

【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18年1月5日(2006.1.5)

【公表番号】特表2005-505535(P2005-505535A)

【公表日】平成17年2月24日(2005.2.24)

【年通号数】公開・登録公報2005-008

【出願番号】特願2003-522539(P2003-522539)

【国際特許分類】

C 07 D 401/12	(2006.01)
A 61 K 31/506	(2006.01)
A 61 K 31/5377	(2006.01)
A 61 P 35/00	(2006.01)
A 61 P 43/00	(2006.01)
C 07 D 401/14	(2006.01)
C 07 D 403/12	(2006.01)
C 07 D 405/14	(2006.01)
C 07 D 413/14	(2006.01)
C 07 D 417/14	(2006.01)
C 07 D 471/04	(2006.01)

【F I】

C 07 D 401/12	
A 61 K 31/506	
A 61 K 31/5377	
A 61 P 35/00	
A 61 P 43/00	1 1 1
C 07 D 401/14	
C 07 D 403/12	
C 07 D 405/14	
C 07 D 413/14	
C 07 D 417/14	
C 07 D 471/04	1 0 8 E

【手続補正書】

【提出日】平成17年6月22日(2005.6.22)

【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

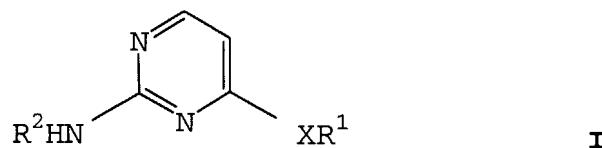
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

R¹が、4-アミノ-2-メチルキノール-6-イルである時、およびXが、NHである時、R²が、4-アミノ-2-メチルキノール-6-イルでないことを条件とする、下記式I:

【化1】



(式中、

Xは、S、O、またはNHであり；

R¹は、キノリル、イソキノリル、ブリニル、ベンズチアゾリル、ベンゾオキサジアゾリル、ベンゾチアジアゾリル、ベンズイソオキサゾリル、ベンズイソチアゾリル、ベンゾトリアゾリル、インドリジニル、ベンゾオキサゾリル、ブテリジニル、アクリジニル、カルバゾリル、インドリニル、ベンゾフリル、ベンズチエニル、キノリジニル、ピリジル、トリアジニル、ピラジニル、ピリミジニル、ピリダジニル、フタラジニル、ナフチリジニル、テトラゾリル、キノキサリニル、キナゾリニルおよびシノリニルから選択され、この場合、R¹は、R³から独自に選択された1個から4個の置換基で置換されていてもよい；

R²は、

H、

C₁～₁₀ - アルキル、

C₂～₁₀ - アルケニル、

C₂～₁₀ - アルキニル、

C(O)R⁵、

COR⁵、

C(O)NR⁵R⁵、

S(O)_nR⁵、

C₃～₁₀ - シクロアルキル、

C₄～₁₀ - シクロアルケニル、

R³から独自に選択された1個から5個の置換基で置換されていてもよいアリール、

R⁴、

アリール、R⁷およびR⁴から独自に選択された1個から3個の置換基で置換されているC₁～₁₀ - アルキル、

アリール、R⁷およびR⁴から独自に選択された1個から3個の置換基で置換されているC₃～₁₀ - シクロアルキル、

アリール、R⁷およびR⁴から独自に選択された1個から3個の置換基で置換されているC₂～₁₀ - アルケニル、

から選択され；

R³は、

H、

C₁～₁₀ - アルキル、

C₂～₁₀ - アルケニル、

C₂～₁₀ - アルキニル、

C₃～₁₀ - シクロアルキル、

C₄～₁₀ - シクロアルケニル、

アリール、

R⁴、

ハロ、

SR⁵、

OR⁵、

OC(O)R⁵、

$\text{N R}^5 \text{ R}^5$ 、
 $\text{N R}^5 \text{ R}^6$ 、
 C O O R^5 、
 N O_2 、
 C N 、
 $\text{C}(\text{O})\text{R}^5$ 、
 $\text{C}(\text{O})\text{C}(\text{O})\text{R}^5$ 、
 $\text{C}(\text{O})\text{N R}^5 \text{ R}^5$ 、
 $\text{S}(\text{O})_n \text{ R}^5$ 、
 $\text{S}(\text{O})_n \text{ N R}^5 \text{ R}^5$ 、
 $\text{N R}^5 \text{ C}(\text{O}) \text{N R}^5 \text{ R}^5$ 、
 $\text{N R}^5 \text{ C}(\text{O}) \text{C}(\text{O})\text{R}^5$ 、
 $\text{N R}^5 \text{ C}(\text{O})\text{R}^5$ 、
 $\text{N R}^5 (\text{C O O R}^5)$ 、
 $\text{N R}^5 \text{ C}(\text{O})\text{R}^4$ 、
 $\text{N R}^5 \text{ S}(\text{O})_n \text{ N R}^5 \text{ R}^5$ 、
 $\text{N R}^5 \text{ S}(\text{O})_n \text{ R}^5$ 、
 $\text{N R}^5 \text{ S}(\text{O})_n \text{ R}^4$ 、
 $\text{N R}^5 \text{ C}(\text{O}) \text{C}(\text{O}) \text{N R}^5 \text{ R}^5$ 、
 $\text{N R}^5 \text{ C}(\text{O}) \text{C}(\text{O}) \text{N R}^5 \text{ R}^6$ 、

アリール、 R^7 および R^4 から独自に選択された 1 個から 3 個の置換基で置換されている $\text{C}_{1 \sim 10}$ - アルキル；ならびに

アリール、 R^7 および R^4 から独自に選択された 1 個から 3 個の置換基で置換されている $\text{C}_{2 \sim 10}$ - アルケニル

から独自に選択され；

R^4 は、独自に、単環式の場合には 1 個から 3 個のヘテロ原子、二環式の場合には 1 個から 6 個のヘテロ原子または三環式の場合には 1 個から 9 個のヘテロ原子を含む、5 ~ 8 員単環式、8 ~ 12 員二環式または 11 ~ 14 員三環式の飽和、部分飽和または不飽和環構造であって、前記ヘテロ原子は、O、N または S から独自に選択され、飽和されていてもよいし、不飽和であってもよく、また、各環の 0、1、2 または 3 個の原子は、 $\text{C}_{1 \sim 10}$ - アルキル、 $\text{C}_{2 \sim 10}$ - アルケニル、 $\text{C}_{2 \sim 10}$ - アルキニル、 $\text{C}_{3 \sim 10}$ - シクロアルキル、 $\text{C}_{4 \sim 10}$ - シクロアルケニル、ハロ、ハロアルキル、スルホ、オキソ、 S R^5 、 O R^5 、 $\text{N R}^5 \text{ R}^5$ 、 $\text{N R}^5 \text{ R}^6$ 、 $\text{N R}^6 \text{ R}^6$ 、 C O O R^5 、ニトロ、シアノ、 $\text{S}(\text{O})_n \text{ R}^5$ 、 $\text{S}(\text{O})_n \text{ N R}^5 \text{ R}^5$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{R}^5$ および $\text{C}(\text{O})\text{N R}^5 \text{ R}^5$ から独自に選択された 1 個または 2 個の置換基で置換されてもよく；

R^5 は、H、 $\text{C}_{1 \sim 10}$ - アルキル、 $\text{C}_{2 \sim 10}$ - アルケニル、 $\text{C}_{2 \sim 10}$ - アルキニル、 $\text{C}_{3 \sim 10}$ - シクロアルキル、 $\text{C}_{4 \sim 10}$ - シクロアルケニル、 R^4 、

アリール、 R^7 および R^4 から独自に選択された 1 個から 3 個の置換基で置換されている $\text{C}_{1 \sim 10}$ - アルキル、

R^3 から独自に選択された 1 個から 3 個の置換基で置換されてもよいアリール、アリール、 R^7 および R^4 から独自に選択された 1 個から 3 個の置換基で置換されている $\text{C}_{3 \sim 10}$ シクロアルキル、ならびに

アリール、 R^7 および R^4 から独自に選択された 1 個から 3 個の置換基で置換されている $\text{C}_{2 \sim 10}$ アルケニル

から独自に選択され；

R^6 は、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^5$ 、 $-\text{C O O R}^5$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N R}^5 \text{ R}^5$ および $-\text{S}(\text{O})_n \text{ R}^5$ から選択され；

R^7 は、独自に、ハロ、 $-\text{C F}_3$ 、 $-\text{S R}^5$ 、 $-\text{O R}^5$ 、 $-\text{O C}(\text{O})\text{R}^5$ 、 $-\text{N R}^5$ 、 $-\text{N R}^5 \text{ R}^6$ 、 $-\text{N R}^6 \text{ R}^6$ 、 $-\text{C O O R}^5$ 、ニトロ、シアノ、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^5$ 、 $\text{O C}(\text{O})\text{N R}^5 \text{ R}^5$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N R}^5 \text{ R}^5$ 、 $-\text{N}(\text{R}^5)\text{C}(\text{O})\text{R}^5$ 、 $-\text{N}(\text{R}^5)$

) (C O O R ⁵) および - S (O) _n N R ⁵ R ⁵ であり ; ならびに
n は、 1 または 2 である)

の化合物、およびその医薬適合性の誘導体。

【請求項 2】

R ¹ が、

キノリル、イソキノリル、ブリニル、ベンズチアゾリル、ベンゾオキサゾリル、ベンゾオキサジアゾリル、ベンゾチアジアゾリル、ベンズイソオキサゾリル、ベンズイソチアゾリル、ベンゾトリアゾリル、インドリジニル、ブテリジニル、アクリジニル、カルバゾリル、インドリニル、ベンゾフリル、ベンズチエニル、キノリジニル、ピリジル、トリアジニル、ピラジニル、ピリミジニル、ピリダジニル、フタラジニル、ナフチリジニル、テトラゾリル、キノキサリニル、キナゾリニルおよびシノリニルから選択され、この場合、R ¹ は、R ³ から独自に選択された 1 個から 4 個の置換基で置換されていてもよく；

R ² が、

C ₁ ~ ₆ - アルキル、
C ₂ ~ ₆ - アルケニル、
C ₂ ~ ₆ - アルキニル、
C ₃ ~ ₆ - シクロアルキル、
C ₄ ~ ₆ - シクロアルケニル、
R ⁴ 、

R ³ から独自に選択された 1 個から 4 個の置換基で置換されていてもよいフェニル、アリール、R ⁷ および R ⁴ から独自に選択された 1 個から 3 個の置換基で置換されている C ₁ ~ ₆ - アルキル、

アリール、R ⁷ および R ⁴ から独自に選択された 1 個から 3 個の置換基で置換されている C ₃ ~ ₆ - シクロアルキル、

アリールおよび R ⁴ から独自に選択された 1 個から 3 個の置換基で置換されている C ₂ ~ ₆ - アルケニル

から選択され；

R ³ が、

C ₁ ~ ₆ - アルキル、
C ₂ ~ ₆ - アルケニル、
C ₂ ~ ₆ - アルキニル、
C ₃ ~ ₆ - シクロアルキル、
C ₄ ~ ₆ - シクロアルケニル、
フェニル、

R ⁴ 、

ハロ、

S R ⁵ 、

O R ⁵ 、

O C (O) R ⁵ 、

N R ⁵ R ⁵ 、

N R ⁵ R ⁶ 、

C O O R ⁵ 、

ニトロ

シアノ、

C (O) R ⁵ 、

C (O) N R ⁵ R ⁵ 、

S (O) _n R ⁵ 、

S (O) _n N R ⁵ R ⁵ 、

N R ⁵ C (O) N R ⁵ R ⁵ 、

N R ⁵ C (O) R ⁵ 、

$\text{N R}^5 (\text{C O O R}^5)$ 、
 $\text{N R}^5 \text{C}(\text{O})\text{R}^4$ 、
 $\text{N R}^5 \text{S}(\text{O})_n \text{N R}^5 \text{R}^5$ 、
 $\text{N R}^5 \text{S}(\text{O})_n \text{R}^5$ 、
 $\text{N R}^5 \text{S}(\text{O})_n \text{R}^4$ 、

アリール、 R^7 および R^4 から独自に選択された 1 個から 3 個の置換基で置換されている $\text{C}_{1 \sim 6}$ - アルキル；ならびに

アリール、 R^7 および R^4 から独自に選択された 1 個から 3 個の置換基で置換されている $\text{C}_{2 \sim 6}$ - アルケニル

から独自に選択され；

R^4 が、独自に、単環式の場合には 1 個から 3 個のヘテロ原子または二環式の場合には 1 個から 6 個のヘテロ原子を含む、5 ~ 7 員単環式または 8 ~ 11 員二環式の飽和、部分飽和または不飽和環構造であって、前記ヘテロ原子は、O、N または S から独自に選択され、飽和されていてもよいし、不飽和であってもよく、また、各環の 0、1、2 または 3 個の原子は、 $\text{C}_{1 \sim 6}$ - アルキル、 $\text{C}_{2 \sim 6}$ - アルケニル、 $\text{C}_{2 \sim 6}$ - アルキニル、ハロ、 $\text{C}_{1 \sim 6}$ - ハロアルキル、オキソ、 S R^5 、 O R^5 、 $\text{N R}^5 \text{R}^5$ 、 C O O R^5 、ニトロ、シアノ、 $\text{S}(\text{O})_n \text{R}^5$ 、 $\text{S}(\text{O})_n \text{N R}^5 \text{R}^5$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{R}^5$ および $\text{C}(\text{O})\text{N R}^5 \text{R}^5$ から独自に選択された 1 個から 2 個の置換基で置換されていてもよく；

R^5 が、H、

$\text{C}_{1 \sim 6}$ - アルキル、および R^3 から独自に選択された 1 個から 4 の置換基で置換されていてもよいフェニル、

R^6 が、 $\text{C}(\text{O})\text{R}^5$ 、 C O O R^5 、 $\text{C}(\text{O})\text{N R}^5 \text{R}^5$ および $\text{S}(\text{O})_n \text{R}^5$ から選択され；

R^7 が、独自に、ハロ、 O R^5 、 $\text{N R}^5 \text{R}^5$ 、 C O O R^5 および CN である、

請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

X が NH であり、

R^1 が、

キノリル、イソキノリル、プリニル、ベンズチアゾリル、ベンゾオキサゾリル、ブテリジニル、アクリジニル、カルバゾリル、インドリニル、ベンゾオキサジアゾリル、ベンゾチアジアゾリル、ベンズイソオキサゾリル、ベンズイソチアゾリル、ベンゾトリアゾリル、インドリジニル、ベンゾフリル、ベンズチエニル、キノリジニル、ピリジル、トリアジニル、ピラジニル、ピリミジニル、ピリダジニル、フタラジニル、ナフチリジニル、テトラゾリル、キノキサリニル、キナゾリニルおよびシノリニル、この場合、 R^1 は、 R^3 から独自に選択された 1 個から 4 個の置換基で置換されていてもよく；

R^2 が、 R^4 、および R^3 から独自に選択された 1 個から 4 個の置換基で置換されていてもよいフェニルから選択され；

R^3 が、 $\text{C}_{1 \sim 4}$ - アルキル、 $\text{C}_{2 \sim 4}$ - アルケニル、 $\text{C}_{2 \sim 4}$ - アルキニル、フェニル、 R^4 、クロロ、フルオロ、ブロモ、トリフルオロメチル、 $\text{C}_{1 \sim 4}$ - アルコキシ、フェノキシ、ヘテロシクリルオキシ、ベンジルオキシ、 $\text{C}_{1 \sim 4}$ - アルキルカルボニルオキシ、アミノ、アルキルアミノ、フェニルアミノ、カルボキシ、 $\text{C}_{1 \sim 4}$ - アルコキシカルボニル、ニトロ、シアノ、 $\text{C}_{1 \sim 4}$ - アルキルカルボニル、アミノカルボニル、 $\text{C}_{1 \sim 4}$ - アルキルアミノカルボニル、 $\text{C}_{1 \sim 4}$ - アルキルスルホニル、 $\text{C}_{1 \sim 4}$ - アルキルアミノスルホニル、ベンジル、 $\text{C}_{1 \sim 4}$ - アルコキシアルキル、 $\text{C}_{1 \sim 4}$ - アミノアルキル、 $\text{C}_{1 \sim 4}$ - アルキルアミノアルキル、および 5 ~ 6 員ヘテロシクリル - $\text{C}_{1 \sim 4}$ - アルキルから独自に選択され；

R^4 が、独自に、単環式の場合には 1 個から 3 個のヘテロ原子、二環式の場合には 1 個から 6 個のヘテロ原子を含む、5 ~ 6 員単環式または 8 ~ 10 員二環式の飽和、部分飽和または不飽和環構造であって、前記ヘテロ原子は、O、N または S から独自に選択され、飽和されていてもよいし、不飽和であってもよく、また、各環の 0、1、2 または 3 個の

原子は、 C_{1-4} - アルキル、ハロ、 C_{1-6} - ハロアルキル、オキソ、 OR^5 、 NR^5 、 $COOR^5$ 、ニトロ、シアノ、 $S(O)_nR^5$ 、 $S(O)_nNR^5R^5$ 、 $C(O)R^5$ および $C(O)NR^5R^5$ から独自に選択された 1 個から 2 個の置換基で置換されていてもよく；ならびに

R^5 が、H、 C_{1-6} - アルキル、および

C_{1-4} - アルキル、クロロ、フルオロ、ブロモ、- CF_3 、ヒドロキシ、 C_{1-4} - アルコキシ、アミノ、 C_{1-4} - アルキルアミノ、カルボキシ、 C_{1-4} - アルコキシカルボニル、ニトロ、シアノ、 C_{1-4} - アルキルカルボニル、 C_{1-4} - アルキルアミノカルボニル、アミノカルボニル、アミノスルホニルおよびアセチルから独自に選択された 1 個から 4 個の置換基で置換されていてもよいフェニル

から選択される。

請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 4】

R^1 が、

2 - キノリル、3 - イソキノリル、3 - キノリル、6 - イソキノリル、6 - キノリル、7 - イソキノリル、7 - キノリル、ピリジル、トリアジニル、ピラジニル、ピリミジニル、ピリダジニル、フタラジニル、ナフチリジニル、キノキサリニル、キナゾリニルおよびシノリニルであり、この場合、 R^1 は、 R^3 から独自に選択された 1 個から 4 個の置換基で置換されていてもよく；

R^2 が、 R^4 、および R^3 から独自に選択された 1 個から 4 個の置換基で置換されていてもよいフェニルから選択され；

R^3 が、メチル、エチル、プロピル、 t - ブチル、イソプロピル、フェニル、クロロ、フルオロ、ブロモ、- CF_3 、メトキシ、フェノキシ、ベンジルオキシ、アセチル、アミノ、メチルアミノ、フェニルアミノ、カルボキシ、エトキシカルボニル、ニトロ、シアノ、メチルカルボニル、アミノカルボニル、メチルアミノカルボニル、メチルスルホニル、メチルアミノスルホニル、ベンジル、メトキシメチル、アミノメチル、N, N - ジメチルアミノエチルおよびフリルメチルから独自に選択され；ならびに

R^4 が、キノリル、イソキノリル、インダゾリル、イミダゾリル、ピラゾリル、ピロリル、インドリル、イソインドリル、ピリニルおよびナフチリジニルから独自に選択され、この場合、 R^4 は、メチル、イソプロピル、 t - ブチル、フルオロ、クロロ、ブロモ、- CF_3 、オキソ、メトキシ、フェノキシ、アミノ、メチルアミノ、フェニルアミノ、カルボキシ、エトキシカルボニル、ニトロ、シアノ、メチルカルボニル、アミノカルボニル、メチルアミノカルボニル、メチルスルホニルおよびメチルアミノスルホニルから独自に選択された 1 個以上の置換基により置換されていてもよい、

請求項 3 に記載の化合物。

【請求項 5】

R^2 が、3, 4, 5 - トリメトキシフェニル、3, 4 - ジメトキシフェニル、2, 5 - ジメトキシフェニル、3, 4 - ジメトキシ - 6 - メチルフェニル、キノリニル、ベンズイミダゾリル、インダゾリル、3 - アミノスルホニルフェニルおよび 4 - アミノスルホニルフェニルから選択される、請求項 4 に記載の化合物。

【請求項 6】

R^1 が、キノリルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 7】

R^1 が、イソキノリルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 8】

R^1 が、ピリジルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 9】

R^1 が、トリアジニルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 10】

R^1 が、ピラジニルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 1 1】

R¹ が、ピリミジニルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 1 2】

R¹ が、ピリダジニルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 1 3】

R¹ が、フタラジニルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 1 4】

R¹ が、ナフチリジニルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 1 5】

R¹ が、キノキサリニルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 1 6】

R¹ が、キナゾリニルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 1 7】

R¹ が、ブリニルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 1 8】

R¹ が、ベンズチアゾリルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 1 9】

R¹ が、ベンゾオキサゾリルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 2 0】

R¹ が、ブテリジニルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 2 1】

R¹ が、アクリジニルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 2 2】

R¹ が、カルバゾリルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 2 3】

R¹ が、インドリニルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 2 4】

R¹ が、ベンゾフリルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 2 5】

R¹ が、ベンズチエニルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 2 6】

R¹ が、キノリジニルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 2 7】

R¹ が、テトラゾリルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 2 8】

R¹ が、シノリニルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 2 9】

N⁴ - キノリン - 3 - イル - N² - (2 , 5 - ジメトキシフェニル) ピリミジン - 2 , 4 - ジアミン ;

N⁴ - キノリン - 3 - イル - N² - (3 , 4 - ジメトキシフェニル) ピリミジン - 2 , 4 - ジアミン ;

N⁴ - キノリン - 6 - イル - N² - (2 , 5 - ジメトキシフェニル) ピリミジン - 2 , 4 - ジアミン ;

N⁴ - キノリン - 6 - イル - N² - (3 , 4 - ジメトキシフェニル) ピリミジン - 2 , 4 - ジアミン ;

N⁴ - キノリン - 3 - イル - N² - (3 , 5 - ジメトキシフェニル) ピリミジン - 2 , 4 - ジアミン ;

N² - ベンゾ [1 , 3] ジオキソール - 5 - イル - N⁴ - キノリン - 3 - イル - ピリミジン - 2 , 4 - ジアミン ;

N⁴ - キノリン - 6 - イル - N² - (3 , 4 - ジエトキシフェニル) ピリミジン - 2 ,

4 - ジアミン；

N^4 - キノリン - 3 - イル - N^2 - (3, 4 - ジエトキシフェニル) ピリミジン - 2 ,

4 - ジアミン；

N^4 - キノリン - 3 - イル - N^2 - (2 - メトキシフェニル) ピリミジン - 2 , 4 - ジアミン；

N^4 - キノリン - 6 - イル - N^2 - (2 - メトキシフェニル) ピリミジン - 2 , 4 - ジアミン；

N^4 - キノリン - 3 - イル - N^2 - (3 - メトキシフェニル) ピリミジン - 2 , 4 - ジアミン；

N^4 - キノリン - 6 - イル - N^2 - (3 - メトキシフェニル) ピリミジン - 2 , 4 - ジアミン；

N^4 - キノリン - 3 - イル - N^2 - (3 - エチルフェニル) ピリミジン - 2 , 4 - ジアミン；

N^4 - キノリン - 6 - イル - N^2 - (3 - エチルフェニル) ピリミジン - 2 , 4 - ジアミン；

N^4 - キノリン - 3 - イル - N^2 - (4 - エチルフェニル) ピリミジン - 2 , 4 - ジアミン；

N^4 - キノリン - 6 - イル - N^2 - (4 - エチルフェニル) ピリミジン - 2 , 4 - ジアミン；

N^2 - (3 - エチニルフェニル) - N^4 - キノリン - 3 - イル - ピリミジン - 2 , 4 - ジアミン；

N^2 - (3 - エチニルフェニル) - N^4 - キノリン - 6 - イル - ピリミジン - 2 , 4 - ジアミン；

N^2 - (3 - シアノフェニル) - N^4 - キノリン - 6 - イル - ピリミジン - 2 , 4 - ジアミン；

N^4 - キノリン - 3 - イル - N^2 - (4 - メトキシフェニル) ピリミジン - 2 , 4 - ジアミン；

N^4 - キノリン - 6 - イル - N^2 - (4 - メトキシフェニル) ピリミジン - 2 , 4 - ジアミン；

N^4 - キノリン - 3 - イル - N^2 - (3 - キノリニル) ピリミジン - 2 , 4 - ジアミン；

N^4 - キノリン - 6 - イル - N^2 - (3 - キノリニル) ピリミジン - 2 , 4 - ジアミン；

N^4 - キノリン - 3 - イル - N^2 - (6 - キノリニル) ピリミジン - 2 , 4 - ジアミン；

N^4 - キノリン - 6 - イル - N^2 - (6 - キノリニル) ピリミジン - 2 , 4 - ジアミン；

N^4 - キノリン - 6 - イル - N^2 - (3, 4, 5 - トリメトキシフェニル) ピリミジン - 2 , 4 - ジアミン；

N^2 - (3 - アミノスルホニルフェニル) - N^4 - キノリン - 6 - イル - ピリミジン - 2 , 4 - ジアミン；

N^2 - (3 - アミノスルホニルフェニル) - N^4 - キノリン - 3 - イル - ピリミジン - 2 , 4 - ジアミン；

N^2 - (4 - アミノスルホニルフェニル) - N^4 - キノリン - 6 - イル - ピリミジン - 2 , 4 - ジアミン；

N^2 - (4 - アミノスルホニルフェニル) - N^4 - キノリン - 3 - イル - ピリミジン - 2 , 4 - ジアミン；

3 - [4 - (ナフタレン - 2 - イルアミノ) - ピリミジン - 2 - イルアミノ] - ベンゼンスルホンアミド；

N^2 - (3, 4 - ジメトキシ - 6 - メチルフェニル) - N^4 - キノリン - 6 - イル - ピ

リミジン - 2 , 4 - ジアミン ; および

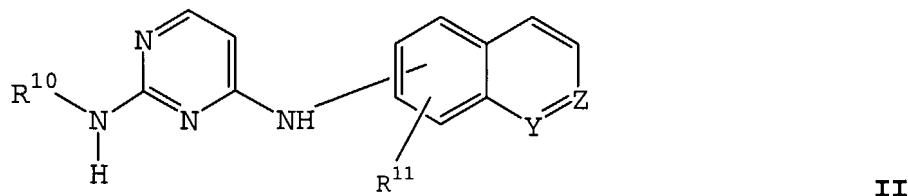
N^2 - (3 , 4 - ジメトキシ - 6 - メチルフェニル) - N^4 - キノリン - 3 - イル - ピリミジン - 2 , 4 - ジアミン

から選択される、請求項 1 に記載の化合物およびその医薬適合性の誘導体。

【請求項 3 0】

下記式 I I :

【化 2】



(式中、

Y および Z は、N または CH であるが、但し、Y および Z のうちの一方が N であり、他方が CH であることを条件とし；

R^{10} は、フェニル、および 5 ~ 10 員ヘテロシクリルから選択され、この場合、 R^1 は、 R^{11} から選択された 1 個から 4 個の置換基で置換されていてもよく；
 R^{11} は、 C_1 ~ C_4 アルキル、 C_2 ~ C_3 アルケニル、 C_2 ~ C_3 アルキニル、 C_3 ~ C_6 シクロアルキル、 C_4 ~ C_6 シクロアルケニル、フェニル、5 ~ 6 員ヘテロシクリル、フルオロ、クロロ、ブロモ、 $C F_3$ 、 $-OR^{12}$ 、 $-OC(O)R^{12}$ 、 $-NR^{12}$ 、 $-COOR^{12}$ 、 $-C(O)R^{12}$ 、 $-C(O)NR^{12}R^{12}$ 、 $-SO_2R^{12}$ 、 $-SO_2NR^{12}R^{12}$ 、 $-NR^{12}C(O)NR^{12}R^{12}$ 、 $-NR^{12}C(O)R^{12}$ 、 $-NR^{12}(COOR^{12})$ 、 $-NR^{12}SO_2NR^{12}R^{12}$ 、 $-NR^{12}SO_2R^{12}$ 、 $-OC(O)NR^{12}R^{12}$ 、

置換されていてもよいフェニルおよび置換されていてもよい 5 ~ 6 員ヘテロシクリルから独自に選択された 1 個から 3 個の置換基で置換されている C_1 ~ C_3 アルキル、ならびに

置換されていてもよいフェニルおよび置換されていてもよい 5 ~ 6 員ヘテロシクリルから独自に選択された 1 個から 3 個の置換基で置換されている C_2 ~ C_3 アルケニルから選択され；この場合、 R^{11} は、二環式置換基のいずれの環に結合していてもよく；

R^{12} は、H、 C_1 ~ C_6 - アルキル、ならびに

C_1 ~ C_4 - アルキル、クロロ、フルオロ、 $-CF_3$ 、ヒドロキシ、 C_1 ~ C_4 - アルコキシ、アミノ、 C_1 ~ C_4 - アルキルアミノ、カルボキシ、 C_1 ~ C_4 - アルコキシカルボニル、ニトロ、シアノ、 C_1 ~ C_4 - アルキルカルボニル、 C_1 ~ C_4 - アルキルアミノカルボニル、アミノカルボニル、アミノスルホニルおよびアセチルから独自に選択された 1 個から 3 個の置換基で置換されていてもよいフェニル

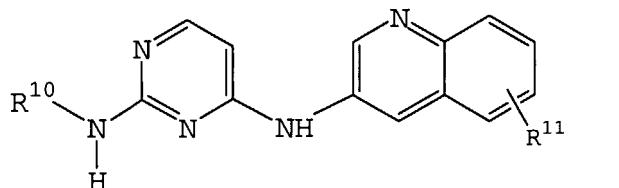
から選択される)

の化合物、およびその医薬適合性の誘導体。

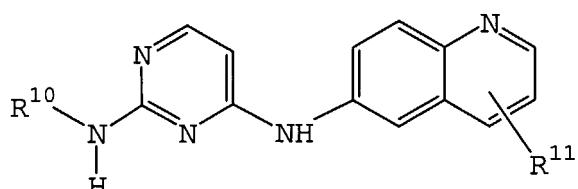
【請求項 3 1】

下記式 I I I a および I I I b :

【化3】



IIIa



IIIb

(式中、

R^{10} は、フェニル、および 5 ~ 10 員ヘテロシクリルから選択され、この場合、 R^1 は、 R^{11} から選択された 1 個から 4 個の置換基で場合によっては置換されており；
 R^{11} は、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_2 \sim C_3$ アルケニル、 $C_2 \sim C_3$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_6$ シクロアルケニル、フェニル、5 ~ 6 員ヘテロシクリル、フルオロ、クロロ、ブロモ、 CF_3 、 $-OR^{12}$ 、 $-OC(O)R^{12}$ 、 $-NR^{12}$ 、 $-COOR^{12}$ 、 $-C(O)R^{12}$ 、 $-C(O)NR^{12}R^{12}$ 、 $-SO_2R^{12}$ 、 $-SO_2NR^{12}R^{12}$ 、 $-NR^{12}C(O)NR^{12}R^{12}$ 、 $-NR^{12}C(O)R^{12}$ 、 $-NR^{12}(COOR^{12})$ 、 $-NR^{12}SO_2NR^{12}R^{12}$ 、 $-NR^{12}SO_2R^{12}$ 、 $-OC(O)NR^{12}R^{12}$ 、

置換されていてもよいフェニルおよび置換されていてもよい 5 ~ 6 員ヘテロシクリルから独自に選択された 1 個から 3 個の置換基で置換されている $C_1 \sim C_3$ アルキル、ならびに

置換されていてもよいフェニルおよび置換されていてもよい 5 ~ 6 員ヘテロシクリルから独自に選択された 1 個から 3 個の置換基で置換されている $C_2 \sim C_3$ アルケニルから選択され； R^{11} は、キノリル置換基のいずれの環に結合していてもよく；

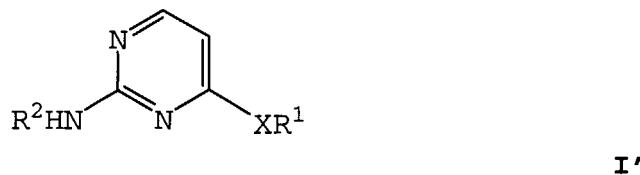
R^{12} は、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、ならびに
 $C_1 \sim C_4$ アルキル、クロロ、フルオロ、 CF_3 、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、アミノ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノ、カルボキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニル、ニトロ、シアノ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノカルボニル、アミノカルボニル、アミノスルホニルおよびアセチルから独自に選択された 1 個から 3 個の置換基で置換されていてもよいフェニル
 から選択される)

の化合物、およびその医薬適合性の誘導体。

【請求項 32】

R^1 が、4-アミノ-2-メチルキノール-6-イルである時、および X が、NH である時、 R^2 が、4-アミノ-2-メチルキノール-6-イルでないことを条件とし；さらに、 R^1 が、1-メチル-5-ベンズイミダゾリルである時、および R^2 が、3-アミノスルホニルフェニルである時、R が、メチルでないことを条件とする、下記式 I' :

【化4】



(式中、

Xは、S、OおよびNRから選択され；

Rは、C₁～₃-アルコキシカルボニル-C₁～₃-アルキル-、-(CH₂)₀～₄-R^a、-C₂～₄-アルケニル-R^a、および-C₂～₄-アルキニル-R^aから選択され；R^aは、H、置換されていてもよいフェニル、置換されていてもよい5～6員ヘテロシクリル、-OR^bおよび-NR^bR^bから独自に選択され；R^bは、H、C₁～₃アルキル、置換されていてもよいフェニル、および置換されていてもよい5～6員ヘテロシクリルから独自に選択され；R¹は、キノリル、イソキノリル、ブリニル、ベンズイミダゾリル、ベンズチアゾリル、ベンゾオキサジアゾリル、ベンゾチアジアゾリル、ベンズイソオキサゾリル、ベンズイソチアゾリル、ベンゾトリニアゾリル、インドリジニル、ベンゾオキサゾリル、ブテリジニル、アクリジニル、カルバゾリル、インドリニル、イミダゾ[1,2-a]ピリジニル、ベンゾフリル、1,1-ジオキソ-ベンゾチエニル、ベンズチエニル、キノリジニル、ピリジル、トリアジニル、ピラジニル、ピリミジニル、ピリダジニル、フタラジニル、ナフチリジニル、テトラゾリル、キノキサリニル、キナゾリニル、シノリニル、ジベンゾフリル、フェナントロリニル、およびペルイミジニルから選択され、この場合、R¹は、R³から独自に選択された1個から4個の置換基で置換されていてもよく；R²は、R⁴、およびR³から独自に選択された1個から5個の置換基で場合によっては置換されているフェニルから選択され；R³は、

H、

C₁～₁₀-アルキル、C₂～₁₀-アルケニル、C₂～₁₀-アルキニル、C₁～₁₀-ハロアルキル、C₃～₁₀-シクロアルキル、C₄～₁₀-シクロアルケニル、

アリール、

R⁴、

ハロ、

SR⁵、OR⁵、OC(O)R⁵、NR⁵R⁵、NR⁵R⁶、COOR⁵、

ニトロ、

シアノ、

C(O)R⁵、C(O)C(O)R⁵、C(O)NR⁵R⁵、

$S(O)_n R^5$ 、
 $S(O)_n NR^5 R^5$ 、
 $S(O)_n NR^5 R^6$ 、
 $NR^5 C(O) NR^5 R^5$ 、
 $NR^5 C(O) C(O) R^5$ 、
 $NR^5 C(O) R^5$ 、
 $NR^5 (COOR^5)$ 、
 $NR^5 C(O) R^4$ 、
 $NR^5 S(O)_n NR^5 R^5$ 、
 $NR^5 S(O)_n R^5$ 、
 $NR^5 S(O)_n R^4$ 、
 $NR^5 C(O) C(O) NR^5 R^5$ 、
 $NR^5 C(O) C(O) NR^5 R^6$ 、

アリール、 R^7 および R^4 から独自に選択された 1 個から 3 個の置換基で置換されている $C_{1 \sim 10}$ - アルキル；ならびに

アリール、 R^7 および R^4 から独自に選択された 1 個から 3 個の置換基で置換されている $C_{2 \sim 10}$ - アルケニル

から独自に選択され；

R^4 は、独自に、単環式の場合には 1 個から 3 個のヘテロ原子、二環式の場合には 1 個から 6 個のヘテロ原子または三環式の場合には 1 個から 9 個のヘテロ原子を含む、5 ~ 8 員単環式、8 ~ 12 員二環式または 11 ~ 14 員三環式の飽和、部分飽和または不飽和環構造であって、前記ヘテロ原子は、O、N または S から独自に選択され、飽和されていてもよいし、不飽和であってもよく、また、各環の 0、1、2 または 3 個の原子は、 $C_{1 \sim 10}$ - アルキル、 $C_{2 \sim 10}$ - アルケニル、 $C_{2 \sim 10}$ - アルキニル、 $C_{3 \sim 10}$ - シクロアルキル、 $C_{4 \sim 10}$ - シクロアルケニル、ハロ、ハロアルキル、スルホ、オキソ、 SR^5 、 OR^5 、 $NR^5 R^5$ 、 $NR^5 R^6$ 、 $NR^6 R^6$ 、 $COOR^5$ 、ニトロ、シアノ、 $S(O)_n R^5$ 、 $S(O)_n NR^5 R^5$ 、 $C(O) R^5$ 、 $C(O) NR^5 R^5$ 、および R^3 から独自に選択された 1 個から 3 個の置換基で置換されていてもよい 6 員ヘテロアリールから独自に選択された置換基により置換されていてもよく；

R^5 は、H、 $C_{1 \sim 10}$ - アルキル、 $C_{2 \sim 10}$ - アルケニル、 $C_{2 \sim 10}$ - アルキニル、 $C_{3 \sim 10}$ - シクロアルキル、 $C_{4 \sim 10}$ - シクロアルケニル、 R^4 、

R^3 から独自に選択された 1 個から 3 個の置換基で置換されていてもよいアリール、

アリール、 R^7 および R^4 から独自に選択された 1 個から 3 個の置換基で置換されている $C_{1 \sim C_{10}}$ アルキル、

アリール、 R^7 および R^4 から独自に選択された 1 個から 3 個の置換基で置換されている $C_{3 \sim C_{10}}$ シクロアルキル、ならびに

アリール、 R^7 および R^4 から独自に選択された 1 個から 3 個の置換基で置換されている $C_{2 \sim C_{10}}$ アルケニルから独自に選択され；

R^6 は、 $-C(O)R^5$ 、 $-COOR^5$ 、 $-C(O)NR^5 R^5$ および $-S(O)_n R^5$ から選択され；

R^7 は、独自に、ハロ、 $-CF_3$ 、 $-SR^5$ 、 $-OR^5$ 、 $-OC(O)R^5$ 、 $-NR^5$ 、 $-NR^5 R^6$ 、 $-NR^6 R^6$ 、 $-COOR^5$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)R^5$ 、 $-OC(O)NR^5 R^5$ 、 $-C(O)NR^5 R^5$ 、 $-N(R^5)C(O)R^5$ 、 $-N(R^5)(COOR^5)$ および $-S(O)_n NR^5 R^5$ であり；ならびに

n は、1 または 2 である）

の化合物、およびその医薬適合性の誘導体。

【請求項 3 3】

X が、O、NH および NR から選択され；

R が、メチル、置換されていてもよいフェニル、 $-CH_2$ _{2 ~ 3} - R^a 、 $C_{2 \sim 3}$ - アルケニル - R^a 、および $-C_{2 \sim 3}$ - アルキニル - R^a から選択され；

R^a が、H、置換されていてもよいフェニル、置換されていてもよい5～6員ヘテロシクリル、および- NR^bR^b から独自に選択され；

R^b が、H、 $C_{1～3}$ アルキル、置換されていてもよいフェニル、および置換されていてもよい5～6員ヘテロシクリルから独自に選択され；

R^1 が、キノリル、イソキノリル、イミダゾ[1,2-a]ピリジニル、ベンズイミダゾリル、ベンズチアゾリル、インドリニル、ピリジルおよびキノキサリニルから選択され、この場合、 R^1 は、 R^3 から独自に選択された1個から3個の置換基で置換されていてもよく；

R^2 が、 R^4 、および R^3 から独自に選択された1個から3個の置換基で置換されていてもよいアリールから選択され；

R^3 が、

H、ハロ、 $C_{1～3}$ - アルキル、 $C_{2～3}$ - アルケニル、 $C_{2～3}$ - アルキニル、フェニル、ヒドロキシ、 $C_{1～3}$ - ハロアルコキシ、 $C_{1～3}$ - アルコキシ、-C(O)-C_{1～3} - アルキル、および $C_{1～3}$ - ハロアルキルから独自に選択され；ならびに

R^4 が、独自に、2,3-ジヒドロ-インドリル、1,3-ベンゾジオキソリル、インドリル、1,3-ジオキソ-イソインドリル、インダゾリル、ピリジル、キノリル、イソキノリル、ベンズチアゾリル、1,2,3-ベンゾトリアゾリル、ベンズイミダゾリルおよびピリジルから選択され、この場合、 R^4 は、ヒドロキシ、 $C_{1～3}$ - アルコキシ、シアノ、ニトロ、ハロ、 $C_{1～3}$ - アルキル、ジ-C_{1～3} - アルキルアミノ、ジ-C_{1～3} - アルキルアミノ-C_{1～3} - アルキル、ジ-C_{1～3} - アルキルアミノ-C_{1～3} - アルコキシ、 $C_{1～3}$ - アルキルカルボニル、 $C_{1～3}$ - アルコキシカルボニル、 $C_{1～3}$ - アルキルカルボニルアミノ、ピロリジニルカルボニル-C_{2～3} - アルケニル、ピロリジニルカルボニル-C_{1～3} - アルキル、ピロリジニル-C_{1～3} - アルキル、 $C_{2～3}$ - アルキニル、アセチル、 $C_{1～3}$ - アルキルカルボニル-C_{1～3} - アルキル、カルボキシ-C_{1～3} - アルキル、(ペリジニル)-C_{1～3} - アルコキシ、(ペラジニル)-C_{1～3} - アルコキシ、2-モルホリニル-C_{1～3} - アルコキシ、 $C_{1～3}$ - ハロアルキル、 $C_{1～3}$ - ハロアルコキシ、アミノカルボニル、アミノスルホニル、 $C_{1～3}$ - アルキルアミノスルホニル、ヒドロキシ-C_{1～3} - アルキルアミノスルホニル、(チアゾリル)アミノスルホニル、 $C_{1～4}$ - アルキルアミノスルホニル、 $C_{1～3}$ - アルキルカルボニルアミノスルホニル、 $C_{1～3}$ - アルキルスルホニル、 $C_{1～3}$ - アルコキシカルボニル-ペラジニル、モルホリニル、 $C_{1～3}$ - アルキルピペルジニル、ペラジニル、 $C_{1～3}$ - アルキル-ペラジニル、およびオキサゾリルで置換されていてもよい、

請求項32に記載の化合物。

【請求項34】

X が、NH および NR から選択され；

R が、メチル、-(CH₂)_{2～3}-R^a、-C_{2～3}-アルケニル-R^a、および2,6-二置換フェニルから選択され；

R^a が、H、置換されていてもよいフェニル、置換されていてもよい5～6員ヘテロシクリル、および- NR^bR^b から独自に選択され；

R^b が、H、 $C_{1～3}$ アルキル、置換されていてもよいフェニル、および置換されていてもよい5～6員ヘテロシクリルから独自に選択され；

R^1 が、3-キノリル、6-キノリル、3-イソキノリル、イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル、5-ベンズイミダゾリル、5-ベンズチアゾリル、6-インドリニル、2-ピリジルおよび6-キノキサリニルから選択され、この場合、 R^1 は、 R^3 から独自に選択された1個から2個の置換基で置換されていてもよく；

R^2 が、2-ナフチル、2,3-ジヒドロ-インドリル-6-イル、1,3-ベンゾジオキソル-5-イル、5-インドリル、4-インドリル、1,3-ジオキソ-イソインドリル-5-イル、5-インダゾリル、6-インダゾリル、3-ピリジル、3-キノリル、6-キノリル、イソキノリル、ベンズチアゾリル-6-イル、ベンズチアゾリル-5-イ

ル、1, 2, 3-ベンゾトリアゾリル-5-イル、6-ベンズイミダゾリル、5-ピリジルおよびフェニルから選択され；

R² が、

ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、シアノ、ニトロ、クロロ、フルオロ、プロモ、ジメチルアミノ、ジメチルアミノエチル、3-ジメチルアミノプロポキシ、メトキシカルボニル、メチルカルボニル、メチルカルボニルアミノ、メチル、エチル、ピロリジン-1-イルカルボニルエテニル、ピロリジン-1-イルカルボニルエチル、ピロリジン-1-イルプロピル、エチニル、アセチル、エトキシカルボニルブチル、カルボキシブチル、2-(1-メチル-ピペリジン-4-イル)-エトキシ、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、3-(ピペリジン-1-イル)プロポキシ、2-ピペリジン-1-イル-エトキシ、2-モルホリン-4-イル-エトキシ、ペンタフルオロエチル、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、アミノカルボニル、アミノスルホニル、N,N'-ジ-プロピルアミノスルホニル、ヒドロキシプロピルアミノスルホニル、(2-チアゾリル)アミノスルホニル、ブチルアミノスルホニル、メチルカルボニルアミノスルホニル、メチルスルホニル、1-メチル-ピペリジン-4-イルメトキシ、1-t-ブトキシカルボニル-ピペラジン-4-イル、4-モルホリニル、4-メチルピペラジン-1-イル、4-ピペラジニル、4-イソプロピル-ピペラジン-1-イル、およびオキサゾール-5-イルから独自に選択された1個から3個の置換基で置換されていてもよく；ならびに

R³ が、H、ヒドロキシ、ヨード、メチル、アセチル、トリフルオロメチル、メトキシ、フェニルおよびトリフルオロメトキシから選択される、

請求項32に記載の化合物。

【請求項35】

Xが、NHである、請求項32に記載の化合物。

【請求項36】

Xが、NRであり；Rが、メチル、2, 6-ジメチルフェニル、および-C₂-アルケニル-R^aから選択され；R^aが、H、置換されていてもよいフェニル、および置換されていてもよい5~6員ヘテロシクリルから独自に選択される、請求項32に記載の化合物。

【請求項37】

R¹が、3-キノリル、6-キノリル、および3-イソキノリルから選択される、請求項32に記載の化合物。

【請求項38】

N⁴-キノリン-3-イル-N²-(3, 4, 5-トリメトキシフェニル)ピリミジン-2, 4-ジアミン；
 N⁴-キノリン-6-イル-N²-(3, 4, 5-トリメトキシフェニル)ピリミジン-2, 4-ジアミン；
 N²-(3, 4-ジメトキシ-6-メチルフェニル)-N⁴-キノリン-3-イル-ピリミジン-2, 4-ジアミン；
 N²-(6-(4-モルホリニル)-3-ピリジニル)-N⁴-(3-キノリニル)-2, 4-ピリミジンジアミン；
 N²-(4-プロモ-2-フルオロフェニル)-N⁴-(3-キノリニル)-2, 4-ピリミジンジアミン；
 N²-(4-ブロモフェニル)-N⁴-(3-キノリニル)-2, 4-ピリミジンジアミン；
 N²-(4-(4-メチル-1-ピペラジニル)フェニル)-N⁴-(3-キノリニル)-2, 4-ピリミジンジアミン；
 N⁴-(3-イソキノリニル)-N²-(3, 4, 5-トリス(メトキシ)フェニル)-2, 4-ピリミジンジアミン；
 N⁴-(3-イソキノリニル)-N²-(2-メチル-4, 5-ビス(メトキシ)フェ

ニル) - 2, 4 - ピリミジンジアミン;

2 - (メトキシ) - 4 - ((4 - (3 - キノリニルアミノ) - 2 - ピリミジニル)アミノ)ベンズアミド;

N^2 - [4 - (3 - ピペリジン - 1 - イル - プロポキシ) - フェニル] - N^4 - キノリン - 3 - イル - ピリミジン - 2, 4 - ジアミン;

N^2 - (4 - ((2 - (1 - ピペリジニル)エチル)オキシ)フェニル) - N^4 - (3 - キノリニル) - 2, 4 - ピリミジンジアミン;

N^2 - (3 - (2 - (ジメチルアミノ)エチル) - 4 - (メトキシ)フェニル) - N^4 - (3 - キノリニル) - 2, 4 - ピリミジンジアミン;

N^2 - (3 - (1, 3 - オキサゾール - 5 - イル)フェニル) - N^4 - (3 - キノリニル) - 2, 4 - ピリミジンジアミン;

N^2 - (3 - (1, 3 - オキサゾール - 5 - イル)フェニル) - N^4 - (6 - キノリニル) - 2, 4 - ピリミジンジアミン;

N^2 - (3 - (メトキシ) - 4 - (1, 3 - オキサゾール - 5 - イル)フェニル) - N^4 - (3 - キノリニル) - 2, 4 - ピリミジンジアミン;

N^2 - (1 - アセチル - 3, 3 - ジメチル - 2, 3 - ジヒドロ - 1H - インドール - 6 - イル) - N^4 - (3 - キノリニル) - 2, 4 - ピリミジンジアミン;

N^4 - (2 - メチル - 6 - キノリニル) - N^2 - (3, 4, 5 - トリス(メトキシ)フェニル) - 2, 4 - ピリミジンジアミン;

N^4 - (1 - メトキシ - イソキノリン - 3 - イル) - N^2 - (3, 4, 5 - トリメトキシ - フェニル)ピリミジン - 2, 4 - ジアミン;

N^2 - [3 - メトキシ - 4 - (2 - {4 - [4 - (キノリン - 3 - イルアミノ) - ピリミジン - 2 - イル] - ピペラジン - 1 - イル} - エトキシ) - フェニル] - N^4 - キノリン - 3 - イル - ピリミジン - 2, 4 - ジアミン;

N^2 - (3 - メトキシ - 4 - モルホリン - 4 - イル - フェニル) - N^4 - キノリン - 3 - イル - ピリミジン - 2, 4 - ジアミン;

N^2 - (3, 4, 5 - トリメトキシフェニル) - N^4 - (6 - メトキシ - キノリン - 3 - イル) - 2, 4 - ピリミジンジアミン;

N^2 - (2 - メチル - 4, 5 - ジメトキシフェニル) - N^4 - (6 - メトキシ - キノリン - 3 - イル) - 2, 4 - ピリミジンジアミン;

N^2 - (3, 4, 5 - トリメトキシフェニル) - N^4 - (6 - トリフルオロメトキシ - キノリン - 3 - イル) - 2, 4 - ピリミジンジアミン;

N^2 - (2 - メチル - 4, 5 - ジメトキシフェニル) - N^4 - (6 - トリフルオロメトキシ - キノリン - 3 - イル) - 2, 4 - ピリミジンジアミン;

3 - {2 - メトキシ - 4 - [4 - (キノリン - 3 - イルアミノ) - ピリミジン - 2 - イルアミノ] - フェニル} - 1 - ピロリジン - 1 - イル - プロペノン;

3 - {2 - メトキシ - 4 - [4 - (キノリン - 3 - イルアミノ) - ピリミジン - 2 - イルアミノ] - フェニル} - 1 - ピロリジン - 1 - イル - プロパノン;

N^2 - [3 - メトキシ - 4 - (3 - ピロリジン - 1 - イル - プロピル) - フェニル] - N^4 - キノリン - 3 - イル - ピリミジン - 2, 4 - ジアミン; および

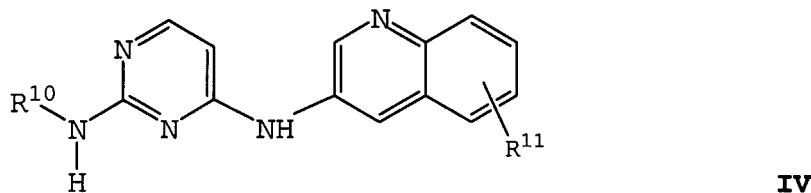
N^2 - [3 - メトキシ - 4 - (2 - {1 - [4 - (キノリン - 3 - イルアミノ) - ピリミジン - 2 - イル] - ピペリジン - 4 - イル} - エトキシ) - フェニル] - N^4 - キノリン - 3 - イル - ピリミジン - 2, 4 - ジアミン

から選択される、請求項32に記載の化合物およびその医薬適合性の誘導体。

【請求項39】

下記式IV:

【化5】



(式中、

R^{10} は、フェニル、ナフチル、および 5 ~ 10 員ヘテロシクリルから選択され、この場合、 R^{10} は、 R^{13} から選択された 1 個から 4 個の置換基で置換されていてもよく；

R^{11} は、H、 C_1 ~ C_4 アルキル、 C_1 ~ C_4 ハロアルキル、 C_2 ~ C_3 アルケニル、 C_2 ~ C_3 アルキニル、 C_3 ~ C_6 シクロアルキル、 C_4 ~ C_6 シクロアルケニル、フェニル、5 ~ 6 員ヘテロシクリル、フルオロ、クロロ、ブロモ、 CF_3 、-OR¹⁴、-OC(O)R¹²、-NR¹²R¹²、-COOR²、-C(O)R¹²、-C(O)NR¹²R¹²、-SO₂R¹²、-SO₂NR¹²R¹²、-NR¹²C(O)NR¹²、-NR¹²(COOR¹²)、-NR¹²SO₂NR¹²、-NR¹²SO₂R¹²、-OC(O)NR¹²R¹²、

置換されていてもよいフェニルおよび置換されていてもよい 5 ~ 6 員ヘテロシクリルから独自に選択された 1 個から 3 個の置換基で置換されている C_1 ~ C_3 アルキル、ならびに

置換されていてもよいフェニルおよび置換されていてもよい 5 ~ 6 員ヘテロシクリルから独自に選択された 1 個から 3 個の置換基で置換されている C_2 ~ C_3 アルケニルから選択された 1 個以上の置換基であり；

R^{11} は、キノリル置換基のいずれの環に結合していてもよく；

R^{12} は、

H、 C_1 ~ C_6 - アルキル、 C_1 ~ C_6 - ハロアルキル、

置換されていてもよいフェニルおよび置換されていてもよい 5 ~ 6 員ヘテロシクリルから独自に選択された 1 個から 3 個の置換基で置換されている C_1 ~ C_3 アルキル；この場合、置換されていてもよいフェニルおよび置換されていてもよい 5 ~ 6 員ヘテロシクリルは、 C_1 ~ C_4 - アルキル、クロロ、フルオロ、 CF_3 、ヒドロキシ、 C_1 ~ C_4 - アルコキシ、アミノ、 C_1 ~ C_4 - アルキルアミノ、カルボキシ、 C_1 ~ C_4 - アルコキシカルボニル、ニトロ、シアノ、 C_1 ~ C_4 - アルキルカルボニル、フェニル、(アルキル、 C_1 ~ C_4 - アルキルアミノカルボニル、アミノカルボニル、アミノスルホニル、アセチル、フェニルから選択された 1 個以上の置換基で置換されていてもよい) 5 ~ 6 員ヘテロシクリル、および [C_1 ~ C_4 - アルキル、クロロ、フルオロ、 CF_3 、ヒドロキシ、 C_1 ~ C_4 - アルコキシ、アミノ、 C_1 ~ C_4 - アルキルアミノ、カルボキシ、 C_1 ~ C_4 - アルコキシカルボニル、ニトロ、シアノ、 C_1 ~ C_4 - アルキルカルボニル、フェニル、(アルキル、 C_1 ~ C_4 - アルキルアミノカルボニル、アミノカルボニル、アミノスルホニル、アセチル、フェニル、および 5 ~ 6 員ヘテロシクリルから選択された 1 個以上の置換基で置換されていてもよい) 5 ~ 6 員ヘテロシクリルから選択された 1 個以上の置換基で置換されていてもよい] 5 ~ 6 員ヘテロシクリルから独自に選択された 1 個から 3 個の置換基で置換されており；および

C_1 ~ C_4 - アルキル、クロロ、フルオロ、 CF_3 、ヒドロキシ、 C_1 ~ C_4 - アルコキシ、アミノ、 C_1 ~ C_4 - アルキルアミノ、カルボキシ、 C_1 ~ C_4 - アルコキシカルボニル、 NO_2 、 CN 、 C_1 ~ C_4 - アルキルカルボニル、 C_1 ~ C_4 - アルキルアミノカルボニル、アミノカルボニル、アミノスルホニルおよびアセチルから独自に選択された 1 個から 3 個の置換基で置換されていてもよいフェニル

から選択され；ならびに、

R^{1-3} は、

$C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_2 \sim C_3$ アルケニル、 $C_2 \sim C_3$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_6$ シクロアルケニル、フェニル、5 ~ 6 員ヘテロシクリル、フルオロ、クロロ、ブロモ、 CF_3 、-OR¹⁻²、-OC(O)R¹⁻²、-NR¹⁻²R¹⁻²、-COOR¹⁻²、-C(O)R¹⁻²、-C(O)NR¹⁻²R¹⁻²、-SO₂R¹⁻²、-SO₂NR¹⁻²R¹⁻²、-NR¹⁻²C(O)NR¹⁻²R¹⁻²、-NR¹⁻²C(O)R¹⁻²、-NR¹⁻²(COOR¹⁻²)、-NR¹⁻²SO₂NR¹⁻²R¹⁻²、-NR¹⁻²SO₂R¹⁻²、-OC(O)NR¹⁻²R¹⁻²、

置換されていてもよいフェニルおよび置換されていてもよい5 ~ 6 員ヘテロシクリルから独自に選択された1個から3個の置換基で置換されている $C_1 \sim C_3$ アルキル、および置換されていてもよいフェニルおよび置換されていてもよい5 ~ 6 員ヘテロシクリルから独自に選択された1個から3個の置換基で置換されている $C_2 \sim C_3$ アルケニル

; ならびに

R^{1-4} は、H、 $C_1 \sim C_6$ - アルキル、アミノ-C₁ ~ C₆ - アルキル、 $C_1 \sim C_6$ - アルキルアミノ-C₁ ~ C₆ - アルキル、アミノカルボニル-C₁ ~ C₆ - アルキル、 $C_1 \sim C_6$ - アルキルアミノカルボニル-C₁ ~ C₆ - アルキル、および

$C_1 \sim C_4$ - アルキル、クロロ、フルオロ、 CF_3 、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_4$ - アルコキシ、アミノ、 $C_1 \sim C_4$ - アルキルアミノ、カルボキシ、 $C_1 \sim C_4$ - アルコキシカルボニル、 NO_2 、 CN 、 $C_1 \sim C_4$ - アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_4$ - アルキルアミノカルボニル、アミノカルボニル、アミノスルホニルおよびアセチル

から独自に選択された1個から3個の置換基で置換されていてもよいフェニル
から選択される)

の化合物およびその医薬適合性の誘導体。

【請求項 40】

R^{1-0} が、3, 4, 5 - トリメトキシフェニル、3, 4 - ジメトキシフェニル、3, 5 - ジメトキシフェニル、3, 4 - ジメトキシ - 6 - シアノフェニル、2, 5 - ジメトキシフェニル、2 - メトキシフェニル、3 - メトキシフェニル、4 - メトキシフェニル、3 - (ジメチルアミノエチル) - 4 - メトキシフェニル、4 - メトキシ - 2 - ニトロフェニル、2 - メトキシ - 4 - ニトロフェニル、3, 4 - ジメトキシ - 6 - メチルフェニル、4 - (3 - ジメチルアミノ - プロポキシ) - フェニル、4 - (1 - t - ブトキシカルボニル - ピペラジン - 4 - イル) フェニル、4 - (4 - ピペラジニル) フェニル、3, 5 - ジメトキシ - 4 - [2 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - エトキシ] - フェニル、3, 5 - ジメトキシ - 4 - [3 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - プロポキシ] - フェニル、3 - メトキシ - 4 - [2 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - エトキシ] - フェニル、3 - メトキシ - 4 - [3 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - ブロボキシ] - フェニル、3, 4 - ジメトキシ - 5 - [3 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - ブロボキシ] - フェニル、3 - メトキシ - 4 - [2 - (1 - メチル - ピペリジン - 4 - イルメトキシ) - フェニル、3 - メトキシ - 4 - [2 - (1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル) - エトキシ] - フェニル、3 - フルオロ - 4 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - フェニル、2 - メチル - 4 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - フェニル、2 - フルオロ - 4 - (3 - ピペリジン - 1 - イル - ブロボキシ) - フェニル、4 - (4 - イソプロピル - ピペラジン - 1 - イル) - フェニル、2 - フルオロ - 4, 5 - ジメトキシ - フェニル、2 - メチル - 4 - [3 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - ブロボキシ] - フェニル、2 - メチル - 4 - (3 - ピペリジン - 1 - イル - ブロボキシ) - フェニル、3, 5 - ジメトキシ - 4 - (2 - ピペリジン - 1 - イル - エトキシ) - フェニル、3, 5 - ジメトキシ - 4 - (2 - モルホリン - 4 - イル - エトキシ) - フェニル、4 - [2 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - エトキシ] - フェニル、3 - フルオロ - 4 - [3 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - ブロボキシ] - フェニル、3 - フルオロ - 4 - [2 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - エトキシ] - フェニル、3 - フルオロ - 4 - (2 - ピペラジン - 1 - イル - エトキシ) - フェニル、4 - (1 - t - ブトキシ

カルボニル - ピペラジン - 4 - イル) - 3 - ジフルオロメトキシ - フェニル、2 - エトキシカルボニルブチル - 4, 5 - ジメトキシフェニル、2 - カルボニルブチル - 4, 5 - ジメトキシフェニル、3 - メトキシ - 4 - (2 - {4 - [4 - (キノリン - 3 - イルアミノ) - ピリミジン - 2 - イル] - ピペラジン - 1 - イル} - エトキシ) - フェニル、3 - メトキシ - 4 - (2 - {1 - [4 - (キノリン - 3 - イルアミノ) - ピリミジン - 2 - イル] - ピペリジン - 4 - イル} - エトキシ) - フェニル、3, 4 - ジエトキシフェニル、3 - メトキシ - 4 - (ピロリジン - 1 - イルカルボニルエテニル) フェニル、3 - メトキシ - 4 - (ピロリジン - 1 - イルプロピル) フェニル、4 - [3 - (ピペリジン - 1 - イル) プロポキシ] フェニル、4 - (2 - (ピペリジン - 1 - イル) エトキシ) フェニル、6 - ベンズイミダゾリル、4 - (メチルカルボニルアミノスルホニル) フェニル、4 - (N, N' - ジ - プロピルアミノスルホニル) フェニル、3 - ブチルアミノスルホニルフェニル、3 - ヒドロキシプロピルアミノスルホニルフェニル、3 - [(2 - チアゾリル) アミノスルホニル] フェニル、3 - アミノスルホニルフェニル、4 - アミノスルホニルフェニル、4 - メチルスルホニルフェニル、3 - キノリル、6 - キノリル、6 - ヒドロキシ - 3 - キノリル、インドール - 4 - イル、ベンゾチアゾール - 6 - イル、ベンゾチアゾール - 5 - イル、1, 2, 3 - ベンゾトリアゾール - 5 - イル、4 - (4 - モルホリニル) フェニル、4 - (4 - メチルビペルジン - 1 - イル) フェニル、3 - メトキシ - 4 - (4 - モルホリニル) フェニル、4 - メトキシカルボニルフェニル、3 - メトキシカルボニルフェニル、4 - (ジメチルアミノ) フェニル、3 - (ジメチルアミノ) フェニル、4 - (ジメチルアミノ) - 2 - メチルフェニル、3 - エチルフェニル、4 - エチルフェニル、4 - ニトロフェニル、4 - (メチルカルボニルアミノ) フェニル、3 - (メチルカルボニルアミノ) フェニル、4 - メチルカルボニルフェニル、3 - アミノカルボニルフェニル、4 - アミノカルボニルフェニル、4 - アミノカルボニル - 3 - メトキシフェニル、3 - フルオロ - 4 - メトキシフェニル、3 - トリフルオロメトキシフェニル、4 - トリフルオロメトキシフェニル、3, 5 - ジトリフルオロメチルフェニル、3 - フルオロ - 5 - トリフルオロメチルフェニル、4 - フルオロ - 3 - トリフルオロメチルフェニル、3 - メトキシ - 5 - トリフルオロメチルフェニル、3 - メトキシ - 4 - ペンタフルオロエチルフェニル、5 - インダゾリル、6 - インダゾリル、1 - メチル - インダゾール - 5 - イル、3 - ピリジル、6 - メトキシ - 3 - ピリジル、2 - (4 - モルホリニル) - 5 - ピリジル、4 - ブロモ - 2 - フルオロフェニル、2 - フルオロフェニル、3 - フルオロフェニル、4 - フルオロフェニル、2 - ブロモフェニル、3 - ブロモフェニル、4 - ブロモフェニル、3 - クロロ - 4 - フルオロフェニル、3, 4 - ジクロロフェニル、3, 5 - ジクロロフェニル、4 - クロロフェニル、3 - エチニルフェニル、3 - シアノフェニル、2, 2 - ジフルオロ - 1, 3 - ベンゾジオキソール - 5 - イル、1, 3 - ベンゾジオキソール - 5 - イル、2 - メチル - 1, 3 - ジオキソ - イソインドール - 5 - イル、3 - (オキサゾール - 5 - イル) フェニル、4 - (オキサゾール - 5 - イル) フェニル、3 - メトキシ - 4 - (オキサゾール - 5 - イル) フェニル、2 - ナフチル、5 - インドリル、1 - アセチル - 2, 3 - ジヒドロ - 3, 3 - ジメチルインドール - 6 - イル、および 2, 3 - ジヒドロ - 3, 3 - ジメチルインドール - 6 - イル

から選択され；

R^{1, 1} が、H、ヒドロキシ、メチル、アセチル、トリフルオロメチル、メトキシ、フェニルおよびトリフルオロメトキシから選択された 1 個以上の置換基である、

請求項 3 9 に記載の化合物およびその医薬適合性の誘導体。

【請求項 4 1】

R^{1, 0} が、3, 4, 5 - トリメトキシフェニル、3 - (ジメチルアミノエチル) - 4 - メトキシフェニル、4 - [3 - (ピペリジン - 1 - イル) プロポキシ] フェニル、3 - メトキシ - 4 - (ピロリジン - 1 - イルプロピル) フェニル、および 3, 4 - ジメトキシ - 6 - メチルフェニルから選択され；ならびに R^{1, 1} が、H、メトキシ、およびトリフルオ

ロメトキシから選択され、また、R¹ が、キノリル置換基の6または7位に結合している、請求項39に記載の化合物。

【請求項42】

N⁴ - キノリン - 3 - イル - N² - (3, 4, 5 - トリメトキシフェニル) ピリミジン - 2, 4 - ジアミン；
 N² - (3, 4 - ジメトキシ - 6 - メチルフェニル) - N⁴ - キノリン - 3 - イル - ピリミジン - 2, 4 - ジアミン；
 N² - (6 - (4 - モルホリニル) - 3 - ピリジニル) - N⁴ - (3 - キノリニル) - 2, 4 - ピリミジンジアミン；
 N² - (4 - ブロモ - 2 - フルオロフェニル) - N⁴ - (3 - キノリニル) - 2, 4 - ピリミジンジアミン；
 N² - (4 - ブロモフェニル) - N⁴ - (3 - キノリニル) - 2, 4 - ピリミジンジアミン；
 N² - (4 - (4 - メチル - 1 - ピペラジニル) フェニル) - N⁴ - (3 - キノリニル) - 2, 4 - ピリミジンジアミン；
 2 - (メトキシ) - 4 - ((4 - (3 - キノリニルアミノ) - 2 - ピリミジニル) アミノ) ベンズアミド；
 N² - [4 - (3 - ピペリジン - 1 - イル - プロポキシ) - フェニル] - N⁴ - キノリン - 3 - イル - ピリミジン - 2, 4 - ジアミン；
 N² - (4 - ((2 - (1 - ピペリジニル) エチル) オキシ) フェニル) - N⁴ - (3 - キノリニル) - 2, 4 - ピリミジンジアミン；
 N² - (3 - (2 - (ジメチルアミノ) エチル) - 4 - (メトキシ) フェニル) - N⁴ - (3 - キノリニル) - 2, 4 - ピリミジンジアミン；
 N² - (3 - (1, 3 - オキサゾール - 5 - イル) フェニル) - N⁴ - (3 - キノリニル) - 2, 4 - ピリミジンジアミン；
 N² - (3 - (メトキシ) - 4 - (1, 3 - オキサゾール - 5 - イル) フェニル) - N⁴ - (3 - キノリニル) - 2, 4 - ピリミジンジアミン；
 N² - (1 - アセチル - 3, 3 - ジメチル - 2, 3 - ジヒドロ - 1H - インドール - 6 - イル) - N⁴ - (3 - キノリニル) - 2, 4 - ピリミジンジアミン；
 N² - [3 - メトキシ - 4 - (2 - {4 - [4 - (キノリン - 3 - イルアミノ) - ピリミジン - 2 - イル] - ピペラジン - 1 - イル} - エトキシ) - フェニル] - N⁴ - キノリン - 3 - イル - ピリミジン - 2, 4 - ジアミン；
 N² - (3 - メトキシ - 4 - モルホリン - 4 - イル - フェニル) - N⁴ - キノリン - 3 - イル - ピリミジン - 2, 4 - ジアミン；
 N² - (3, 4, 5 - トリメトキシフェニル) - N⁴ - (6 - メトキシ - キノリン - 3 - イル) - 2, 4 - ピリミジンジアミン；
 N² - (2 - メチル - 4, 5 - ジメトキシフェニル) - N⁴ - (6 - メトキシ - キノリン - 3 - イル) - 2, 4 - ピリミジンジアミン；
 N² - (3, 4, 5 - トリメトキシフェニル) - N⁴ - (6 - トリフルオロメトキシ - キノリン - 3 - イル) - 2, 4 - ピリミジンジアミン；
 N² - (2 - メチル - 4, 5 - ジメトキシフェニル) - N⁴ - (6 - トリフルオロメトキシ - キノリン - 3 - イル) - 2, 4 - ピリミジンジアミン；
 3 - {2 - メトキシ - 4 - [4 - (キノリン - 3 - イルアミノ) - ピリミジン - 2 - イルアミノ] - フェニル} - 1 - ピロリジン - 1 - イル - プロペノン；
 3 - {2 - メトキシ - 4 - [4 - (キノリン - 3 - イルアミノ) - ピリミジン - 2 - イルアミノ] - フェニル} - 1 - ピロリジン - 1 - イル - プロパノン；
 N² - [3 - メトキシ - 4 - (3 - ピロリジン - 1 - イル - プロピル) - フェニル] - N⁴ - キノリン - 3 - イル - ピリミジン - 2, 4 - ジアミン；および
 N² - [3 - メトキシ - 4 - (2 - {1 - [4 - (キノリン - 3 - イルアミノ) - ピリミジン - 2 - イル] - ピペリジン - 4 - イル} - エトキシ) - フェニル] - N⁴ - キノリ

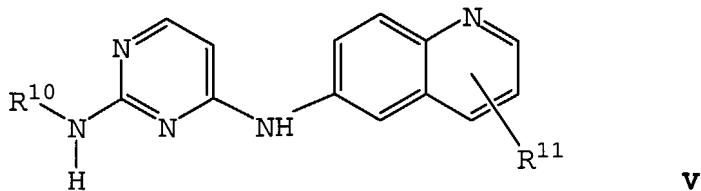
ン-3-イル-ピリミジン-2,4-ジアミン

から選択される、請求項32に記載の化合物およびその医薬適合性の誘導体。

【請求項43】

R^{11} が、4-アミノ-2-メチル置換である時、 R^{10} が、4-アミノ-2-メチルキノール-6-イルでないことを条件とする、下記式V：

【化6】



(式中、

R^{10} は、フェニル、ナフチル、および5～10員ヘテロシクリルから選択され、この場合、 R^{10} は、 R^{13} から選択された1個から4個の置換基で置換されていてもよく；

R^{11} は、H、 C_1 ～ C_4 アルキル、 C_1 ～ C_4 ハロアルキル、 C_2 ～ C_3 アルケニル、 C_2 ～ C_3 アルキニル、 C_3 ～ C_6 シクロアルキル、 C_4 ～ C_6 シクロアルケニル、フェニル、5～6員ヘテロシクリル、フルオロ、クロロ、ブロモ、 CF_3 、-OR¹⁴、-OC(O)R¹²、-NR¹²R¹²、-COOR¹²、-C(O)R¹²、-C(O)NR¹²R¹²、-SO₂R¹²、-SO₂NR¹²R¹²、-NR¹²C(O)NR¹²R¹²、-NR¹²C(O)R²、-NR¹²(COOR¹²)、-NR¹²SO₂NR¹²R¹²、-NR¹²SO₂R¹²、-OC(O)NR¹²R¹²、

置換されていてもよいフェニルおよび置換されていてもよい5～6員ヘテロシクリルから独自に選択された1個から3個の置換基で置換されている C_1 ～ C_3 アルキル、ならびに

置換されていてもよいフェニルおよび置換されていてもよい5～6員ヘテロシクリルから独自に選択された1個から3個の置換基で置換されている C_2 ～ C_3 アルケニルから選択された1個以上の置換基であり；

R^{12} は、キノリル置換基のいずれの環に結合していてもよく；

R^{13} は、

H、 C_1 ～ C_6 -アルキル、 C_1 ～ C_6 -ハロアルキル、

置換されていてもよいフェニルおよび置換されていてもよい5～6員ヘテロシクリルから独自に選択された1個から3個の置換基で置換されている C_1 ～ C_3 アルキル；この場合、置換されていてもよいフェニルおよび置換されていてもよい5～6員ヘテロシクリルは、 C_1 ～ C_4 -アルキル、クロロ、フルオロ、 CF_3 、ヒドロキシ、 C_1 ～ C_4 -アルコキシ、アミノ、 C_1 ～ C_4 -アルキルアミノ、カルボキシ、 C_1 ～ C_4 -アルコキシカルボニル、ニトロ、シアノ、 C_1 ～ C_4 -アルキルカルボニル、フェニル、(アルキル、 C_1 ～ C_4 -アルキルアミノカルボニル、アミノカルボニル、アミノスルホニル、アセチル、フェニルから選択された1個以上の置換基で置換されていてもよい)5～6員ヘテロシクリル、および[C_1 ～ C_4 -アルキル、クロロ、フルオロ、 CF_3 、ヒドロキシ、 C_1 ～ C_4 -アルコキシ、アミノ、 C_1 ～ C_4 -アルキルアミノ、カルボキシ、 C_1 ～ C_4 -アルコキシカルボニル、ニトロ、シアノ、 C_1 ～ C_4 -アルキルカルボニル、フェニル、(アルキル、 C_1 ～ C_4 -アルキルアミノカルボニル、アミノカルボニル、アミノスルホニル、アセチル、フェニル、および5～6員ヘテロシクリルから選択された1個以上の置換基で置換されていてもよい)5～6員ヘテロシクリルから選択された1個以上の置換基で置換されていてもよい]5～6員ヘテロシクリルから独自に選択された1個から3個の置換基で置換されている；および

C_1 ～ C_4 -アルキル、クロロ、フルオロ、 CF_3 、ヒドロキシ、 C_1 ～ C_4 -アルコキシ、アミノ、 C_1 ～ C_4 -アルキルアミノ、カルボキシ、 C_1 ～ C_4 -アルコキシカルボニル、

ニトロ、シアノ、C₁ ~ C₄ - アルキルカルボニル、C₁ ~ C₄ - アルキルアミノカルボニル、アミノカルボニル、アミノスルホニルおよびアセチルから独自に選択された1個から3個置換基で置換されていてもよいフェニル

から選択され；

R¹ ~ R³ は、C₁ ~ C₄ アルキル、C₂ ~ C₃ アルケニル、C₂ ~ C₃ アルキニル、C₃ ~ C₆ シクロアルキル、C₄ ~ C₆ シクロアルケニル、フェニル、5 ~ 6員ヘテロシクリル、フルオロ、クロロ、ブロモ、CF₃、-OR¹ ~ R²、-OC(O)R¹ ~ R²、-R¹ ~ R²、-COOR¹ ~ R²、-C(O)R¹ ~ R²、-C(O)NR¹ ~ R²、-SO₂R¹ ~ R²、-SO₂NR¹ ~ R²、-NR¹ ~ R²C(O)NR¹ ~ R²、-NR¹ ~ R²C(O)R¹ ~ R²、-NR¹ ~ R²(COOR¹ ~ R²)、-NR¹ ~ R²SO₂NR¹ ~ R²、-NR¹ ~ R²SO₂R¹ ~ R²、-OC(O)NR¹ ~ R²、

置換されていてもよいフェニルおよび置換されていてもよい5 ~ 6員ヘテロシクリルから独自に選択された1個から3個の置換基で置換されているC₁ ~ C₃ アルキル、および

置換されていてもよいフェニルおよび置換されていてもよい5 ~ 6員ヘテロシクリルから独自に選択された1個から3個の置換基で置換されているC₂ ~ C₃ アルケニルから選択され；ならびに

R¹ ~ R⁴ は、H、C₁ ~ C₆ - アルキル、アミノ - C₁ ~ C₆ - アルキル、C₁ ~ C₆ - アルキルアミノ - C₁ ~ C₆ - アルキル、アミノカルボニル - C₁ ~ C₆ - アルキル、C₁ ~ C₆ - アルキルアミノカルボニル - C₁ ~ C₆ - アルキル、ならびに

C₁ ~ C₄ - アルキル、クロロ、フルオロ、CF₃、ヒドロキシ、C₁ ~ C₄ - アルコキシ、アミノ、C₁ ~ C₄ - アルキルアミノ、カルボキシ、C₁ ~ C₄ - アルコキシカルボニル、NO₂、CN、C₁ ~ C₄ - アルキルカルボニル、C₁ ~ C₄ - アルキルアミノカルボニル、アミノカルボニル、アミノスルホニルおよびアセチル

から独自に選択された1個から3個の置換基で置換されていてもよいフェニル

から選択される）

の化合物およびその医薬適合性の塩。

【請求項 4 4】

R¹ ~ R¹⁰ が、3, 4, 5 - トリメトキシフェニル、3, 4 - ジメトキシフェニル、3, 5 - ジメトキシフェニル、3, 4 - ジメトキシ - 6 - シアノフェニル、2, 5 - ジメトキシフェニル、2 - メトキシフェニル、3 - メトキシフェニル、4 - メトキシフェニル、3 - (ジメチルアミノエチル) - 4 - メトキシフェニル、4 - メトキシ - 2 - ニトロフェニル、2 - メトキシ - 4 - ニトロフェニル、3, 4 - ジメトキシ - 6 - メチルフェニル、4 - (3 - ジメチルアミノ - プロポキシ) - フェニル、4 - (1 - t - ブトキシカルボニル - ピペラジン - 4 - イル) フェニル、4 - (4 - ピペラジニル) フェニル、3, 5 - ジメトキシ - 4 - [2 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - エトキシ] - フェニル、3, 5 - ジメトキシ - 4 - [3 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - プロポキシ] - フェニル、3 - メトキシ - 4 - [2 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - エトキシ] - フェニル、3 - メトキシ - 4 - [3 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - プロポキシ] - フェニル、3, 4 - ジメトキシ - 5 - [3 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - プロポキシ] - フェニル、3 - メトキシ - 4 - [2 - (1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル) - プロポキシ] - フェニル、3 - メトキシ - 4 - (1 - メチル - ピペリジン - 4 - イルメトキシ) - フェニル、3 - メトキシ - 4 - [2 - (1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル) - エトキシ] - フェニル、3 - フルオロ - 4 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - フェニル、3 - フルオロ - 4 - (3 - ピペリジン - 1 - イル - プロポキシ) - フェニル、4 - (4 - イソプロピル - ピペラジン - 1 - イル) - フェニル、2 - メチル - 4 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - フェニル、2 - フルオロ - 4 - (3 - ピペリジン - 1 - イル - プロポキシ) - フェニル、3, 5 - ジメトキシ - 4 - (2 - ピペリジン - 1 - イル - エトキシ) - フェニル、3, 5 - ジメトキシ - 4 - (2 - モルホリン - 4 - イル - エトキシ) - フェニル、4 - [2 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - エトキシ] - フェニル、3 - フルオロ - 4 - [

3 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - プロポキシ] - フェニル、 3 - フルオロ - 4 - [2 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - エトキシ] - フェニル、 3 - フルオロ - 4 - (2 - ピペリジン - 1 - イル - エトキシ) - フェニル、 4 - (1 - t - ブトキシカルボニル - ピペラジン - 4 - イル) - 3 - ジフルオロメトキシ - フェニル、 2 - エトキシカルボニルブチル - 4 , 5 - ジメトキシフェニル、 2 - カルボニルブチル - 4 , 5 - ジメトキシフェニル、 3 - メトキシ - 4 - (2 - { 4 - [4 - (キノリン - 3 - イルアミノ) - ピリミジン - 2 - イル] - ピペラジン - 1 - イル } - エトキシ) - フェニル、 3 - メトキシ - 4 - (2 - { 1 - [4 - (キノリン - 3 - イルアミノ) - ピリミジン - 2 - イル] - ピペリジン - 4 - イル } - エトキシ) - フェニル、 3 , 4 - ジエトキシフェニル、 3 - メトキシ - 4 - (ピロリジン - 1 - イルカルボニルエテニル) フェニル、 3 - メトキシ - 4 - (ピロリジン - 1 - イルプロピル) フェニル、 4 - [3 - (ピペリジン - 1 - イル) プロポキシ] フェニル、 4 - (2 - (ピペリジン - 1 - イル) エトキシ) フェニル、 6 - ベンズイミダゾリル、 4 - (メチルカルボニルアミノスルホニル) フェニル、 4 - (N , N ' - ジ - プロピルアミノスルホニル) フェニル、 3 - ブチルアミノスルホニルフェニル、 3 - ヒドロキシプロピルアミノスルホニルフェニル、 3 - [(2 - チアゾリル) アミノスルホニル] フェニル、 3 - アミノスルホニルフェニル、 4 - アミノスルホニルフェニル、 4 - メチルスルホニルフェニル、 3 - キノリル、 6 - キノリル、 6 - ヒドロキシ - 3 - キノリル、 インドール - 4 - イル、 ベンゾチアゾール - 6 - イル、 ベンゾチアゾール - 5 - イル、 1 , 2 , 3 - ベンゾトリアゾール - 5 - イル、 4 - (4 - モルホリニル) フェニル、 4 - (4 - メチルピペルジン - 1 - イル) フェニル、 3 - メトキシ - 4 - (4 - モルホリニル) フェニル、 4 - メトキシカルボニルフェニル、 3 - メトキシカルボニルフェニル、 4 - (ジメチルアミノ) フェニル、 3 - (ジメチルアミノ) フェニル、 4 - (ジメチルアミノ) - 2 - メチルフェニル、 3 - エチルフェニル、 4 - エチルフェニル、 4 - ニトロフェニル、 4 - (メチルカルボニルアミノ) フェニル、 3 - (メチルカルボニルアミノ) フェニル、 4 - メチルカルボニルフェニル、 3 - アミノカルボニルフェニル、 4 - アミノカルボニルフェニル、 4 - アミノカルボニル - 3 - メトキシフェニル、 3 - フルオロ - 4 - メトキシフェニル、 3 - クロロ - 4 - メトキシフェニル、 3 - トリフルオロメトキシフェニル、 4 - トリフルオロメトキシフェニル、 3 - クロロ - 4 - トリフルオロメトキシフェニル、 3 , 5 - ジトリフルオロメチルフェニル、 3 - フルオロ - 5 - トリフルオロメチルフェニル、 4 - フルオロ - 3 - トリフルオロメチルフェニル、 3 - メトキシ - 5 - トリフルオロメチルフェニル、 3 - メトキシ - 4 - ペンタフルオロエチルフェニル、 5 - インダゾリル、 6 - インダゾリル、 1 - メチル - インダゾール - 5 - イル、 3 - ピリジル、 6 - メトキシ - 3 - ピリジル、 2 - (4 - モルホリニル) - 5 - ピリジル、 4 - ブロモ - 2 - フルオロフェニル、 2 - フルオロフェニル、 3 - フルオロフェニル、 4 - フルオロフェニル、 2 - ブロモフェニル、 3 - ブロモフェニル、 4 - ブロモフェニル、 3 - クロロフェニル、 3 , 4 - ジクロロフェニル、 3 , 5 - ジクロロフェニル、 4 - クロロフェニル、 3 - エチニルフェニル、 3 - シアノフェニル、 2 , 2 - ジフルオロ - 1 , 3 - ベンゾジオキソール - 5 - イル、 1 , 3 - ベンゾジオキソール - 5 - イル、 2 - メチル - 1 , 3 - ジオキソ - イソインドール - 5 - イル、 3 - (オキサゾール - 5 - イル) フェニル、 4 - (オキサゾール - 5 - イル) フェニル、 3 - メトキシ - 4 - (オキサゾール - 5 - イル) フェニル、 2 - ナフチル、 5 - インドリル、 1 - アセチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 3 , 3 - ジメチルインドール - 6 - イル、 および 2 , 3 - ジヒドロ - 3 , 3 - ジメチルインドール - 6 - イル

から選択され；

R¹¹ が、 H、 ヒドロキシ、 メチル、 アセチル、 トリフルオロメチル、 メトキシ、 フェニルおよびトリフルオロメトキシから選択される、

請求項 4 3 に記載の化合物およびその医薬適合性の誘導体。

【請求項 4 5】

R¹⁰ が、 3 , 4 , 5 - トリメトキシフェニル、 3 - (ジメチルアミノエチル) - 4 -

メトキシフェニル、3-(1,3-オキサゾール-5-イル)フェニル、4-[3-(ピペリジン-1-イル)プロボキシ]フェニル、3-メトキシ-4-(ピロリジン-1-イルプロピル)フェニル、および3,4-ジメトキシ-6-メチルフェニルから選択され；ならびにR¹が、H、メトキシ、およびトリフルオロメトキシから選択され、また、R¹が、キノリル環の6または7位に結合している、請求項43に記載の化合物。

【請求項46】

N⁴-キノリン-6-イル-N²-(3,4,5-トリメトキシフェニル)-ピリミジン-2,4-ジアミン；

N²-(3-(1,3-オキサゾール-5-イル)フェニル)-N⁴-(6-キノリニル)-2,4-ピリミジンジアミン；および

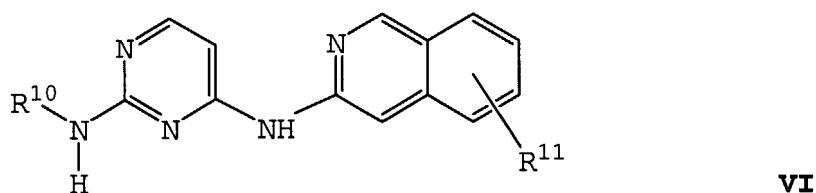
N⁴-(2-メチル-6-キノリニル)-N²-(3,4,5-トリス(メトキシ)フェニル)-2,4-ピリミジンジアミン

から選択される、請求項32に記載の化合物およびその医薬適合性の誘導体。

【請求項47】

下記式VI：

【化7】



(式中、

R¹は、フェニル、ナフチル、および5~10員ヘテロシクリルから選択され、この場合、R¹は、R¹から選択された1個から4個の置換基で場合によっては置換されており；

R¹は、H、C₁~C₄アルキル、C₁~C₄ハロアルキル、C₂~C₃アルケニル、C₂~C₃アルキニル、C₃~C₆シクロアルキル、C₄~C₆シクロアルケニル、フェニル、5~6員ヘテロシクリル、フルオロ、クロロ、ブロモ、CF₃、-OR¹⁴、-OC(O)R¹²、-NR¹²R¹²、-COOR²、-C(O)R¹²、-C(O)NR¹²R¹²、-SO₂R¹²、-SO₂NR¹²R¹²、-NR¹²C(O)NR¹²R¹²、-NR¹²C(O)R²、-NR¹²(COOR¹²)、-NR¹²SO₂NR¹²R¹²、-NR¹²SO₂R¹²、-OC(O)NR¹²R¹²、

置換されていてもよいフェニルおよび置換されていてもよい5~6員ヘテロシクリルから独自に選択された1個から3個の置換基で置換されているC₁~C₃アルキル、ならびに

置換されていてもよいフェニルおよび置換されていてもよい5~6員ヘテロシクリルから独自に選択された1個から3個の置換基で置換されているC₂~C₃アルケニルから選択された1個以上の置換基であり；

R¹は、キノリル置換基のいずれの環に結合していてもよく；

R¹は、

H、C₁~₆-アルキル、C₁~₆-ハロアルキル、

置換されていてもよいフェニルおよび置換されていてもよい5~6員ヘテロシクリルから独自に選択された1個から3個の置換基で置換されているC₁~C₃アルキル；この場合、置換されていてもよいフェニルおよび置換されていてもよい5~6員ヘテロシクリルは、C₁~₄-アルキル、クロロ、フルオロ、CF₃、ヒドロキシ、C₁~₄-アルコキシ、アミノ、C₁~₄-アルキルアミノ、カルボキシ、C₁~₄-アルコキシカルボニル、ニトロ、シアノ、C₁~₄-アルキルカルボニル、フェニル、(アルキル、C₁~₄-

アルキルアミノカルボニル、アミノカルボニル、アミノスルホニル、アセチル、フェニルから選択された1個以上の置換基で置換されていてもよい)5~6員ヘテロシクリル、および[C_{1~4}-アルキル、クロロ、フルオロ、CF₃、ヒドロキシ、C_{1~4}-アルコキシ、アミノ、C_{1~4}-アルキルアミノ、カルボキシ、C_{1~4}-アルコキシカルボニル、ニトロ、シアノ、C_{1~4}-アルキルカルボニル、フェニル、(アルキル、C_{1~4}-アルキルアミノカルボニル、アミノカルボニル、アミノスルホニル、アセチル、フェニル、および5~6員ヘテロシクリルから選択された1個以上の置換基で置換されていてもよい)5~6員ヘテロシクリルから選択された1個以上の置換基で置換されていてもよい]5~6員ヘテロシクリルから独自に選択された1個から3個の置換基で置換されている;および

C_{1~4}-アルキル、クロロ、フルオロ、CF₃、ヒドロキシ、C_{1~4}-アルコキシ、アミノ、C_{1~4}-アルキルアミノ、カルボキシ、C_{1~4}-アルコキシカルボニル、ニトロ、シアノ、C_{1~4}-アルキルカルボニル、C_{1~4}-アルキルアミノカルボニル、アミノカルボニル、アミノスルホニルおよびアセチルから独自に選択された1個から3個置換基で置換されていてもよいフェニル

から選択され;

R^{1~3}は、

C_{1~4}アルキル、C_{2~C3}アルケニル、C_{2~C3}アルキニル、C_{3~C6}シクロアルキル、C_{4~C6}シクロアルケニル、フェニル、5~6員ヘテロシクリル、フルオロ、クロロ、ブロモ、CF₃、-OR^{1~2}、-OC(O)R^{1~2}、-NR^{1~2}R^{1~2}、-COOR^{1~2}、-C(O)R^{1~2}、-C(O)NR^{1~2}R^{1~2}、-SO₂R^{1~2}、-SO₂NR^{1~2}R^{1~2}、-NR^{1~2}C(O)NR^{1~2}R^{1~2}、-NR^{1~2}C(O)R^{1~2}、-NR^{1~2}(COOR^{1~2})、-NR^{1~2}SO₂NR^{1~2}R^{1~2}、-NR^{1~2}SO₂R^{1~2}、-OC(O)NR^{1~2}R^{1~2}、

置換されていてもよいフェニルおよび置換されていてもよい5~6員ヘテロシクリルから独自に選択された1個から3個の置換基で置換されているC_{1~C3}アルキル、および

置換されていてもよいフェニルおよび置換されていてもよい5~6員ヘテロシクリルから独自に選択された1個から3個の置換基で置換されているC_{2~C3}アルケニルから選択され;ならびに

R^{1~4}は、H、C_{1~6}-アルキル、アミノ-C_{1~6}-アルキル、C_{1~6}-アルキルアミノ-C_{1~6}-アルキル、アミノカルボニル-C_{1~6}-アルキル、C_{1~6}-アルキルアミノカルボニル-C_{1~6}-アルキル、および

C_{1~4}-アルキル、クロロ、フルオロ、CF₃、ヒドロキシ、C_{1~4}-アルコキシ、アミノ、C_{1~4}-アルキルアミノ、カルボキシ、C_{1~4}-アルコキシカルボニル、NO₂、CN、C_{1~4}-アルキルカルボニル、C_{1~4}-アルキルアミノカルボニル、アミノカルボニル、アミノスルホニルおよびアセチル

から独自に選択された1個から3個の置換基で置換されていてもよいフェニル

から選択される)

の化合物およびその医薬適合性の誘導体。

【請求項4~8】

R^{1~0}が、3,4,5-トリメトキシフェニル、3,4-ジメトキシフェニル、3,5-ジメトキシフェニル、3,4-ジメトキシ-6-シアノフェニル、2,5-ジメトキシフェニル、2-メトキシフェニル、3-メトキシフェニル、4-メトキシフェニル、3-(ジメチルアミノエチル)-4-メトキシフェニル、4-メトキシ-2-ニトロフェニル、2-メトキシ-4-ニトロフェニル、3,4-ジメトキシ-6-メチルフェニル、4-(3-ジメチルアミノ-プロポキシ)-フェニル、4-(1-t-ブトキシカルボニル-ピペラジン-4-イル)フェニル、4-(4-ピペラジニル)フェニル、3,5-ジメトキシ-4-[2-(4-メチル-ピペラジン-1-イル)-エトキシ]-フェニル、3,5-ジメトキシ-4-[3-(4-メチル-ピペラジン-1-イル)-プロポキシ]-フェニル、3-メトキシ-4-[2-(4-メチル-ピペラジン-1-イル)-エトキシ]

- フェニル、3 - メトキシ - 4 - [3 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - プロポキシ] - フェニル、3 , 4 - ジメトキシ - 5 - [3 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - プロポキシ] - フェニル、3 - メトキシ - 4 - (1 - メチル - ピペリジン - 4 - イルメトキシ) - フェニル、3 - メトキシ - 4 - [2 - (1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル) - エトキシ] - フェニル、3 - フルオロ - 4 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - フェニル、3 - フルオロ - 4 - (3 - ピペリジン - 1 - イル - プロポキシ) - フェニル、4 - (4 - イソプロピル - ピペラジン - 1 - イル) - フェニル、2 - メチル - 4 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - フェニル、2 - フルオロ - 4 , 5 - ジメトキシ - フェニル、2 - メチル - 4 - [3 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - プロポキシ] - フェニル、2 - メチル - 4 - (3 - ピペリジン - 1 - イル - プロポキシ) - フェニル、3 , 5 - ジメトキシ - 4 - (2 - ピペリジン - 1 - イル - エトキシ) - フェニル、3 , 5 - ジメトキシ - 4 - (2 - モルホリン - 4 - イル - エトキシ) - フェニル、4 - [2 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - エトキシ] - フェニル、3 - フルオロ - 4 - [3 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - プロポキシ] - フェニル、3 - フルオロ - 4 - [2 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - エトキシ] - フェニル、3 - フルオロ - 4 - (2 - ピペリジン - 1 - イル - エトキシ) - フェニル、4 - (1 - t - ブトキシカルボニル - ピペラジン - 4 - イル) - 3 - ジフルオロメトキシ - フェニル、2 - エトキシカルボニルブチル - 4 , 5 - ジメトキシフェニル、2 - カルボニルブチル - 4 , 5 - ジメトキシフェニル、3 - メトキシ - 4 - (2 - { 4 - [4 - (キノリン - 3 - イルアミノ) - ピリミジン - 2 - イル] - ピペラジン - 1 - イル } - エトキシ) - フェニル、3 - メトキシ - 4 - (2 - { 1 - [4 - (キノリン - 3 - イルアミノ) - ピリミジン - 2 - イル] - ピペリジン - 4 - イル } - エトキシ) - フェニル、3 , 4 - ジエトキシフェニル、3 - メトキシ - 4 - (ピロリジン - 1 - イルカルボニルエテニル) フェニル、3 - メトキシ - 4 - (ピロリジン - 1 - イルカルボニルエチル) フェニル、3 - メトキシ - 4 - (ピロリジン - 1 - イルプロピル) フェニル、4 - [3 - (ピペリジン - 1 - イル) プロポキシ] フェニル、4 - (2 - (ピペリジン - 1 - イル) エトキシ) フェニル、6 - ベンズイミダゾリル、4 - (メチルカルボニルアミノスルホニル) フェニル、4 - (N , N ' - ジ - プロピルアミノスルホニル) フェニル、3 - ブチルアミノスルホニルフェニル、3 - ヒドロキシプロピルアミノスルホニルフェニル、3 - [(2 - チアゾリル) アミノスルホニル] フェニル、3 - アミノスルホニルフェニル、4 - アミノスルホニルフェニル、4 - メチルスルホニルフェニル、3 - キノリル、6 - キノリル、6 - ヒドロキシ - 3 - キノリル、イソキノリル、インドール - 4 - イル、ベンゾチアゾール - 6 - イル、ベンゾチアゾール - 5 - イル、1 , 2 , 3 - ベンゾトリアゾール - 5 - イル、4 - (4 - モルホリニル) フェニル、4 - (4 - メチルビペルジン - 1 - イル) フェニル、3 - メトキシ - 4 - (4 - モルホリニル) フェニル、4 - メトキシカルボニルフェニル、3 - メトキシカルボニルフェニル、4 - (ジメチルアミノ) フェニル、3 - (ジメチルアミノ) フェニル、4 - (ジメチルアミノ) - 2 - メチルフェニル、3 - エチルフェニル、4 - エチルフェニル、4 - ニトロフェニル、4 - (メチルカルボニルアミノ) フェニル、3 - (メチルカルボニルアミノ) フェニル、4 - メチルカルボニルフェニル、3 - アミノカルボニルフェニル、4 - アミノカルボニルフェニル、4 - アミノカルボニル - 3 - メトキシフェニル、3 - フルオロ - 4 - メトキシフェニル、3 - クロロ - 4 - メトキシフェニル、3 - トリフルオロメトキシフェニル、4 - トリフルオロメトキシフェニル、3 - クロロ - 4 - トリフルオロメトキシフェニル、3 , 5 - ジトリフルオロメチルフェニル、3 - フルオロ - 5 - トリフルオロメチルフェニル、4 - フルオロ - 3 - トリフルオロメチルフェニル、3 - メトキシ - 5 - トリフルオロメチルフェニル、3 - メトキシ - 4 - ペンタフルオロエチルフェニル、5 - インダゾリル、6 - インダゾリル、1 - メチル - インダゾール - 5 - イル、3 - ピリジル、6 - メトキシ - 3 - ピリジル、2 - (4 - モルホリニル) - 5 - ピリジル、4 - ブロモ - 2 - フルオロフェニル、2 - フルオロフェニル、3 - フルオロフェニル、4 - フルオロフェニル、2 - プロモフェニル、3 - プロモフェニル、4 - プロモフェニル、3 - クロロ - 4 - フルオロフェニル、3 - クロロフェニル、3 , 4 - ジクロロフェニル、3 , 5 -

ジクロロフェニル、4-クロロフェニル、3-エチルフェニル、3-シアノフェニル、2,2-ジフルオロ-1,3-ベンゾジオキソール-5-イル、1,3-ベンゾジオキソール-5-イル、2-メチル-1,3-ジオキソ-イソインドール-5-イル、3-(オキサゾール-5-イル)フェニル、4-(オキサゾール-5-イル)フェニル、3-メトキシ-4-(オキサゾール-5-イル)フェニル、2-ナフチル、イミダゾリル、ピラゾリル、ピロリル、5-インドリル、イソインドリル、1-アセチル-2,3-ジヒドロ-3,3-ジメチルインドール-6-イル、2,3-ジヒドロ-3,3-ジメチルインドール-6-イル、ブリニル、およびナフチリジニル

から選択され；

R^{1,1}が、H、ヒドロキシ、メチル、アセチル、トリフルオロメチル、メトキシ、フェニルおよびトリフルオロメトキシから選択される。

請求項47に記載の化合物およびその医薬適合性の誘導体。

【請求項49】

R^{1,0}が、3,4,5-トリメトキシフェニル、3-(ジメチルアミノエチル)-4-メトキシフェニル、3-(1,3-オキサゾール-5-イル)フェニル、4-[3-(ピペリジン-1-イル)プロポキシ]フェニル、3-メトキシ-4-(ピロリジン-1-イルプロピル)フェニル、および3,4-ジメトキシ-6-メチルフェニルから選択され；ならびにR^{1,1}が、H、メトキシ、およびトリフルオロメトキシから選択され、また、R^{1,1}が、キノリル置換基の6または7位に結合している、請求項47に記載の化合物。

【請求項50】

N⁴-(3-イソキノリニル)-N²-(3,4,5-トリス(メトキシ)フェニル)-2,4-ピリミジンジアミン；

N⁴-(3-イソキノリニル)-N²-(2-メチル-4,5-ビス(メトキシ)フェニル)-2,4-ピリミジンジアミン；および

N⁴-(1-メトキシ-イソキノリン-3-イル)-N²-(3,4,5-トリメトキシフェニル)-ピリミジン-2,4-ジアミン

から選択される、請求項47に記載の化合物およびその医薬適合性の誘導体。

【請求項51】

請求項1から50のいずれかに記載の化合物および医薬適合性の担体を含む組成物。

【請求項52】

哺乳動物におけるキナーゼ活性の阻害法において使用するための、請求項51に記載の組成物。

【請求項53】

対象における癌を治療する方法において使用するための、請求項51に記載の組成物。

【請求項54】

人体または動物体のための治療的治療法において使用するための、請求項1から50のいずれかに記載の化合物。

【請求項55】

哺乳動物におけるIGF-1R関連疾患の治療法において使用するための、請求項51に記載の組成物。

【請求項56】

哺乳動物におけるキナーゼ媒介疾病または疾病徴候の治療法において使用するための、請求項51に記載の組成物。

【請求項57】

対象における腫瘍サイズを低下させる方法において使用するための、請求項51に記載の組成物。

【請求項58】

癌治療用の薬物を調製するための、請求項1から50のいずれかに記載の化合物の使用。