3 1 に記載の化合物。

【請求項 4 8】

薬学的に許容可能な塩、水和物、溶媒和物又はその組み合わせであってもよい、N - { 5 - [(シクロプロピルアミノ) メチル] - 2 - メチルフェニル } - 4 - [(4 - フェニルキナゾリン - 2 - イル) アミノ] ベンズアミドと名前を付けた請求項 3 1 に記載の化合物。

【請求項 4 9】

薬学的に許容可能な塩、水和物、溶媒和物又はその組み合わせであってもよい、N - { 5 - [(N , N - ジメチルグリシル) アミノ] - 2 - メチルフェニル } - 4 - [(4 - フェニルキナゾリン - 2 - イル) アミノ] ベンズアミドと名前を付けた請求項 3 1 に記載の化合物。

【請求項 5 0】

薬学的に許容可能な塩、水和物、溶媒和物又はその組み合わせであってもよい、N - [2 - メチル - 5 - (モルフォリン - 4 - イルメチル) フェニル] - 4 - [(4 - フェニルキナゾリン - 2 - イル) アミノ] ベンズアミドと名前を付けた請求項 3 7 から 4 3 に記載の方法。

【請求項 5 1】

薬学的に許容可能な塩、水和物、溶媒和物又はその組み合わせであってもよい、N - { 5 - [(ジメチルアミノ) メチル] - 2 - メチルフェニル } - 4 - [(4 - フェニルキナゾリン - 2 - イル) アミノ] ベンズアミドと名前を付けた請求項 3 7 から 4 3 に記載の方法。

【請求項 5 2】

薬学的に許容可能な塩、水和物、溶媒和物又はその組み合わせであってもよい、N - { 2 - メチル - 5 - [(メチルアミノ) メチル] フェニル } - 4 - [(4 - フェニルキナゾリン - 2 - イル) アミノ] ベンズアミドと名前を付けた請求項 3 7 から 4 3 に記載の方法。

【請求項 5 3】

薬学的に許容可能な塩、水和物、溶媒和物又はその組み合わせであってもよい、4 - { [4 - (4 - クロロフェニル) キナゾリン - 2 - イル] アミノ } - N - { 5 - [(ジメチルアミノ) メチル] - 2 - メチルフェニル } ベンズアミドと名前を付けた請求項 3 7 から 4 3 に記載の方法。

【請求項 5 4】

薬学的に許容可能な塩、水和物、溶媒和物又はその組み合わせであってもよい、N - { 5 - [(シクロプロピルアミノ) メチル] - 2 - メチルフェニル } - 4 - [(4 - フェニルキナゾリン - 2 - イル) アミノ] ベンズアミドと名前を付けた請求項 3 7 から 4 3 に記載の方法。

【請求項 55】

薬学的に許容可能な塩、水和物、溶媒和物又はその組み合わせであってもよい、N - { 5 - [(N , N - ジメチルグリシル) アミノ] - 2 - メチルフェニル } - 4 - [(4 - フェニルキナゾリン - 2 - イル) アミノ] ベンズアミドと名前を付けた請求項 37 から 43 に記載の方法。