

【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 07 D 239/84	(2006.01)
A 61 K 31/517	(2006.01)
A 61 K 31/5377	(2006.01)
C 07 D 403/12	(2006.01)
C 07 D 401/12	(2006.01)
C 07 D 401/14	(2006.01)
C 07 D 413/14	(2006.01)
C 07 D 403/04	(2006.01)
C 07 D 417/12	(2006.01)
C 07 D 409/04	(2006.01)
C 07 D 405/04	(2006.01)
C 07 D 413/12	(2006.01)
A 61 K 31/553	(2006.01)
C 07 D 405/12	(2006.01)
A 61 K 31/55	(2006.01)
C 07 D 413/04	(2006.01)
C 07 D 451/04	(2006.01)
C 07 D 487/08	(2006.01)
C 07 D 409/12	(2006.01)
C 07 D 487/04	(2006.01)
A 61 K 31/519	(2006.01)
C 07 D 471/04	(2006.01)
C 07 D 239/70	(2006.01)
A 61 P 43/00	(2006.01)
A 61 P 35/00	(2006.01)

【F I】

C 07 D 239/84	C S P
A 61 K 31/517	
A 61 K 31/5377	
C 07 D 403/12	
C 07 D 401/12	
C 07 D 401/14	
C 07 D 413/14	
C 07 D 403/04	
C 07 D 417/12	
C 07 D 409/04	
C 07 D 405/04	
C 07 D 413/12	
A 61 K 31/553	
C 07 D 405/12	
A 61 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

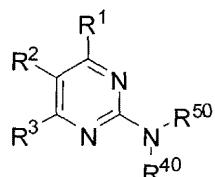
【補正方法】変更

【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、

R¹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R⁶で置換されていてもよく；

R²及びR³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

R²及びR³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

R²及びR³は、それらが結合するピリミジニルと共に6,7-ジヒドロ-5H-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-5H-シクロヘプタ[d]ピリミジニルを形成し；あるいは

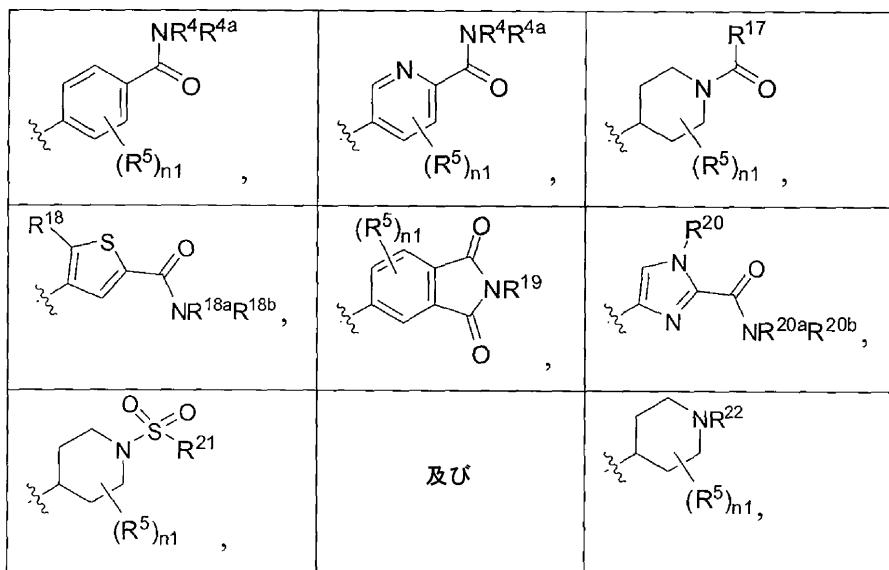
R²及びR³は、それらが結合するピリミジニルと共に、アルキル、アルコキシカルボニル、ベンジルオキシカルボニル、及び置換されていてもよいフェニルアルキルから独立して選択される一又は二の基で5位、6位、7位及び8位がそれぞれ置換されていてもよ

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；

R^4 は水素又はアルキルであり；

R 5 0 は



から選択され；

n_1 は 0、1、又は 2 であり；

R^5 が存在する場合、各 R^5 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 R^5 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^4 は水素又はアルキルであり；

R^4 は、一の R^8 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； R^4 は一の 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^4 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 R^4 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^{1-7} 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—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 R^{1-7} 中の基の一部として、一、二、又は三の R^{9-a} で置換され；

R^{1~8}は水素、ハロ、又はアルキルであり；

R¹⁸^aは水素又はアルキルであり；

R¹⁸^bは一、二、又は三のR⁸^aで置換されたヘテロアリールであるか、あるいはR¹⁸^bは一、二、又は三のR⁹^aで置換されたフェニルであり；

R¹⁹は一、二、又は三のR⁹^aで置換されたフェニルであるか、あるいはR¹⁹は一、二、又は三のR⁸^aで置換されたヘテロアリールであり；

R²⁰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；

R²⁰^aは水素又はアルキルであり；

R²⁰^bは一、二、又は三のR⁸^aで置換されたヘテロアリールであるか、あるいはR²⁰^bは一、二、又は三のR⁹^aで置換されたフェニルであり；

R²¹は、一、二、又は三のR⁹^aで置換されたフェニルであるか、あるいはR²¹は一、二、又は三のR⁸^aで置換されたヘテロアリールであり；あるいはR²¹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；

R²²は、一、二、又は三のR⁹^aで置換されたフェニルであるか、あるいはR²²は一、二、又は三のR⁸^aで置換されたヘテロアリールであり；

各R⁸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R⁹^bから独立して選択され；

各R⁸^aは独立して水素、ハロ、又はR⁸であり；

各R⁹^aは独立して水素、R⁹^b、又はR⁹^cであり；

R²⁹はR⁹^b又はR⁹^cであり；但し、R¹がヘテロシクロアルキルであるとき、R¹が未置換フェニルであるとき、及びR¹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R⁶で置換されたフェニルであるとき、R²⁹はR⁹^bであり；

各R⁹^bは、R⁹^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)R¹⁴；-CR¹⁴^a(=NR¹⁴^b)；-C(=NR²⁴)R²⁴^a；-S(O)₂NR¹³R¹³^a；-NR²³C(O)R²³^a；-C(O)NR¹²R¹²^a、又は一又は二のR¹¹で置換されたアルキルであり；

各R⁹^cは、R⁹^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R¹¹は、ヒドロキシ、-NR¹⁵R¹⁵^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；

R¹²は水素又はアルキルであり；R¹²^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R¹²及びR¹²^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；

R¹³は水素又はアルキルであり；

R¹³^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R¹⁴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

いへテロアリールアルキル、又は置換されていてもよいへ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へ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へ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、R² 及び R³ 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]-N-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]-N-[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]-N-[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]-N-(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]-N-[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]-N-(4-メチルピロリジン-3-イル)ベンズアミド;
N-(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]-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;
4-[(6-クロロ-4-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; 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】

R² 及び R³ 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】

R¹ 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】

R¹ が一、二、又は三の R⁶ 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】

R¹ が一、二、又は三の R⁶ 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】

R¹ が一又は二の R⁶ で置換されたフェニルであり、ここで、各 R⁶ 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】

R¹ 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。

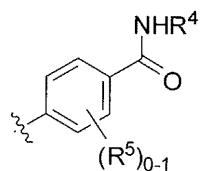
【請求項 1 1】

<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> -イソインドール-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】

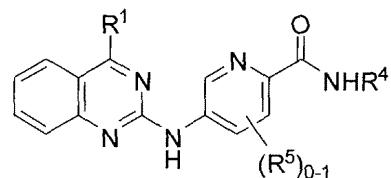
R⁵ が



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】

N-(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;
N-(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;
N-(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;
N-(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;
N-(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;
N-(3-シクロプロピル-1H-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;
N-[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;
N-(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]-N-(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】

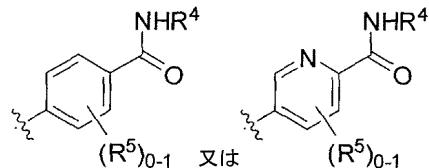
R⁴ がーの R²~⁹ で置換されたフェニルである請求項 1 2 又は 1 3 に記載の化合物又はその単一の異性体であって、場合によってはその薬学的に許容可能な塩、水和物、溶媒和物又は組合せである化合物。

【請求項 1 7】

各 R⁹ 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】

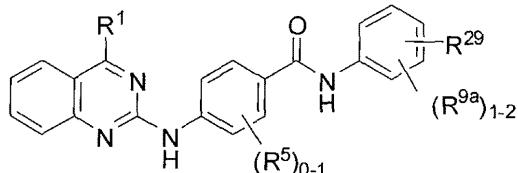
R^1 がアルキル、シクロアルキル、又はヘテロアリールであり、該シクロアルキル及びヘテロアリールが一、二、又は三の R^6 で置換されていてもよく； $R^{5,0}$ が



であり； R^4 が一の $R^{2,9}$ で置換され、更に一又は二の $R^{9,a}$ で置換されたフェニルであり； $R^{2,9}$ が $R^{9,c}$ であり；各 $R^{9,a}$ が独立して水素又は $R^{9,c}$ 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】

N -(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]- N -(2,6-ジメチルフェニル)ベンズアミド；
N -[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；
N -[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-シクロヘキシリルキナゾリン-2-イル)アミノ]- N -(2,6-ジメチルフェニル)ベンズアミド；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； $R^{2,9}$ が $R^{9,c}$ であり、ここで、 $R^{9,c}$ はアルキルであり；各 $R^{9,a}$ が独立して水素又は $R^{9,c}$ であり、ここで、 $R^{9,c}$ 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； $R^{2\ 9}$ が $R^{9\ c}$ であり、ここで、 $R^{9\ c}$ はアルキルであり； $R^{9\ a}$ が水素又は $R^{9\ c}$ であり、ここで、 $R^{9\ c}$ 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 $R^{9\ a}$ が独立して水素又はアルキルであり； $R^{2\ 9}$ が $R^{9\ b}$ 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】

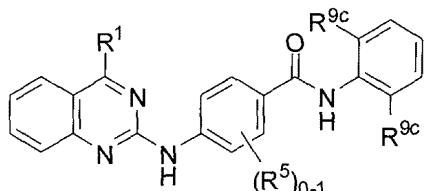
$R^{9\ b}$ が置換されていてもよいヘテロシクロアルキル、ジアルキルアミノアルキルオキシ、ヘテロシクロアルキルアルキルオキシ、 $-C(O)NR^{1\ 2}R^{1\ 2\ a}$ 、 $-S(O)_2$ 、 $NR^{1\ 3}R^{1\ 3\ a}$ 、 $-C(O)R^{1\ 4}$ 、置換されていてもよいヘテロアリール、 $-NR^{2\ 3}C(O)R^{2\ 3\ a}$ 、又は一の $R^{1\ 1}$ で置換されたアルキルである請求項 22 又は 23 に記載の化合物又はその単一の異性体であって、場合によってはその薬学的に許容可能な塩、水和物、溶媒和物又は組合せである化合物。

【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 II



（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。

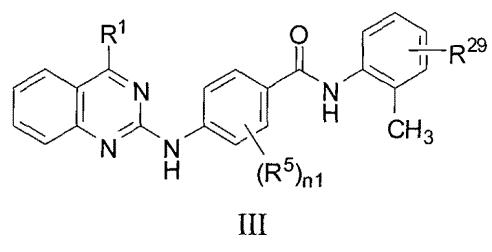
【請求項 27】

<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-[(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 2 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 2 8】

式 I I I



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 2 9】

<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-プロモフェニル)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-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-1H-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-(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； $R^{2\ b}$ 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,4</i> -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-[(シクロヘキシリル(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-{{[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> -{[(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-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-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> -{[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-[(8aR)-ヘキサヒドロピロ口[1,2-a]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-[(8aS)-ヘキサヒドロピロ口[1,2-a]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】

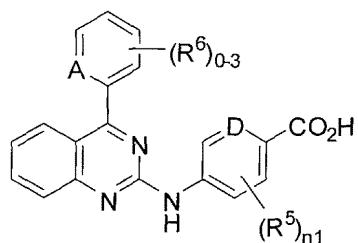
<i>N</i> -(2-メチル-5-ニトロフェニル)-4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
4-[(4-フェニルキナゾリン-2-イル)アミノ]- <i>N</i> -(1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-7-イル)ベンズアミド;
<i>N</i> -(2,6-ジメチルフェニル)-4-{[4-(1-メチルピペリジン-4-イル)キナゾリン-2-イル]アミノ}ベンズアミド;
<i>N</i> -[2-メチル-5-(モルホリン-4-イルメチル)フェニル]-4-[(4-モルホリン-4-イルキナゾリン-2-イル)アミノ]ベンズアミド;
<i>N</i> -(2,6-ジメチルフェニル)-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-d]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-d]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-d]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-d]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-d]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。

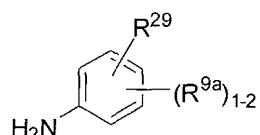
【請求項 3 3】

請求項 1 から 3 2 の何れかに記載の化合物の製造方法であって、

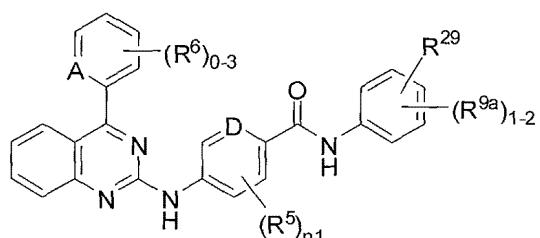
a . 式 8 の中間体、又はその塩、水和物、溶媒和物又は組合せ：



(該式中、A及びDはC H又はNである)を、式9

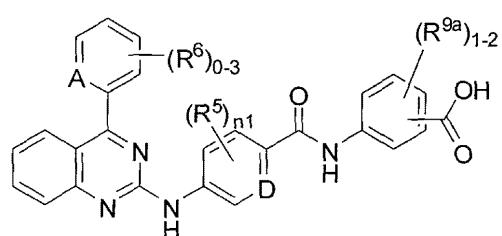


の中間体と反応させて、式X I :

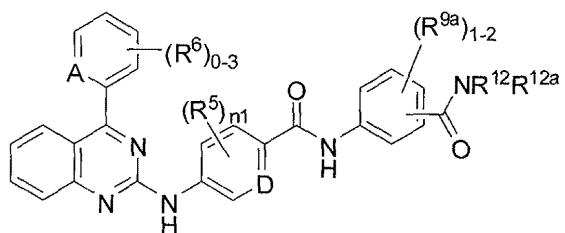


の化合物を得、場合によっては個々の異性体を分離し；場合によってはR⁶、R²⁻⁹、及びR^{9a}基の何れかを変更し；場合によってはその薬学的に許容可能な塩、水和物、溶媒和物又は組合せを形成し；又は

b. 式11の中間体、又はその塩、水和物、溶媒和物又は組合せ：



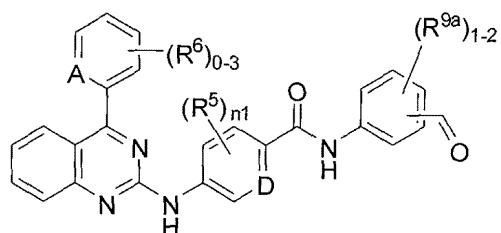
(該式中、A及びDは独立してC H又はNである)を、式N H R¹⁻² R¹⁻²aの中間体と反応させて、式8 f



8f

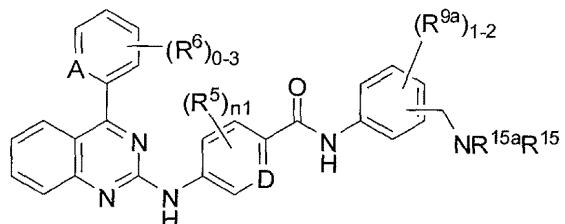
の化合物を得、場合によっては個々の異性体を分離し；場合によってはR⁶、R^{9a}、及びR¹⁻²^b基の何れかを変更し；場合によってはその薬学的に許容可能な塩、水和物、溶媒和物又は組合せを形成し；又は

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

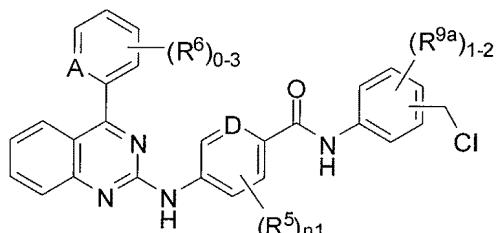
(該式中、A及びDは独立してCH又はNである)を、式NH₂R¹⁻⁵R^{1-5a}の中間体と反応させて、式XII



XII

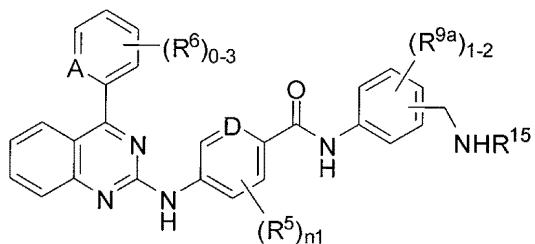
の化合物を得、場合によっては個々の異性体を分離し；場合によってはR⁶、R^{9a}、及びR¹⁻⁵基の何れかを変更し；場合によってはその薬学的に許容可能な塩、水和物、溶媒和物又は組合せを形成し；又は

d. 式15aの中間体、又はその塩、水和物、溶媒和物又は組合せ：



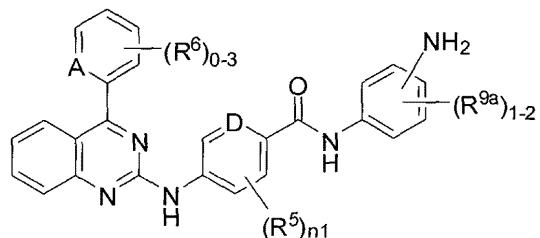
15a

(該式中、A及びDは独立してCH又はNである)を、式NH₂R¹⁻⁵の中間体と反応させて、式XIII



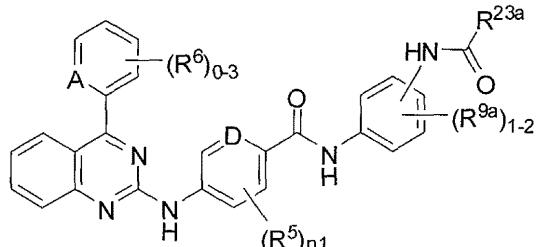
の化合物を得、場合によっては個々の異性体を分離し；場合によってはR⁶、R^{9a}、及びR¹⁵基の何れかを変更し；場合によってはその薬学的に許容可能な塩、水和物、溶媒和物又は組合せを形成し；又は

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

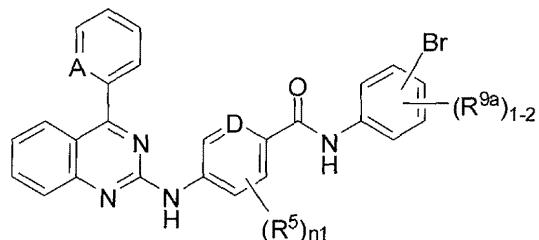
(該式中、A及びDは独立してCH又はNである)を、式R²₃^aC(O)OH又はR²₃^aC(O)Clの中間体と反応させて、式XIV



XIV

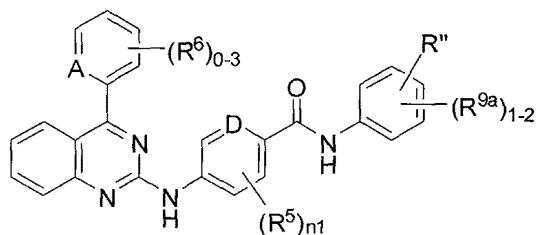
の化合物を得、場合によっては個々の異性体を分離し；場合によってはR⁶、R^{9a}、及びR²₃^a基の何れかを変更し；場合によってはその薬学的に許容可能な塩、水和物、溶媒和物又は組合せを形成し；又は

f. 式26の中間体、又はその塩、水和物、溶媒和物又は組合せ：



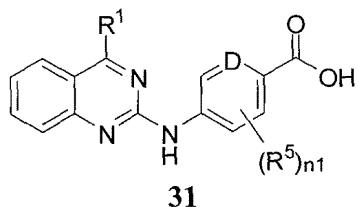
26

(該式中、A及びDは独立してCH又はNである)を、式R"Br(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：

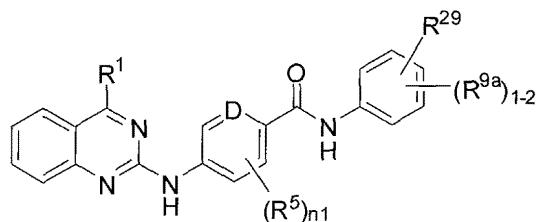


の化合物を得、場合によっては個々の異性体を分離し；場合によってはR⁶、R^{9a}、及びR["]基の何れかを変更し；場合によってはその薬学的に許容可能な塩、水和物、溶媒和物又は組合せを形成し；又は

g. 式31の中間体、又はその塩、水和物、溶媒和物又は組合せ



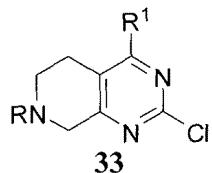
(該式中、R¹はシクロアルキルであり、DはC H又はNである)を、上述の式9の中間体と反応させて、式XVI



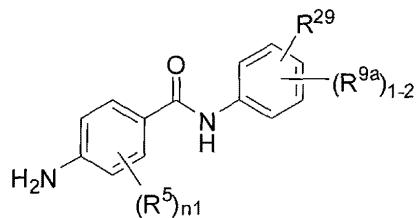
XVI

(該式中、R²⁹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R⁶、R¹、R^{9a}、及びR²⁹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

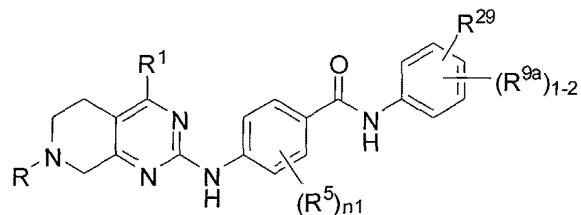
h. 式33の中間体、又はその塩、水和物、溶媒和物又は組合せ



(該式中、R¹はフェニル又はヘテロアリールであり、その各々が一、二、又は三のR⁶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



(該式中、 $R^{2,9}$ 及び $R^{9,a}$ 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



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 、 $R^{9,a}$ 、及び $R^{2,9}$ 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 3 4】

請求項 1 から 3 2 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 3 5】

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、該疾患有する患者に、治療的有効量の請求項 1 から 3 2 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 3 6】

疾患が増殖性疾患である請求項 3 5 に記載の方法。

【請求項 3 7】

疾患が癌である請求項 3 5 に記載の方法。

【請求項 3 8】

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 3 7 に記載の方法。

【請求項 3 9】

癌が、胃癌である請求項 3 7 に記載の方法。

【請求項 4 0】

癌が、食道癌である請求項 3 7 に記載の方法。

【請求項 4 1】

癌が、多発性骨髄腫である請求項 3 7 に記載の方法。

【請求項 4 2】

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、慢性骨髓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 5 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-[(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 7 から 4 3 に記載の
方法。