

【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17年11月24日(2005.11.24)

【公表番号】特表2001-519788(P2001-519788A)

【公表日】平成13年10月23日(2001.10.23)

【出願番号】特願平10-541981

【国際特許分類第7版】

C 0 7 D 215/54

A 6 1 K 31/47

A 6 1 K 31/4709

A 6 1 K 31/4741

A 6 1 K 31/496

A 6 1 K 31/5377

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 43/00

C 0 7 D 401/12

C 0 7 D 491/056

【F I】

C 0 7 D 215/54

A 6 1 K 31/47

A 6 1 K 31/4709

A 6 1 K 31/4741

A 6 1 K 31/496

A 6 1 K 31/5377

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 43/00 1 1 1

C 0 7 D 401/12

C 0 7 D 491/056

【手続補正書】

【提出日】平成17年4月1日(2005.4.1)

【手続補正1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】補正の内容のとおり

【補正方法】変更

【補正の内容】

手続補正書

平成17年 4月 1日

特許庁長官殿

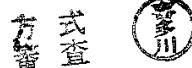


1. 事件の表示

平成10年特許願第541981号

2. 補正をする者

氏名（名称） ワイス・ホールディングズ・コーポレイション



3. 代理人

住所

〒540-0001
大阪府大阪市中央区城見1丁目3番7号 IMPビル
青山特許事務所
電話 06-6949-1261 FAX 06-6949-0361

氏名

弁理士 (6214) 青山 葵



4. 補正対象書類名 請求の範囲



5. 補正対象項目名 請求の範囲

6. 補正の内容
別紙のとおり。

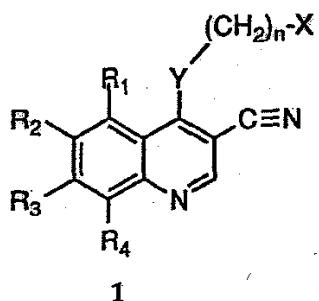
7. その他

請求の範囲の最終頁（請求項45）の3つの化学式の位置を変えて補正しております。この誤りは翻訳文作成の際に代理人の錯誤により生じたものであり、補正後の内容は、明細書の第24頁、第25頁に支持されております。

(別紙)

請求の範囲

1. 式:



[式中、Xは、所望により、1個またはそれ以上の炭素数1～6のアルキル基で置換されていてもよい、炭素数3～7のシクロアルキル；あるいは、ピリジニル環、ピリミジニル環またはフェニル環；ここで、ピリジニル環、ピリミジニル環またはフェニル環は、所望により、ハロゲン、炭素数1～6のアルキル、炭素数2～6のアルケニル、炭素数2～6のアルキニル、アジド、炭素数1～6のヒドロキシアルキル、ハロメチル、炭素数2～7のアルコキシメチル、炭素数2～7のアルカノイルオキシメチル、炭素数1～6のアルコキシ、炭素数1～6のアルキルチオ、ヒドロキシ、トリフルオロメチル、シアノ、ニトロ、カルボキシ、炭素数2～7のカルボアルコキシ、炭素数2～7のカルボアルキル、フェノキシ、フェニル、チオフェノキシ、ベンゾイル、ベンジル、アミノ、炭素数1～6のアルキルアミノ、炭素数2～12のジアルキルアミノ、フェニルアミノ、ベンジルアミノ、炭素数1～6のアルカノイルアミノ、炭素数3～8のアルケノイルアミノ、炭素数3～8のアルキノイルアミノおよびベンゾイルアミノからなる群から選択される置換基で一置換、二置換または三置換されていてもよい；

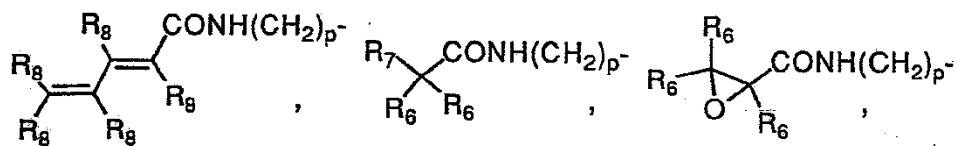
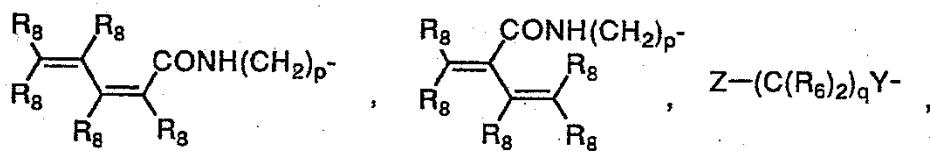
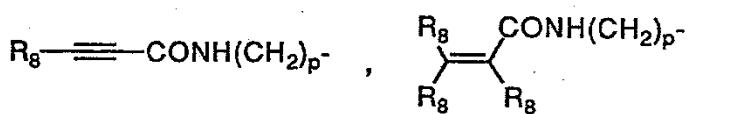
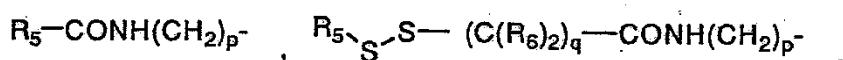
nは、0～1；

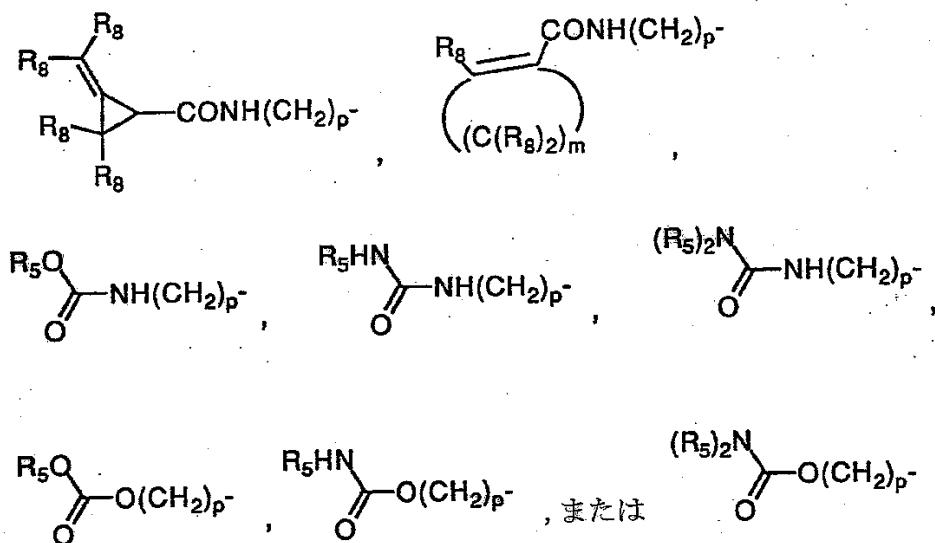
Yは、-NH-、-O-、-S-または-NR-；

Rは、炭素数1～6のアルキル；

R₁、R₂、R₃およびR₄は、各々独立して、水素、ハロゲン、炭素数1～6のアルキル、炭素数2～6のアルケニル、炭素数2～6のアルキニル、炭素数2

～6のアルケニルオキシ、炭素数2～6のアルキニルオキシ、ヒドロキシメチル、ハロメチル、炭素数1～6のアルカノイルオキシ、炭素数3～8のアルケノイルオキシ、炭素数3～8のアルキノイルオキシ、炭素数2～7のアルカノイルオキシメチル、炭素数4～9のアルケノイルオキシメチル、炭素数4～9のアルキノイルオキシメチル、炭素数2～7のアルコキシメチル、炭素数1～6のアルコキシ、炭素数1～6のアルキルチオ、炭素数1～6のアルキルスルフィニル、炭素数1～6のアルキルスルホニル、炭素数1～6のアルキルスルホニアミド、炭素数2～6のアルケニルスルホニアミド、炭素数2～6のアルキニルスルホニアミド、ヒドロキシ、トリフルオロメチル、シアノ、ニトロ、カルボキシ、炭素数2～7のカルボアルコキシ、炭素数2～7のカルボアルキル、フェノキシ、フェニル、チオフェノキシ、ベンジル、アミノ、ヒドロキシアミノ、炭素数1～4のアルコキシアミノ、炭素数1～6のアルキルアミノ、炭素数2～12のジアルキルアミノ、炭素数1～4のアミノアルキル、炭素数2～7のN-アルキルアミノアルキル、炭素数3～14のN,N-ジアルキルアミノアルキル、フェニルアミノ、ベンジルアミノ、





R₅は、炭素数1～6のアルキル、所望により、1個またはそれ以上のハロゲン原子で置換されていてもよいアルキル；フェニル、あるいは、所望により、1個またはそれ以上のハロゲン原子、炭素数1～6のアルコキシ基、トリフルオロメチル基、アミノ基、ニトロ基、シアノ基または炭素数1～6のアルキル基で置換されていてもよいフェニル；

R₆は、水素、炭素数1～6のアルキルまたは炭素数2～6のアルケニル；

R₇は、クロロまたはブロモ；

R₈は、水素、炭素数1～6のアルキル、炭素数1～6のアミノアルキル、炭素数2～9のN-アルキルアミノアルキル、炭素数3～12のN,N-ジアルキルアミノアルキル、炭素数4～12のN-シクロアルキルアミノアルキル、炭素数5～18のN-シクロアルキル-N-アルキルアミノアルキル、炭素数7～18のN,N-ジシクロアルキルアミノアルキル、モルホリノ-N-アルキル(ここで、アルキル基は炭素数1～6)、ピペリジノ-N-アルキル(ここで、アルキル基は炭素数1～6)、N-アルキル-ピペリジノ-N-アルキル(ここで、各アルキル基は炭素数1～6)、炭素数3～11のアザシクロアルキル-N-アルキル、炭素数1～6のヒドロキシアルキル、炭素数2～8のアルコキシアルキル、カルボキシ、炭素数1～6のカルボアルコキシ、フェニル、炭素数2～7のカルボアルキル、クロ

ロ、フルオロまたはプロモ；

Zは、アミノ、ヒドロキシ、炭素数1～6のアルコキシ、アルキルアミノ(ここで、アルキル部分は炭素数1～6)、ジアルキルアミノ(ここで、各アルキル部分は炭素数1～6)、モルホリノ、ピペラジノ、N-アルキルピペラジノ(ここで、アルキル部分は炭素数1～6)またはピロリジノ；

$m = 1 \sim 4$ 、 $q = 1 \sim 3$ および $p = 0 \sim 3$ ；

[隣接する炭素原子上に位置する置換基 R_1 、 R_2 、 R_3 または R_4 のいずれかは、共に、二価の基-O-C(R_8)₂-O-であり得る]

で示される化合物またはその医薬上許容される塩(ただし、Yが-NH-であり、 R_1 、 R_2 、 R_3 および R_4 が水素であり、かつnが0のとき、Xは2-メチルフェニルではない；ただし、Yが-NH-であり、 R_1 、 R_2 および R_4 が水素であり、 R_3 が塩素であり、かつnが0のとき、Xはフェニルまたは3-クロロフェニルではない)。

2. Yが-NH-であり、かつn=0である請求項1記載の化合物またはその医薬上許容される塩。

3. Xが所望により置換されていてもよいフェニルである請求項2記載の化合物またはその医薬上許容される塩。

4. R_1 および R_4 が水素である請求項3記載の化合物またはその医薬上許容される塩。

5. 4-[(3-プロモフェニル)アミノ]-6,7-ジエトキシ-3-キノリンカルボニトリルである請求項1記載の化合物またはその医薬上許容される塩。

6. 4-ジメチルアミノ-ブタ-2-エン酸[4-(3-クロロ-4-フルオロ-フェニルアミノ)-3-シアノ-7-メトキシ-キノリン-6-イル]-アミドである請求項1記載の化合物またはその医薬上許容される塩。

7. 4-ジエチルアミノ-ブタ-2-エン酸[4-(3-クロロ-4-フルオロ-フェニルアミノ)-3-シアノ-7-メトキシ-キノリン-6-イル]-アミドである請求項1記載の化合物またはその医薬上許容される塩。

8. 4-ジメチルアミノ-ブタ-2-エン酸[4-(3-プロモ-4-フルオロ-フェニ

ルアミノ)-3-シアノ-7-メトキシ-キノリン-6-イル]-アミドである請求項1記載の化合物またはその医薬上許容される塩。

9. 4-ジメチルアミノ-ブタ-2-エン酸[4-(3-プロモフェニルアミノ)-3-シアノ-7-エトキシ-キノリン-6-イル]-アミドである請求項1記載の化合物またはその医薬上許容される塩。

10. 4-ジエチルアミノ-ブタ-2-エン酸[4-(3-プロモフェニルアミノ)-3-シアノ-7-エトキシ-キノリン-6-イル]-アミドである請求項1記載の化合物またはその医薬上許容される塩。

11. 4-モルホリン-4-イル-ブタ-2-エン酸[4-(3-クロロ-4-フルオロフェニルアミノ)-3-シアノ-7-メトキシ-キノリン-6-イル]-アミドである請求項1記載の化合物またはその医薬上許容される塩。

12. 4-ジメチルアミノ-ブタ-2-エン酸[4-(3-プロモフェニルアミノ)-3-シアノ-7-メトキシ-キノリン-6-イル]-アミドである請求項1記載の化合物またはその医薬上許容される塩。

13. N-[4-[(3-プロモフェニル)アミノ]-3-シアノ-6-キノリニル]-4-メトキシ-2-ブチニアミドである請求項1記載の化合物またはその医薬上許容される塩。

14. N-{4-[(3-クロロ-4-フルオロフェニル)アミノ]-3-シアノ-6-キノリニル}-4-ジメチルアミノ-2-ブテンアミドである請求項1記載の化合物またはその医薬上許容される塩。

15. a) 4-[(3-プロモフェニル)アミノ]-7-メトキシ-3-キノリンカルボニトリル；

b) 4-[(3-プロモフェニル)アミノ]-7-メトキシ-6-ニトロ-3-キノリンカルボニトリル；

c) 6-アミノ-4-[(3-プロモフェニル)アミノ]-7-メトキシ-3-キノリンカルボニトリル；

d) N-[4-[(3-プロモフェニル)アミノ]-3-シアノ-7-メトキシ-6-キノリニル]-2-ブチニアミド；

- e) N-[4-[(3-プロモフェニル)アミノ]-3-シアノ-7-メトキシ-6-キノリニル]-2-プロペンアミド；
- f) 4-[(3-プロモフェニル)アミノ]-6-ニトロ-3-キノリンカルボニトリル；
- g) 6-アミノ-4-[(3-プロモフェニル)アミノ]-3-キノリンカルボニトリル；
- h) N-[4-[(3-プロモフェニル)アミノ]-3-シアノ-6-キノリニル]-2-ブチルアミド；
- i) N-[4-[(3-プロモフェニル)アミノ]-3-シアノ-6-キノリニル]アセトアミド；
- j) N-[4-[(3-プロモフェニル)アミノ]-3-シアノ-6-キノリニル]ブタンアミド；
- k) N-[4-[(3-プロモフェニル)アミノ]-3-シアノ-6-キノリニル]-2-プロペンアミド；
- l) N-[4-[(3-プロモフェニル)アミノ]-3-シアノ-6-キノリニル]-2-クロロアセトアミド；
- m) 4-[(3, 4-ジプロモフェニル)アミノ]-6-ニトロ-3-キノリンカルボニトリル；
- n) 6-アミノ-4-[(3, 4-ジプロモフェニル)アミノ]-3-キノリンカルボニトリル；
- o) N-[4-[(3, 4-ジプロモフェニル)アミノ]-3-シアノ-6-キノリノル]-2-ブチルアミド；
- p) 6-ニトロ-4-[(3-トリフルオロメチルフェニル)アミノ]-3-キノリンカルボニトリル；
- q) 6-アミノ-4-[(3-トリフルオロメチルフェニル)アミノ]-3-キノリンカルボニトリル；
- r) N-[4-[(3-トリフルオロメチルフェニル)アミノ]-3-シアノ-6-キノリニル]-2-ブチルアミド；
- s) 4-[(3-プロモフェニル)アミノ]-6, 7-ジメトキシ-3-キノリンカルボニトリル；

- t) 4-[(3-フルオロフェニル)アミノ]-6, 7-ジメトキシ-3-キノリンカルボニトリル；
- u) 4-(シクロヘキシリルアミノ)-6, 7-ジメトキシ-3-キノリンカルボニトリル；
- v) 4-[(3-ブロモフェニル)アミノ]-6, 7-ジヒドロキシ-3-キノリンカルボニトリル；
- w) 8-[(3-ブロモフェニル)アミノ]-[1, 3]-ジオキソロ[4, 5-g]キノリン-7-カルボニトリル；
- x) 4-[(3-クロロフェニル)アミノ]-6, 7-ジメトキシ-3-キノリンカルボニトリル；
- y) 4-[(3-トリフルオロメチルフェニル)アミノ]-6, 7-ジメトキシ-3-キノリンカルボニトリル；
- z) 4-[(3, 4-ジメトキシフェニル)アミノ]-6, 7-ジメトキシ-3-キノリンカルボニトリル；
- aa) 4-[(メチルフェニル)アミノ]-6, 7-ジメトキシ-3-キノリンカルボニトリル；
- bb) 4-[(3-シアノフェニル)アミノ]-6, 7-ジメトキシ-3-キノリンカルボニトリル；
- cc) 4-[(4-フルオロフェニル)アミノ]-6, 7-ジメトキシ-3-キノリンカルボニトリル；
- dd) 4-[(3-(ヒドロキシメチル)フェニル)アミノ]-6, 7-ジメトキシ-3-キノリンカルボニトリル；
- ee) 4-(3-ブロモフェノキシ)-6, 7-ジメトキシ-3-キノリンカルボニトリル；
- ff) 4-[(4-ブロモフェニル)スルファニル]-6, 7-ジメトキシ-3-キノリンカルボニトリル；
- gg) N-[4-[(3-ブロモフェニル)アミノ]-3-シアノ-6-キノリニル]-3(E)-クロロ-2-プロペンアミド；

- hh) N-[4-[(3-ブロモフェニル)アミノ]-3-シアノ-6-キノリニル]-3(Z)-クロロ-2-プロペンアミド；
- ii) N-[4-[(3-ブロモフェニル)アミノ]-3-シアノ-6-キノリニル]-2-メチル-2-プロペンアミド；
- jj) N-[4-[(3, 4-ジブロモフェニル)アミノ]-3-シアノ-6-キノリニル]-2-プロペンアミド；
- kk) N-[4-[(5-ブロモ-3-ピリジニル)アミノ]-6, 7-ジメトキシ-3-キノリンカルボニトリル；
- ll) 4[(3-ブロモフェニル)アミノ]-6, 7-ビス(メトキシメトキシ)-3-キノリンカルボニトリル；
- mm) N-[4-[(3-ブロモフェニル)アミノ]-3-シアノ-6-キノリニル]-4-ヒドロキシ-2-ブチナミド；
- nn) N-[4-[(3-ブロモフェニル)アミノ]-3-シアノ-6-キノリニル]-4-モルホリノ-2-ブチナミド；
- oo) N-[4-[(3-ブロモフェニル)アミノ]-3-シアノ-6-キノリニル]-4-ジメチルアミノ-2-ブチナミド；
- pp) N-[4-[(3-ブロモフェニル)アミノ]-3-シアノ-6-キノリニル]-4-メトキシ-2-ブチナミド；
- qq) 4-(3-ブロモフェニルメチルアミノ)-6, 7-ジエトキシ-3-キノリンカルボニトリル；
- rr) 4-(3-フェニルメチルアミノ)-6, 7-ジエトキシ-3-キノリンカルボニトリル；
- ss) 4-(3, 4-ジメトキシフェニルメチルアミノ)-6, 7-ジエトキシ-3-キノリンカルボニトリル；
- tt) 4-(3, 4-ジクロロフェニルメチルアミノ)-6, 7-ジエトキシ-3-キノリンカルボニトリル；
- uu) 4-メトキシブタ-2-エン酸[4-(3-ブロモフェニルアミノ)-3-シアノ-キノリン-6-イル]-アミド；

vv) 4-(4-クロロ-2-フルオロフェニルアミノ)-7-(3-クロロ-プロポキシ)-6-メトキシキノリン-3-カルボニトリル；

ww) 4-(4-クロロ-2-フルオロフェニルアミノ)-6-メトキシ-7-(3-モルホリン-4-イル-プロポキシ)-キノリン-3-カルボニトリル；

xx) 7-(2-ジメチルアミノ-エトキシ)-4-(3-ヒドロキシ-4-メチルフェニルアミノ)-6-メトキシ-キノリン-3-カルボニトリル；

yy) 4-(3-ヒドロキシ-4-メチルフェニルアミノ)-6-メトキシ-7-(2-モルホリン-4-イル-エトキシ)-キノリン-3-カルボニトリル；または

zz) 4-(4-クロロ-2-フルオロ-5-ヒドロキシフェニルアミノ)-7-(3-ジメチルアミノプロポキシ)-6-メトキシ-キノリン-3-カルボニトリル
である請求項1記載の化合物またはその医薬上許容される塩。

16. a) 4-(4-クロロ-2-フルオロ-5-ヒドロキシフェニルアミノ)-6-メトキシ-7-(3-モルホリン-4-イル-プロポキシ)キノリン-3-カルボニトリル；

b) 4-(4-クロロ-2-フルオロ-5-ヒドロキシフェニルアミノ)-7-(2-ジメチルアミノ-エトキシ)-6-メトキシ-キノリン-3-カルボニトリル；

c) 4-(4-クロロ-2-フルオロ-5-ヒドロキシフェニルアミノ)-6-メトキシ-7-(2-モルホリン-4-イル-エトキシ)-キノリン-3-カルボニトリル；

d) N-[3-シアノ-4-(3-フルオロフェニルアミノ)キノリン-6-イル]アクリルアミド；

e) 6, 7-ジメトキシ4-(3-ニトロフェニルアミノ)キノリン-3-カルボニトリル；

f) 4-(3-ブロモフェニルアミノ)-6-エトキシ-7-メトキシキノリン-3-カルボニトリル；

g) 6-エトキシ-4-(3-ヒドロキシ-4-メチルフェニルアミノ)-7-メトキシキノリン-3-カルボニトリル；

h) 4-ジメチルアミノ-ブタ-2-エン酸[4-(3-ブロモフェニルアミノ)-3-シアノ-キノリン-6-イル]-アミド；

i) 4-ジエチルアミノ-ブタ-2-エン酸[4-(3-ブロモフェニルアミノ)-3-

シアノ-キノリン-6-イル]-アミド；

j) 4-メチルアミノ-ブタ-2-エン酸[4-(3-プロモフェニルアミノ)-3-シアノ-キノリン-6-イル]-アミド；

k) 4-[(3-プロモフェニル)アミノ]-8-メチル-6-ニトロ-3-キノリンカルボニトリル；

l) 4-[(3-プロモフェニル)アミノ]-8-ジメチルアミノメチル-6-ニトロ-3-キノリンカルボニトリル；

m) 6-アミノ-4-[(3-プロモフェニル)アミノ]-8-ジメチルアミノメチル-3-キノリンカルボニトリル；

n) N-{4-[(3-プロモフェニル)アミノ]-3-シアノ-8-ジメチルアミノメチル-6-キノリニル}-2-ブチニアミド；

o) N-{4-[(3-プロモフェニル)アミノ]-3-シアノ-8-ジメチルアミノメチル-6-キノリニル}-2-プロペンアミド；

p) N-{4-[(3-プロモフェニル)アミノ]-3-シアノ-8-ジメチルアミノメチル-6-キノリニル}アセトアミド；

q) 4-[(3-クロロ-4-フルオロフェニル)アミノ]-7-メトキシ-6-(モルホリノプロポキシ)-3-キノリンカルボニトリル；

r) 4-[(3-プロモフェニル)アミノ]-7-メトキシ-6-(モルホリノプロポキシ)-3-キノリンカルボニトリル；

s) 4-[(4-クロロ-2-フルオロフェニル)アミノ]-7-メトキシ-6-(モルホリノプロポキシ)-3-キノリンカルボニトリル；

t) 4-[(3-ヒドロキシ-4-メチルフェニル)アミノ]-7-メトキシ-6-(モルホリノプロポキシ)-3-キノリンカルボニトリル；

u) N-{3-シアノ-4-[(3-ヨードフェニル)アミノ]-6-キノリニル}-2-プロペンアミド；

v) 6-アミノ-4-[(3-ヨードフェニル)アミノ]-3-キノリンカルボニトリル；

w) 4-[(3-ヨードフェニル)アミノ]-6-ニトロ-3-キノリンカルボニトリル；

x) N-{3-シアノ-4-[(3-メチルフェニル)アミノ]-6-キノリニル}-2-ブチ

ンアミド；

y) 6-アミノ-4-[(3-メチルフェニル)アミノ]-3-キノリンカルボニトリル；

z) 6-ニトロ-4-[(3-メチルフェニル)アミノ]-3-キノリンカルボニトリル；

aa) N-{4-[(3-クロロフェニル)アミノ]-3-シアノ-6-キノリニル}-2-プロペンアミド；

bb) 6-アミノ-4-[(3-クロロフェニル)アミノ]-3-キノリンカルボニトリル；

cc) 4-[(3-クロロフェニル)アミノ]-6-ニトロ-3-キノリンカルボニトリル；

dd) N-{3-シアノ-4-[(3-メトキシフェニル)アミノ]-6-キノリニル}-2-プロペンアミド；

ee) N-{3-シアノ-4-[(3-メトキシフェニル)アミノ]-6-キノリニル}-2-ブチナミド；

ff) N-{3-シアノ-4-[(3-メトキシフェニル)アミノ]-6-キノリニル}-4-ビペリジノ-2-ブチナミド；

gg) 6-アミノ-4-[(3-メトキシフェニル)アミノ]-3-キノリンカルボニトリル；

hh) 4-[(3-メトキシフェニル)アミノ]-6-ニトロ-3-キノリンカルボニトリル；

ii) N-{4-[(3-クロロ-4-フルオロフェニル)アミノ]-3-シアノ-6-キノリニル}-2-ブチナミド；

jj) N-{4-[(3-クロロ-4-フルオロフェニル)アミノ]-3-シアノ-6-キノリニル}-2-プロペンアミド；

kk) N-{4-[(3-クロロ-4-フルオロフェニル)アミノ]-3-シアノ-6-キノリニル}-4-ジエチルアミノ-2-ブテンアミド；

ll) N-{4-[(3-クロロ-4-フルオロフェニル)アミノ]-3-シアノ-6-キノリニル}-4-モルホリノ-2-ブテンアミド；

mm) N-{4-[(3-クロロ-4-フルオロフェニル)アミノ]-3-シアノ-6-キノリニル}-2-モルホリン-4-イルメチル-2-プロペンアミド；

nn) 6-アミノ-4-[(3-クロロ-4-フルオロフェニル)アミノ]-3-キノリンカ

ルボニトリル；

oo) 4-[(3-クロロ-4-フルオロフェニル)アミノ]-6-ニトロ-3-キノリンカルボニトリル；

pp) N-{4-[(4-プロモフェニル)アミノ]-3-シアノ-6-キノリニル}-2-プロペンアミド；

qq) 6-アミノ-4-[(4-プロモフェニル)アミノ]-3-キノリンカルボニトリル；

rr) [(4-プロモフェニル)アミノ]-6-ニトロ-3-キノリンカルボニトリル；

ss) N-{3-シアノ-4-[(3, 4-ジフルオロフェニル)アミノ]-6-キノリニル}-2-プロペンアミド；

tt) 6-アミノ-4-[(3, 4-ジフルオロフェニル)アミノ]-3-キノリンカルボニトリル；

uu) 4-[(3, 4-ジフルオロフェニル)アミノ]-6-ニトロ-3-キノリンカルボニトリル；

ww) N-{4-[(3-クロロ-4-チオフェノキシフェニル)アミノ]-3-シアノ-6-キノリニル}-2-ブチナミド；

xx) 6-アミノ-4-[(3-クロロ-4-チオフェノキシフェニル)アミノ]-3-キノリンカルボニトリル；

yy) 4-[(3-クロロ-4-チオフェノキシフェニル)アミノ]-6-ニトロ-3-キノリンカルボニトリル；または

zz) N-{3-シアノ-4-[(3-シアノフェニル)アミノ]-6-キノリニル}-2-プロペンアミド。

である請求項1記載の化合物またはその医薬上許容される塩。

17. a) N-{3-シアノ-4-[(3-シアノフェニル)アミノ]-6-キノリニル}-4-ペペリジノ-2-ブチナミド；

b) 6-アミノ-4-[(3-シアノフェニル)アミノ]-3-キノリンカルボニトリル；

c) 4-[(3-シアノフェニル)アミノ]-6-ニトロ-3-キノリンカルボニトリル；

d) N-{3-シアノ-4-[(3-エチニルフェニル)アミノ]-6-キノリニル}-2-ブチナミド；

- e) N-{3-シアノ-4-[(3-エチニルフェニル)アミノ]-6-キノリニル}-2-プロペンアミド；
- f) N-{3-シアノ-4-[(3-エチニルフェニル)アミノ]-6-キノリニル}-4-ピペリジノ-2-ブチナミド；
- g) 6-アミノ-4-[(3-エチニルフェニル)アミノ]-3-キノリンカルボニトリル；
- h) 4-[(3-エチニルフェニル)アミノ]-6-ニトロ-3-キノリンカルボニトリル；
- i) N-{4-[(3-ブロモフェニル)アミノ]-3-シアノ-6-キノリニル}-4-ピペリジノ-2-ブチナミド；
- j) N-{4-[(3-ブロモフェニル)アミノ]-3-シアノ-6-キノリニル}-4-ジプロピルアミノ-2-ブチナミド；
- k) N-{4-[(3-ブロモフェニル)アミノ]-3-シアノ-6-キノリニル}-2-モルホリン-4-イルメチル-2-プロペンアミド；
- l) N-{4-[(3-ブロモ-4-フルオロフェニル)アミノ]-3-シアノ-6-キノリニル}-4-ジメチルアミノ-2-ブテンアミド；
- m) N-{4-[(3-ブロモ-4-フルオロフェニル)アミノ]-3-シアノ-6-キノリニル}-4-ジエチルアミノ-2-ブテンアミド；
- n) N-{4-[(3-ブロモ-4-フルオロフェニル)アミノ]-3-シアノ-6-キノリニル}-4-モルホリノ-2-ブテンアミド；
- o) N-{4-[(3-ブロモ-4-フルオロフェニル)アミノ]-3-シアノ-7-メトキシ-6-キノリニル}-4-モルホリノ-2-ブテンアミド；
- p) 4-[(3-ブロモフェニル)アミノ]-7-エトキシ-6-メトキシ-3-キノリンカルボニトリル；
- q) 7-エトキシ-4-[(3-ヒドロキシ-4-メチルフェニル)アミノ]-6-メトキシ-3-キノリンカルボニトリル；
- r) N-[4-[(3-クロロ-4-フルオロフェニル)アミノ]-3-シアノ-6-キノリニル]-4-ジメチルアミノ-(z)-2-ブテンアミド；

- s) N-[4-[(3-クロロ-4-フルオロフェニル)アミノ]-3-シアノ-6-キノリニル]-4-メトキシ-(z)-2-ブテンアミド；
- t) 4-[[4-[(3-プロモフェニル)アミノ]-3-シアノ-6-キノリニル]アミノ]-2-メチレン-4-オキソ-ブタン酸；
- u) N-[4-[(3-プロモフェニル)アミノ]-3-シアノ-6-キノリニル]-4-ジエチルアミノ-2-ブチンアミド；
- v) N-[4-[(3-プロモフェニル)アミノ]-3-シアノ-6-キノリニル]-4-(n-エチルピペラジノ)-2-ブチンアミド；
- w) N-[4-[(3-クロロ-4-フルオロフェニル)アミノ]-3-シアノ-6-キノリニル]-4-ジエチルアミノ-2-ブチンアミド；
- x) N-[4-[(3-プロモフェニル)アミノ]-3-シアノ-6-キノリニル]-4-(n-メチルピペラジノ)-2-ブチンアミド；
- y) N-[4-[(3-プロモフェニル)アミノ]-3-シアノ-6-キノリニル]-4-(n-イソプロピル-n-メチルアミノ)-2-ブチンアミド；
- z) N-[4-[(3-プロモフェニル)アミノ]-3-シアノ-6-キノリニル]-4-ジイソプロピルアミノ-2-ブチンアミド；
- aa) N-[4-[(3-クロロ-4-フルオロフェニル)アミノ]-3-シアノ-6-キノリニル]-4-ジメチルアミノ-2-ブチンアミド；
- bb) N-[4-[-(3-クロロ-4-フルオロフェニル)アミノ]-3-シアノ-6-キノリニル]-4-メトキシ-2-ブチンアミド；
- cc) 4-[(3-プロモ-4-フルオロフェニル)アミノ]-6-ニトロ-3-キノリンカルボニトリル；
- dd) 6-アミノ-4-[(3-プロモ-4-フルオロフェニル)アミノ]-3-キノリンカルボニトリル；
- ee) N-[4-[(3-プロモ-4-フルオロフェニル)アミノ]-3-シアノ-6-キノリニル]-4-ジメチルアミノ-2-ブチンアミド；
- ff) 4-ジエチルアミノ-ブタ-2-エン酸[4-(3-プロモフェニルアミノ)-3-シアノ-7-メトキシ-キノリン-6-イル]-アミド；

- gg) 4-モルホリン-4-イル-ブタ-2-エン酸[4-(3-プロモフェニルアミノ)-3-シアノ-7-メトキシ-キノリン-6-イル]-アミド；
- hh) 4-(3-クロロ-4-フルオロフェニルアミノ)-7-メトキシ-6-ニトロ-キノリン-3-カルボニトリル；
- ii) 6-アミノ-4-(3-クロロ-4-フルオロフェニルアミノ)-7-メトキシ-キノリン-3-カルボニトリル；
- jj) 4-(3-プロモ-4-フルオロフェニルアミノ)-7-メトキシ-6-ニトロ-キノリン-3-カルボニトリル；
- kk) 6-アミノ-4-(3-プロモ-4-フルオロフェニルアミノ)-7-メトキシキノリン-3-カルボニトリル；
- ll) 4-ジエチルアミノ-ブタ-2-エン酸[4-(3-プロモ-4-フルオロフェニルアミノ)-3-シアノ-7-メトキシ-キノリン-6-イル]-アミド；
- mm) 4-(3-プロモフェニルアミノ)-7-エトキシ-6-ニトロ-キノリン-3-カルボニトリル；
- nn) 6-アミノ-4-(3-プロモフェニルアミノ)-7-エトキシ-キノリン-3-カルボニトリル；
- oo) 4-プロモ-ブタ-2-エン酸[4-(3-プロモフェニルアミノ)-3-シアノ-7-エトキシキノリン-6-イル]-アミド；
- pp) 4-モルホリン-4-イル-ブタ-2-エン酸[4-(3-プロモフェニルアミノ)-3-シアノ-7-エトキシ-キノリン-6-イル]-アミド；
- qq) 6-アミノ-4-(3-プロモフェニルアミノ)-8-メトキシ-キノリン-3-カルボニトリル；
- rr) 6-アミノ-4-(3-プロモフェニルアミノ)-8-メトキシ-キノリン-3-カルボニトリル；
- ss) 4-プロモ-ブタ-2-エン酸[4-(3-プロモフェニルアミノ)-3-シアノ-8-メトキシ-キノリン-6-イル]-アミド；
- tt) 4-ジメチルアミノブタ-2-エン酸[4-(3-プロモフェニルアミノ)-3-シアノ-8-メトキシ-キノリン-6-イル]-アミド；

- uu) 4-ジエチルアミノ-ブタ-2-エン酸[4-(3-ブロモフェニルアミノ)-3-シアノ-8-メトキシ-キノリン-6-イル]-アミド；
- vv) 4-モルホリン-4-イル-ブタ-2-エン酸[4-(3-ブロモフェニルアミノ)-3-シアノ-8-メトキシ-キノリン-6-イル]-アミド；
- ww) 4-ジメチルアミノ-ブタ-2-イン酸[4-(3-ブロモフェニルアミノ)-3-シアノ-7-メトキシ-キノリン-6-イル]-アミド；
- xx) 4-(4-クロロ-2-フルオロフェニルアミノ)-6, 7-ジメトキシ-キノリ-3-カルボニトリル；
- yy) 4-(3-ヒドロキシ-4-メチルフェニルアミノ)-6, 7-ジメトキシ-キノリ-3-カルボニトリル；または
- zz) 4-(3-ジメチルアミノ-フェニルアミノ)-6, 7, 8-トリメトキシ-キノリ-3-カルボニトリル
- である請求項1記載の化合物またはその医薬上許容される塩。
18. a) 4-(3-ヒドロキシ-4-メチルフェニルアミノ)-6, 7, 8-トリメトキシ-キノリン-3-カルボニトリル；
- b) 4-(4-クロロ-2-フルオロフェニルアミノ)-6, 7, 8-トリメトキシ-キノリン-3-カルボニトリル；
- c) 4-(4-クロロ-2-フルオロフェニルアミノ)-5, 8-ジメトキシ-キノリ-3-カルボニトリル；
- d) 4-(3-ヒドロキシ-4-メチルフェニルアミノ)-5, 8-ジメトキシ-キノリ-3-カルボニトリル；
- e) 4-(3-ブロモフェニルアミノ)-5, 8-ジメトキシ-キノリン-3カルボニトリル；
- f) 4-(3-ブロモフェニルアミノ)-6, 7, 8-トリメトキシ-キノリン-3-カルボニトリル；
- g) 4-(3-ジメチルアミノ-フェニルアミノ)-5, 8-ジメトキシ-キノリン-3-カルボニトリル；
- h) 4-(4-クロロ-2-フルオロ-5-ヒドロキシフェニルアミノ)-5, 8-ジメ

トキシ-キノリン-3-カルボニトリル；

- i) 4-(4-クロロ-2-フルオロ-5-ヒドロキシフェニルアミノ)-6, 7, 8-トリメトキシ-キノリン-3-カルボニトリル；
- j) 4-(3-ヒドロキシ-2-メチルフェニルアミノ)-6, 7-ジメトキシ-キノリン-3-カルボニトリル；
- k) 4-(2-ヒドロキシ-6-メチルフェニルアミノ)-6, 7-ジメトキシ-キノリン-3-カルボニトリル；
- l) 4-(3-ブロモ-4-メチルフェニルアミノ)-6, 7-ジメトキシ-キノリン-3-カルボニトリル；
- m) 4-(3-クロロ-4-ヒドロキシフェニルアミノ)-6, 7-ジメトキシ-キノリン-3-カルボニトリル；
- n) 6, 7-ジメトキシ-4-(2-メチルスルファニルフェニルアミノ)-キノリン-3-カルボニトリル；
- o) 1, 4-ジヒドロキノリン-6, 7-ジエトキシ-4-オキソ-3カルボニトリル；
- p) 4-[3-クロロ-4-(フェニルチオ)フェニルアミノ]-6, 7-ジエトキシ-3-キノリン-カルボニトリル；
- q) 4-[3-クロロ-4-(フェニルチオ)フェニルアミノ]-6, 7-ジメトキシ-3-キノリン-カルボニトリル；
- r) 4-(3-クロロ-4-フルオロフェニルアミノ)-6, 7-ジエトキシ-3-キノリン-カルボニトリル；
- s) 4-(3-アセチルフェニルアミノ)-6, 7-ジエトキシ-3-キノリンカルボニトリル；
- t) 4-(n-メチルフェニルアミノ)-6, 7-ジエトキシ-3-キノリンカルボニトリル；
- u) 4-(フェニルアミノ)-6, 7-ジエトキシ-3-キノリンカルボニトリル；
- v) 4-(4-フルオロフェニルアミノ)-6, 7-ジエトキシ-3-キノリンカルボニトリル；
- w) 4-(4-フルオロ-2-メチルフェニルアミノ)-6, 7-ジエトキシ-3-キノリ

ンカルボニトリル；

x) 4-(3-クロロフェニルアミノ)-6, 7-ジエトキシ-3-キノリンカルボニトリル；

y) 4-(3-フルオロフェニルアミノ)-6, 7-ジエトキシ-3-キノリンカルボニトリル；

z) 4-(3-アミノフェニルアミノ)-6, 7-ジメトキシ-3-キノリンカルボニトリル；

aa) 4-(3-アセトアミドフェニルアミノ)-6, 7-ジメトキシ-3-キノリンカルボニトリル；

bb) 4-[3-(2-ブチノイルアミノ)フェニルアミノ]-6, 7-ジメトキシ-3-キノリン-カルボニトリル；

cc) 4-[3-(ヒドロキシメチル)フェニルアミノ]-6, 7-ジメトキシ-3-キノリ-ンカルボニトリル；

dd) 4-[3-(クロロメチル)フェニルアミノ]-6, 7-ジメトキシ-3-キノリン-カルボニトリル；

ee) 4-[3-(アセチルチオメチル)フェニルアミノ]-6, 7-ジメトキシ-3-キノリ-ンカルボニトリル；

ff) 4-[3-(チオメチル)フェニルアミノ]-6, 7-ジメトキシ-3-キノリンカルボニトリル；

gg) 4-[(3-プロモフェニル)アミノ]-8-メトキシ-3-キノリンカルボニトリル；

hh) 4-(4-クロロ-2-フルオロフェニルアミノ)-8-メトキシ-キノリン-3-カルボニトリル；

ii) 4-(3-ヒドロキシ-4-メチルフェニルアミノ)-8-メトキシ-キノリン-3-カルボニトリル；

jj) 4-(3-ジメチルアミノ-フェニルアミノ)-8-メトキシ-キノリン-3-カルボニトリル；

kk) 4-(4-ブロモ-3-ヒドロキシフェニルアミノ)-8-メトキシ-キノリン-

3-カルボニトリル；

11) 4-(3-ヒドロキシ-4-メトキシフェニルアミノ)-8-メトキシ-キノリン-3-カルボニトリル；

mm) 8-メトキシ-4-(2, 4, 6-トリフルオロフェニルアミノ)-キノリン-3-カルボニトリル；

nn) 4-(3-ヒドロキシ-4-メチルフェニルアミノ)-7-メトキシ-キノリン-3-カルボニトリル；

oo) 4-(4-クロロ-2-フルオロ-5-ヒドロキシフェニルアミノ)-7-メトキシ-キノリン-3-カルボニトリル；

pp) 4-(4-クロロ-2-フルオロフェニルアミノ)-6-メトキシ-キノリン-3-カルボニトリル；

qq) 4-(3-ヒドロキシ-4-メチルフェニルアミノ)-6-メトキシ-キノリン-3-カルボニトリル；

rr) 4-(4-クロロ-2-フルオロ-5-ヒドロキシフェニルアミノ)-6-メトキシ-キノリン-3-カルボニトリル；

ss) 4-(3, 5-ジクロロ-4-ヒドロキシフェニルアミノ)-6, 7-ジメトキシ-キノリン-3-カルボニトリル；

tt) 4-(2-ヒドロキシ-4-メチルフェニルアミノ)-6, 7-ジメトキシ-キノリン-3-カルボニトリル；

uu) 4-(4-ヒドロキシ-3, 5-ジメチルフェニルアミノ)-6, 7-ジメトキシ-キノリン-3-カルボニトリル；

vv) 4-(5-クロロ-2-ヒドロキシフェニルアミノ)-6, 7-ジメトキシ-キノリン-3-カルボニトリル；

ww) 4-(3, 5-ジブロモ-4-ヒドロキシフェニルアミノ)-6, 7-ジメトキシ-キノリン-3-カルボニトリル；

xx) 4-(4-ヒドロキシ-2-メチルフェニルアミノ)-6, 7-ジメトキシ-キノリン-3-カルボニトリル；

yy) 6, 7-ジメトキシ-4-(ピリジン-3-イルアミノ)-キノリン-3-カルボニト

リル；または

zz) 6, 7-ジメトキシ-4-(3-メチルスルファニルフェニルアミノ)-キノリン-3-カルボニトリル

である請求項1記載の化合物またはその医薬上許容される塩。

19. a) 4-(2-ヒドロキシ-5-メチルフェニルアミノ)-6, 7-ジメトキシ-キノリン-3-カルボニトリル；

b) 4-(2-クロロ-4-ヒドロキシフェニルアミノ)-6, 7-ジメトキシ-キノリン-3-カルボニトリル；

c) 6, 7-ジメトキシ-4-(4-メチルスルファニルフェニルアミノ)-キノリン-3-カルボニトリル；

d) 4-[4-(2-ヒドロキシエチル)-フェニルアミノ]-6, 7-ジメトキシ-キノリン-3-カルボニトリル；

e) 4-(2, 4-ジヒドロキシフェニルアミノ)-6, 7-ジメトキシ-キノリン-3-カルボニトリル；

f) 4-[2-(2-ヒドロキシエチル)-フェニルアミノ]-6, 7-ジメトキシ-キノリン-3-カルボニトリル；

g) 4-(3-ブロモフェニルアミノ)-6, 7-ジヒドロキシ-3-キノリンカルボニトリル；

h) 4-(3-ブロモフェニルアミノ)-6, 7-ジ-n-プロポキシ-3-キノリンカルボニトリル；

i) 4-[(3-ブロモフェニル)-n-アセチルアミノ]-6, 7-ジヒドロキシ-3-キノリンカルボニトリル；

j) 4-(3-ブロモフェニルアミノ)-6, 7-ジ-n-ブトキシ-3-キノリンカルボニトリル；

k) 4-(4-クロロ-2-フルオロフェニルアミノ)-7-メトキシ-3-キノリンカルボニトリル；

l) 4-(4-クロロ-2-フルオロフェニルアミノ)-7-ヒドロキシ-3-キノリンカルボニトリル；

- m) 4-[(4-クロロ-2-フルオロフェニルアミノ)-n-アセチルアミノ]-7-ヒドロキシ-3-キノリンカルボニトリル；
- n) 4-(4-クロロ-2-フルオロフェニルアミノ)-7-エトキシ-3-キノリンカルボニトリル；
- o) 4-[(3-ブロモフェニル)アミノ]-6, 7-ビス(2-メトキシエトキシ)-3-キノリンカルボニトリル；
- p) 4-(2-アミノフェニルメチルアミノ)-6, 7-ジエトキシ-3-キノリンカルボニトリル；
- q) 4-(3, 4-ジフルオロフェニルメチルアミノ)-6, 7-ジエトキシ-3-キノリン-カルボニトリル；
- r) 4-メトキシ-ブタ-2-エン酸[4-(3-ブロモフェニルアミノ)-キナゾリン-6-イル]-アミド；
- s) 7-ベンジルオキシ-4-(4-クロロ-2-フルオロフェニルアミノ)-6-メトキシ-キノリン-3-カルボニトリル；
- t) 4-(4-クロロ-2-フルオロ-5-ヒドロキシフェニルアミノ)-7-メトキシ-6-(3-モルホリン-4-イル)-プロポキシル-キノリン-3-カルボニトリル；
- u) N-[4-(3-ブロモフェニルアミノ)-3-シアノ-キノリン-6-イル]-3-クロロ-(e)-アクリルアミド；
- v) N-[4-(3-ブロモフェニルアミノ)-3-シアノ-キノリン-6-イル]-3-クロロ-(z)-アクリルアミド；
- w) N-[4-[(3-ブロモフェニル)アミノ]-3-シアノ-6-キノリニル]-4-モルホリノ-2-ブチニアミド；
- x) N-[4-[(3-ブロモフェニル)アミノ]-3-シアノ-6-キノリニル]-4-ジメチルアミノ-2-ブチニアミド；
- y) N-[4-[(3-ブロモフェニル)アミノ]-3-シアノ-6-キノリニル]-4-t-ブチルジメチルシロキシ-2-ブチニアミド；
- z) N-[4-[(3-ブロモフェニル)アミノ]-3-シアノ-6-キノリニル]-4-ヒドロキシ-2-ブチニアミド；

- aa) 4-(3-ヒドロキシメチル-2-メチルフェニルアミノ)-6, 7-ジメトキシキノリン-3-カルボニトリル；
- bb) 4-(2-アミノ-4, 5-ジメチルフェニルアミノ)-6, 7-ジメトキシキノリン-3-カルボニトリル；
- cc) 4-(4-エチルフェニルアミノ)-6, 7-ジメトキシキノリン-3-カルボニトリル；
- dd) 4-(4-クロロ-2-メチルフェニルアミノ)-6, 7-ジメトキシキノリン-3-カルボニトリル；
- ee) 6, 7-ジメトキシ-4-(3-フェノキシフェニルアミノ)キノリン-3-カルボニトリル；
- ff) 4-(4-クロロ-3-トリフルオロメチルフェニルアミノ)-6, 7-ジメトキシキノリン-3-カルボニトリル；
- gg) 4-(3-ヒドロキシフェニルアミノ)-6, 7-ジメトキシ-キノリン-3-カルボニトリル；
- hh) 4-(4-メチルフェニルアミノ)-6, 7-ジメトキシ-キノリン-3-カルボニトリル；
- ii) 4-(3-ヒドロキシ-4-メチルフェニルアミノ)-8-メトキシ-6-ニトロ-キノリン-3-カルボニトリル；
- jj) 4-(4-クロロ-2-フルオロフェニルアミノ)-8-メトキシ-6-ニトロ-キノリン-3-カルボニトリル；
- kk) 4-(3-ヒドロキシ-4-メトキシフェニルアミノ)-8-メトキシ-6-ニトロ-キノリン-3-カルボニトリル；
- ll) 6-アミノ-4-(3-ヒドロキシ-4-メチルフェニルアミノ)-8-メトキシキノリン-3-カルボニトリル；
- mm) 6-アミノ-4-(3-ヒドロキシ-4メトキシフェニルアミノ)-8-メトキシキノリン-3-カルボニトリル；
- nn) N-{4-[$(3\text{-ブロモ}-4\text{-フルオロフェニル})\text{アミノ}]$ -3-シアノ-7-メトキシ-6-キノリニル}-4-ブロモ-2-ブテンアミド；

- oo) N-{4-[$(3\text{-ブロモフェニル})\text{アミノ}$]-3-シアノ-7-メトキシ-6-キノリニル}-4-クロロ-2-ブテンアミド；
- pp) N-{3-シアノ-4-[$(3\text{-ヨードフェニル})\text{アミノ}$]-6-キノリニル}-2-ブチシアミド；
- qq) N-{3-シアノ-4-[$(3\text{-メチルフェニル})\text{アミノ}$]-6-キノリニル}-2-プロペンアミド；
- rr) N-{4-[$(4\text{-ブロモフェニル})\text{アミノ}$]-3-シアノ-6-キノリニル}-2-ブチシアミド；
- ss) N-{4-[$(3\text{-クロロ-4-チオフェノキシフェニル})\text{アミノ}$]-3-シアノ-6-キノリニル}-2-プロペンアミド；
- tt) N-{3-シアノ-4-[$(3, 4\text{-ジフルオロフェニル})\text{アミノ}$]-6-キノリニル}-2-ブチシアミド；
- uu) N-{4-[$(3\text{-クロロフェニル})\text{アミノ}$]-3-シアノ-6-キノリニル}-2-ブチシアミド；
- vv) N-{3-シアノ-4-[$(3\text{-イソプロピルフェニル})\text{アミノ}$]-6-キノリニル}-2-ブチシアミド；
- ww) N-{3-シアノ-4-[$(3\text{-イソプロピルフェニル})\text{アミノ}$]-6-キノリニル}-2-プロペンアミド；
- xx) 6-アミノ-4-[$(3\text{-イソプロピルフェニル})\text{アミノ}$]-3-キノリンカルボニトリル；
- yy) 4-[$(3\text{-イソプロピルフェニル})\text{アミノ}$]-6-ニトロ-3-キノリンカルボニトリル；または
- zz) 4-(3-ブロモフェニルアミノ)-6-($3\text{-ピロリジン-1-イル-プロピルアミノ}$)-キノリン-3-カルボニトリル

である請求項1記載の化合物またはその医薬上許容される塩。

20. a) 4-(3-アジド-フェニルアミノ)-6, 7-ジメトキシ-キノリン-3-カルボニトリル；
- b) 6-アミノ-4-[$(4\text{-クロロ-2-フルオロフェニル})\text{アミノ}$]-7-メトキシ-

3-キノリンカルボニトリル；

c) 4-[(4-クロロ-2-フルオロフェニル)アミノ]-7-メトキシ-6-ニトロ-3-キノリンカルボニトリル；

d) 4-[(3, 4-ジクロロフェニル)アミノ]-6-ニトロ-3-キノリンカルボニトリル；

e) 6-アミノ-4-[(3-メチルスルファニルフェニル)アミノ]-3-キノリンカルボニトリル；

f) 4-[(3-メチルスルファニルフェニル)アミノ]-6-ニトロ-3-キノリンカルボニトリル；

g) 4-[(3-トリフルオロメトキシフェニル)アミノ]-6-ニトロ-3-キノリンカルボニトリル；

h) 4-(3-ジメチルアミノ-フェニルアミノ)-6, 7-ジメトキシ-キノリン-3-カルボニトリル；

i) 6, 7-ジメトキシ-4-(4-メトキシ-2-メチルフェニルアミノ)-キノリン-3-カルボニトリル；

j) 4-(3-ヒドロキシ-4-メトキシフェニルアミノ)-6, 7-ジメトキシ-キノリン-3-カルボニトリル；

k) 4-(3-クロロ-4-メチルフェニルアミノ)-6, 7-ジメトキシ-キノリン-3-カルボニトリル；

l) 6, 7-ジメトキシ-4-(4-フェノキシフェニルアミノ)-キノリン-3-カルボニトリル；

m) 4-(5-クロロ-2-メトキシフェニルアミノ)-6, 7-ジメトキシ-キノリン-3-カルボニトリル；

n) 3-(3-シアノ-6, 7-ジメトキシ-キノリン-4-イルアミノ)-2-メチル-安息香酸；

o) 4-(4-クロロ-2-フルオロフェニルアミノ)-6, 7-ジヒドロキシ-キノリン-3-カルボニトリル；

p) 4-(3-ヒドロキシ-2-メチルフェニルアミノ)-6, 7-ジメトキシ-キノリ

ン-3-カルボニトリル；

q) 4-(3-クロロ-4-メトキシフェニルアミノ)-6, 7-ジメトキシ-キノリ
ン-3-カルボニトリル；

r) 6, 7-ジメトキシ-4-(4-トリフルオロメチルフェニルアミノ)-キノリ
ン-3-カルボニトリル；

s) 4-(3, 4-ジブロモフェニルアミノ)-6-ニトロキノリン-3-カルボニトリ
ル；

t) 6-アミノ-4-(3-トリフルオロメチルフェニルアミノ)キノリン-3-カル
ボニトリル；

u) 6-アミノ-4-(3, 4-ジブロモフェニルアミノ)キノリン-3-カルボニトリ
ル；

v) N-[3-シアノ-4-(3, 4-ジブロモフェニルアミノ)キノリン-6-イル]ア
クリルアミド；

w) N-[4-(3-ブロモフェニルアミノ)-3-シアノキノリン-6-イル]プロピオ
ニアミド；

x) (e)-ブタ-2-エン酸[4-(3-ブロモフェニルアミノ)-3-シアノキノリン-
6-イル]-アミド；

y) N-[4-(3-ブロモフェニルアミノ)-3-シアノキノリン-6-イル]-2-メチ
ルアクリルアミド；

z) 4-(3-フルオロフェニルアミノ)-6-ニトロキノリン-3-カルボニトリ
ル；

aa) 6-アミノ-4-(3-フルオロフェニルアミノ)キノリン-3-カルボニトリル；

bb) 4-(3-ジメチルアミノフェニルアミノ)-6-ニトロキノリン-3-カルボニ
トリル；

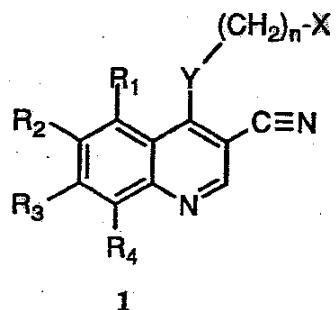
cc) 4-(4-ジメチルアミノフェニルアミノ)-6-ニトロキノリン-3-カルボニ
トリル；

dd) 6-アミノ-4-(3-ジメチルアミノフェニルアミノ)キノリン-3-カルボニ
トリル；

- ee) 6-アミノ-4-(4-ジメチルアミノフェニルアミノ)キノリン-3-カルボニトリル；
- ff) ブタ-2-イン酸[4-(3-フルオロフェニルアミノ)-3-シアノキノリン-6-イル]アミド；
- gg) N-[3-シアノ-4-(3-ジメチルアミノフェニルアミノ)キノリン-6-イル]アクリルアミド；
- hh) N-[3-シアノ-4-(4-ジメチルアミノフェニルアミノ)キノリン-6-イル]アクリルアミド；
- ii) ブタ-2-イン酸[3-シアノ-4-(3-ジメチルアミノフェニルアミノ)キノリン-6-イル]アミド；
- j) ブタ-2-イン酸[3-シアノ-4-(4-ジメチルアミノフェニルアミノ)キノリン-6-イル]アミド；
- kk) 4-(3-プロモフェニルアミノ)-6-ジメチルアミノキノリン-3-カルボニトリル塩酸塩；
- ll) 6-ジメチルアミノ-4-(3-メトキシフェニルアミノ)キノリン-3-カルボニトリル塩酸塩；
- mm) 2-プロモ-n-[4-(3-プロモフェニルアミノ)-3-シアノキノリン-6-イル]アセトアミド；
- nn) 6-ヨード-4-(3-メトキシフェニルアミノ)キノリン-3-カルボニトリル；
- oo) 4-(4-ヒドロキシ-2-メチルフェニルアミノ)-6-メトキシ-7-(3-モルホリン-4-イルプロポキシ)-キノリン-3-カルボニトリル；
- pp) 4-(3-プロモフェニルアミノ)-6-メトキシ-7-(3-モルホリン-4-イルプロポキシ)キノリン-3-カルボニトリル；
- qq) 6-メトキシ-4-(2-メチルスルファニルフェニルアミノ)-7-(3-モルホリン-4-イルプロポキシ)-キノリン-3-カルボニトリル；または
4-(4-ヒドロキシ-3,5-ジメチルフェニルアミノ)-6-メトキシ-7-(3-モルホリン-4-イルプロポキシ)-キノリン-3-カルボニトリル

である請求項1記載の化合物またはその医薬上許容される塩。

21. 哺乳動物の非調節タンパクキナーゼの生物学的効果を阻害する方法であつて、該哺乳動物に有効量の式：



[式中、Xは、所望により、1個またはそれ以上の炭素数1～6のアルキル基で置換されていてもよい、炭素数3～7のシクロアルキル；あるいは、ピリジニル環、ピリミジニル環またはフェニル環；ここで、ピリジニル環、ピリミジニル環またはフェニル環は、所望により、ハロゲン、炭素数1～6のアルキル、炭素数2～6のアルケニル、炭素数2～6のアルキニル、アジド、炭素数1～6のヒドロキシアルキル、ハロメチル、炭素数2～7のアルコキシメチル、炭素数2～7のアルカノイルオキシメチル、炭素数1～6のアルコキシ、炭素数1～6のアルキルチオ、ヒドロキシ、トリフルオロメチル、シアノ、ニトロ、カルボキシ、炭素数2～7のカルボアルコキシ、炭素数2～7のカルボアルキル、フェノキシ、フェニル、チオフェノキシ、ベンゾイル、ベンジル、アミノ、炭素数1～6のアルキルアミノ、炭素数2～12のジアルキルアミノ、フェニルアミノ、ベンジルアミノ、炭素数1～6のアルカノイルアミノ、炭素数3～8のアルケノイルアミノ、炭素数3～8のアルキノイルアミノおよびベンゾイルアミノからなる群から選択される置換基で一置換、二置換または三置換されていてもよい；

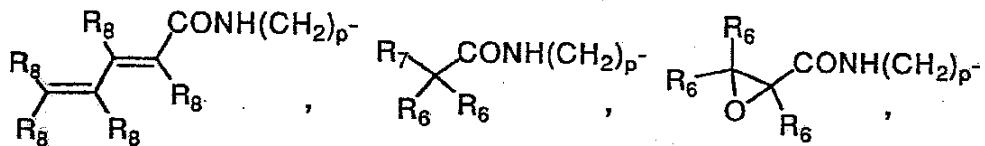
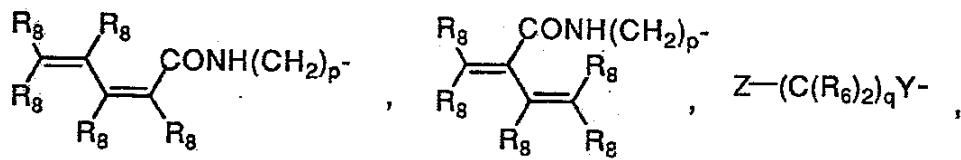
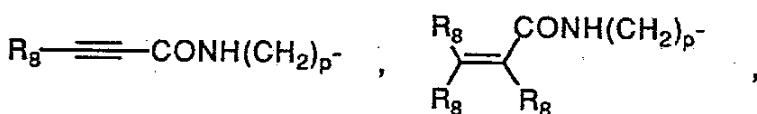
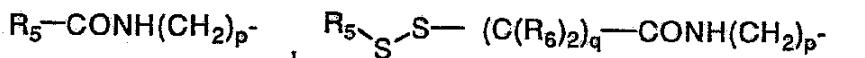
nは、0～1；

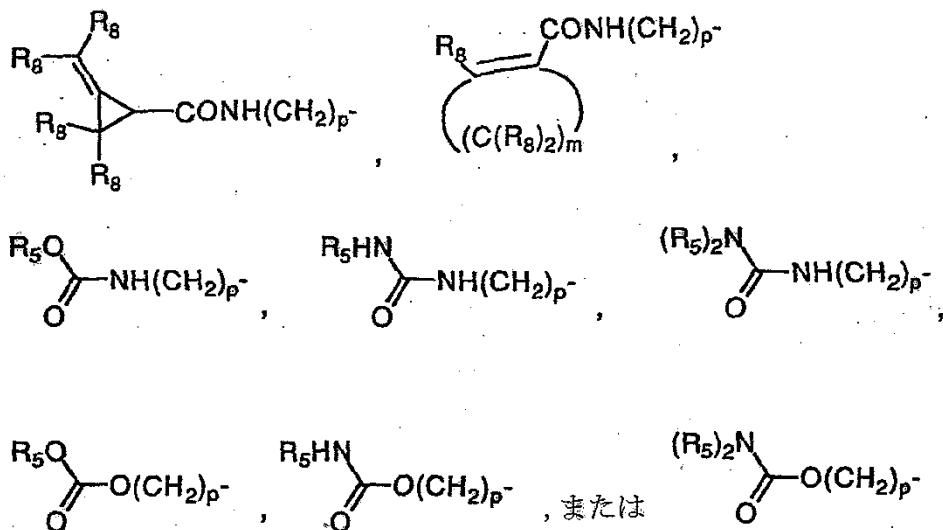
Yは、-NH-、-O-、-S-または-NR-；

Rは、炭素数1～6のアルキル；

R₁、R₂、R₃およびR₄は、各々独立して、水素、ハロゲン、炭素数1～6

のアルキル、炭素数2～6のアルケニル、炭素数2～6のアルキニル、炭素数2～6のアルケニルオキシ、炭素数2～6のアルキニルオキシ、ヒドロキシメチル、ハロメチル、炭素数1～6のアルカノイルオキシ、炭素数3～8のアルケノイルオキシ、炭素数3～8のアルキノイルオキシ、炭素数2～7のアルカノイルオキシメチル、炭素数4～9のアルケノイルオキシメチル、炭素数4～9のアルキノイルオキシメチル、炭素数2～7のアルコキシメチル、炭素数1～6のアルコキシ、炭素数1～6のアルキルチオ、炭素数1～6のアルキルスルフィニル、炭素数1～6のアルキルスルホニル、炭素数1～6のアルキルスルホニアミド、炭素数2～6のアルケニルスルホニアミド、炭素数2～6のアルキニルスルホニアミド、ヒドロキシ、トリフルオロメチル、シアノ、ニトロ、カルボキシ、炭素数2～7のカルボアルコキシ、炭素数2～7のカルボアルキル、フェノキシ、フェニル、チオフェノキシ、ベンジル、アミノ、ヒドロキシアミノ、炭素数1～4のアルコキシアミノ、炭素数1～6のアルキルアミノ、炭素数2～12のジアルキルアミノ、炭素数1～4のアミノアルキル、炭素数2～7のN-アルキルアミノアルキル、炭素数3～14のN,N-ジアルキルアミノアルキル、フェニルアミノ、ベンジルアミノ、





R₅は、炭素数1～6のアルキル、所望により、1個またはそれ以上のハロゲン原子で置換されていてもよいアルキル；フェニル、あるいは、所望により、1個またはそれ以上のハロゲン原子、炭素数1～6のアルコキシ基、トリフルオロメチル基、アミノ基、ニトロ基、シアノ基または炭素数1～6のアルキル基で置換されていてもよいフェニル；

R₆は、水素、炭素数1～6のアルキルまたは炭素数2～6のアルケニル；

R₇は、クロロまたはプロモ；

R₈は、水素、炭素数1～6のアルキル、炭素数1～6のアミノアルキル、炭素数2～9のN-アルキルアミノアルキル、炭素数3～12のN,N-ジアルキルアミノアルキル、炭素数4～12のN-シクロアルキルアミノアルキル、炭素数5～18のN-シクロアルキル-N-アルキルアミノアルキル、炭素数7～18のN,N-ジシクロアルキルアミノアルキル、モルホリノ-N-アルキル(ここで、アルキル基は炭素数1～6)、ピペリジノ-N-アルキル(ここで、アルキル基は炭素数1～6)、N-アルキル-ピペリジノ-N-アルキル(ここで、各アルキル基は炭素数1～6)、炭素数3～11のアザシクロアルキル-N-アルキル、炭素数1～6のヒドロキシアルキル、炭素数2～8のアルコキシアルキル、カルボキシ、炭素数1～6のカルボアルコキシ、フェニル、炭素数2～7のカルボアルキル、クロロ、フルオロまたはプロモ；

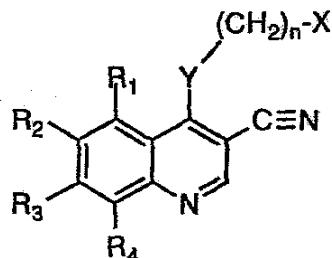
Zは、アミノ、ヒドロキシ、炭素数1～6のアルコキシ、アルキルアミノ(ここで、アルキル部分は炭素数1～6)、ジアルキルアミノ(ここで、各アルキル部分は炭素数1～6)、モルホリノ、ピペラジノ、N-アルキルピペラジノ(ここで、アルキル部分は炭素数1～6)またはピロリジノ；

$m = 1 \sim 4$ 、 $q = 1 \sim 3$ および $p = 0 \sim 3$ ；

[隣接する炭素原子上に位置する置換基 R_1 、 R_2 、 R_3 または R_4 のいずれかは、共に、二価の基-O-C(R_8)₂-O-であり得る]

で示される化合物またはその医薬上許容される塩(ただし、Yが-NH-であり、 R_1 、 R_2 、 R_3 および R_4 が水素であり、かつnが0のとき、Xは2-メチルフェニルではない)を投与することからなる方法。

22. それを必要とする哺乳動物の新生物を治療するか、その成長を阻害するか、あるいは根治させる方法であって、該哺乳動物に有効量の式：



[式中、Xは、所望により、1個またはそれ以上の炭素数1～6のアルキル基で置換されていてもよい、炭素数3～7のシクロアルキル；あるいは、ピリジニル環、ピリミジニル環またはフェニル環；ここで、ピリジニル環、ピリミジニル環またはフェニル環は、所望により、ハロゲン、炭素数1～6のアルキル、炭素数2～6のアルケニル、炭素数2～6のアルキニル、アジド、炭素数1～6のヒドロキシアルキル、ハロメチル、炭素数2～7のアルコキシメチル、炭素数2～7のアルカノイルオキシメチル、炭素数1～6のアルコキシ、炭素数1～6のアルキルチオ、ヒドロキシ、トリフルオロメチル、シアノ、ニトロ、カルボキシ、炭素数2～7のカルボアルコキシ、炭素数2～7のカルボアルキル、フェノキシ、フェニル、チオフェノキシ、ベンゾイル、ベンジル、アミノ、炭素数1～6のア

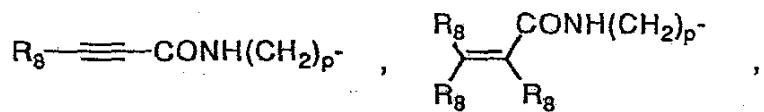
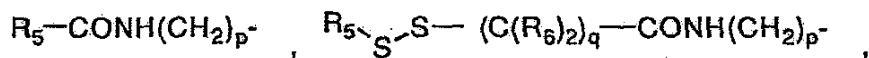
ルキルアミノ、炭素数2～12のジアルキルアミノ、フェニルアミノ、ベンジルアミノ、炭素数1～6のアルカノイルアミノ、炭素数3～8のアルケノイルアミノ、炭素数3～8のアルキノイルアミノおよびベンゾイルアミノからなる群から選択される置換基で一置換、二置換または三置換されていてもよい；

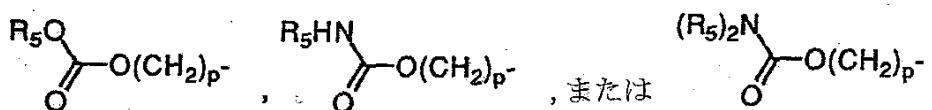
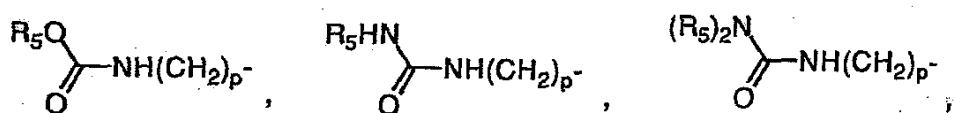
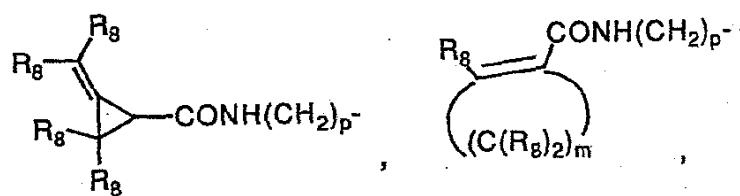
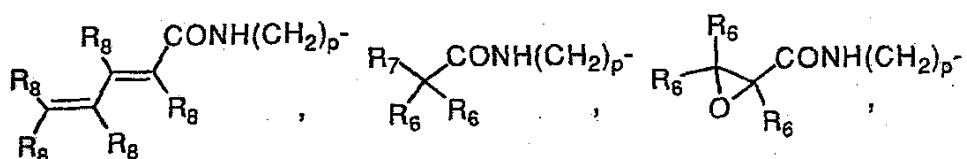
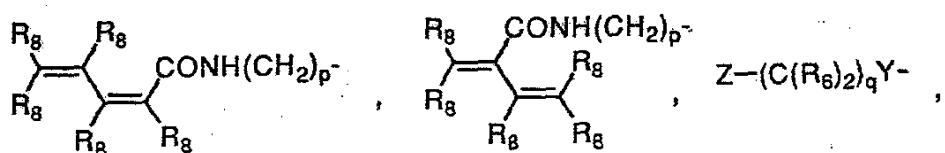
nは、0～1；

Yは、-NH-、-O-、-S-または-NR-；

Rは、炭素数1～6のアルキル；

R₁、R₂、R₃およびR₄は、各々独立して、水素、ハロゲン、炭素数1～6のアルキル、炭素数2～6のアルケニル、炭素数2～6のアルキニル、炭素数2～6のアルケニルオキシ、炭素数2～6のアルキニルオキシ、ヒドロキシメチル、ハロメチル、炭素数1～6のアルカノイルオキシ、炭素数3～8のアルケノイルオキシ、炭素数3～8のアルキノイルオキシ、炭素数2～7のアルカノイルオキシメチル、炭素数4～9のアルケノイルオキシメチル、炭素数4～9のアルキノイルオキシメチル、炭素数2～7のアルコキシメチル、炭素数1～6のアルコキシ、炭素数1～6のアルキルチオ、炭素数1～6のアルキルスルフィニル、炭素数1～6のアルキルスルホニル、炭素数1～6のアルキルスルホニアミド、炭素数2～6のアルケニルスルホニアミド、炭素数2～6のアルキニルスルホニアミド、ヒドロキシ、トリフルオロメチル、シアノ、ニトロ、カルボキシ、炭素数2～7のカルボアルコキシ、炭素数2～7のカルボアルキル、フェノキシ、フェニル、チオフェノキシ、ベンジル、アミノ、ヒドロキシアミノ、炭素数1～4のアルコキシアミノ、炭素数1～6のアルキルアミノ、炭素数2～12のジアルキルアミノ、炭素数1～4のアミノアルキル、炭素数2～7のN-アルキルアミノアルキル、炭素数3～14のN,N-ジアルキルアミノアルキル、フェニルアミノ、ベンジルアミノ、





R_5 は、炭素数1～6のアルキル、所望により、1個またはそれ以上のハロゲン原子で置換されていてもよいアルキル；フェニル、あるいは、所望により、1個またはそれ以上のハロゲン原子、炭素数1～6のアルコキシ基、トリフルオロメチル基、アミノ基、ニトロ基、シアノ基または炭素数1～6のアルキル基で置換されていてもよいフェニル；

R₆は、水素、炭素数1～6のアルキルまたは炭素数2～6のアルケニル；

R₇は、クロロまたはプロモ；

R₈は、水素、炭素数1～6のアルキル、炭素数1～6のアミノアルキル、炭素数2～9のN-アルキルアミノアルキル、炭素数3～12のN,N-ジアルキルアミノアルキル、炭素数4～12のN-シクロアルキルアミノアルキル、炭素数

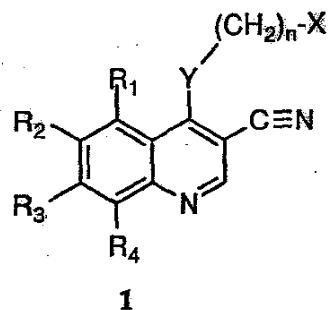
5～18のN-シクロアルキル-N-アルキルアミノアルキル、炭素数7～18のN,N-ジシクロアルキルアミノアルキル、モルホリノ-N-アルキル(ここで、アルキル基は炭素数1～6)、ピペリジノ-N-アルキル(ここで、アルキル基は炭素数1～6)、N-アルキル-ピペリジノ-N-アルキル(ここで、各アルキル基は炭素数1～6)、炭素数3～11のアザシクロアルキル-N-アルキル、炭素数1～6のヒドロキシアルキル、炭素数2～8のアルコキシアルキル、カルボキシ、炭素数1～6のカルボアルコキシ、フェニル、炭素数2～7のカルボアルキル、クロロ、フルオロまたはプロモ；

Zは、アミノ、ヒドロキシ、炭素数1～6のアルコキシ、アルキルアミノ(ここで、アルキル部分は炭素数1～6)、ジアルキルアミノ(ここで、各アルキル部分は炭素数1～6)、モルホリノ、ピペラジノ、N-アルキルピペラジノ(ここで、アルキル部分は炭素数1～6)またはピロリジノ；

$m = 1 \sim 4$ 、 $q = 1 \sim 3$ および $p = 0 \sim 3$ ；

[隣接する炭素原子上に位置する置換基 R_1 、 R_2 、 R_3 または R_4 のいずれかは、共に、二価の基-O-C(R_8)₂-O-であり得る]で示される化合物またはその医薬上許容される塩(ただし、Yが-NH-であり、 R_1 、 R_2 、 R_3 および R_4 が水素であり、かつnが0のとき、Xは2-メチルフェニルではない)を投与することからなる方法。

23. 新生物がEGFRを発現する請求項22記載の方法。
24. 新生物がMAPKを発現する請求項22記載の方法。
25. 新生物がECKを発現する請求項22記載の方法。
26. 新生物がKDRを発現する請求項22記載の方法。
27. 新生物が、胸部、腎臓、膀胱、口腔、喉頭、食道、胃、大腸、卵巣および肺からなる群から選択される請求項22記載の方法。
28. 哺乳動物の多囊胞性腎疾患を治療するか、その進行を阻害するか、あるいは根治させる方法であって、該哺乳動物に有効量の式：



[式中、Xは、所望により、1個またはそれ以上の炭素数1～6のアルキル基で置換されていてもよい、炭素数3～7のシクロアルキル；あるいは、ピリジニル環、ピリミジニル環またはフェニル環；ここで、ピリジニル環、ピリミジニル環またはフェニル環は、所望により、ハロゲン、炭素数1～6のアルキル、炭素数2～6のアルケニル、炭素数2～6のアルキニル、アジド、炭素数1～6のヒドロキシアルキル、ハロメチル、炭素数2～7のアルコキシメチル、炭素数2～7のアルカノイルオキシメチル、炭素数1～6のアルコキシ、炭素数1～6のアルキルチオ、ヒドロキシ、トリフルオロメチル、シアノ、ニトロ、カルボキシ、炭素数2～7のカルボアルコキシ、炭素数2～7のカルボアルキル、フェノキシ、フェニル、チオフェノキシ、ベンゾイル、ベンジル、アミノ、炭素数1～6のアルキルアミノ、炭素数2～12のジアルキルアミノ、フェニルアミノ、ベンジルアミノ、炭素数1～6のアルカノイルアミノ、炭素数3～8のアルケノイルアミノ、炭素数3～8のアルキノイルアミノおよびベンゾイルアミノからなる群から選択される置換基で一置換、二置換または三置換されていてもよい；

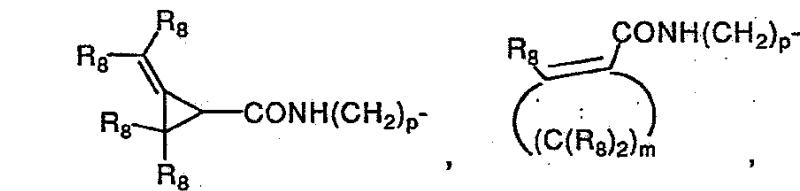
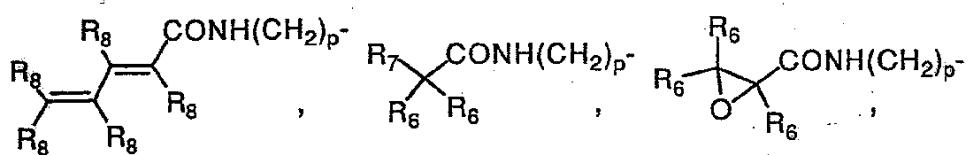
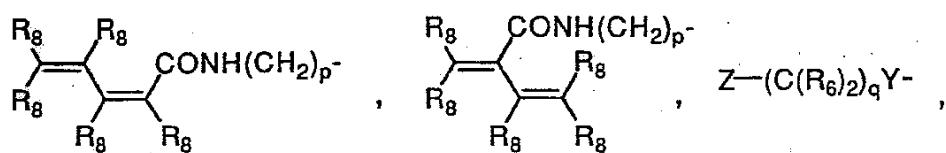
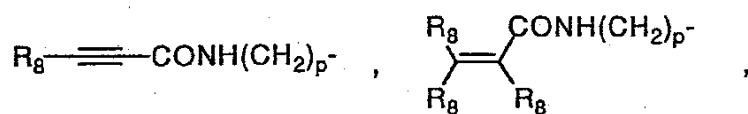
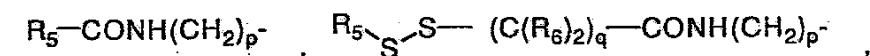
nは、0～1；

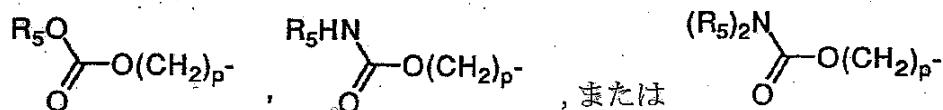
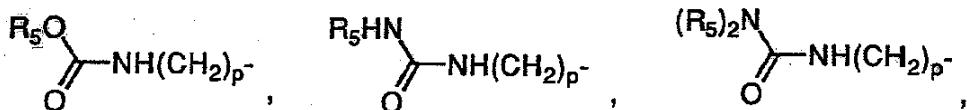
Yは、 $-NH-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ または $-NR-$ ；

Rは、炭素数1～6のアルキル；

R_1 、 R_2 、 R_3 および R_4 は、各々独立して、水素、ハロゲン、炭素数1～6のアルキル、炭素数2～6のアルケニル、炭素数2～6のアルキニル、炭素数2～6のアルケニルオキシ、炭素数2～6のアルキニルオキシ、ヒドロキシメチル、ハロメチル、炭素数1～6のアルカノイルオキシ、炭素数3～8のアルケノイルオキシ、炭素数3～8のアルキノイルオキシ、炭素数2～7のアルカノイルオキ

シメチル、炭素数4～9のアルケノイルオキシメチル、炭素数4～9のアルキノイルオキシメチル、炭素数2～7のアルコキシメチル、炭素数1～6のアルコキシ、炭素数1～6のアルキルチオ、炭素数1～6のアルキルスルフィニル、炭素数1～6のアルキルスルホニル、炭素数1～6のアルケニルスルホニアミド、炭素数2～6のアルケニルスルホニアミド、炭素数2～6のアルキニルスルホニアミド、ヒドロキシ、トリフルオロメチル、シアノ、ニトロ、カルボキシ、炭素数2～7のカルボアルコキシ、炭素数2～7のカルボアルキル、フェノキシ、フェニル、チオフェノキシ、ベンジル、アミノ、ヒドロキシアミノ、炭素数1～4のアルコキシアミノ、炭素数1～6のアルキルアミノ、炭素数2～12のジアルキルアミノ、炭素数1～4のアミノアルキル、炭素数2～7のN-アルキルアミノアルキル、炭素数3～14のN,N-ジアルキルアミノアルキル、フェニルアミノ、ベンジルアミノ、





R_5 は、炭素数1～6のアルキル、所望により、1個またはそれ以上のハロゲン原子で置換されていてもよいアルキル；フェニル、あるいは、所望により、1個またはそれ以上のハロゲン原子、炭素数1～6のアルコキシ基、トリフルオロメチル基、アミノ基、ニトロ基、シアノ基または炭素数1～6のアルキル基で置換されていてもよいフェニル；

R_6 は、水素、炭素数1～6のアルキルまたは炭素数2～6のアルケニル；

R_7 は、クロロまたはブロモ；

R_8 は、水素、炭素数1～6のアルキル、炭素数1～6のアミノアルキル、炭素数2～9のN-アルキルアミノアルキル、炭素数3～12のN,N-ジアルキルアミノアルキル、炭素数4～12のN-シクロアルキルアミノアルキル、炭素数5～18のN-シクロアルキル-N-アルキルアミノアルキル、炭素数7～18のN,N-ジシクロアルキルアミノアルキル、モルホリノ-N-アルキル(ここで、アルキル基は炭素数1～6)、ピペリジノ-N-アルキル(ここで、アルキル基は炭素数1～6)、N-アルキル-ピペリジノ-N-アルキル(ここで、各アルキル基は炭素数1～6)、炭素数3～11のアザシクロアルキル-N-アルキル、炭素数1～6のヒドロキシアルキル、炭素数2～8のアルコキシアルキル、カルボキシ、炭素数1～6のカルボアルコキシ、フェニル、炭素数2～7のカルボアルキル、クロロ、フルオロまたはブロモ；

Z は、アミノ、ヒドロキシ、炭素数1～6のアルコキシ、アルキルアミノ(ここで、アルキル部分は炭素数1～6)、ジアルキルアミノ(ここで、各アルキル部分は炭素数1～6)、モルホリノ、ピペラジノ、N-アルキルピペラジノ(ここで、

アルキル部分は炭素数1～6)またはピロリジノ;

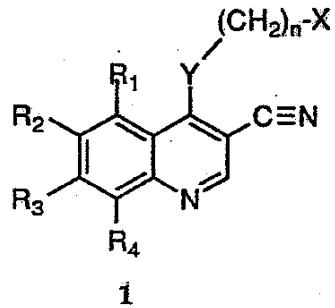
$m = 1 \sim 4$ 、 $q = 1 \sim 3$ および $p = 0 \sim 3$;

隣接する炭素原子上に位置する置換基 R_1 、 R_2 、 R_3 または R_4 のいずれかは、共に、二価の基- $O-C(R_8)_2-O-$ であり得る】

で示される化合物またはその医薬上許容される塩(ただし、Yが-NH-であり、

R_1 、 R_2 、 R_3 および R_4 が水素であり、かつnが0のとき、Xは2-メチルフェニルではない)を投与することからなる方法。

29. 式:



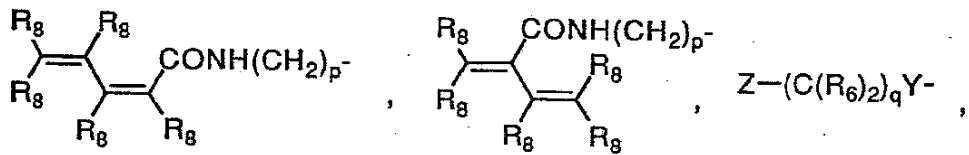
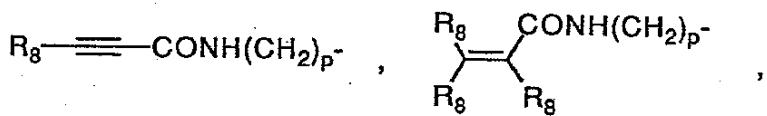
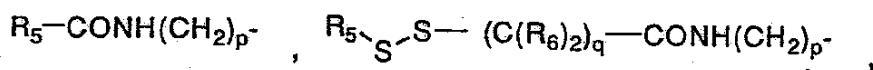
[式中、Xは、所望により、1個またはそれ以上の炭素数1～6のアルキル基で置換されていてもよい、炭素数3～7のシクロアルキル;あるいは、ピリジニル環、ピリミジニル環またはフェニル環;ここで、ピリジニル環、ピリミジニル環またはフェニル環は、所望により、ハロゲン、炭素数1～6のアルキル、炭素数2～6のアルケニル、炭素数2～6のアルキニル、アジド、炭素数1～6のヒドロキシアルキル、ハロメチル、炭素数2～7のアルコキシメチル、炭素数2～7のアルカノイルオキシメチル、炭素数1～6のアルコキシ、炭素数1～6のアルキチオ、ヒドロキシ、トリフルオロメチル、シアノ、ニトロ、カルボキシ、炭素数2～7のカルボアルコキシ、炭素数2～7のカルボアルキル、フェノキシ、フェニル、チオフェノキシ、ベンゾイル、ベンジル、アミノ、炭素数1～6のアルキルアミノ、炭素数2～12のジアルキルアミノ、フェニルアミノ、ベンジルアミノ、炭素数1～6のアルカノイルアミノ、炭素数3～8のアルケノイルアミノ、炭素数3～8のアルキノイルアミノおよびベンゾイルアミノからなる群から選択される置換基で一置換、二置換または三置換されていてもよい;

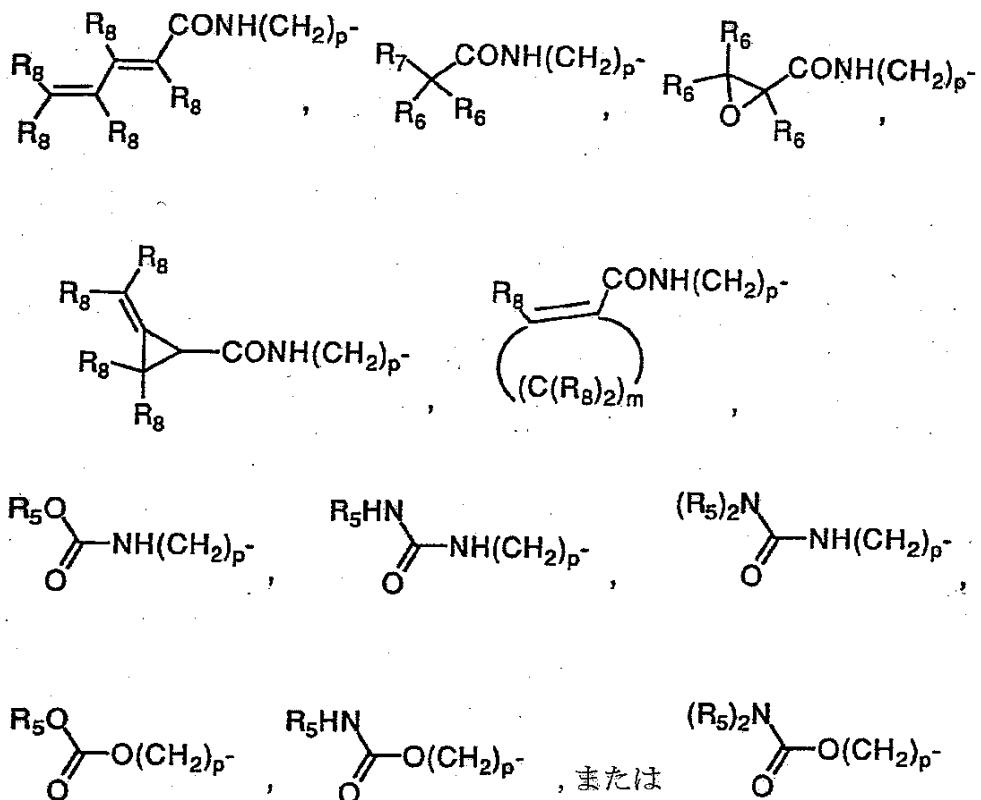
nは、0～1；

Yは、-NH-、-O-、-S-または-NR-；

Rは、炭素数1～6のアルキル；

R₁、R₂、R₃およびR₄は、各々独立して、水素、ハロゲン、炭素数1～6のアルキル、炭素数2～6のアルケニル、炭素数2～6のアルキニル、炭素数2～6のアルケニルオキシ、炭素数2～6のアルキニルオキシ、ヒドロキシメチル、ハロメチル、炭素数1～6のアルカノイルオキシ、炭素数3～8のアルケノイルオキシ、炭素数3～8のアルキノイルオキシ、炭素数2～7のアルカノイルオキシメチル、炭素数4～9のアルケノイルオキシメチル、炭素数4～9のアルキノイルオキシメチル、炭素数2～7のアルコキシメチル、炭素数1～6のアルコキシ、炭素数1～6のアルキルチオ、炭素数1～6のアルキルスルフィニル、炭素数1～6のアルキルスルホニル、炭素数1～6のアルキルスルホニアミド、炭素数2～6のアルケニルスルホニアミド、炭素数2～6のアルキニルスルホニアミド、ヒドロキシ、トリフルオロメチル、シアノ、ニトロ、カルボキシ、炭素数2～7のカルボアルコキシ、炭素数2～7のカルボアルキル、フェノキシ、フェニル、チオフェノキシ、ベンジル、アミノ、ヒドロキシアミノ、炭素数1～4のアルコキシアミノ、炭素数1～6のアルキルアミノ、炭素数2～12のジアルキルアミノ、炭素数1～4のアミノアルキル、炭素数2～7のN-アルキルアミノアルキル、フェニルアミノ、ベンジルアミノ、





R_5 は、炭素数1～6のアルキル、所望により、1個またはそれ以上のハロゲン原子で置換されていてもよいアルキル；フェニル、あるいは、所望により、1個またはそれ以上のハロゲン原子、炭素数1～6のアルコキシ基、トリフルオロメチル基、アミノ基、ニトロ基、シアノ基または炭素数1～6のアルキル基で置換されていてもよいフェニル；

R_6 は、水素、炭素数1～6のアルキルまたは炭素数2～6のアルケニル；

R_7 は、クロロまたはブロモ；

R_8 は、水素、炭素数1～6のアルキル、炭素数1～6のアミノアルキル、炭素数2～9のN-アルキルアミノアルキル、炭素数3～12のN,N-ジアルキルアミノアルキル、炭素数4～12のN-シクロアルキルアミノアルキル、炭素数5～18のN-シクロアルキル-N-アルキルアミノアルキル、炭素数7～18のN,N-ジシクロアルキルアミノアルキル、モルホリノ-N-アルキル(ここで、アルキル基は炭素数1～6)、ピペリジノ-N-アルキル(ここで、アルキル基は炭素数1～6)、N-アルキル-ピペリジノ-N-アルキル(ここで、各アルキル基は炭素

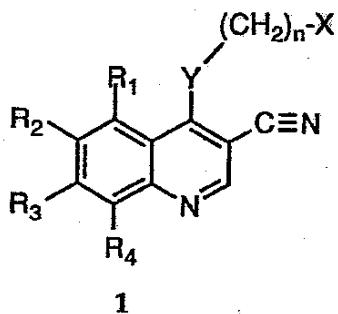
数1～6)、炭素数3～11のアザシクロアルキル-N-アルキル、炭素数1～6のヒドロキシアルキル、炭素数2～8のアルコキシアルキル、カルボキシ、炭素数1～6のカルボアルコキシ、フェニル、炭素数2～7のカルボアルキル、クロロ、フルオロまたはブロモ；

Zは、アミノ、ヒドロキシ、炭素数1～6のアルコキシ、アルキルアミノ(ここで、アルキル部分は炭素数1～6)、ジアルキルアミノ(ここで、各アルキル部分は炭素数1～6)、モルホリノ、ピペラジノ、N-アルキルピペラジノ(ここで、アルキル部分は炭素数1～6)またはピロリジノ；

$m = 1 \sim 4$ 、 $q = 1 \sim 3$ および $p = 0 \sim 3$ ；

[隣接する炭素原子上に位置する置換基 R_1 、 R_2 、 R_3 または R_4 のいずれかは、共に、二価の基-O-C(R_8)₂-O-であり得る]
で示される化合物またはその医薬上許容される塩(ただし、Yが-NH-であり、 R_1 、 R_2 、 R_3 および R_4 が水素であり、かつnが0のとき、Xは2-メチルフェニルではない)と医薬用担体とからなる医薬組成物。

30. 式：



[式中、Xは、所望により、ハロゲン、炭素数1～6のアルキル、炭素数2～6のアルケニル、炭素数2～6のアルキニル、アジド、炭素数1～6のヒドロキシアルキル、ハロメチル、炭素数2～7のアルコキシメチル、炭素数2～7のアルカノイルオキシメチル、炭素数1～6のアルコキシ、炭素数1～6のアルキルチオ、ヒドロキシ、トリフルオロメチル、シアノ、ニトロ、カルボキシ、炭素数2～7のカルボアルコキシ、炭素数2～7のカルボアルキル、フェノキシ、フェニル、チオフェノキシ、ベンゾイル、ベンジル、アミノ、炭素数1～6のアルキル

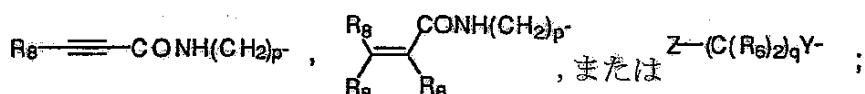
アミノ、炭素数2～12のジアルキルアミノ、フェニルアミノ、ベンジルアミノ、炭素数1～6のアルカノイルアミノ、炭素数3～8のアルケノイルアミノ、炭素数3～8のアルキノイルアミノおよびベンゾイルアミノからなる群から選択される置換基で一置換、二置換または三置換されていてもよいフェニル環；

nは、0～1；

Yは、-NH-；

R₁およびR₄は、水素；

R₂は、



R₃は、水素、炭素数1～6のアルコキシまたはZ-(C(R₆)₂)_qY-；

R₆は、水素または炭素数1～6のアルキル；

R₈は、水素、炭素数1～6のアルキル、炭素数3～12のN,N-ジアルキルアミノアルキルまたはモルホリノ-N-アルキル(ここで、アルキル基は炭素数1～6)；

Zは、ジアルキルアミノ(ここで、各々のアルキル部分は炭素数1～6)またはモルホリノ；

q=1～4およびp=0～3]

で示される化合物またはその医薬上許容される塩。

31. Xが、所望により、ハロゲンで一置換、二置換または三置換されていてもよいフェニルであり、かつqが2～4である請求項30記載の化合物。

32. 治療薬として用いるための請求項1～20および30～31のいずれか1項に定義される式1で示される化合物。

33. それを必要とする哺乳動物の非調節タンパクキナーゼの生物学的効果を阻害するのに用いるための請求項1～20および30～31のいずれか1項に定義される式1で示される化合物。

34. それを必要とする哺乳動物の新生物を治療するか、その成長を阻害する

か、あるいは根治させるのに用いるための請求項1～20および30～31のいずれか1項に定義される式1で示される化合物。

35. 新生物がEGFRを発現する請求項32に定義される式1で示される化合物。

36. 新生物がMAPKを発現する請求項32に定義される式1で示される化合物。

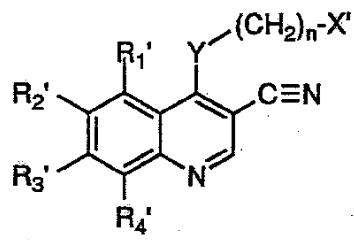
37. 新生物がECKを発現する請求項32に定義される式1で示される化合物。

38. 新生物がKDRを発現する請求項32に定義される式1で示される化合物。

39. 新生物が、胸部、腎臓、膀胱、口腔、喉頭、食道、胃、大腸、卵巢および肺からなる群から選択される請求項32に定義される式1で示される化合物。

40. 哺乳動物の多囊胞性腎疾患を治療するか、その進行を阻害するか、あるいは根治させるのに用いるための請求項1～20および30～31のいずれか1項に定義される式1で示される化合物。

41. 式：

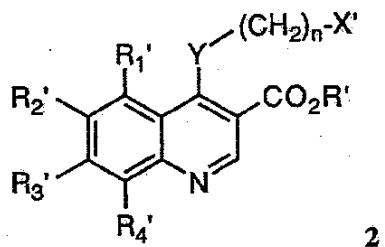


5

[式中、Yおよびnは、請求項1と同意義、X'は、所望により、水素、ハロゲノ、炭素数1～6のアルキル、炭素数2～6のアルケニル、炭素数2～6のアルキニル、ハロメチル、炭素数1～6のアルコキシ、炭素数1～6のアルキルチオ、トリフルオロメチル、シアノ、ニトロ、炭素数2～7のカルボアルキル、フェノキシ、フェニル、チオフェノキシ、ベンジル、炭素数2～12のジアルキルアミノからなる群から選択される1個またはそれ以上の置換基で置換されていてもよいシクロアルキルまたはフェニル；R₁'、R₂'、R₃'およびR₄'は、各々独立

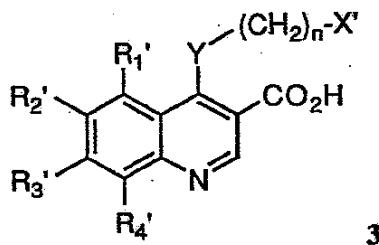
して、水素、ハロゲノ、炭素数1～6のアルキル、炭素数2～6のアルケニル、炭素数2～6のアルキニル、炭素数2～6のアルケニルオキシ、炭素数2～6のアルキニルオキシ、ハロメチル、炭素数2～7のアルコキシメチル、炭素数1～6のアルコキシ、炭素数1～6のアルキルチオ、炭素数1～6のアルキルスルフィニル、炭素数1～6のアルキルスルホニル、炭素数1～6のアルキルスルホンアミド、トリフルオロメチル、シアノ、ニトロ、カルボキシ、炭素数2～7のカルボアルキル、フェノキシ、フェニル、チオフェノキシ、ベンジル、炭素数1～4のアルコキシアミノ、炭素数2～12のジアルキルアミノ、炭素数3～14のN,N-ジアルキルアミノアルキル、フェニルアミノ、ベンジルアミノ、炭素数1～6のN-アルキルカルバモイル、炭素数2～12のN,N-ジアルキルカルバモイルであるか；あるいは隣接炭素原子上に位置する置換基R₁'、R₂'、R₃'およびR₄'のいずれかは、共に、二価の基-O-C(R₈)₂-O-であり得る】
で示される化合物の製造方法であって、

式2：



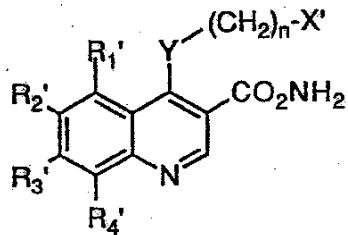
[式中、R'は炭素数1～6のアルキル基]

で示される酸エステルを塩基で加水分解して、式3：



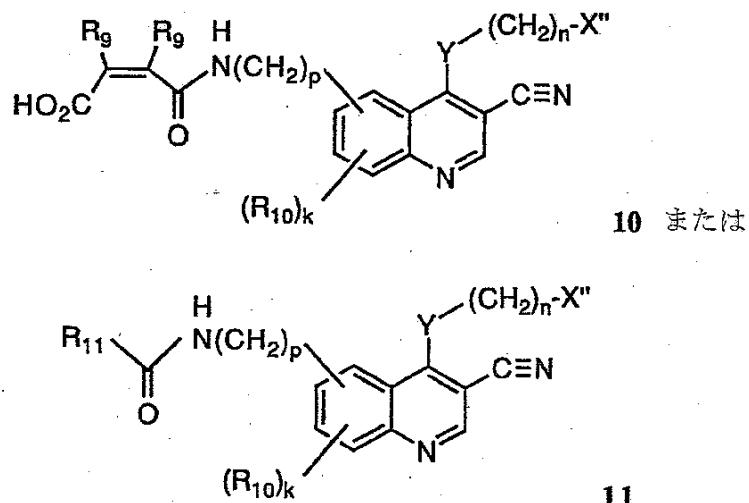
で示される化合物を形成し、次いで、それを不活性溶媒中でカルボニルイミダゾールと加熱することにより、式3のカルボン酸基をアシリイミダゾールに変換し

た後、アンモニアを加えて、式4：



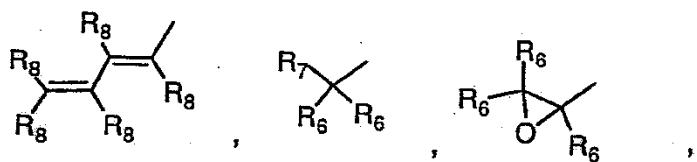
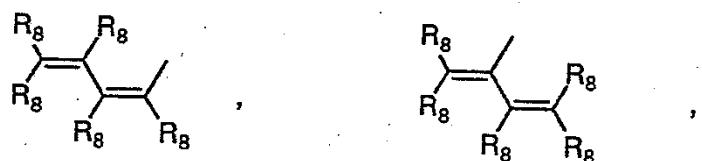
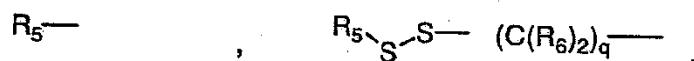
で示されるアミドを得、さらに、脱水剤と反応させて、上記の式5で示される化合物を得、そして、所望により、その後、その医薬上許容される塩を形成するこ^トからなる製造方法。

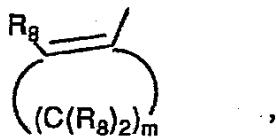
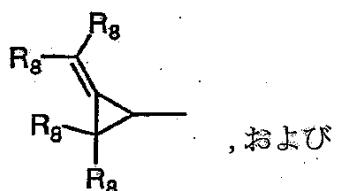
42. 式10または式11：



[式中、Y、pおよびnは請求項1と同意義、X''は、所望により、水素、ハロゲノ、炭素数1～6のアルキル、炭素数2～6のアルケニル、炭素数2～6のアルキニル、ハロメチル、炭素数2～7のアルコキシメチル、炭素数2～7のアルカノイルオキシメチル、炭素数1～6のアルコキシ、炭素数1～6のアルキルチオ、トリフルオロメチル、シアノ、ニトロ、カルボキシ、炭素数2～7のカルボアルコキシ、炭素数2～7のカルボアルキル、フェノキシ、フェニル、チオフェノキシ、ベンゾイル、ベンジル、炭素数2～12のジアルキルアミノ、フェニルアミノ、ベンジルアミノ、炭素数1～6のアルカノイルアミノ、炭素数3～8の

アルケノイルアミノ、炭素数3～8のアルキノイルアミノおよびベンジルアミノからなる群から選択される1個またはそれ以上の置換基で置換されていてもよいシクロアルキルまたはフェニルからなる群から選択され、R₉は、独立して、水素、フェニルまたは炭素数1～6のアルキル、部分(R₁₀)_kは、同一または相異なり、独立して、水素、ハロゲン、炭素数1～6のアルキル、炭素数2～6のアルケニル、炭素数2～6のアルキニル、炭素数2～6のアルケニルオキシ、炭素数2～6のアルキニルオキシ、ハロメチル、炭素数2～7のアルコキシメチル、炭素数1～6のアルコキシ、炭素数1～6のアルキルチオ、炭素数1～6のアルキルスルフィニル、炭素数1～6のアルキルスルホニル、トリフルオロメチル、シアノ、ニトロ、カルボキシ、炭素数2～7のカルボアルキル、フェノキシ、フェニル、チオフェノキシ、ベンジル、炭素数1～4のアルコキシアミノ、炭素数2～12のジアルキルアミノ、炭素数3～14のN,N-ジアルキルアミノアルキル、フェニルアミノ、ベンジルアミノ、炭素数1～6のN-アルキルカルバモイル、炭素数2～12のN,N-ジアルキルカルバモイルからなる群から選択される芳香族環上の1～3個の置換基を表し、R₁₁は基であり、以下のものからなる群から選択される：

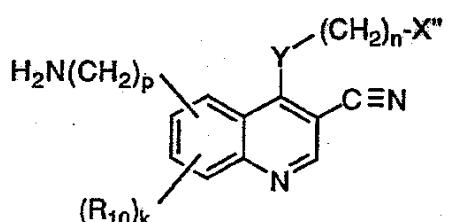




[式中、q、m、R₅、R₆、R₇およびR₈は請求項1と同意義]]

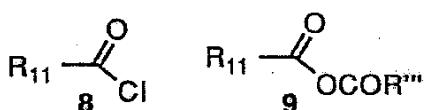
で示される化合物の製造方法であって、

式6：

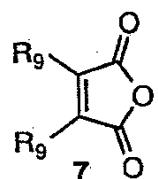


6

で示される化合物を、有機塩基の存在下、式8で示される酸塩化物または式9
(ここで、R'''は炭素数1～6のアルキル)で示される混合無水物

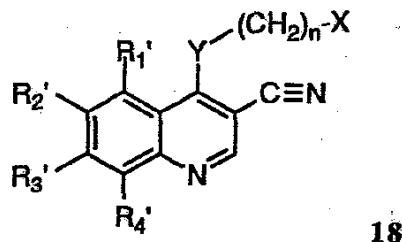


でアシル化して、式11で示される化合物を得るか、あるいは、式6で示される
化合物を、塩基性触媒の存在下、式7：



で示される環状無水物でアシル化し、そして、所望により、その後、その医薬上
許容される塩を形成することからなる製造方法。

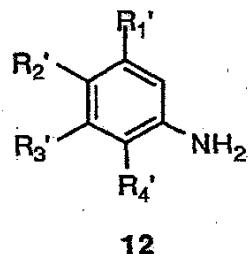
43. 式18：



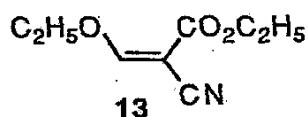
[式中、X、Yおよびnは請求項1と同意義、R₁'、R₂'、R₃'およびR₄'は請求項41と同意義]

で示される化合物の製造方法であって、

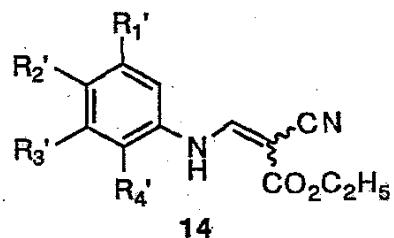
式12：



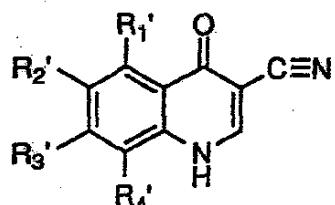
で示される置換アニリンを式13：



と共に加熱して、式14：

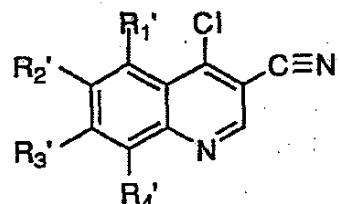


で示される化合物を得、次いで、これを高沸点溶媒中で熱分解して、式15：



15

で示される化合物を得、次いで、式15で示される化合物を塩素化剤と共に加熱して、式16：



16

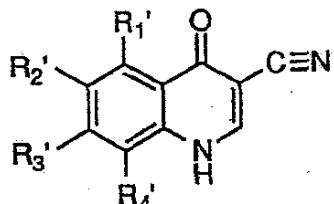
で示される化合物を得、これを式17：



17

で示される化合物と縮合させて、式18で示される化合物を得、そして、所望により、その後、その医薬上許容される塩を形成することからなる製造方法。

44. 式15：

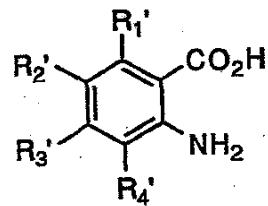


15

[式中、R₁'、R₂'、R₃'およびR₄'は請求項41と同意義]

で示される化合物の製造方法であって、

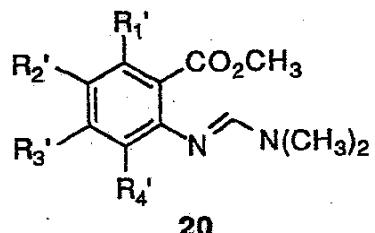
式19：



19

で示される化合物をジメチルホルムアミドジメチルアセタールと共に加熱して、

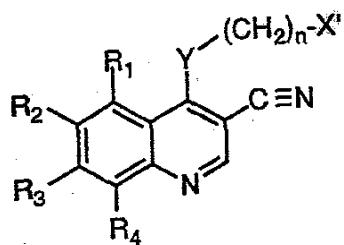
式20：



20

で示される化合物を得、次いで、これを、塩基の存在下、アセトニトリルと反応させて、式15で示される化合物を得ることからなる製造方法。

45. 式22(ここで、R₁、R₂、R₃、R₄およびnは請求項1と同意義、X'は請求項41と同意義)：



22

で示される化合物の製造方法であって、

R₁、R₂、R₃またはR₄の1個またはそれ以上がニトロ基である場合に、還元剤を用いて、対応するアミノ基に変換すること；

R_1 、 R_2 、 R_3 または R_4 の1個またはそれ以上がアミノ基である場合に、炭素数1～6のハロゲン化アルキルを用いたアルキル化により、対応する炭素数2～12のジアルキルアミノ基に変換すること；

R_1 、 R_2 、 R_3 または R_4 の1個またはそれ以上がメトキシ基である場合に、脱メチル化剤または塩化ピリジニウムとの反応により、対応するヒドロキシ基に変換すること；

R_1 、 R_2 、 R_3 または R_4 の1個またはそれ以上がアミノ基である場合に、塩基性触媒を用いて、塩化アルキルスルホニル、塩化アルケニルスルホニルまたは塩化アルキニルスルホニルとの反応により、対応する炭素数2～6のアルキルスルホンアミド基、アルケニルスルホンアミド基またはアルキニルスルホンアミド基に変換すること；

R_1 、 R_2 、 R_3 または R_4 の1個またはそれ以上がアミノ基である場合に、過剰の有機塩基を用いて、試薬 $C1-C(R'_6)_2-CHR'_6SO_2Cl$ （ここで、 R'_6 は水素または炭素数1～4のアルキル）との反応により、対応するアルケニルスルホンアミド基に変換すること；

R_1 、 R_2 、 R_3 または R_4 の2個が隣接するメトキシ基である場合に、脱メチル化剤との反応により、あるいは、塩化ピリジニウムと共に加熱することにより、隣接するヒドロキシ基を有する化合物に変換すること；

R_1 、 R_2 、 R_3 または R_4 の2個が隣接するヒドロキシ基である場合に、塩基を用いて、 $J-C(R_8)_2-J$ （ここで、Jはクロロ、ブロモまたはヨードであり、各Jは同一または相異なる）との反応により、隣接する2個の基 R_1 、 R_2 、 R_3 または R_4 が、共に、二価の基-O-C(R_8)₂-O-（ここで、 R_8 は請求項1と同意義）である化合物に変換すること；

R_1 、 R_2 、 R_3 または R_4 の1個またはそれ以上がアミノ基である場合に、炭素数1～6のハロゲン化アルキルを用いたアルキル化により、あるいは、炭素数1～6のアルデヒドおよび還元剤を用いた還元アルキル化により、対応する炭素数1～6のアルキルアミノ基に変換すること；

R_1 、 R_2 、 R_3 または R_4 の1個またはそれ以上がヒドロキシである場合に、

不活性溶媒中、触媒を用いて、適当なカルボン酸の塩化物、無水物または混合無水物との反応により、対応する炭素数1～6のアルカノイルオキシ基に変換すること；

R₁、R₂、R₃またはR₄の1個またはそれ以上がヒドロキシである場合に、不活性溶媒中、触媒を用いて、適当なカルボン酸の塩化物、無水物または混合無水物との反応により、対応する炭素数1～6のアルケノイルオキシ基に変換すること；

R₁、R₂、R₃またはR₄の1個またはそれ以上がヒドロキシである場合に、不活性溶媒中、触媒を用いて、適当なカルボン酸の塩化物、無水物または混合無水物との反応により、対応する炭素数1～6のアルキノイルオキシ基に変換すること；

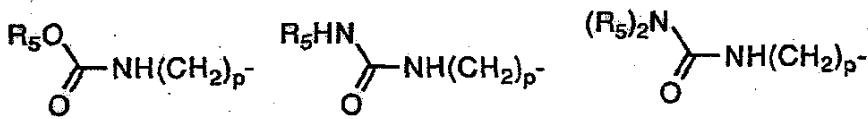
R₁、R₂、R₃またはR₄の1個またはそれ以上がカルボキシ基または炭素数2～7のカルボアルコキシ基である場合に、還元剤との反応により、対応するヒドロキシメチル基に変換し、所望により、ハロゲン化試薬との反応により、ヒドロキシメチル基を対応するハロメチル基に変換するか、あるいは、所望により、不活性溶媒中、触媒を用いて、酸塩化物、無水物または混合無水物でヒドロキシメチル基をアシル化して、対応する炭素数2～7のアルカノイルオキシメチル基、炭素数2～7のアルケノイルオキシメチル基または炭素数2～7のアルキノイルオキシメチル基を得ること；

R₁、R₂、R₃またはR₄の1個またはそれ以上がハロメチル基である場合に、不活性溶媒中で、ハロゲン原子をナトリウムアルコキシドで置換することにより、炭素数2～7のアルコキシメチル基に変換すること；

R₁、R₂、R₃またはR₄の1個またはそれ以上がハロメチル基である場合に、不活性溶媒中で、ハロゲン原子をアンモニア、第一アミンまたは第二アミンで置換することにより、それぞれ、アミノメチル基、炭素数2～7のN-アルキルアミノメチル基または炭素数3～14のN,N-ジアルキルアミノメチル基に変換すること；

R₁、R₂、R₃またはR₄の1個またはそれ以上がH₂N(CH₂)_p-基である場

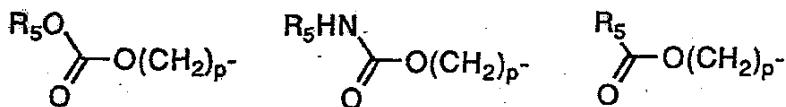
合に、不活性溶媒中、塩基の存在下で、ホスゲンとの反応により、対応する基：



[式中、R₅およびpは請求項1と同意義]

に変換して、イソシアネートを得、これを、それぞれ、過剰のアルコールR₅-OH、あるいは、アミンR₅-NH₂または(R₅)₂NHで処理すること；

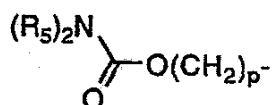
R₁、R₂、R₃またはR₄の1個またはそれ以上がHO-(CH₂)_p-基である場合に、不活性溶媒中、塩基触媒を用いて、適当なクロロギ酸アルキルまたはフェニルR₅-OCOC1、アルキルまたはフェニル置換イソシアネートR₅-N=C=O、あるいは、アルキルまたはフェニル置換カルボン酸塩化物R₅-COClとの反応により、それぞれ、対応する基：



[式中、R₅およびpは上記と同意義]

に変換すること；

R₁、R₂、R₃またはR₄の1個またはそれ以上がHO-(CH₂)_p-基である場合に、不活性溶媒中、塩基触媒を用いて、試薬(R₅)₂NCOClとの反応により、対応する基：



[式中、R₅およびpは上記と同意義]

に変換すること、からなる製造方法。