

【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20年12月25日(2008.12.25)

【公表番号】特表2008-519814(P2008-519814A)

【公表日】平成20年6月12日(2008.6.12)

【年通号数】公開・登録公報2008-023

【出願番号】特願2007-540715(P2007-540715)

【国際特許分類】

C 07D 213/36 (2006.01)
 C 07D 213/75 (2006.01)
 A 61K 31/444 (2006.01)
 A 61K 31/4409 (2006.01)
 C 07D 213/74 (2006.01)
 C 07D 401/04 (2006.01)
 A 61K 31/4709 (2006.01)
 C 07D 401/14 (2006.01)
 A 61K 31/4545 (2006.01)
 C 07D 405/14 (2006.01)
 A 61K 31/497 (2006.01)
 A 61P 43/00 (2006.01)
 A 61P 9/02 (2006.01)
 A 61P 9/12 (2006.01)
 A 61P 9/10 (2006.01)
 A 61P 35/00 (2006.01)
 A 61P 15/10 (2006.01)
 A 61P 19/10 (2006.01)
 A 61P 31/18 (2006.01)
 A 61P 27/06 (2006.01)
 A 61P 27/02 (2006.01)
 A 61P 25/28 (2006.01)
 A 61P 25/16 (2006.01)

【F I】

C 07D 213/36
 C 07D 213/75 C S P
 A 61K 31/444
 A 61K 31/4409
 C 07D 213/74
 C 07D 401/04
 A 61K 31/4709
 C 07D 401/14
 A 61K 31/4545
 C 07D 405/14
 A 61K 31/497
 A 61P 43/00 1 1 1
 A 61P 9/02
 A 61P 9/12
 A 61P 9/10 1 0 1
 A 61P 35/00
 A 61P 15/10

A 6 1 P 19/10
 A 6 1 P 31/18
 A 6 1 P 27/06
 A 6 1 P 27/02
 A 6 1 P 25/28
 A 6 1 P 25/16

【手続補正書】

【提出日】平成20年11月10日(2008.11.10)

【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

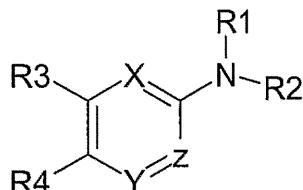
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)の化合物、或いはその医薬として許容し得る塩、水和物、溶媒和物、幾何異性体、互変異性体、光学異性体、又はプロドラッグ形態:

【化1】



式(I)

(式中、

X、Y、Zは、同じでも異なっていてもよく、

窒素、或いは

水素、ヒドロキシ、ハロゲン、トリフルオロメチル、アミノ、C_{1～6}-アミノアルキル、C_{1～6}-アルキル、C_{1～6}-アルコキシ、CONR₄R₅、CO₂R₄、CO₂H、NHCOR₄、NR₄R₅、NHS(O)₂R₄、NC(O)NR₄R₅、NC(O)OR₄、OR₄、又はSR₄で置換された炭素(式中、R₄及びR₅は、同じでも異なっていてもよく、水素、C_{1～6}-アルキル、C_{1～6}-アルコキシ、C_{1～6}-アルキルアミノ、アリール、ヘテロ、又はヘテロアリールである。)であり;

R₁及びR₂は、同じでも異なっていてもよく、また同時に水素ではなく、

水素、

1種以上のメチレンジオキシ、ヒドロキシ、C_{1～6}-アルキルヒドロキシ、C_{1～6}-アルコキシ、C_{1～6}-アルキル、トリフルオロメチル、O-CF₃、ハロゲン、CN、NO₂、アリール、ヘテロアリール、アミノ、C_{1～6}-アミノアルキル、CONR₄R₅、CO₂R₄、CO₂H、NHCOR₄、NR₄R₅、NHS(O)₂R₄、NC(O)NR₄R₅、NC(O)OR₄、OR₄、又はSR₄で、独立に場合によって置換されたアリール-C_{1～6}-アルキル(式中、R₄及びR₅は、同じでも異なっていてもよく、水素、C_{1～6}-アルキル、C_{1～6}-アルコキシ、C_{1～6}-アルキルアミノ、アリール、ヘテロ、又はヘテロアリールである。);或いは

1種以上のメチレンジオキシ、ヒドロキシ、C_{1～6}-アルキルヒドロキシ、C_{1～6}-

6 - アルコキシ、C₁ ~ 6 - アルキル、トリフルオロメチル、O - CF₃、ハロゲン、C N、NO₂、アリール、ヘテロアリール、アミノ、C₁ ~ 6 - アミノアルキル、CONR₄R₅、CO₂R₄、CO₂H、NHCOR₄、NR₄R₅、NHS(O)₂R₄、NC(O)NR₄R₅、NC(O)OR₄、OR₄、又はSR₄で、独立に場合によって置換されたアリール(式中、R₄及びR₅は、同じでも異なっていてもよく、水素、C₁ ~ 6 - アルキル、C₁ ~ 6 - アルコキシ、C₁ ~ 6 - アルキルアミノ、アリール、ヘテロ、又はヘテロアリールである。)；或いは

1種以上のメチレンジオキシ、ヒドロキシ、C₁~₆-アルキルヒドロキシ、C₁~₆-アルコキシ、C₁~₆-アルキル、トリフルオロメチル、O-CF₃、ハロゲン、CN、NO₂、アリール、ヘテロアリール、アミノ、C₁~₆-アミノアルキル、CONR₄R₅、CO₂R₄、CO₂H、NHCOR₄、NR₄R₅、NHS(O)₂R₄、NC(O)NR₄R₅、NC(O)OR₄、OR₄、又はSR₄で、独立に場合によって置換されたアリールオキシ(式中、R₄及びR₅は、同じでも異なっていてもよく、水素、C₁~₆-アルキル、C₁~₆-アルコキシ、C₁~₆-アルキルアミノ、アリール、ヘテロ、又はヘテロアリールである。)；或いは

1種以上のメチレンジオキシ、ヒドロキシ、C_{1～6}-アルキルヒドロキシ、C_{1～6}-アルコキシ、C_{1～6}-アルキル、トリフルオロメチル、O-CF₃、ハロゲン、CN、NO₂、アリール、ヘテロアリール、アミノ、C_{1～6}-アミノアルキル、CONR_{4R5}、CO₂R₄、CO₂H、NHCOR₄、NR_{4R5}、NHS(O)₂R₄、NC(O)NR_{4R5}、NC(O)OR₄、OR₄、又はSR₄で、独立に場合によって置換されたヘテロアリール-C_{1～6}-アルキル(式中、R₄及びR₅は、同じでも異なっていてもよく、水素、C_{1～6}-アルキル、C_{1～6}-アルコキシ、C_{1～6}-アルキルアミノ、アリール、ヘテロ、又はヘテロアリールである。)；或いは

1種以上のメチレンジオキシ、ヒドロキシ、C_{1～6}-アルキルヒドロキシ、C_{1～6}-アルコキシ、C_{1～6}-アルキル、トリフルオロメチル、O-CF₃、ハロゲン、CN、NO₂、アリール、ヘテロアリール、アミノ、C_{1～6}-アミノアルキル、CONR₄R₅、CO₂R₄、CO₂H、NHCOR₄、NR₄R₅、NHS(O)₂R₄、NC(O)NR₄R₅、NC(O)OR₄、OR₄、又はSR₄で、独立に場合によって置換されたヘテロアリール(式中、R₄及びR₅は、同じでも異なっていてもよく、水素、C_{1～6}-アルキル、C_{1～6}-アルコキシ、C_{1～6}-アルキルアミノ、アリール、ヘテロ、又はヘテロアリールである。)；或いは

1種以上のメチレンジオキシ、ヒドロキシ、C_{1～6}-アルキルヒドロキシ、C_{1～6}-アルコキシ、C_{1～6}-アルキル、トリフルオロメチル、O-CF₃、ハロゲン、CN、NO₂、アリール、ヘテロアリール、アミノ、C_{1～6}-アミノアルキル、CONR₄R₅、CO₂R₄、CO₂H、NHCOR₄、NR₄R₅、NHS(O)₂R₄、NC(O)NR₄R₅、NC(O)OR₄、OR₄、又はSR₄で、独立に場合によって置換されたヘテロアリールオキシ(式中、R₄及びR₅は、同じでも異なっていてもよく、水素、C_{1～6}-アルキル、C_{1～6}-アルコキシ、C_{1～6}-アルキルアミノ、アリール、ヘテロ、又はヘテロアリールである。)；或いは

1種以上のメチレンジオキシ、ヒドロキシ、C_{1～6}-アルキルヒドロキシ、C_{1～6}-アルコキシ、C_{1～6}-アルキル、トリフルオロメチル、O-CF₃、ハロゲン、CN、NO₂、アリール、ヘテロアリール、アミノ、C_{1～6}-アミノアルキル、CONR_{4R5}、CO₂R₄、CO₂H、NHCOR₄、NR_{4R5}、NHS(O)₂R₄、NC(O)NR_{4R5}、NC(O)OR₄、OR₄、又はSR₄で、独立に場合によって置換されたCO-C_{1～6}-アルキルアリール(式中、R₄及びR₅は、同じでも異なっていてもよく、水素、C_{1～6}-アルキル、C_{1～6}-アルコキシ、C_{1～6}-アルキルアミノ、アリール、ヘテロ、又はヘテロアリールである。)；或いは

1種以上のメチレンジオキシ、ヒドロキシ、C₁~₆-アルキルヒドロキシ、C₁~₆-アルコキシ、C₁~₆-アルキル、トリフルオロメチル、O-CF₃、ハロゲン、CN、NO₂、アリール、ヘテロアリール、アミノ、C₁~₆-アミノアルキル、CONR

4 R 5、CO₂R 4、CO₂H、NHCOR 4、NR 4R 5、NHS(O)₂R 4、NC(O)NR 4R 5、NC(O)OR 4、OR 4、又はSR 4で、独立に場合によって置換されたCO-アリール(式中、R 4及びR 5は、同じでも異なっていてもよく、水素、C_{1～6}-アルキル、C_{1～6}-アルコキシ、C_{1～6}-アルキルアミノ、アリール、ヘテロ、又はヘテロアリールである。)；或いは

1種以上のメチレンジオキシ、ヒドロキシ、C_{1～6}-アルキルヒドロキシ、C_{1～6}-アルコキシ、C_{1～6}-アルキル、トリフルオロメチル、O-CF₃、ハロゲン、CN、NO₂、アリール、ヘテロアリール、アミノ、C_{1～6}-アミノアルキル、CONR 4R 5、CO₂R 4、CO₂H、NHCOR 4、NR 4R 5、NHS(O)₂R 4、NC(O)NR 4R 5、NC(O)OR 4、OR 4、又はSR 4で、独立に場合によって置換されたSO₂-アリール(式中、R 4及びR 5は、同じでも異なっていてもよく、水素、C_{1～6}-アルキル、C_{1～6}-アルコキシ、C_{1～6}-アルキルアミノ、アリール、ヘテロ、又はヘテロアリールである。)；或いは

1種以上のC_{1～6}-アルコキシ、アリール、ヘテロアリール、C_{3～8}-シクロアルキル、C_{3～8}-シクロアルキルアミン、CONR 4R 5、CO₂R 4、CO₂H、NHCOR 4、NR 4R 5、NHS(O)₂R 4、NC(O)NR 4R 5、NC(O)OR 4、OR 4、又はSR 4で、独立に場合によって置換されたC_{1～6}-アルキル(式中、R 4及びR 5は、同じでも異なっていてもよく、水素、C_{1～6}-アルキル、C_{1～6}-アルコキシ、C_{1～6}-アルキルアミノ、アリール、ヘテロ、又はヘテロアリールである。)；或いは

1種以上のC_{1～6}-アルコキシ、C_{1～6}-アルキル、C_{1～6}-アルキルアミノ、アリール、ヘテロアリール、CONR 4R 5、CO₂R 4、CO₂H、NHCOR 4、NR 4R 5、NHS(O)₂R 4、NC(O)NR 4R 5、NC(O)OR 4、OR 4、又はSR 4で、独立に場合によって置換されたC_{3～8}-シクロアルキル(式中、R 4及びR 5は、同じでも異なっていてもよく、水素、C_{1～6}-アルキル、C_{1～6}-アルコキシ、C_{1～6}-アルキルアミノ、アリール、ヘテロ、又はヘテロアリールである。)；或いは

1種以上のC_{1～6}-アルコキシ、C_{1～6}-アルキル、C_{1～6}-アルキルアミノ、アリール、ヘテロアリール、CONR 4R 5、CO₂R 4、CO₂H、NHCOR 4、NR 4R 5、NHS(O)₂R 4、NC(O)NR 4R 5、NC(O)OR 4、OR 4、又はSR 4で、独立に場合によって置換されたアルケニル(式中、R 4及びR 5は、同じでも異なっていてもよく、水素、C_{1～6}-アルキル、C_{1～6}-アルコキシ、C_{1～6}-アルキルアミノ、アリール、ヘテロ、又はヘテロアリールである。)；或いは

1種以上のC_{1～6}-アルコキシ、C_{1～6}-アルキル、C_{1～6}-アルキルアミノ、アリール、ヘテロアリール、CONR 4R 5、CO₂R 4、CO₂H、NHCOR 4、NR 4R 5、NHS(O)₂R 4、NC(O)NR 4R 5、NC(O)OR 4、OR 4、又はSR 4で、独立に場合によって置換されたアルキニル(式中、R 4及びR 5は、同じでも異なっていてもよく、水素、C_{1～6}-アルキル、C_{1～6}-アルコキシ、C_{1～6}-アルキルアミノ、アリール、ヘテロ、又はヘテロアリールである。)；或いは

1種以上のC_{1～6}-アルコキシ、C_{1～6}-アルキル、C_{1～6}-アルキルアリール、C_{1～6}-アルキルアミノ、アリール、ヘテロアリール、CONR 4R 5、CO₂R 4、CO₂H、NHCOR 4、NR 4R 5、NHS(O)₂R 4、NC(O)NR 4R 5、NC(O)OR 4、OR 4、又はSR 4で、独立に場合によって置換されたヘテロシクリル(式中、R 4及びR 5は、同じでも異なっていてもよく、水素、C_{1～6}-アルキル、C_{1～6}-アルコキシ、C_{1～6}-アルキルアミノ、アリール、ヘテロ、又はヘテロアリールである。)であり；

R 3及びR 4は、同じでも異なっていてもよく、同時に水素ではなく、

水素、或いは

1種以上のメチレンジオキシ、ヒドロキシ、C_{1～6}-アルキルヒドロキシ、C_{1～6}-アルコキシ、C_{1～6}-アルキル、アミノ、アミノC_{1～6}-アルキル、アミノC₁

~₆ - アルキルヒドロキシ、アミノC₁~₆ - アルキルアリール、アミノC₃~₈ - シクロアルキル、ハロゲン、アリール、ヘテロアリール、トリフルオロメチル、O-CF₃、CN、NO₂、CONR₄R₅、CO₂R₄、CO₂H、NHCOR₄、NR₄R₅、NHS(O)₂R₄、NC(O)NR₄R₅、NC(O)OR₄、OR₄、又はSR₄で、独立に場合によって置換されたヘテロアリール(式中、R₄及びR₅は、同じでも異なっていてもよく、水素、C₁~₆ - アルキル、C₁~₆ - アルコキシ、C₁~₆ - アルキルアミノ、アリール、ヘテロ、又はヘテロアリールである。)；或いは

1種以上のメチレンジオキシ、ヒドロキシ、C₁~₆ - アルキルヒドロキシ、C₁~₆ - アルコキシ、C₁~₆ - アルキル、アミノ、アミノC₁~₆ - アルキル、アミノC₁~₆ - アルキルアリール、アミノC₃~₈ - シクロアルキル、ハロゲン、アリール、ヘテロアリール、トリフルオロメチル、O-CF₃、CN、NO₂、CONR₄R₅、CO₂R₄、CO₂H、NHCOR₄、NR₄R₅、NHS(O)₂R₄、NC(O)NR₄R₅、NC(O)OR₄、OR₄、又はSR₄で、独立に場合によって置換されたヘテロアリール - C₁~₆ - アルキル(式中、R₄及びR₅は、同じでも異なっていてもよく、水素、C₁~₆ - アルキル、C₁~₆ - アルコキシ、C₁~₆ - アルキルアミノ、アリール、ヘテロ、又はヘテロアリールである。)；或いは

1種以上のメチレンジオキシ、ヒドロキシ、C₁~₆ - アルキルヒドロキシ、C₁~₆ - アルコキシ、C₁~₆ - アルキル、アミノ、アミノC₁~₆ - アルキル、アミノC₁~₆ - アルキルアリール、アミノC₃~₈ - シクロアルキル、ハロゲン、アリール、ヘテロアリール、トリフルオロメチル、O-CF₃、CN、NO₂、CONR₄R₅、CO₂R₄、CO₂H、NHCOR₄、NR₄R₅、NHS(O)₂R₄、NC(O)NR₄R₅、NC(O)OR₄、OR₄、又はSR₄で、独立に場合によって置換されたヘテロアリールオキシ(式中、R₄及びR₅は、同じでも異なっていてもよく、水素、C₁~₆ - アルキル、C₁~₆ - アルコキシ、C₁~₆ - アルキルアミノ、アリール、ヘテロ、又はヘテロアリールである。)；或いは

1種以上のメチレンジオキシ、ヒドロキシ、C₁~₆ - アルキルヒドロキシ、C₁~₆ - アルコキシ、C₁~₆ - アルキル、アミノ、アミノC₁~₆ - アルキル、アミノC₁~₆ - アルキルアリール、アミノC₃~₈ - シクロアルキル、ハロゲン、アリール、ヘテロアリール、トリフルオロメチル、O-CF₃、CN、NO₂、CONR₄R₅、CO₂R₄、CO₂H、NHCOR₄、NR₄R₅、NHS(O)₂R₄、NC(O)NR₄R₅、NC(O)OR₄、OR₄、又はSR₄で、独立に場合によって置換されたアリール(式中、R₄及びR₅は、同じでも異なっていてもよく、水素、C₁~₆ - アルキル、C₁~₆ - アルコキシ、C₁~₆ - アルキルアミノ、アリール、ヘテロ、又はヘテロアリールである。)；或いは

1種以上のメチレンジオキシ、ヒドロキシ、C₁~₆ - アルキルヒドロキシ、C₁~₆ - アルコキシ、C₁~₆ - アルキル、アミノ、アミノC₁~₆ - アルキル、アミノC₁~₆ - アルキルアリール、アミノC₃~₈ - シクロアルキル、ハロゲン、アリール、ヘテロアリール、トリフルオロメチル、O-CF₃、CN、NO₂、CONR₄R₅、CO₂R₄、CO₂H、NHCOR₄、NR₄R₅、NHS(O)₂R₄、NC(O)NR₄R₅、NC(O)OR₄、OR₄、又はSR₄で、独立に場合によって置換されたアリール - C₁~₆ - アルキル(式中、R₄及びR₅は、同じでも異なっていてもよく、水素、C₁~₆ - アルキル、C₁~₆ - アルコキシ、C₁~₆ - アルキルアミノ、アリール、ヘテロ、又はヘテロアリールである。)；或いは

1種以上のメチレンジオキシ、ヒドロキシ、C₁~₆ - アルキルヒドロキシ、C₁~₆ - アルコキシ、C₁~₆ - アルキル、アミノ、アミノC₁~₆ - アルキル、アミノC₁~₆ - アルキルアリール、アミノC₃~₈ - シクロアルキル、ハロゲン、アリール、ヘテロアリール、トリフルオロメチル、O-CF₃、CN、NO₂、CONR₄R₅、CO₂R₄、CO₂H、NHCOR₄、NR₄R₅、NHS(O)₂R₄、NC(O)NR₄R₅、NC(O)OR₄、OR₄、又はSR₄で、独立に場合によって置換されたアリールオキシ(式中、R₄及びR₅は、同じでも異なっていてもよく、水素、C₁~₆ - アルキ

ル、C_{1～6}-アルコキシ、C_{1～6}-アルキルアミノ、アリール、ヘテロ、又はヘテロアリールである。)；或いは

1種以上のC_{1～6}-アルコキシ、アリール、ヘテロアリール、C_{3～8}-シクロアルキル、C_{3～8}-シクロアルキルアミン、CONR₄R₅、CO₂R₄、CO₂H、NHCOR₄、NR₄R₅、NHS(O)₂R₄、NC(O)NR₄R₅、NC(O)OR₄、OR₄、又はSR₄で、独立に場合によって置換されたC_{1～6}-アルキル(式中、R₄及びR₅は、同じでも異なっていてもよく、水素、C_{1～6}-アルキル、C_{1～6}-アルコキシ、C_{1～6}-アルキルアミノ、アリール、ヘテロ、又はヘテロアリールである。)；或いは

1種以上のC_{1～6}-アルコキシ、C_{1～6}-アルキル、C_{1～6}-アルキルアミノ、アリール、ヘテロアリール、CONR₄R₅、CO₂R₄、CO₂H、NHCOR₄、NR₄R₅、NHS(O)₂R₄、NC(O)NR₄R₅、NC(O)OR₄、OR₄、又はSR₄で、独立に場合によって置換されたC_{3～8}-シクロアルキル(式中、R₄及びR₅は、同じでも異なっていてもよく、水素、C_{1～6}-アルキル、C_{1～6}-アルコキシ、C_{1～6}-アルキルアミノ、アリール、ヘテロ、又はヘテロアリールである。)；或いは

1種以上のC_{1～6}-アルコキシ、C_{1～6}-アルキル、C_{1～6}-アルキルアミノ、アリール、ヘテロアリール、CONR₄R₅、CO₂R₄、CO₂H、NHCOR₄、NR₄R₅、NHS(O)₂R₄、NC(O)NR₄R₅、NC(O)OR₄、OR₄、又はSR₄で、独立に場合によって置換されたアルケニル(式中、R₄及びR₅は、同じでも異なっていてもよく、水素、C_{1～6}-アルキル、C_{1～6}-アルコキシ、C_{1～6}-アルキルアミノ、アリール、ヘテロ、又はヘテロアリールである。)；或いは

1種以上のC_{1～6}-アルコキシ、C_{1～6}-アルキル、C_{1～6}-アルキルアミノ、アリール、ヘテロアリール、CONR₄R₅、CO₂R₄、CO₂H、NHCOR₄、NR₄R₅、NHS(O)₂R₄、NC(O)NR₄R₅、NC(O)OR₄、OR₄、又はSR₄で、独立に場合によって置換されたアルキニル(式中、R₄及びR₅は、同じでも異なっていてもよく、水素、C_{1～6}-アルキル、C_{1～6}-アルコキシ、C_{1～6}-アルキルアミノ、アリール、ヘテロ、又はヘテロアリールである。)；或いは

1種以上のC_{1～6}-アルコキシ、C_{1～6}-アルキル、C_{1～6}-アルキルアミノ、アリール、ヘテロアリール、CONR₄R₅、CO₂R₄、CO₂H、NHCOR₄、NR₄R₅、NHS(O)₂R₄、NC(O)NR₄R₅、NC(O)OR₄、OR₄、又はSR₄で、独立に場合によって置換されたヘテロシクリル(式中、R₄及びR₅は、同じでも異なっていてもよく、水素、C_{1～6}-アルキル、C_{1～6}-アルコキシ、C_{1～6}-アルキルアミノ、アリール、ヘテロ、又はヘテロアリールである。)である。)。

【請求項2】

R₁が、水素とC_{1～6}-アルキルから選択され、該C_{1～6}-アルキルが1種以上のC_{1～6}-アルコキシ、アリール、ヘテロアリール、C_{3～8}-シクロアルキル、C_{3～8}-シクロアルキルアミン、CONR₄R₅、CO₂R₄、CO₂H、NHCOR₄、NR₄R₅、NHS(O)₂R₄、NC(O)NR₄R₅、NC(O)OR₄、OR₄、又はSR₄で、独立に場合によって置換された(式中、R₄及びR₅は、同じでも異なっていてもよく、水素、C_{1～6}-アルキル、C_{1～6}-アルコキシ、C_{1～6}-アルキルアミノ、アリール、ヘテロ、又はヘテロアリールである)、請求項1記載の化合物。

【請求項3】

R₁が水素である、請求項1又は2記載の化合物。

【請求項4】

R₂が、(i)1種以上のメチレンジオキシ、ヒドロキシ、C_{1～6}-アルキルヒドロキシ、C_{1～6}-アルコキシ、C_{1～6}-アルキル、トリフルオロメチル、O-CF₃、ハロゲン、CN、NO₂、アリール、ヘテロアリール、アミノ、C_{1～6}-アミノアルキル、CONR₄R₅、CO₂R₄、CO₂H、NHCOR₄、NR₄R₅、NHS(O)₂R₄、NC(O)NR₄R₅、NC(O)OR₄、OR₄、又はSR₄で、独立に場合によ

って置換されたアリール - C_{1-6} - アルキルである、或いは(ii)1種以上の C_{1-6} - アルコキシ、 C_{1-6} - アルキル、 C_{1-6} - アルキルアミノ、アリール、ヘテロアリール、CONR₄R₅、CO₂R₄、CO₂H、NHCOR₄、NR₄R₅、NHS(O)₂R₄、NC(O)NR₄R₅、NC(O)OR₄、OR₄、又はSR₄で、独立に場合によって置換されたヘテロシクリルである(式中、R₄及びR₅は、同じでも異なっていてもよく、水素、 C_{1-6} - アルキル、 C_{1-6} - アルコキシ、 C_{1-6} - アルキルアミノ、アリール、ヘテロ、又はヘテロアリールである。)、請求項1から3のいずれか1項記載の化合物。

【請求項5】

R₂が、4-クロロベンジル、3-ヒドロキシベンジル又は4-クロロ、3-フルオロベンジルである、請求項1から4のいずれか1項記載の化合物。

【請求項6】

R₃が、水素である、或いは1種以上のメチレンジオキシ、ヒドロキシ、 C_{1-6} - アルキルヒドロキシ、 C_{1-6} - アルコキシ、 C_{1-6} - アルキル、アミノ、アミノC₁₋₆ - アルキル、アミノC₁₋₆ - アルキルヒドロキシ、アミノC₁₋₆ - アルキルアリール、アミノC₃₋₈ - シクロアルキル、ハロゲン、アリール、ヘテロアリール、トリフルオロメチル、O-CF₃、CN、NO₂、CONR₄R₅、CO₂R₄、CO₂H、NHCOR₄、NR₄R₅、NHS(O)₂R₄、NC(O)NR₄R₅、NC(O)OR₄、OR₄、又はSR₄で、独立に場合によって置換されたヘテロアリール(式中、R₄及びR₅は、同じでも異なっていてもよく、水素、 C_{1-6} - アルキル、 C_{1-6} - アルコキシ、 C_{1-6} - アルキルアミノ、アリール、ヘテロ、又はヘテロアリールである)である、請求項1から5のいずれか1項記載の化合物。

【請求項7】

R₃が、水素、4-ピリジル、4-ヒドロキシフェニル、3-ベンゾアミド、又は5-キノリンである、請求項1から6のいずれか1項記載の化合物。

【請求項8】

R₄が、水素である、或いは1種以上のメチレンジオキシ、ヒドロキシ、 C_{1-6} - アルキルヒドロキシ、 C_{1-6} - アルコキシ、 C_{1-6} - アルキル、アミノ、アミノC₁₋₆ - アルキル、アミノC₁₋₆ - アルキルヒドロキシ、アミノC₁₋₆ - アルキルアリール、アミノC₃₋₈ - シクロアルキル、ハロゲン、アリール、ヘテロアリール、トリフルオロメチル、O-CF₃、CN、NO₂、CONR₄R₅、CO₂R₄、CO₂H、NHCOR₄、NR₄R₅、NHS(O)₂R₄、NC(O)NR₄R₅、NC(O)OR₄、OR₄、又はSR₄で、独立に場合によって置換されたヘテロアリール(式中、R₄及びR₅は、同じでも異なっていてもよく、水素、 C_{1-6} - アルキル、 C_{1-6} - アルコキシ、 C_{1-6} - アルキルアミノ、アリール、ヘテロ、又はヘテロアリールである)である、請求項1から7のいずれか1項記載の化合物。

【請求項9】

R₄が水素である、請求項1から8のいずれか1項記載の化合物。

【請求項10】

X、Y=N、Z=Cであるとき、R₃が水素である、又はX=C、Y=N、Z=Cであるとき、R₄が水素である、請求項1から9のいずれか1項記載の化合物。

【請求項11】

下記化合物：

N-[3,4']ビピリジニル-5-イル-2-(4-クロロ-フェニル)-アセトアミド
(4-クロロ-3-フルオロ-ベンジル)-(3-ピリジン-4-イル-フェニル)-アミン
(4-クロロ-3-フルオロ-ベンジル)-(3'-フルオロ-[3,4']ビピリジニル-5-イル)-アミン
(2'-クロロ-[3,4']ビピリジニル-5-イル)-(4-クロロ-3-フルオロ-ベンジル)-アミン
(3'-クロロ-[3,4']ビピリジニル-5-イル)-(4-クロロ-3-フルオロ-ベンジル)-アミン
(4-クロロ-3-フルオロ-ベンジル)-(2',3'-ジクロロ-[3,4']ビピリジニル-5-イル)-アミン

ン

(4-クロロ-3-フルオロ-ベンジル)-(5-キノリン-5-イル-ピリジン-3-イル)-アミン
 (4-クロロ-3-フルオロ-ベンジル)-(2'-クロロ-3'-フルオロ-[3,4']ビピリジニル-5-イル)-アミン
 ベンジル-[3,4']ビピリジニル-5-イル-アミン
 [3,4']ビピリジニル-5-イル-(2,6-ジクロロ-ベンジル)-アミン
 [3,4']ビピリジニル-5-イル-(4-クロロ-2-トリフルオロメチル-ベンジル)-アミン
 1-[5-(4-クロロ-ベンジルアミノ)-[3,4']ビピリジニル-2'-イルアミノ]-プロパン-2-オール
 3-([3,4']ビピリジニル-5-イルアミノメチル)-ピペリジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル
 4-([3,4']ビピリジニル-5-イルアミノメチル)-ピペリジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル
 4-([3,4']ビピリジニル-5-イルアミノ)-ピペリジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル
 [3,4']ビピリジニル-5-イル-ピペリジン-3-イルメチル-アミン
 [3,4']ビピリジニル-5-イル-(3-トリフルオロメチル-ベンジル)-アミン
 [3,4']ビピリジニル-5-イル-(4-トリフルオロメチル-ベンジル)-アミン
 [3,4']ビピリジニル-5-イル-(4-クロロ-2-フルオロ-ベンジル)-アミン
 N-[3,4']ビピリジニル-5-イル-4-クロロ-ベンズアミド
 N-[3,4']ビピリジニル-5-イル-4-クロロ-ベンゼンスルホンアミド
 [3,4']ビピリジニル-5-イル-(2,4-ジフルオロ-ベンジル)-アミン
 (1-ベンジル-ピロリジン-3-イル)-[3,4']ビピリジニル-5-イル-アミン
 (1-ベンジル-ピペリジン-4-イル)-[3,4']ビピリジニル-5-イル-アミン
 [3,4']ビピリジニル-5-イル-ピペリジン-4-イルメチル-アミン
 [3,4']ビピリジニル-5-イル-ピペリジン-4-イル-アミン
 (1-ベンジル-ピペリジン-3-イルメチル)-[3,4']ビピリジニル-5-イル-アミン
 [3,4']ビピリジニル-5-イル-ピロリジン-3-イル-アミン
 (2-クロロ-[3,4']ビピリジニル-5-イル)-(4-クロロ-3-フルオロ-ベンジル)-アミン
 (4-クロロ-3-フルオロ-ベンジル)-(6-クロロ-5-キノリン-5-イル-ピリジン-3-イル)-アミン
 3-[(2-クロロ-[3,4']ビピリジニル-5-イルアミノ)-メチル]-フェノール
 3-[(6-クロロ-5-キノリン-5-イル-ピリジン-3-イルアミノ)-メチル]-フェノール
 (4-クロロ-ベンジル)-(2'-メトキシ-[3,4']ビピリジニル-5-イル)-アミン
 [3,4']ビピリジニル-5-イル-(4-クロロ-フェニル)-アミン
 5-([3,4']ビピリジニル-5-イルアミノメチル)-ベンゼン-1,3-ジオール
 [3,4']ビピリジニル-5-イル-(3,5-ジフルオロ-ベンジル)-アミン
 [3,4']ビピリジニル-5-イル-(2,3-ジフルオロ-ベンジル)-アミン
 [3,4']ビピリジニル-5-イル-(3-フルオロ-4-メチル-ベンジル)-アミン
 [3,4']ビピリジニル-5-イル-キノリン-6-イルメチル-アミン
 ベンゾフラン-5-イルメチル-[3,4']ビピリジニル-5-イル-アミン
 [3,3']ビピリジニル-5-イル-(4-クロロ-3-フルオロ-ベンジル)-アミン
 N*5*-(4-クロロ-ベンジル)-N*2**-シクロペンチル-[3,4']ビピリジニル-5,2'-ジアミン
 [3,4']ビピリジニル-5-イル-シクロプロピルメチル-アミン
 [3,4']ビピリジニル-5-イル-キノリン-7-イルメチル-アミン
 (4-クロロ-3-フルオロ-ベンジル)-(6-ピリジン-4-イル-ピラジン-2-イル)-アミン
 3-[(6-ピリジン-4-イル-ピラジン-2-イルアミノ)-メチル]-フェノール
 3-[(6-キノリン-5-イル-ピラジン-2-イルアミノ)-メチル]-フェノール
 から選択される、請求項1から10のいずれか1項記載の化合物。

【請求項12】

HBTUを、アミン、酸、及びジイソプロピルエチルアミンのTHF溶液に添加するステップと、終夜室温で攪拌するステップと、次いで後処理するステップと、所望の中間体を精製

するステップと、その後、窒素下でボロン酸のDMF溶液及びNa₂CO₃（水）溶液を所望の中間体のDMF溶液に添加するステップと、1,4-ジオキサン中酢酸パラジウム及びトリフェニルホスフィンを超音波浴中に置くステップと、パラジウム触媒を窒素下で反応混合物に添加するステップと、攪拌しながら加熱するステップと、化合物を精製するステップとを含む、請求項1から11のいずれか1項記載の化合物の製造方法。

【請求項13】

トリアセトキシ水素化ホウ素ナトリウムを、アミン及びアルデヒドの乾燥DCM溶液に添加するステップと、終夜室温で攪拌するステップと、次いで後処理するステップと、所望の中間体を精製するステップと、その後、窒素雰囲気下でボロン酸及びNaHCO₃を中間体のDME/H₂O(3:1)溶液に添加し、続いてPd(dppf)Cl₂を添加するステップと、反応物を終夜加熱するステップと、その後後処理するステップと、生成物を精製するステップとを含む、請求項1から11のいずれか1項記載の化合物の製造方法。

【請求項14】

請求項1から11のいずれか1項記載の、構造的に関係する一組の化合物を含む又はそれからなる少なくとも2種類の化合物の群。

【請求項15】

請求項12又は13記載の方法からの連続した一連のステップを含む、請求項14記載の化合物の群の製造方法。

【請求項16】

請求項1から11のいずれか1項記載の化合物の群、或いは1種以上の化合物を含むアッセイ。

【請求項17】

治療効果を有する化合物を同定するための、請求項16記載のアッセイ。

【請求項18】

請求項1から11のいずれか1項記載の化合物、請求項14記載の化合物の群、或いは請求項16又は17記載のアッセイで同定される1種以上の化合物を含む、医薬組成物。

【請求項19】

治療に使用するための、請求項1から11のいずれか1項記載の化合物、又は請求項14記載の化合物の群。

【請求項20】

異常キナーゼ活性を特徴とする症状の治療又は予防のための医薬品の製造における、請求項1から11のいずれか1項記載の化合物、又は請求項14記載の化合物の群の使用。

【請求項21】

前記症状が、循環器疾患（冠攣縮性狭心症、高血圧性疾患、動脈硬化症）、脳卒中、癌、勃起不全、喘息、骨粗鬆症、AIDS、又は線内障、加齢性黄斑変性症、涙腺疾患、若しくは糖尿病性網膜症を含めた眼症状、又は神経突起成長の抑制を要する症状ひいては神経細胞伸長及び接続を要する症状、新しい軸索成長及び軸索（再）配線の促進を含めた神経再生、外傷（例えば、脳卒中、外傷性脳損傷等）若しくは神経変性（例えば、アルツハイマー性、パーキンソン性等）によって生じるCNS中のニューロンへの損傷の修復、脊髄損傷などの障害からの修復及び治療、並びにその後のその作用の軽減、又は外傷後若しくは切断後など、例えば神経因性疼痛の治療における神経細胞損傷によって生じる疼痛から選択される、請求項20記載の使用。