

【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6日 (2011.5.6)

【公表番号】特表2010-522191 (P2010-522191A)

【公表日】平成22年7月1日 (2010.7.1)

【年通号数】公開・登録公報2010-026

【出願番号】特願2009-554682 (P2009-554682)

【国際特許分類】

C 07 D 215/38 (2006.01)

C 07 D 215/56 (2006.01)

C 07 D 471/04 (2006.01)

A 61 K 31/47 (2006.01)

A 61 K 31/4375 (2006.01)

A 61 P 27/02 (2006.01)

A 61 P 9/10 (2006.01)

A 61 P 3/10 (2006.01)

A 61 P 1/04 (2006.01)

A 61 P 19/02 (2006.01)

A 61 P 29/00 (2006.01)

A 61 P 17/06 (2006.01)

A 61 P 13/08 (2006.01)

A 61 P 31/04 (2006.01)

A 61 P 13/12 (2006.01)

A 61 P 1/18 (2006.01)

A 61 P 25/04 (2006.01)

A 61 P 35/00 (2006.01)

A 61 P 43/00 (2006.01)

A 61 P 11/06 (2006.01)

A 61 P 9/00 (2006.01)

【 F I 】

C 07 D 215/38

C 07 D 215/56 C S P

C 07 D 471/04 1 1 4 A

A 61 K 31/47

C 07 D 471/04 1 1 4 N

A 61 K 31/4375

A 61 P 27/02

A 61 P 9/10

A 61 P 3/10

A 61 P 1/04

A 61 P 19/02

A 61 P 29/00 1 0 1

A 61 P 17/06

A 61 P 13/08

A 61 P 9/10 1 0 1

A 61 P 31/04

A 61 P 13/12

A 61 P 1/18

A 61 P 25/04

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 11/06

A 6 1 P 9/00

【手続補正書】

【提出日】平成23年3月16日(2011.3.16)

【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

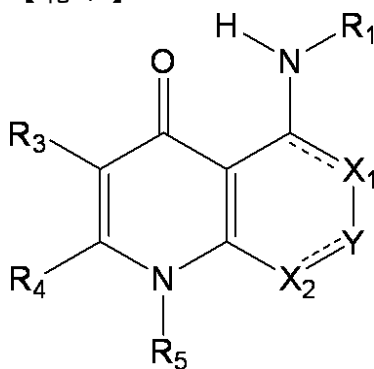
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

【化 1】



(式中、

X_1 及び X_2 は、それぞれ独立して、 $-CR_6-$ 、 $-CH-$ 、 $-N-$ 及び $-NR_8-$ からなる群から選択され；

Y は、 $-CR_9-$ 及び $-CO-$ からなる群から選択され；

R_1 は、置換又は非置換の (C_{4-12}) アリールであり；

R_3 は、それぞれ置換又は非置換の、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、 (C_{1-10}) アルコキシ、 (C_{4-12}) アリールオキシ、ヘテロ (C_{1-10}) アリールオキシ、カルボニル、オキシカルボニル、アミノカルボニル、アミノ、 (C_{1-10}) アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、 (C_{1-10}) アルキル、ハロ (C_{1-10}) アルキル、ヒドロキシ (C_{1-10}) アルキル、カルボニル (C_{1-10}) アルキル、チオカルボニル (C_{1-10}) アルキル、スルホニル (C_{1-10}) アルキル、スルフィニル (C_{1-10}) アルキル、アザ (C_{1-10}) アルキル、 (C_{1-10}) オキサアルキル、 (C_{1-10}) オキソアルキル、イミノ (C_{1-10}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-10}) アルキル、アリール (C_{1-10}) アルキル、ヘテロ (C_{1-10}) アリール (C_{1-5}) アルキル、 (C_{9-12}) ビシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{8-12}) ビシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{1-10}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル、 (C_{9-12}) ビシクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) ビシクロアルキル、 (C_{4-12}) アリール、ヘテロ (C_{1-10}) アリール、 (C_{9-12}) ビシクロアリール及びヘテロ (C_{4-12}) ビシクロアリールからなる群から選択され；

R_4 は、それぞれ置換又は非置換の、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、 (C_{1-10}) アルコキシ、 (C_{4-12}) アリールオキシ、ヘテロ (C_{1-10}) アリールオキシ、カルボニル、オキシカルボニル、アミノカルボ

ニル、アミノ、 $(C_1 - 1_0)$ アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、 $(C_1 - 1_0)$ アルキル、ハロ $(C_1 - 1_0)$ アルキル、ヒドロキシ $(C_1 - 1_0)$ アルキル、カルボニル $(C_1 - 1_0)$ アルキル、チオカルボニル $(C_1 - 1_0)$ アルキル、スルホニル $(C_1 - 1_0)$ アルキル、スルフィニル $(C_1 - 1_0)$ アルキル、アザ $(C_1 - 1_0)$ アルキル、 $(C_1 - 1_0)$ オキサアルキル、 $(C_1 - 1_0)$ オキソアルキル、イミノ $(C_1 - 1_0)$ アルキル、 $(C_3 - 1_2)$ シクロアルキル $(C_1 - 5)$ アルキル、ヘテロ $(C_3 - 1_2)$ シクロアルキル $(C_1 - 1_0)$ アルキル、アリール $(C_1 - 1_0)$ アルキル、ヘテロ $(C_1 - 1_0)$ アリール $(C_1 - 5)$ アルキル、 $(C_9 - 1_2)$ ビシクロアリール $(C_1 - 5)$ アルキル、ヘテロ $(C_8 - 1_2)$ ビシクロアリール $(C_1 - 5)$ アルキル、ヘテロ $(C_1 - 1_0)$ アルキル、 $(C_3 - 1_2)$ シクロアルキル、ヘテロ $(C_3 - 1_2)$ シクロアルキル、 $(C_9 - 1_2)$ ビシクロアルキル、ヘテロ $(C_3 - 1_2)$ ビシクロアルキル、 $(C_4 - 1_2)$ アリール、ヘテロ $(C_1 - 1_0)$ アリール、 $(C_9 - 1_2)$ ビシクロアリール及びヘテロ $(C_4 - 1_2)$ ビシクロアリールからなる群から選択されるか、あるいは、 R_3 及び R_4 が一緒になって置換又は非置換の環を形成し；

R_5 は、それぞれ置換又は非置換の、水素、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、 $(C_1 - 1_0)$ アルコキシ、 $(C_4 - 1_2)$ アリールオキシ、ヘテロ $(C_1 - 1_0)$ アリールオキシ、カルボニル、オキシカルボニル、アミノ、 $(C_1 - 1_0)$ アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、 $(C_1 - 1_0)$ アルキル、ハロ $(C_1 - 1_0)$ アルキル、ヒドロキシ $(C_1 - 1_0)$ アルキル、カルボニル $(C_1 - 1_0)$ アルキル、チオカルボニル $(C_1 - 1_0)$ アルキル、スルホニル $(C_1 - 1_0)$ アルキル、スルフィニル $(C_1 - 1_0)$ アルキル、アザ $(C_1 - 1_0)$ アルキル、イミノ $(C_1 - 1_0)$ アルキル、 $(C_3 - 1_2)$ シクロアルキル $(C_1 - 5)$ アルキル、ヘテロ $(C_3 - 1_2)$ シクロアルキル $(C_1 - 1_0)$ アルキル、アリール $(C_1 - 1_0)$ アルキル、ヘテロ $(C_1 - 1_0)$ アリール $(C_1 - 5)$ アルキル、 $(C_9 - 1_2)$ ビシクロアリール $(C_1 - 5)$ アルキル、ヘテロ $(C_8 - 1_2)$ ビシクロアリール $(C_1 - 5)$ アルキル、ヘテロ $(C_1 - 1_0)$ アルキル、 $(C_3 - 1_2)$ シクロアルキル、ヘテロ $(C_3 - 1_2)$ シクロアルキル、 $(C_9 - 1_2)$ ビシクロアルキル、ヘテロ $(C_3 - 1_2)$ ビシクロアルキル、 $(C_4 - 1_2)$ アリール、ヘテロ $(C_1 - 1_0)$ アリール、 $(C_9 - 1_2)$ ビシクロアリール及びヘテロ $(C_4 - 1_2)$ ビシクロアリールからなる群から選択されるか、あるいは、 R_4 及び R_5 が一緒になって置換又は非置換の環を形成し；

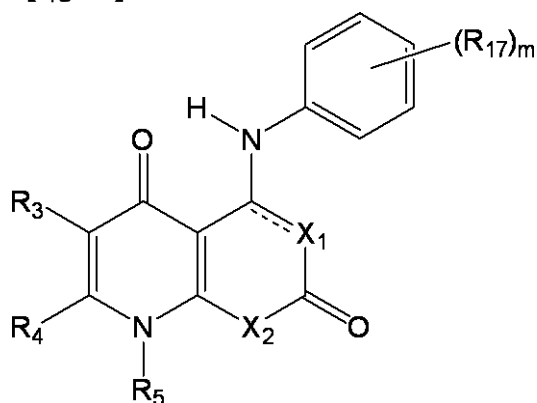
R_6 は、それぞれ置換又は非置換の、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、 $(C_1 - 1_0)$ アルコキシ、 $(C_4 - 1_2)$ アリールオキシ、ヘテロ $(C_1 - 1_0)$ アリールオキシ、カルボニル、オキシカルボニル、アミノカルボニル、アミノ、 $(C_1 - 1_0)$ アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、 $(C_1 - 1_0)$ アルキル、ハロ $(C_1 - 1_0)$ アルキル、ヒドロキシ $(C_1 - 1_0)$ アルキル、カルボニル $(C_1 - 1_0)$ アルキル、チオカルボニル $(C_1 - 1_0)$ アルキル、スルホニル $(C_1 - 1_0)$ アルキル、スルフィニル $(C_1 - 1_0)$ アルキル、アザ $(C_1 - 1_0)$ アルキル、 $(C_1 - 1_0)$ オキサアルキル、 $(C_1 - 1_0)$ オキソアルキル、イミノ $(C_1 - 1_0)$ アルキル、 $(C_3 - 1_2)$ シクロアルキル $(C_1 - 5)$ アルキル、ヘテロ $(C_3 - 1_2)$ シクロアルキル $(C_1 - 1_0)$ アルキル、アリール $(C_1 - 1_0)$ アルキル、ヘテロ $(C_1 - 1_0)$ アリール $(C_1 - 5)$ アルキル、 $(C_9 - 1_2)$ ビシクロアリール $(C_1 - 5)$ アルキル、ヘテロ $(C_8 - 1_2)$ ビシクロアリール $(C_1 - 5)$ アルキル、ヘテロ $(C_1 - 1_0)$ アルキル、 $(C_3 - 1_2)$ シクロアルキル、ヘテロ $(C_3 - 1_2)$ シクロアルキル、 $(C_9 - 1_2)$ ビシクロアルキル、ヘテロ $(C_3 - 1_2)$ ビシクロアルキル、 $(C_4 - 1_2)$ アリール、ヘテロ $(C_1 - 1_0)$ アリール、 $(C_9 - 1_2)$ ビシクロアリール及びヘテロ $(C_4 - 1_2)$ ビシクロアリールからなる群から選択されるか、あるいは、 R_5 及び R_6 が一緒になって置換又は非置換の環を形成し；

R_8 は、それぞれ置換又は非置換の、水素、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、 $($

かつ

で表される化合物、又は、その互変異性体、エナンチオマー若しくは薬学的に許容される塩。

【化 2】



各 R₁₋₇ は、独立して、それぞれ置換又は非置換の、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、アルコキシ、アリアルオキシ、ヘテロアリー

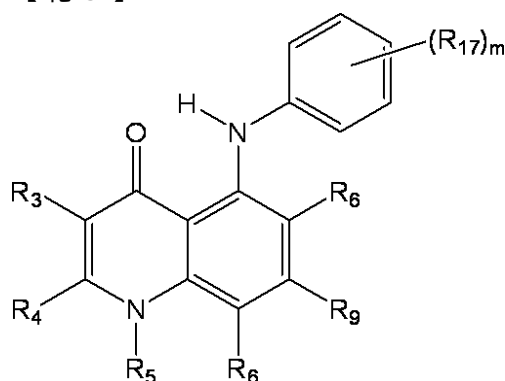
ルオキシ、カルボニル、オキシカルボニル、アミノカルボニル、アミノ、(C₁-10)アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C₁-10)アルキル、ハロ(C₁-10)アルキル、カルボニル(C₁-3)アルキル、チオカルボニル(C₁-3)アルキル、スルホニル(C₁-3)アルキル、スルフィニル(C₁-3)アルキル、アミノ(C₁-10)アルキル、イミノ(C₁-3)アルキル、(C₃-12)シクロアルキル(C₁-5)アルキル、ヘテロ(C₃-12)シクロアルキル(C₁-5)アルキル、アリール(C₁-10)アルキル、ヘテロアリール(C₁-5)アルキル、(C₉-12)ビスクロアリール(C₁-5)アルキル、ヘテロ(C₈-12)ビスクロアリール(C₁-5)アルキル、(C₃-12)シクロアルキル、ヘテロ(C₃-12)シクロアルキル、(C₉-12)ビスクロアルキル、ヘテロ(C₃-12)ビスクロアルキル、(C₄-12)アリール、ヘテロ(C₁-10)アリール、(C₉-12)ビスクロアリール及びヘテロ(C₄-12)ビスクロアリールからなる群から選択されるか、あるいは、二個のR₁₇が一緒になって置換又は非置換の環を形成し；かつ

その他の記号は請求項1と同意義を示す)

で表される、請求項1に記載の化合物、又は、その互変異性体、エナンチオマー若しくは薬学的に許容される塩。

【請求項3】

【化3】



(式中、

mは、0、1、2、3、4及び5からなる群から選択され；

各R₁₇は、独立して、それぞれ置換又は非置換の、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、オキシカルボニル、アミノカルボニル、アミノ、(C₁-10)アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C₁-10)アルキル、ハロ(C₁-10)アルキル、カルボニル(C₁-3)アルキル、チオカルボニル(C₁-3)アルキル、スルホニル(C₁-3)アルキル、スルフィニル(C₁-3)アルキル、アミノ(C₁-10)アルキル、イミノ(C₁-3)アルキル、(C₃-12)シクロアルキル(C₁-5)アルキル、ヘテロ(C₃-12)シクロアルキル(C₁-5)アルキル、アリール(C₁-10)アルキル、ヘテロアリール(C₁-5)アルキル、(C₉-12)ビスクロアリール(C₁-5)アルキル、ヘテロ(C₈-12)ビスクロアリール(C₁-5)アルキル、(C₃-12)シクロアルキル、ヘテロ(C₃-12)シクロアルキル、(C₉-12)ビスクロアルキル、ヘテロ(C₃-12)ビスクロアルキル、(C₄-12)アリール、ヘテロ(C₁-10)アリール、(C₉-12)ビスクロアリール及びヘテロ(C₄-12)ビスクロアリールからなる群から選択されるか、あるいは、二個のR₁₇が一緒になって置換又は非置換の環を形成し；かつ

その他の記号は請求項1と同意義を示す)

で表される、請求項1に記載の化合物、又は、その互変異性体、エナンチオマー若しくは薬学的に許容される塩。

【請求項4】

Yが-CO-である、請求項1に記載の化合物。

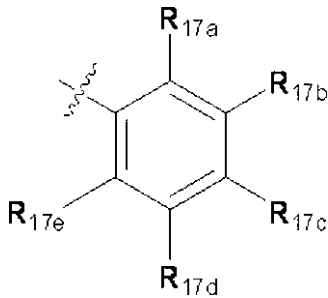
【請求項 5】

Y が - C R₉ = である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 6】

R₁ が、

【化 4】



(式中、

R_{17a}、R_{17b}、R_{17c}、R_{17d} 及び R_{17e} は、それぞれ独立して、それぞれ置換又は非置換の、水素、ハロ、シアノ、チオ、アルコキシ、(C₁ - 3) アルキル及びヒドロキシ(C₁ - 3) アルキルからなる群から選択される)

である、請求項 1、4 及び 5 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 7】

R₂ が、水素である、請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 8】

R₃ が、それぞれ置換又は非置換の、水素、ヒドロキシル、アルコキシ、(C₁ - 10) アルキル、ヒドロキシ(C₁ - 10) アルキル、(C₃ - 12) シクロアルキル、ヘテロ(C₃ - 12) シクロアルキル及びヘテロ(C₁ - 10) アリールからなる群から選択される、請求項 1 ~ 7 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 9】

R₃ が、水素である、請求項 1 ~ 7 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 10】

R₄ が、それぞれ置換又は非置換の、水素、(C₁ - 10) アルキル、オキサ(C₁ - 10) アルキル、アザ(C₁ - 10) アルキル及びチオ(C₁ - 10) アルキルからなる群から選択される、請求項 1 ~ 9 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 11】

R₅ が、それぞれ置換又は非置換の、水素、(C₁ - 10) アルキル及びオキサ(C₁ - 10) アルキルからなる群から選択される、請求項 1 ~ 10 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 12】

R₆ が、水素及び置換又は非置換の(C₁ - 5) アルキルからなる群から選択される、請求項 1 ~ 11 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 13】

R₇ が、水素及び置換又は非置換の(C₁ - 5) アルキルからなる群から選択される、請求項 1 ~ 12 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 14】

R₈ が、水素及び置換又は非置換の(C₁ - 5) アルキルからなる群から選択される、請求項 1、2 及び 4 ~ 13 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 15】

1 - シクロプロピル - 6 , 8 - ジフルオロ - 5 - (2 - フルオロ - 4 - ヨードフェニルアミノ) - 4 - オキソ - 1 , 4 - ジヒドロキノリン - 3 - カルボン酸 ;

1 - シクロプロピル - 6 , 8 - ジフルオロ - 5 - (2 - フルオロ - 4 - ヨードフェニルアミノ) - 1 H - キノリン - 4 - オン ;

3 - プロモ - 1 - シクロプロピル - 6 , 8 - ジフルオロ - 5 - (2 - フルオロ - 4 - ヨー

ドフェニルアミノ) - 1 H - キノリン - 4 - オン ;

6 , 8 - ジフルオロ - 5 - (2 - フルオロ - 4 - ヨードフェニルアミノ) - 1 - メチル - 4 - オキソ - 1 , 4 - ジヒドロキノリン - 3 - カルボン酸 ;

1 - (3 - (アセチルアミノ)フェニル) - 6 , 8 - ジフルオロ - 5 - (2 - フルオロ - 4 - ヨードフェニルアミノ) - 4 - オキソ - 1 , 4 - ジヒドロキノリン - 3 - カルボン酸 ;

N - (3 - (6 , 8 - ジフルオロ - 5 - (2 - フルオロ - 4 - ヨードフェニルアミノ) - 4 - オキソキノリン - 1 (4 H) - イル)フェニル)アセトアミド ;

1 - シクロプロピル - 7 - フルオロ - 5 - (2 - フルオロ - 4 - ヨードフェニルアミノ) - 3 - ヒドロキシ - 2 - メチル - 1 H - キノリン - 4 - オン ;

1 - シクロプロピル - 7 - フルオロ - 5 - (2 - フルオロ - 4 - ヨードフェニルアミノ) - 3 - (2 - ヒドロキシエトキシ) - 2 - メチル - 1 H - キノリン - 4 - オン ;

1 - シクロプロピル - 7 - フルオロ - 5 - (2 - フルオロ - 4 - ヨードフェニルアミノ) - 3 - (3 - ヒドロキシシプロポキシ) - 2 - メチル - 1 H - キノリン - 4 - オン ;

1 - シクロプロピル - 5 - (2 - フルオロ - 4 - ヨードフェニルアミノ) - 3 - (2 - ヒドロキシエトキシ) - 7 - メトキシ - 2 - メチル - 1 H - キノリン - 4 - オン ;

7 - フルオロ - 5 - (2 - フルオロ - 4 - ヨードフェニルアミノ) - 3 - メトキシ - 1 , 2 - ジメチル - 1 H - キノリン - 4 - オン ;

7 - フルオロ - 5 - (2 - フルオロ - 4 - ヨードフェニルアミノ) - 3 - ヒドロキシ - 1 , 2 - ジメチル - 1 H - キノリン - 4 - オン ;

7 - フルオロ - 5 - (2 - フルオロ - 4 - ヨードフェニルアミノ) - 3 - (2 - ヒドロキシエトキシ) - 1 , 2 - ジメチル - 1 H - キノリン - 4 - オン ;

7 - フルオロ - 5 - (2 - フルオロ - 4 - ヨードフェニルアミノ) - 3 - ヒドロキシ - 1 - メチル - 1 H - キノリン - 4 - オン ;

7 - フルオロ - 5 - (2 - フルオロ - 4 - ヨードフェニルアミノ) - 3 - (2 - ヒドロキシエトキシ) - 1 - メチル - 1 H - キノリン - 4 - オン ;

3 - ((R) - 2 , 3 - ジヒドロキシシプロポキシ) - 7 - フルオロ - 5 - (2 - フルオロ - 4 - ヨードフェニルアミノ) - 1 - メチル - 1 H - キノリン - 4 - オン ;

3 - ((S) - 2 , 3 - ジヒドロキシシプロポキシ) - 7 - フルオロ - 5 - (2 - フルオロ - 4 - ヨードフェニルアミノ) - 1 - メチル - 1 H - キノリン - 4 - オン ;

7 - フルオロ - 5 - (2 - フルオロ - 4 - ヨードフェニルアミノ) - 3 - (3 - ヒドロキシシプロポキシ) - 1 - メチルキノリン - 4 (1 H) - オン ;

(R) - 7 - フルオロ - 5 - (2 - フルオロ - 4 - ヨードフェニルアミノ) - 3 - (3 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロポキシ) - 1 - メチルキノリン - 4 (1 H) - オン ;

7 - フルオロ - 5 - (2 - フルオロ - 4 - ヨードフェニルアミノ) - 1 - メチル - 3 - (ピロリジン - 3 - イル)メトキシキノリン - 4 (1 H) - オン ;

7 - フルオロ - 5 - (2 - フルオロ - 4 - ヨードフェニルアミノ) - 3 - ((S) - 3 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロポキシ) - 1 - メチル - 1 H - キノリン - 4 - オン ;

3 - (2 - アミノエトキシ) - 7 - フルオロ - 5 - (2 - フルオロ - 4 - ヨードフェニルアミノ) - 1 - メチル - 1 H - キノリン - 4 - オン ;

3 - (3 - アミノプロポキシ) - 7 - フルオロ - 5 - (2 - フルオロ - 4 - ヨードフェニルアミノ) - 1 - メチル - 1 H - キノリン - 4 - オン ;

3 - [7 - フルオロ - 5 - (2 - フルオロ - 4 - ヨードフェニルアミノ) - 1 - メチル - 4 - オキソ - 1 , 4 - ジヒドロキノリン - 3 - イルオキシ] プロピオンアミド ;

2 - [7 - フルオロ - 5 - (2 - フルオロ - 4 - ヨードフェニルアミノ) - 1 - メチル - 4 - オキソ - 1 , 4 - ジヒドロ - キノリン - 3 - イルオキシ] アセトアミド ;

7 - フルオロ - 5 - (2 - フルオロ - 4 - ヨードフェニルアミノ) - 1 - (4 - メトキシベンジル) - 4 - オキソ - 1 , 4 - ジヒドロキノリン - 3 - カルボン酸 ;

7 - フルオロ - 5 - (2 - フルオロ - 4 - ヨードフェニルアミノ) - 1 - (4 - メトキシベンジル) - 1 H - キノリン - 4 - オン ;

7 - フルオロ - 5 - (2 - フルオロ - 4 - ヨードフェニルアミノ) - 1 H - キノリン - 4 - オン ;
 7 - フルオロ - 5 - (2 - フルオロ - 4 - ヨードフェニルアミノ) - 1 - (3 - ヒドロキシプロピル) - 1 H - キノリン - 4 - オン ;
 7 - フルオロ - 5 - (2 - フルオロ - 4 - ヨードフェニルアミノ) - 1 - メチルキノリン - 4 (1 H) - オン ;
 2 - [7 - フルオロ - 5 - (2 - フルオロ - 4 - ヨードフェニルアミノ) - 4 - オキソ - 4 H - キノリン - 1 - イル] - N - メチルアセトアミド ;
 3 - [7 - フルオロ - 5 - (2 - フルオロ - 4 - ヨードフェニルアミノ) - 4 - オキソ - 4 H - キノリン - 1 - イル] プロピオン酸メチルエステル ;
 1 - シクロプロピル - 7 - フルオロ - 5 - (2 - フルオロ - 4 - ヨードフェニルアミノ) - 3 - ヒドロキシ - 1 H - キノリン - 4 - オン ;
 1 - シクロプロピル - 3 - ((R) - 2 , 3 - ジヒドロキシプロボキシ) - 7 - フルオロ - 5 - (2 - フルオロ - 4 - ヨードフェニルアミノ) - 1 H - キノリン - 4 - オン ;
 5 - (2 - フルオロ - 4 - ニトロフェニルアミノ) - 1 , 8 - ジメチル - 4 , 7 - ジオキソ - 1 , 4 , 7 , 8 - テトラヒドロ [1 , 8] ナフチリジン - 3 - カルボン酸メチルエステル ;
 5 - (4 - アミノ - 2 - フルオロフェニルアミノ) - 1 , 8 - ジメチル - 4 , 7 - ジオキソ - 1 , 4 , 7 , 8 - テトラヒドロ [1 , 8] ナフチリジン - 3 - カルボン酸メチルエステル ;
 5 - (2 - フルオロ - 4 - ヨードフェニルアミノ) - 1 , 8 - ジメチル - 4 , 7 - ジオキソ - 1 , 4 , 7 , 8 - テトラヒドロ [1 , 8] ナフチリジン - 3 - カルボン酸メチルエステル ;
 5 - (2 - フルオロ - 4 - ヨードフェニルアミノ) - 1 , 8 - ジメチル - 4 , 7 - ジオキソ - 1 , 4 , 7 , 8 - テトラヒドロ [1 , 8] ナフチリジン - 3 - カルボン酸 ;
 4 - (2 - フルオロ - 4 - ヨードフェニルアミノ) - 1 , 8 - ジメチル - 1 H , 8 H - [1 , 8] ナフチリジン - 2 , 5 - ジオン ;
 6 - クロロ - 5 - (2 - フルオロ - 4 - ヨードフェニルアミノ) - 1 , 8 - ジメチル - 4 , 7 - ジオキソ - 1 , 4 , 7 , 8 - テトラヒドロ [1 , 8] ナフチリジン - 3 - カルボン酸メチルエステル ;
 6 - クロロ - 5 - (2 - フルオロ - 4 - ヨードフェニルアミノ) - 1 , 8 - ジメチル - 4 , 7 - ジオキソ - 1 , 4 , 7 , 8 - テトラヒドロ [1 , 8] ナフチリジン - 3 - カルボン酸 ;
 (R) - 6 - (2 , 3 - ジヒドロキシプロボキシ) - 4 - (2 - フルオロ - 4 - ヨードフェニルアミノ) - 1 , 8 - ジメチル - 1 , 8 - ナフチリジン - 2 , 5 (1 H , 8 H) - ジオン ;
 (R) - 3 - (2 , 3 - ジヒドロキシプロボキシ) - 5 - (2 - フルオロ - 4 - ヨードフェニルアミノ) - 1 , 6 - ジメチル - 1 , 6 - ナフチリジン - 4 , 7 (1 H , 6 H) - ジオン ;
 5 - (2 - フルオロ - 4 - ヨードフェニルアミノ) - 3 - (2 - ヒドロキシエトキシ) - 1 , 6 - ジメチル - 1 , 6 - ナフチリジン - 4 , 7 (1 H , 6 H) - ジオン ;
 (S) - 3 - (1 , 2 - ジヒドロキシエチル) - 5 - (2 - フルオロ - 4 - ヨードフェニルアミノ) - 1 , 6 - ジメチル - 1 , 6 - ナフチリジン - 4 , 7 (1 H , 6 H) - ジオン ;
 (R) - 4 - (4 - プロモ - 2 - クロロフェニルアミノ) - 6 - (2 , 3 - ジヒドロキシプロボキシ) - 1 , 8 - ジメチル - 1 , 8 - ナフチリジン - 2 , 5 (1 H , 8 H) - ジオン ;
 (R) - 4 - (2 - クロロ - 4 - ヨードフェニルアミノ) - 6 - (2 , 3 - ジヒドロキシプロボキシ) - 1 , 8 - ジメチル - 1 , 8 - ナフチリジン - 2 , 5 (1 H , 8 H) - ジオン ;

(R) - 6 - (2 , 3 - ジヒドロキシプロポキシ) - 3 - フルオロ - 4 - (2 - フルオロ - 4 - ヨードフェニルアミノ) - 1 , 8 - ジメチル - 1 , 8 - ナフチリジン - 2 , 5 (1 H , 8 H) - ジオン ;

4 - (2 - フルオロ - 4 - ヨードフェニルアミノ) - 6 - (ヒドロキシメチル) - 1 , 8 - ジメチル - 1 , 8 - ナフチリジン - 2 , 5 (1 H , 8 H) - ジオン ;

(S) - 6 - (2 , 3 - ジヒドロキシプロポキシ) - 3 - フルオロ - 4 - (2 - フルオロ - 4 - ヨードフェニルアミノ) - 1 , 8 - ジメチル - 1 , 8 - ナフチリジン - 2 , 5 (1 H , 8 H) - ジオン ;

3 - フルオロ - 4 - (2 - フルオロ - 4 - ヨードフェニルアミノ) - 6 - (2 - ヒドロキシエトキシ) - 1 , 8 - ジメチル - 1 , 8 - ナフチリジン - 2 , 5 (1 H , 8 H) - ジオン ;

4 - (2 - フルオロ - 4 - ヨードフェニルアミノ) - 8 - (2 - ヒドロキシエチル) - 1 - メチル - 1 , 8 - ナフチリジン - 2 , 5 (1 H , 8 H) - ジオン ;

4 - (2 - フルオロ - 4 - ヨードフェニルアミノ) - 6 - (2 - ヒドロキシエトキシ) - 1 , 3 , 8 - トリメチル - 1 , 8 - ナフチリジン - 2 , 5 (1 H , 8 H) - ジオン ;

(R) - 3 - クロロ - 6 - (2 , 3 - ジヒドロキシプロポキシ) - 4 - (2 - フルオロ - 4 - ヨードフェニルアミノ) - 1 , 8 - ジメチル - 1 , 8 - ナフチリジン - 2 , 5 (1 H , 8 H) - ジオン ;

(R) - 6 - (2 , 3 - ジヒドロキシプロポキシ) - 4 - (2 - フルオロ - 4 - ヨードフェニルアミノ) - 1 , 3 , 8 - トリメチル - 1 , 8 - ナフチリジン - 2 , 5 (1 H , 8 H) - ジオン ;

(S) - 6 - (2 , 3 - ジヒドロキシプロポキシ) - 4 - (2 - フルオロ - 4 - ヨードフェニルアミノ) - 1 , 8 - ジメチル - 1 , 8 - ナフチリジン - 2 , 5 (1 H , 8 H) - ジオン ;

(S) - 6 - (2 , 4 - ジヒドロキシブトキシ) - 4 - (2 - フルオロ - 4 - ヨードフェニルアミノ) - 1 , 8 - ジメチル - 1 , 8 - ナフチリジン - 2 , 5 (1 H , 8 H) - ジオン ;

(R) - 6 - (2 , 4 - ジヒドロキシブトキシ) - 4 - (2 - フルオロ - 4 - ヨードフェニルアミノ) - 1 , 8 - ジメチル - 1 , 8 - ナフチリジン - 2 , 5 (1 H , 8 H) - ジオン ;

(S) - 6 - (1 , 2 - ジヒドロキシエチル) - 4 - (2 - フルオロ - 4 - ヨードフェニルアミノ) - 1 , 8 - ジメチル - 1 , 8 - ナフチリジン - 2 , 5 (1 H , 8 H) - ジオン ;

(R) - 6 - (1 , 2 - ジヒドロキシエチル) - 4 - (2 - フルオロ - 4 - ヨードフェニルアミノ) - 1 , 8 - ジメチル - 1 , 8 - ナフチリジン - 2 , 5 (1 H , 8 H) - ジオン ;

(S) - 6 - (1 , 3 - ジヒドロキシプロピル) - 4 - (2 - フルオロ - 4 - ヨードフェニルアミノ) - 1 , 8 - ジメチル - 1 , 8 - ナフチリジン - 2 , 5 (1 H , 8 H) - ジオン ;

(R) - 6 - (1 , 3 - ジヒドロキシプロピル) - 4 - (2 - フルオロ - 4 - ヨードフェニルアミノ) - 1 , 8 - ジメチル - 1 , 8 - ナフチリジン - 2 , 5 (1 H , 8 H) - ジオン ;

(S) - 3 - (1 , 2 - ジヒドロキシエチル) - 5 - (2 - フルオロ - 4 - ヨードフェニルアミノ) - 8 - メチル - 4 H - ピラノ [2 , 3 - b] ピリジン - 4 , 7 (8 H) - ジオン ;

5 - (2 - フルオロ - 4 - ヨードフェニルアミノ) - 3 - (2 - ヒドロキシエトキシ) - 8 - メチル - 4 H - ピラノ [2 , 3 - b] ピリジン - 4 , 7 (8 H) - ジオン ; 及び

(R) - 3 - (2 , 3 - ジヒドロキシプロポキシ) - 5 - (2 - フルオロ - 4 - ヨードフェニルアミノ) - 8 - メチル - 4 H - ピラノ [2 , 3 - b] ピリジン - 4 , 7 (8 H) - ジオン ;

からなる群から選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 16】

化合物が薬学的に許容される塩の形態である、請求項 1 ～ 15 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 17】

化合物が立体異性体の混合物で存在している、請求項 1 ～ 16 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 18】

化合物が単一の立体異性体を含む、請求項 1 ～ 16 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 19】

請求項 1 ～ 18 のいずれか一項に記載の化合物を有効成分として含む、医薬組成物。

【請求項 20】

癌性過剰増殖異常、非癌性過剰増殖異常、膵炎、腎疾患または疼痛の治療剤；未分化胚芽細胞の移植の予防剤；脈管形成もしくは血管形成関連疾患、喘息、好中球走化性、敗血性ショック、免疫抑制が有効であろう T - 細胞が介在する疾患またはアテローム性動脈硬化の治療剤；あるいは、成長因子カクテルに対するケラチノサイト反応の阻害剤である、請求項 19 に記載の医薬組成物。

【請求項 21】

過剰増殖異常が癌である、請求項 20 に記載の医薬組成物。

【請求項 22】

癌が、脳癌、肺癌、扁平上皮細胞癌、膀胱癌、胃癌、膵臓癌、乳癌、頭部癌、頸部癌、腎臓（renal）癌、腎臓（kidney）癌、卵巣癌、前立腺癌、結腸直腸癌、前立腺癌、結腸癌、扁平上皮癌、食道癌、精巣癌、婦人科癌又は甲状腺癌からなる群から選択される、請求項 21 に記載の医薬組成物。

【請求項 23】

過剰増殖異常が、良性過皮膚形成、再狭窄及び良性前立腺肥大症（BPH）からなる群から選択される、請求項 20 に記載の医薬組成物。

【請求項 24】

良性過皮膚形成が乾癬である、請求項 23 に記載の医薬組成物。

【請求項 25】

脈管形成又は血管形成関連疾患が、腫瘍血管形成及び慢性炎症性疾患なる群から選択される、請求項 20 に記載の医薬組成物。

【請求項 26】

慢性炎症性疾患が、関節リウマチ、アテローム性動脈硬化、炎症性腸疾患、皮膚疾患、糖尿病、糖尿病性網膜症、未熟児網膜症、加齢性黄斑変性症、血管腫、神経膠腫、黒色腫、カポジ肉腫、並びに卵巣癌、乳癌、肺癌、膵臓癌、前立腺癌、結腸癌及び扁平上皮癌からなる群から選択される、請求項 25 に記載の医薬組成物。