

【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26年6月19日(2014.6.19)

【公表番号】特表2013-525333(P2013-525333A)

【公表日】平成25年6月20日(2013.6.20)

【年通号数】公開・登録公報2013-032

【出願番号】特願2013-505483(P2013-505483)

【国際特許分類】

C 07 D 401/12	(2006.01)
C 07 D 403/12	(2006.01)
A 61 K 31/517	(2006.01)
C 07 D 401/14	(2006.01)
A 61 K 31/506	(2006.01)
C 07 D 403/14	(2006.01)
A 61 K 31/5377	(2006.01)
A 61 K 31/498	(2006.01)
C 07 D 405/14	(2006.01)
A 61 K 31/4709	(2006.01)
C 07 D 409/14	(2006.01)
A 61 P 35/00	(2006.01)
A 61 P 31/04	(2006.01)
A 61 P 29/00	(2006.01)
A 61 P 43/00	(2006.01)
A 61 K 31/551	(2006.01)
A 61 P 37/02	(2006.01)

【F I】

C 07 D 401/12	
C 07 D 403/12	C S P
A 61 K 31/517	
C 07 D 401/14	
A 61 K 31/506	
C 07 D 403/14	
A 61 K 31/5377	
A 61 K 31/498	
C 07 D 405/14	
A 61 K 31/4709	
C 07 D 409/14	
A 61 P 35/00	
A 61 P 31/04	
A 61 P 29/00	
A 61 P 43/00	1 1 1
A 61 K 31/551	
A 61 P 37/02	

【手続補正書】

【提出日】平成26年4月21日(2014.4.21)

【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

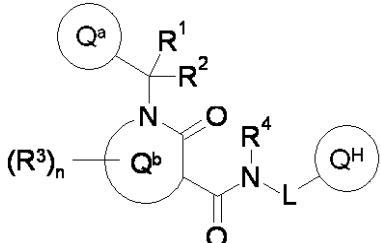
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

下記一般式(1)の化合物

【化1】



(1)

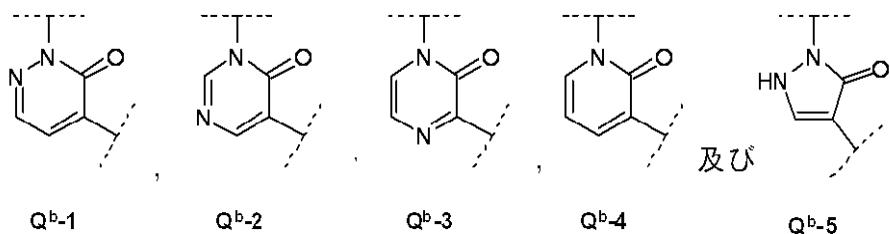
(式中、

Q^a は、 $C_{3\sim 10}$ シクロアルキル、 $C_{6\sim 10}$ アリール、5~12員ヘテロアリール及び3~14員ヘテロシクリルの中から選択された、1つ以上の同一若しくは異なる R^a 及び/又は R^b で置換されていてもよい環系であり；

R^1 及び R^2 は、互いに独立に水素、ハロゲン、 $C_{1\sim 4}$ アルキル、 $C_{2\sim 4}$ アルケニル、 $C_{2\sim 4}$ アルキニル、 $C_{1\sim 4}$ ハロアルキル、-NH₂、-CN、-NHC_{1\sim 4}アルキル、-N(C_{1\sim 4}アルキル)₂、-OH、-OC_{1\sim 4}アルキル、HO-C_{1\sim 4}アルキレン-、C_{1\sim 4}アルキル-O-C_{1\sim 4}アルキレン-、H₂N-C_{1\sim 4}アルキレン-、-OC_{1\sim 4}ハロアルキル、(C_{1\sim 4}アルキル)NH-C_{1\sim 4}アルキレン-及び(C_{1\sim 4}アルキル)₂N-C_{1\sim 4}アルキレンの中から選択され、さらに前記基中のアルキル、アルケニル、アルキニル及びアルキレンは1つ以上の同一若しくは異なるハロゲンで置換されていてもよく；

前記環系 Q^b は下記

【化2】



の中から選択され；

各 R^3 は、独立にハロゲン、 $C_{1\sim 4}$ アルキル、 $C_{2\sim 4}$ アルケニル、 $C_{2\sim 4}$ アルキニル、 $C_{1\sim 4}$ ハロアルキル、-NH₂、-CN、-NHC_{1\sim 4}アルキル、-N(C_{1\sim 4}アルキル)₂、-OH、-OC_{1\sim 4}アルキル、HO-C_{1\sim 4}アルキレン-、HO-C_{2\sim 4}アルキレン-O-、C_{1\sim 4}アルキル-O-C_{1\sim 4}アルキレン-、C_{1\sim 4}ハロアルキル-O-C_{1\sim 4}アルキレン-、H₂N-C_{1\sim 4}アルキレン-、C_{1\sim 4}アルキル-O-C_{2\sim 4}アルキレン-O-、(C_{1\sim 4}アルキル)NH-C_{1\sim 4}アルキレン-、(C_{1\sim 4}アルキル)₂N-C_{1\sim 4}アルキレン-、-OC_{1\sim 4}ハロアルキル、H₂N-C_{2\sim 4}アルキレン-O-、-NH(C_{2\sim 4}アルキレン-NH₂)、-NH[C_{2\sim 4}アルキレン-N(HC_{1\sim 4}アルキル)]、-NH[C_{2\sim 4}アルキレン-N(C_{1\sim 4}アルキル)₂]、(C_{1\sim 4}アルキル)₂N-C_{2\sim 4}アルキレン-O-、(C_{1\sim 4}ハロアルキル)₂N-C_{2\sim 4}アルキレン-O-、(C_{1\sim 4}ハロアルキル)NH-C_{2\sim 4}アルキレン-O-及び(C_{1\sim 4}アルキル)NH-C_{2\sim 4}アルキレン-O-の中から選択され；

nは、 Q^b が環系 Q^b -4に相当する場合、数0、1、2又は3を表し；

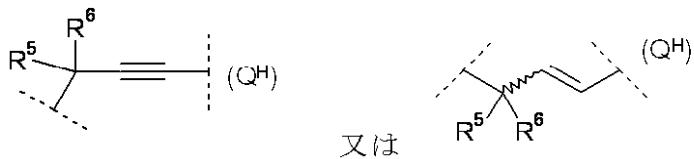
各nは、 Q^b が環系 Q^b -1、 Q^b -2、 Q^b -3又は Q^b -5の1つに相当する場合、独立に数0、1又は2を表し；

さらに環系 Q^b -1~ Q^b -5中の基 R^3 は、いずれの場合も水素に取って代わり；

R^4 は、水素又は $C_{1\sim 4}$ アルキルを表し；

Lは下記基

【化3】

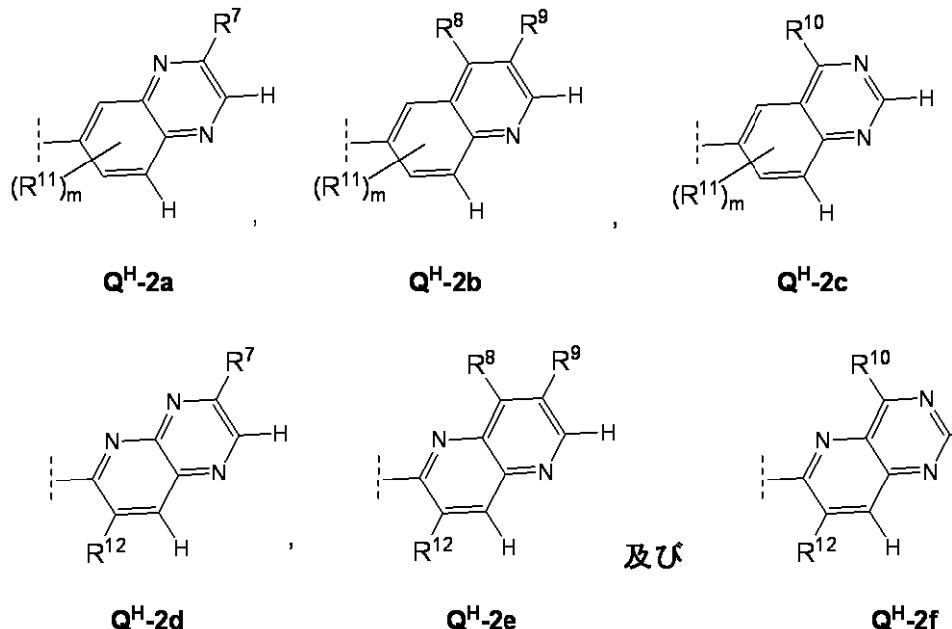


を表し、後者の場合、基-CR⁵R⁶-及びQ^Hは、二重結合に対してcis及びtrans配置の両方を想定することができ；

R⁵及びR⁶は、それぞれ互いに独立に水素、ハロゲン、C_{1~4}アルキル、C_{1~4}ハロアルキルの中から選択され；

前記環系Q^Hは下記

【化4】



の中から選択され；

R⁷及びR⁹は、それぞれ互いに独立に水素、ハロゲン、-NR^aR^a、-N(OR^a)R^a、-OR^a、-COOR^a、-COR^a、-CONR^aR^a、-SR^a、-NO₂及び-CNの中から選択されるか或いはC_{1~6}アルキル、C_{2~6}アルケニル、C_{2~6}アルキニル、C_{3~10}シクロアルキル、C_{6~10}アリール、5~12員ヘテロアリール及び3~14員ヘテロシクリルの中から選択された、1つ以上の同一若しくは異なるR^b及び/又はR^cで置換されていてもよい基を表し；

R⁸は、独立に水素、-NR^aR^a、-N(OR^a)R^a、-OR^a、-COOR^a、-COR^a、-CONR^aR^a及び-SR^aの中から選択されるか或いはC_{1~6}アルキル、C_{2~6}アルケニル、C_{2~6}アルキニル、C_{3~10}シクロアルキル、C_{6~10}アリール、5~12員ヘテロアリール及び3~14員ヘテロシクリルの中から選択された、1つ以上の同一若しくは異なるR^b及び/又はR^cで置換されていてもよい基を表し；

R¹⁰は、独立に-NR^aR^a、-N(OR^a)R^a、-OR^a及び-SR^aの中から選択されるか或いはC_{1~6}アルキル、C_{2~6}アルケニル、C_{2~6}アルキニル、C_{3~10}シクロアルキル、C_{6~10}アリール、5~12員ヘテロアリール及び3~14員ヘテロシクリルの中から選択された、1つ以上の同一若しくは異なるR^b及び/又はR^cで置換されていてもよい基を表し；

各R¹¹及びR¹²は、独立にR^a及びR^bの中から選択され；

mは、数0、1又は2を表し；

各R^aは、独立に水素或いはC_{1~6}アルキル、C_{2~6}アルケニル、C_{2~6}アルキニル、C_{3~10}シクロアルキル、C_{6~10}アリール、5~12員ヘテロアリール及び3~14員ヘテロシクリルの中から選択された、1つ以上の同一若しくは異なるR^b及び/又はR^cで置換されていてもよい基を表し；

各R^bは、独立に-OR^c、-NR^cR^c、ハロゲン、-CN、-NO₂、-C(O)R^c、-C(O)OR^c、-C(O)NR^cR^c、-S(O)₂R^c、-S(O)₂NR^cR^c、-NHC(O)R^c及び-N(C₁₋₄アルキル)C(O)R^c並びに二価置換基=Oの中から選択され、さらに後者は非芳香環系にのみ存在し得る置換基であり；

各R^cは、独立に水素或いはC₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₃₋₁₀シクロアルキル、C₆₋₁₀アリール、5~12員ヘテロアリール及び3~14員ヘテロシクリルの中から選択された、1つ以上の同一若しくは異なるR^d及び/又はR^eで置換されていてもよい基を表し；

各R^dは、独立に-OR^e、-NR^eR^e、ハロゲン、-CN、-NO₂、-C(O)R^e、-C(O)OR^e、-C(O)NR^eR^e、-S(O)₂R^e、-S(O)₂NR^eR^e、-NHC(O)R^e及び-N(C₁₋₄アルキル)C(O)R^e、並びに二価置換基=Oの中から選択され、さらに後者は非芳香環系にのみ存在し得る置換基であり；

各R^eは、独立に水素或いはC₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₃₋₁₀シクロアルキル、C₆₋₁₀アリール、5~12員ヘテロアリール及び3~14員ヘテロシクリルの中から選択された、1つ以上の同一若しくは異なるR^f及び/又はR^gで置換されていてもよい基を表し；

各R^fは、独立に-OR^g、-NR^gR^g、ハロゲン、-CN、-NO₂、-C(O)R^g、-C(O)OR^g、-C(O)NR^gR^g、-S(O)₂R^g、-S(O)₂NR^gR^g、-NHC(O)R^g及び-N(C₁₋₄アルキル)C(O)R^g、並びに二価置換基=Oの中から選択され、さらに後者は非芳香環系にのみ存在し得る置換基であり；

各R^gは、独立に水素、C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₃₋₁₀シクロアルキル、C₆₋₁₀アリール、5~12員ヘテロアリール及び3~14員ヘテロシクリルの中から選択され；

さらに前記化合物(1)は、その互変異性体、ラセミ体、エナンチオマー、ジアステレオマー又は混合物の形態で或いは前記全ての形態のそれぞれの塩として存在してもよい)。

【請求項2】

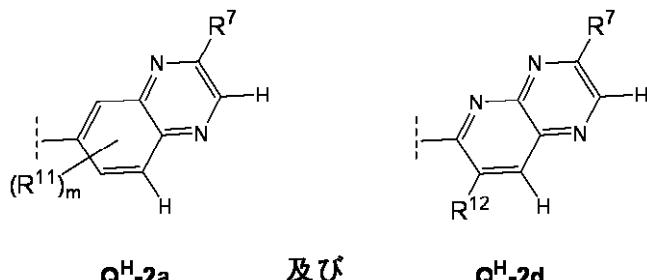
Q^aが、C₅₋₆シクロアルキル、フェニル、5~6員ヘテロアリール及び5~7員ヘテロシクリルの中から選択された、1つ以上の同一若しくは異なるR^a及び/又はR^bで置換されていてもよい環系であり、かつ

R^a及びR^bが請求項1の定義どおりである、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

前記環系Q^Hが下記

【化5】



の中から選択され；

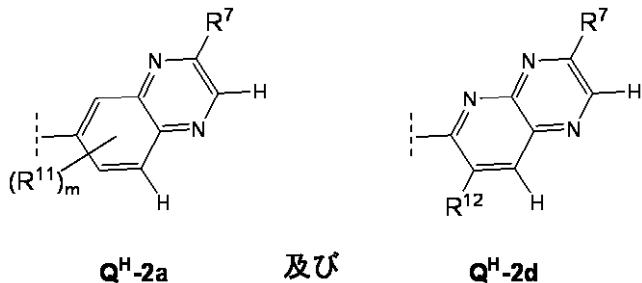
R⁷が、独立に水素、-NR^aR^a、-N(OR^a)R^a、-OR^a、-COOR^a、-COR^a、-CONR^aR^a及び-SR^aの中から選択されるか或いはC₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₃₋₁₀シクロアルキル、C₆₋₁₀アリール、5~12員ヘテロアリール及び3~14員ヘテロシクリルの中から選択された、1つ以上の同一若しくは異なるR^b及び/又はR^cで置換されていてもよい基を表し、かつ

R¹¹、R¹²、R^a、R^b、R^c及びmが請求項1の定義どおりである、請求項1又は2に記載の化合物。

【請求項4】

前記環系Q^Hが下記

【化6】



の中から選択され；

R⁷が、独立に水素、-NR^{a1}R^{a1}、-N(OR^{a1})R^{a1}、-OR^{a1}、-COOR^{a1}、-COR^{a1}、-CONR^{a1}R^{a1}及び-SR^{a1}の中から選択されるか或いはC_{1~6}アルキル、C_{2~6}アルケニル、C_{2~6}アルキニル、C_{3~10}シクロアルキル、C_{6~10}アリール、5~12員ヘテロアリール及び3~14員ヘテロシクリルの中から選択された、1つ以上の同一若しくは異なるR^{b1}及び/又はR^{c1}で置換されていてもよい基を表し；

各R^{a1}が、独立に水素或いはC_{1~6}アルキル、C_{3~10}シクロアルキル及び3~14員ヘテロシクリルの中から選択された、1つ以上の同一若しくは異なるR^{b1}及び/又はR^{c1}で置換されていてもよい基を表し；

各R^{b1}が、独立に-OR^{c1}、-NR^{c1}R^{c1}及びハロゲンの中から選択され；

各R^{c1}が、独立に水素或いはC_{1~6}アルキル、C_{3~10}シクロアルキル及び3~14員ヘテロシクリルの中から選択された、1つ以上の同一若しくは異なるR^{d1}及び/又はR^{e1}で置換されていてもよい基を表し；

各R^{d1}が、独立に-OR^{e1}、-CN及び-C(O)OR^{e1}の中から選択され；

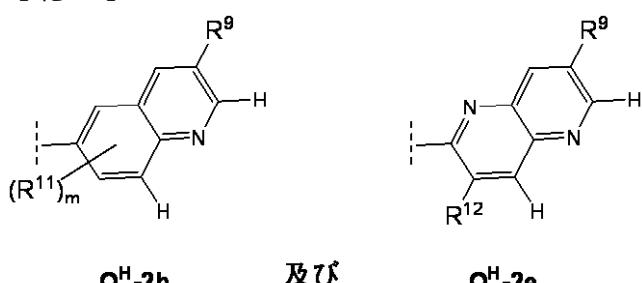
各R^{e1}が、独立に水素或いはC_{1~6}アルキル及びC_{3~10}シクロアルキルの中から選択された、1つ以上の同一若しくは異なるC_{3~6}シクロアルキルで置換されていてもよい基を表し、かつ

R¹¹、R¹²及びmが請求項1の定義どおりである、請求項3に記載の化合物。

【請求項5】

前記環系Q^Hが下記

【化7】



の中から選択され；

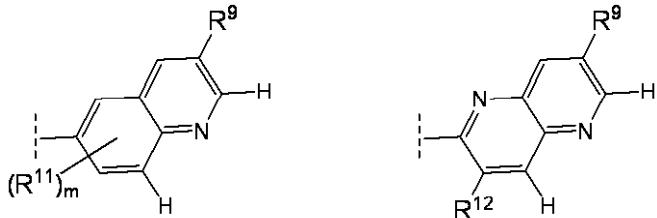
R⁹が、独立に水素、-NR^aR^a、-N(OR^a)R^a、-OR^a、-COOR^a、-COR^a、-CONR^aR^a及び-SR^aの中から選択されるか或いはC_{1~6}アルキル、C_{2~6}アルケニル、C_{2~6}アルキニル、C_{3~10}シクロアルキル、C_{6~10}アリール、5~12員ヘテロアリール及び3~14員ヘテロシクリルの中から選択された、1つ以上の同一若しくは異なるR^b及び/又はR^cで置換されていてもよい基を表し、かつ

R¹¹、R¹²、R^a、R^b、R^c及びmが請求項1の定義どおりである、請求項1又は2に記載の化合物。

【請求項6】

前記環系Q^Hが下記

【化8】

**Q^H-2b**

及び

Q^H-2e

の中から選択され；

R⁹が、独立に水素、-NR^{a2}R^{a2}、-N(OR^{a2})R^{a2}、-OR^{a2}、-COOR^{a2}、-COR^{a2}、-CONR^{a2}R^{a2}及び-SR^{a2}の中から選択されるか或いはC_{1~6}アルキル、C_{2~6}アルケニル、C_{2~6}アルキニル、C_{3~10}シクロアルキル、C_{6~10}アリール、5~12員ヘテロアリール及び3~14員ヘテロシクリルの中から選択された、1つ以上の同一若しくは異なるR^{b2}及び/又はR^{c2}で置換されていてもよい基を表し；

各R^{a2}が、独立に水素或いはC_{1~6}アルキル、C_{3~10}シクロアルキル及び3~14員ヘテロシクリルの中から選択された、1つ以上の同一若しくは異なるR^{b2}及び/又はR^{c2}で置換されていてもよい基を表し；

各R^{b2}が、独立に-OR^{c2}、-NR^{c2}R^{c2}及びハロゲンの中から選択され；

各R^{c2}が、独立に水素或いはC_{1~6}アルキル、C_{3~10}シクロアルキル及び3~14員ヘテロシクリルの中から選択された、1つ以上の同一若しくは異なるR^{d2}及び/又はR^{e2}で置換されていてもよい基を表し；

各R^{d2}が、独立に-OR^{e2}、-CN及び-C(O)OR^{e2}中から選択され；

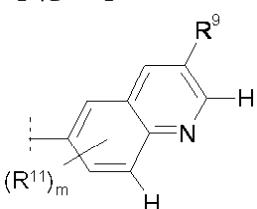
各R^{e2}が、独立に水素或いはC_{1~6}アルキル及びC_{3~10}シクロアルキルの中から選択されら、1つ以上の同一若しくは異なるC_{3~6}シクロアルキルで置換されていてもよい基を表し、かつ

R¹¹、R¹²及びmが請求項1の定義どおりである、請求項5に記載の化合物。

【請求項7】

前記環系Q^Hが下記

【化9】

**Q^H-2b**

を表し；

R⁹が、水素、-NR^{a2}R^{a2}、-OR^{a2}及び-SR^{a2}の中から選択されるか或いはC_{1~6}アルキル、C_{2~6}アルケニル、ピロリジニル、ピペラジニル、ピペリジニル、モルフォリニル、ホモモルフォリニル、アゼチジニル及びホモピペラジニルの中から選択された、1つ以上の同一若しくは異なるR^{b2}及び/又はR^{c2}で置換されていてもよい基を表し；

各R^{a2}が、独立に水素或いはC_{1~6}アルキル、C_{3~6}シクロアルキル、ピペラジニル、ピペリジニル、モルフォリニル、アゼチジニル及びピロリジニルの中から選択された、1つ以上の同一若しくは異なるR^{b2}及び/又はR^{c2}で置換されていてもよい基を表し；

各R^{b2}が、独立に-OR^{c2}、-NR^{c2}R^{c2}及びハロゲンの中から選択され；

各R^{c2}が、独立に水素或いはC_{1~6}アルキル、C_{3~6}シクロアルキル、ピロリジニル、モルフォリニル、ホモモルフォリニル、ピペラジニル、ホモピペラジニル、オキセタニル及びピペリジニルの中から選択された、1つ以上の同一若しくは異なるR^{d2}及び/又はR^{e2}で置換

されていてもよい基を表し；

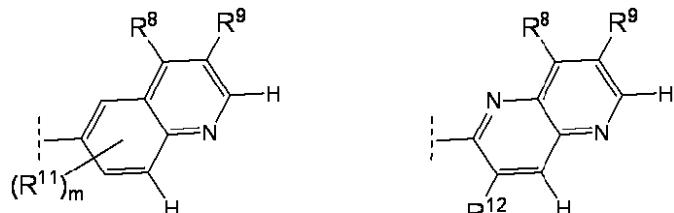
各R^{d2}が、独立に-OR^{e2}、-CN及び-C(O)OR^{e2}の中から選択され；

各R^{e2}が、独立に水素或いはC_{1~6}アルキル及びC_{3~6}シクロアルキルの中から選択された、1つ以上の同一若しくは異なるC_{3~6}シクロアルキルで置換されていてもよい基を表し、かつR¹¹及びmが請求項1の定義どおりである、請求項6に記載の化合物。

【請求項8】

前記環系Q^Hが下記

【化10】



の中から選択され；

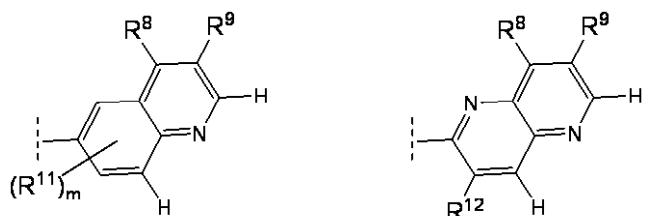
R⁸が、水素、-NR^aR^a、-N(OR^a)R^a、-OR^a及び-SR^aの中から選択されるか或いはC_{1~6}アルキル、C_{2~6}アルケニル、C_{2~6}アルキニル、C_{3~10}シクロアルキル、C_{6~10}アリール、5~12員ヘテロアリール及び3~14員ヘテロシクリルの中から選択された、1つ以上の同一若しくは異なるR^b及び/又はR^cで置換されていてもよい基を表し；

R⁹が、独立に水素、ハロゲン、-NO₂、-CN及びC_{1~4}アルキルの中から選択され、かつR¹¹、R¹²、R^a、R^b、R^c及びmが請求項1の定義どおりである、請求項1又は2に記載の化合物。

【請求項9】

前記環系Q^Hが下記

【化11】



の中から選択され；

R⁸が、-NR^{a3}R^{a3}及び-OR^{a3}の中から選択されるか或いはC_{1~6}アルキル、C_{2~6}アルケニル、C_{2~6}アルキニル、5~12員ヘテロアリール及び3~14員ヘテロシクリルの中から選択された、1つ以上の同一若しくは異なるR^{b3}及び/又はR^{c3}で置換されていてもよい基を表し；

R⁹が、独立に水素、ハロゲン、-NO₂、-CN及びC_{1~4}アルキルの中から選択され；

各R^{a3}が、独立に水素或いはC_{1~6}アルキル、C_{3~10}シクロアルキル、C_{6~10}アリール及び3~14員ヘテロシクリルの中から選択された、1つ以上の同一若しくは異なるR^{b3}及び/又はR^{c3}で置換されていてもよい基を表し；

各R^{b3}が、独立に-OR^{c3}及び-NR^{c3}R^{c3}の中から選択され；

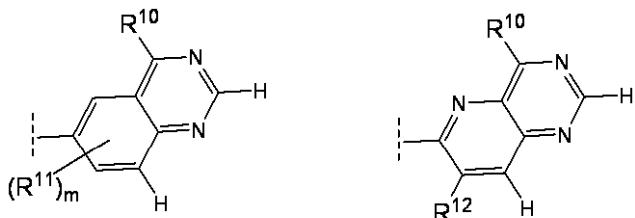
各R^{c3}が、独立に水素或いはC_{1~6}アルキル、C_{3~10}シクロアルキル、C_{6~10}アリール及び3~14員ヘテロシクリルの中から選択された、1つ以上の同一若しくは異なるC_{1~6}アルキルで置換されていてもよい基を表し、かつ

R¹¹、R¹²及びmが請求項1の定義どおりである、請求項8に記載の化合物。

【請求項10】

前記環系Q^Hが下記

【化12】

**Q^H-2c**

及び

Q^H-2f

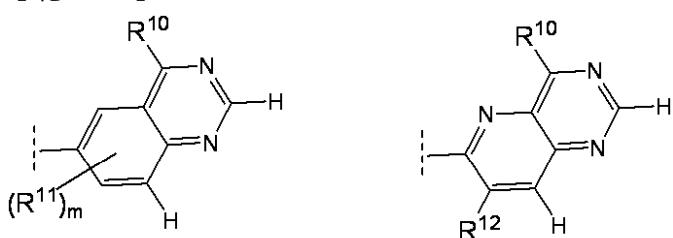
の中から選択され；

R^{10} が、独立に $-NR^aR^a$ 、 $-N(OR^a)R^a$ 、 $-OR^a$ 及び $-SR^a$ の中から選択されるか或いは C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-10} シクロアルキル、 C_{6-10} アリール、5~12員ヘテロアリール及び3~14員ヘテロシクリルの中から選択された、1つ以上の同一若しくは異なる R^b 及び/又は R^c で置換されていてもよい基を表し、かつ
 R^{11} 、 R^{12} 、 R^a 、 R^b 、 R^c 及び m が請求項1の定義どおりである、請求項1又は2に記載の化合物。

【請求項11】

前記環系 Q^H が下記

【化13】

**Q^H-2c**

及び

Q^H-2f

の中から選択され；

R^{10} が、独立に $-NR^{a4}R^{a4}$ 、 $-N(OR^{a4})R^{a4}$ 、 $-OR^{a4}$ 及び $-SR^{a4}$ の中から選択されるか或いは C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-10} シクロアルキル、 C_{6-10} アリール、5~12員ヘテロアリール及び3~14員ヘテロシクリルの中から選択された、1つ以上の同一若しくは異なる R^{b4} 及び/又は R^{c4} で置換されていてもよい基を表し；

各 R^{a4} が、独立に水素或いは C_{1-6} アルキル、 C_{3-10} シクロアルキル、 C_{6-10} アリール及び3~14員ヘテロシクリルの中から選択された、1つ以上の同一若しくは異なる R^{b4} 及び/又は R^{c4} で置換されていてもよい基を表し；

各 R^{b4} が、独立に $-OR^{c4}$ 、 $-NR^{c4}R^{c4}$ 、 $-C(O)R^{c4}$ 、 $-C(O)OR^{c4}$ 、 $-C(O)NR^{c4}R^{c4}$ 、 $-NHC(O)R^{c4}$ 及び $-N(C_{1-4} \text{アルキル})C(O)R^{c4}$ の中から選択され；

各 R^{c4} が、独立に水素或いは C_{1-6} アルキル、 C_{3-10} シクロアルキル、 C_{6-10} アリール、5~12員ヘテロアリール及び3~14員ヘテロシクリルの中から選択された、1つ以上の同一若しくは異なる R^{d4} 及び/又は R^{e4} で置換されていてもよい基を表し；

各 R^{d4} が $-OR^{e1}$ を表し；

各 R^{e4} が、独立に水素或いは C_{1-6} アルキル及び C_{6-10} アリールの中から選択された、1つ以上の同一若しくは異なる R^{f4} で置換されていてもよい基を表し；

各 R^{f4} がハロゲンを表し、かつ

R^{11} 、 R^{12} 及び m が請求項1の定義どおりである、請求項10に記載の化合物。

【請求項12】

下記の請求項1に記載の化合物：

- I-88 1-[(3, 4-ジフルオロフェニル) メチル]-N-[3-[4-[3-(ジメチルアミノ) プロポキシ] キノリン-6-イル] プロパ-2-イニル]-6-オキソピリミジン-5-カルボキサミド;
- I-101 1-[(3, 4-ジフルオロフェニル) メチル]-6-オキソ-N-[3-[4-[(3S)-ピロリジン-3-イル] オキシキノリン-6-イル] プロパ-2-イニル] ピリミジン-5-カルボキサミド;
- I-125. 9 N-[3-[4-[[(3R)-1-メチルピロリジン-3-イル] メトキシ] キノリン-6-イル] プロパ-2-イニル]-2-オキソ-1-[(3, 4, 5-トリフルオロフェニル) メチル] ピリジン-3-カルボキサミド;
- I-125. 11 N-[3-[4-[[(3S)-1-メチルピロリジン-3-イル] メトキシ] キノリン-6-イル] プロパ-2-イニル]-2-オキソ-1-[(1R)-1-(3, 4, 5-トリフルオロフェニル) エチル] ピリジン-3-カルボキサミド;
- I-125. 15 1-[(1R)-1-(3, 4-ジフルオロフェニル)-2-ヒドロキシエチル]-N-[3-(4-エトキシキノリン-6-イル) プロパ-2-イニル]-2-オキソピリジン-3-カルボキサミド;
- I-125. 17 N-[3-[4-[[(3R)-1-メチルピペリジン-3-イル] メトキシ] キノリン-6-イル] プロパ-2-イニル]-2-オキソ-1-[(3, 4, 5-トリフルオロフェニル) メチル] ピリジン-3-カルボキサミド;
- I-125. 20 N-[3-[4-[[(3S)-1-(2-モルフォリン-4-イルエチル) ピペリジン-3-イル] メトキシ] キノリン-6-イル] プロパ-2-イニル]-2-オキソ-1-[(1R)-1-(3, 4, 5-トリフルオロフェニル) エチル] ピリジン-3-カルボキサミド;
- I-125. 22 1-[(3, 4-ジフルオロフェニル) メチル]-2-オキソ-N-[3-[4-[[(3R)-1-プロパン-2-イルピペリジン-3-イル] メトキシ] キノリン-6-イル] プロパ-2-イニル] ピリジン-3-カルボキサミド;
- I-125. 21 1-[(1R)-2-ヒドロキシ-1-(3, 4, 5-トリフルオロフェニル) エチル]-N-[3-[4-[[(3R)-1-メチルピペリジン-3-イル] メトキシ] キノリン-6-イル] プロパ-2-イニル]-2-オキソピリジン-3-カルボキサミド;
- I-125. 19 N-[3-[4-[[(3S)-1-(2-モルフォリン-4-イルエチル) ピペリジン-3-イル] メトキシ] キノリン-6-イル] プロパ-2-イニル]-2-オキソ-1-[(3, 4, 5-トリフルオロフェニル) メチル] ピリジン-3-カルボキサミド;
- I-125. 16 1-[(1S)-1-(3, 4-ジフルオロフェニル)-2-ヒドロキシエチル]-N-[3-[4-(オキサン-4-イルメトキシ) キノリン-6-イル] プロパ-2-イニル]-2-オキソピリジン-3-カルボキサミド;
- II-59 2-[(3, 4-ジフルオロフェニル) メチル]-6-メトキシ-N-[3-[4-(メチルアミノ) キナゾリン-6-イル] プロパ-2-イニル]-3-オキソピリダジン-4-カルボキサミド;

- I-93 1-[(3, 4-ジフルオロフェニル) メチル]-N-[3-[4-[3-(ジメチルアミノ) プロポキシ] キノリン-6-イル] プロパ-2-イニル]-2-オキソピリジン-3-カルボキサミド;
- I-122 1-[(3, 4-ジフルオロフェニル) メチル]-6-オキソ-N-[3-[4-(ピロリジン-3-イルメトキシ) キノリン-6-イル] プロパ-2-イニル] ピリミジン-5-カルボキサミド;
- I-125. 4 1-[(1S)-1-(3, 4-ジフルオロフェニル)-2-ヒドロキシエチル]-2-オキソ-N-[3-[4-(オキソラン-3-イルメトキシ) キノリン-6-イル] プロパ-2-イニル] ピリジン-3-カルボキサミド;
- I-30 1-[(1R)-1-(3, 4-ジフルオロフェニル) エチル]-N-[3-[3-[(1-メチルピペリジン-4-イル) アミノ] キノキサリン-6-イル] プロパ-2-イニル]-2-オキソピリジン-3-カルボキサミド;
- I-40 1-[(3, 4-ジフルオロフェニル) メチル]-N-[3-[3-[(4-モルフォリン-4-イルシクロヘキシル) アミノ] キノキサリン-6-イル] プロパ-2-イニル]-6-オキソピリミジン-5-カルボキサミド;
- I-42 N-[3-[3-[[4-[4-(シクロプロピルメチル) ピペラジン-1-イル] シクロヘキシル] アミノ] キノキサリン-6-イル] プロパ-2-イニル]-1-[(3, 4-ジフルオロフェニル) メチル]-6-オキソピリミジン-5-カルボキサミド;
- I-46 1-[(3, 4-ジフルオロフェニル) メチル]-N-[3-[3-[(1-エチルピペリジン-4-イル) アミノ] キノキサリン-6-イル] プロパ-2-イニル]-2-オキソピリジン-3-カルボキサミド;
- I-51 1-[(1S)-1-(3, 4-ジフルオロフェニル) エチル]-N-[3-[3-[(1-エチルピペリジン-4-イル) アミノ] キノキサリン-6-イル] プロパ-2-イニル]-2-オキソピリジン-3-カルボキサミド;
- I-52 1-[(1S)-1-(3, 4-ジフルオロフェニル) エチル]-N-[3-[3-[[1-(2-メトキシエチル) ピペリジン-4-イル] アミノ] キノキサリン-6-イル] プロパ-2-イニル]-2-オキソピリジン-3-カルボキサミド;
- I-72 1-[(3, 4-ジフルオロフェニル) メチル]-N-[3-[3-[(1-エチルピペリジン-4-イル) アミノ] キノリン-6-イル] プロパ-2-イニル]-2-オキソピリジン-3-カルボキサミド;
- I-74 1-[(3, 4-ジフルオロフェニル) メチル]-N-[3-[3-[[1-(2-メトキシエチル) ピペリジン-4-イル] アミノ] キノリン-6-イル] プロパ-2-イニル]-2-オキソピリジン-3-カルボキサミド;
- I-75 1-[(1S)-1-(3, 4-ジフルオロフェニル) エチル]-N-[3-[3-[(1-エチルピペリジン-4-イル) アミノ] キノリン-6-イル] プロパ-2-イニル]-2-オキソピリジン-3-カルボキサミド;

- I-78 1-[(1S)-1-(3,4-ジフルオロフェニル)エチル]-N-[3-[3-[[1-(2-メトキシエチル)ピペリジン-4-イル]アミノ]キノリン-6-イル]プロパ-2-イニル]-2-オキソピリジン-3-カルボキサミド;
- I-47 1-[(3,4-ジフルオロフェニル)メチル]-N-[3-[3-[[3S,4R)-1-エチル-3-フルオロピペリジン-4-イル]アミノ]キノキサリン-6-イル]プロパ-2-イニル]-6-オキソピリミジン-5-カルボキサミド;
- I-48 1-[(1R)-1-(3,4-ジフルオロフェニル)-2-ヒドロキシエチル]-N-[3-[3-[[1-(2-メトキシエチル)ピペリジン-4-イル]アミノ]キノキサリン-6-イル]プロパ-2-イニル]-2-オキソピリジン-3-カルボキサミド;
- I-49 1-[(3,4-ジフルオロフェニル)メチル]-N-[3-[3-[[1-(2-メトキシエチル)ピペリジン-4-イル]アミノ]キノキサリン-6-イル]プロパ-2-イニル]-2-オキソピリジン-3-カルボキサミド;
- I-53 2-[(3,4-ジフルオロフェニル)メチル]-N-[3-[3-[[1-(2-メトキシエチル)ピペリジン-4-イル]アミノ]キノキサリン-6-イル]プロパ-2-イニル]-3-オキソピリダジン-4-カルボキサミド;
- I-57 1-[(3,4-ジフルオロフェニル)メチル]-N-[3-[3-[[1-(オキサタン-3-イル)ピペリジン-4-イル]アミノ]キノキサリン-6-イル]プロパ-2-イニル]-2-オキソピリジン-3-カルボキサミド;
- I-61 N-[3-[3-[[4-[4-(シクロプロピルメチル)ピペラジン-1-イル]シクロヘキシリ]アミノ]キノキサリン-6-イル]プロパ-2-イニル]-1-[(1S)-1-(3-フルオロフェニル)-2-ヒドロキシエチル]-2-オキソピリジン-3-カルボキサミド;
- I-73 1-[(3,4-ジフルオロフェニル)メチル]-N-[3-[3-[[1-(2-メトキシエチル)ピペリジン-4-イル]アミノ]キノリン-6-イル]プロパ-2-イニル]-6-オキソピリミジン-5-カルボキサミド;
- I-77 1-[(1R)-1-(3,4-ジフルオロフェニル)-2-ヒドロキシエチル]-N-[3-[3-[[1-(2-メトキシエチル)ピペリジン-4-イル]アミノ]キノリン-6-イル]プロパ-2-イニル]-2-オキソピリジン-3-カルボキサミド;
- I-87 1-[(3,4-ジフルオロフェニル)メチル]-6-オキソ-N-[3-(3-ピペリジン-4-イルオキシキノリン-6-イル)プロパ-2-イニル]ピリミジン-5-カルボキサミド;
- II-88 1-[(3,4-ジフルオロフェニル)メチル]-6-オキソ-N-[3-[4-(1H-ピロール-3-イル)キノリン-6-イル]プロパ-2-イニル]ピリミジン-5-カルボキサミド。

【請求項 1 3】

任意に通常の賦形剤及び／又は担体と組み合わせて、活性物質として請求項1～12のいずれか1項に記載の一般式(1)の化合物、又はその医薬的に許容できる塩を含有する医薬製剤。

【請求項 1 4】

請求項1～12のいずれか1項に記載の一般式(1)の化合物、又は1種のその医薬的に許容できる塩と、式(1)とは異なる少なくとも1種の他の細胞分裂停止活性物質又は細胞傷害活性物質とを含んでなる医薬製剤。

【請求項 1 5】

がん、感染症、炎症及び自己免疫疾患の治療及び／又は予防に用いるための、請求項13又は14に記載の医薬製剤。