

【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

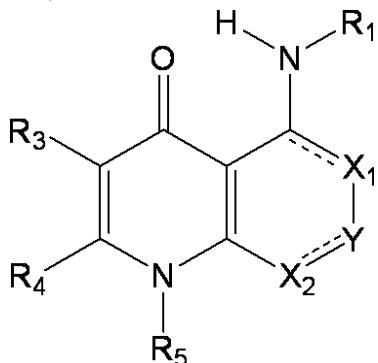
【補正方法】変更

【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、(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、ヒドロキシ(C₁-1₀)アルキル、カルボニル(C₁-1₀)アルキル、チオカルボニル(C₁-1₀)アルキル、スルホニル(C₁-1₀)アルキル、アザ(C₁-1₀)アルキル、(C₁-1₀)オキサアルキル、(C₁-1₀)オキソアルキル、イミノ(C₁-1₀)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(C₁-1₀)アルキル、アリール(C₁-1₀)アルキル、ヘテロ(C₁-1₀)アリール(C₁-5)アルキル、(C₉-1₂)ビシクロアリール(C₁-5)アルキル、ヘテロ(C₈-1₂)ビシクロアリール(C₁-5)アルキル、ヘテロ(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、(C₉-1₂)ビシクロアルキル、ヘテロ(C₃-1₂)ビシクロアルキル、(C₄-1₂)アリール、ヘテロ(C₁-1₀)アリール、(C₉-1₂)ビシクロアリール及びヘテロ(C₄-1₂)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、R₃及びR₄が一緒になって置換又は非置換の環を形成し；

R₅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、(C₁-1₀)アルコキシ、(C₄-1₂)アリールオキシ、ヘテロ(C₁-1₀)アリールオキシ、カルボニル、オキシカルボニル、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、ヒドロキシ(C₁-1₀)アルキル、カルボニル(C₁-1₀)アルキル、スルホニル(C₁-1₀)アルキル、アザ(C₁-1₀)アルキル、イミノ(C₁-1₀)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(C₁-1₀)アルキル、アリール(C₁-1₀)アルキル、ヘテロ(C₁-1₀)アルキル、(C₉-1₂)ビシクロアリール(C₁-5)アルキル、ヘテロ(C₈-1₂)ビシクロアリール(C₁-5)アルキル、ヘテロ(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、(C₉-1₂)ビシクロアルキル、ヘテロ(C₃-1₂)ビシクロアルキル、(C₄-1₂)アリール、ヘテロ(C₁-1₀)アリール、(C₉-1₂)ビシクロアリール及びヘテロ(C₄-1₂)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、R₄及びR₅が一緒になって置換又は非置換の環を形成し；

R₆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、(C₁-1₀)アルコキシ、(C₄-1₂)アリールオキシ、ヘテロ(C₁-1₀)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、(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、ヒドロキシ(C₁-1₀)アルキル、カルボニル(C₁-1₀)アルキル、チオカルボニル(C₁-1₀)アルキル、スルホニル(C₁-1₀)アルキル、スルフィニル(C₁-1₀)アルキル、アザ(C₁-1₀)アルキル、(C₁-1₀)オキサアルキル、(C₁-1₀)オキソアルキル、イミノ(C₁-1₀)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(C₁-1₀)アルキル、アリール(C₁-1₀)アルキル、ヘテロ(C₁-1₀)アルキル、(C₉-1₂)ビシクロアリール(C₁-5)アルキル、ヘテロ(C₈-1₂)ビシクロアリール(C₁-5)アルキル、ヘテロ(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、(C₉-1₂)ビシクロアルキル、(C₄-1₂)アリール、ヘテロ(C₁-1₀)アリール、(C₉-1₂)ビシクロアリール及びヘテロ(C₄-1₂)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、R₅及びR₆が一緒になって置換又は非置換の環を形成し；

R₈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_{1-10}) 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、 (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、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_{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るか、あるいは、 R_5 及び R_8 が一緒にになって置換又は非置換の環を形成し；

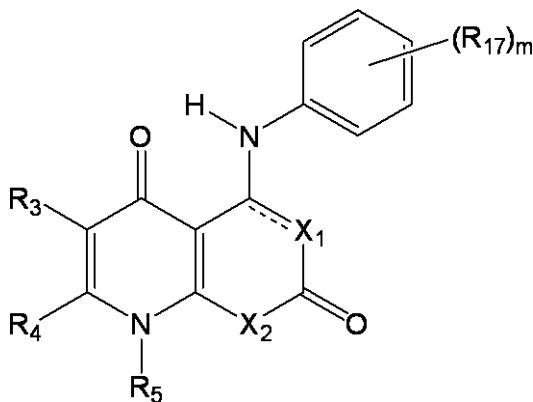
かつ

R_{11} 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_{1-10}) 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、 (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、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_{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る）

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。

【請求項 2】

【化 2】



(式中、

m は、0、1、2、3、4 及び 5 からなる群から選択され；

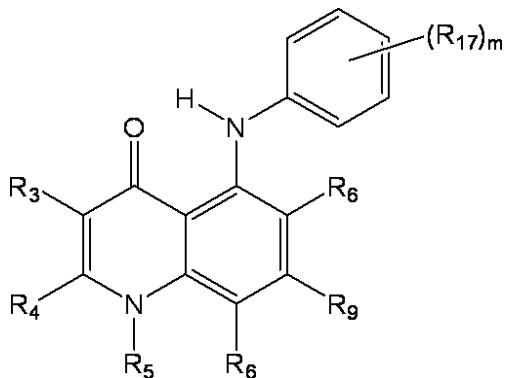
各 R_{17} は、独立して、それぞれ置換又は非置換の、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリー

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)ビシクロアリール(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)ビシクロアルキル、(C₄₋₁₂)アリール、ヘテロ(C₁₋₁₀)アリール、(C₉₋₁₂)ビシクロアリール及びヘテロ(C₄₋₁₂)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、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)ビシクロアリール(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)ビシクロアルキル、(C₄₋₁₂)アリール、ヘテロ(C₁₋₁₀)アリール、(C₉₋₁₂)ビシクロアリール及びヘテロ(C₄₋₁₂)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、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。

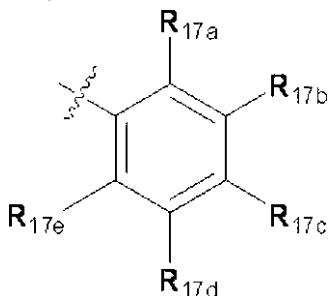
【請求項 5】

Y が $-\text{C}\text{R}_9=$ である、請求項1に記載の化合物。

【請求項 6】

R_1 が、

【化4】



(式中、

$\text{R}_{17\text{a}}$ 、 $\text{R}_{17\text{b}}$ 、 $\text{R}_{17\text{c}}$ 、 $\text{R}_{17\text{d}}$ 及び $\text{R}_{17\text{e}}$ 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、(C_{1-3})アルキル及びヒドロキシ(C_{1-3})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】

R_2 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】

R_3 が、それぞれ置換又は非置換の、水素、ヒドロキシリ、アルコキシ、(C_{1-10})アルキル、ヒドロキシ(C_{1-10})アルキル、(C_{3-12})シクロアルキル、ヘテロ(C_{3-12})シクロアルキル及びヘテロ(C_{1-10})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】

R_3 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】

R_4 が、それぞれ置換又は非置換の、水素、(C_{1-10})アルキル、オキサ(C_{1-10})アルキル、アザ(C_{1-10})アルキル及びチオ(C_{1-10})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】

R_5 が、それぞれ置換又は非置換の、水素、(C_{1-10})アルキル及びオキサ(C_{1-10})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】

R_6 が、水素及び置換又は非置換の(C_{1-5})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】

R_7 が、水素及び置換又は非置換の(C_{1-5})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】

R_8 が、水素及び置換又は非置換の(C_{1-5})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 - ブロモ - 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 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) - 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) - 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 - ブロモ - 2 - クロロフェニルアミノ) - 6 - (2 , 3 - ジヒドロキシプロポキシ) - 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 - ジヒドロキシプロポキシ) - 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 1 6】

化合物が薬学的に許容される塩の形態である、請求項 1 ~ 1 5 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 1 7】

化合物が立体異性体の混合物で存在している、請求項 1 ~ 1 6 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 1 8】

化合物が単一の立体異性体を含む、請求項 1 ~ 1 6 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 1 9】

請求項 1 ~ 1 8 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 2 0】

癌性過剰増殖異常、非癌性過剰増殖異常、脾炎、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 1 9 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 1】

過剰増殖異常が癌である、請求項 2 0 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 2】

癌が、脳癌、肺癌、扁平上皮細胞癌、膀胱癌、胃癌、脾臓癌、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 2 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 3】

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 2 0 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 4】

良性過皮膚形成が乾癬である、請求項 2 3 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 5】

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 2 0 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 6】

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、脾臓癌、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 2 5 に記載の医薬組成物。