

【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18年10月19日(2006.10.19)

【公表番号】特表2006-515886(P2006-515886A)

【公表日】平成18年6月8日(2006.6.8)

【年通号数】公開・登録公報2006-022

【出願番号】特願2006-501021(P2006-501021)

【国際特許分類】

C 0 7 D 239/36 (2006.01)
A 6 1 K 31/513 (2006.01)
C 0 7 D 471/04 (2006.01)
A 6 1 K 31/519 (2006.01)
A 6 1 K 45/00 (2006.01)
A 6 1 P 35/00 (2006.01)
A 6 1 P 35/02 (2006.01)
A 6 1 P 37/00 (2006.01)
A 6 1 P 31/10 (2006.01)
A 6 1 P 19/02 (2006.01)
A 6 1 P 37/06 (2006.01)
A 6 1 P 1/04 (2006.01)
A 6 1 P 41/00 (2006.01)
A 6 1 P 9/00 (2006.01)
A 6 1 P 9/04 (2006.01)
A 6 1 P 29/00 (2006.01)
A 6 1 P 43/00 (2006.01)
A 6 1 P 17/06 (2006.01)
A 6 1 P 17/02 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 239/36 C S P
A 6 1 K 31/513
C 0 7 D 471/04 1 1 7 A
A 6 1 K 31/519
A 6 1 K 45/00 1 0 1
A 6 1 P 35/00
A 6 1 P 35/02
A 6 1 P 37/00
A 6 1 P 31/10
A 6 1 P 19/02
A 6 1 P 37/06
A 6 1 P 1/04
A 6 1 P 41/00
A 6 1 P 9/00
A 6 1 P 9/04
A 6 1 P 29/00
A 6 1 P 43/00 1 1 1
A 6 1 P 43/00 1 0 5
A 6 1 P 43/00 1 2 1
A 6 1 P 17/06
A 6 1 P 17/02

【手続補正書】

【提出日】平成18年8月29日(2006.8.29)

【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

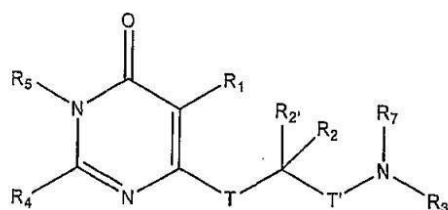
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

一般式I:

【化1】



一般式 I

[式中、

TおよびT'は独立して共有結合または置換されていてもよい低級アルキレンであり；

R₁は、水素、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいアラルキル、置換されていてもよいヘテロアリール、および置換されていてもよいヘテロアラルキルから選択され；

R₂およびR_{2'}は独立して水素、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいアラルキル、置換されていてもよいヘテロアリール、および置換されていてもよいヘテロアラルキルから選択されるか、またはR₂およびR_{2'}は共同して置換されていてもよい3から7員の環を形成し；

R₃は、水素、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいアラルキル、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいヘテロアラルキル、-C(O)-R₆、および-S(O)₂-R_{6a}から選択され；

R₄は独立して水素、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルコキシ、ヒドロキシル、ニトロ、シアノ、ジアルキルアミノ、アルキルスルホニル、アルキルスルホンアミド、アルキルチオ、カルボキシアルキル、カルボキサミド、アミノカルボニル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいアラルキル、置換されていてもよいヘテロアラルキルおよび置換されていてもよいヘテロアリールから選択され、かつ

R₅は、水素、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいアラルキル、置換されていてもよいヘテロアリール、もしくは置換されていてもよいヘテロアラルキルであるか、または

R₄はR₅と共同して置換されていてもよい5から7員の環である窒素含有ヘテロ環を形成し、該環はそのヘテロ環中にN、OおよびSから選択される1から2個の追加のヘテロ原子を組み込んでいてもよく；

R₆は、水素、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいアラルキル、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいヘテロアラルキル、R₁₁O-およびR₁₂-NH-から選択され；

R_{6a}は、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいアルキルアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアルキルヘテロアリール、およびR₁₂-NH-から選択され；

R₇は、水素、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアリール、置換さ

れていてもよいアラルキル、置換されていてもよいヘテロアリール、および置換されていてもよいヘテロアラルキルから選択されるか、

または R_7 は R_3 およびそれらが結合している窒素と共同して置換されていてもよい5から12員の窒素含有ヘテロ環を形成し、該環はそのヘテロ環中にN、OおよびSから選択される1から2個の追加のヘテロ原子を組み込んでいてもよく、

または R_7 は R_2 と共同して置換されていてもよい5から12員の窒素含有ヘテロ環を形成し、該環はそのヘテロ環中にN、OおよびSから選択される1から2個の追加のヘテロ原子を組み込んでいてもよく、

R_{11} は、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいアラルキル、置換されていてもよいヘテロアリール、および置換されていてもよいヘテロアラルキルから選択され；そして

R_{12} は、水素、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいアラルキル、置換されていてもよいヘテロアリール、および置換されていてもよいヘテロアラルキルから選択される]

で表される群から選択される化合物；

一般式Iの化合物の製薬上許容される塩；

一般式Iの化合物の製薬上許容される溶媒和物；あるいは

一般式Iの化合物の製薬上許容される塩の製薬上許容される溶媒和物。

【請求項2】

以下：

TおよびT'の一方が存在せず、かつ他方が置換されていてもよいアルキレンである；

R_1 が、置換されていてもよい低級アルキル、置換されていてもよいアリール、または置換されていてもよいアラルキルから選択される；

R_2 が置換されていてもよい C_1 - C_4 アルキルである；

R_2 が、水素または置換されていてもよい C_1 - C_4 アルキルである；

R_3 が $-C(O)R_6$ である；

R_6 が、置換されていてもよい C_1 - C_8 アルキル、置換されていてもよいアリール- C_1 - C_4 -アルキル、置換されていてもよいヘテロアリール- C_1 - C_4 -アルキル、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアリール、 $R_{11}O$ -および $R_{12}-NH$ -から選択される；

R_{11} が、置換されていてもよい C_1 - C_8 アルキルおよび置換されていてもよいアリールから選択される；

R_{12} が、水素、置換されていてもよい C_1 - C_8 アルキルおよび置換されていてもよいアリールから選択される；

R_7 が、水素、 C_1 - C_4 アルキル；シクロヘキシル；ヒドロキシル、 C_1 - C_4 アルコキシまたは C_1 - C_4 アルキルで置換されたフェニル；ベンジル；および R_{16} -アルキレン-から選択される；

R_{16} が、それぞれが置換されていてもよいヒドロキシル、カルボキシ、(C_1 - C_4 アルコキシ)カルボニル、ジ(C_1 - C_4 アルキル)アミノ、(C_1 - C_4 アルキル)アミノ、アミノ、(C_1 - C_4 アルコキシ)カルボニルアミノ、 C_1 - C_4 アルコキシ、または置換されていてもよいN-ヘテロシクリル(特に、アゼチジニル、モルホリニル、ピリジニル、インドリル、フラニル、ピロリジニル、ピペリジニルもしくはイミダゾリル)である；

R_4 が、水素、ヒドロキシル、低級アルキル(特に、メチル)、低級アルコキシ(特に、メトキシ)およびシアノから選択される；ならびに

R_5 が、水素、低級アルキル(特に、メチル)、およびアラルキル(特に、ベンジル)から選択される、

のうちの1つ以上を含む、請求項1記載の化合物。

【請求項3】

以下：

TおよびT'が存在しない；

R_1 が、エチル、プロピル、メトキシエチル、ナフチル、フェニル、プロモフェニル、ク

クロロフェニル、メトキシフェニル、エトキシフェニル、トリル、ジメチルフェニル、クロロフルオロフェニル、メチルクロロフェニル、エチルフェニル、フェネチル、ベンジル、クロロベンジル、メチルベンジル、メトキシベンジル、シアノベンジル、ヒドロキシベンジル、ジクロロベンジル、ジメトキシベンジル、ナフチルメチル、および(エトキシカルボニル)エチルから選択される；

R_2 が水素である；

R_2 が置換されていてもよい C_1 - C_4 アルキルである；

R_6 が、フェニル；以下の置換基：ハロ； C_1 - C_4 アルキル；ヒドロキシで置換された C_1 - C_4 アルキル(たとえば、ヒドロキシメチル)； C_1 - C_4 アルコキシ； C_1 - C_4 アルコキシ、ハロ、ニトロ、ホルミル、カルボキシ、シアノ、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、アシル(たとえば、アセチル)、-N-アシル(たとえば、N-アセチル)またはトリフルオロメチルで置換された C_1 - C_4 アルキル；ベンジル；フェノキシメチル；ハロフェノキシメチル；フェニルビニル；ヘテロアリール； C_1 - C_4 アルキルまたはハロで置換された C_1 - C_4 アルキル(たとえば、 CF_3)で置換されたヘテロアリール； C_1 - C_4 アルコキシで置換された C_1 - C_4 アルキル；およびベンジルオキシメチル、のうちの1つ以上で置換されたフェニルから選択される；

R_7 が、水素、メチル、エチル、プロピル、ブチル、シクロヘキシル、カルボキシエチル、カルボキシメチル、メトキシエチル、ヒドロキシエチル、ヒドロキシプロピル、ジメチルアミノエチル、ジメチルアミノプロピル、ジエチルアミノエチル、ジエチルアミノプロピル、アミノプロピル、メチルアミノプロピル、2,2-ジメチル-3-(ジメチルアミノ)プロピル、アミノエチル、アミノブチル、アミノベンチル、アミノヘキシル、イソプロピルアミノプロピル、ジイソプロピルアミノエチル、1-メチル-4-(ジエチルアミノ)ブチル、(t-Boc)アミノプロピル、ヒドロキシフェニル、ベンジル、メトキシフェニル、メチルメトキシフェニル、ジメチルフェニル、トリル、エチルフェニル、(オキソピロリジニル)プロピル、(メトキシカルボニル)エチル、ベンジルピペリジニル、ピリジニルエチル、ピリジニルメチル、モルホリニルエチル、モルホリニルプロピル、ピペリジニル、アゼチジニルメチル、アゼチジニルエチル、アゼチジニルプロピル、ピロリジニルエチル、ピロリジニルプロピル、ピペリジニルメチル、ピペリジニルエチル、イミダゾリルプロピル、イミダゾリルエチル、(エチルピロリジニル)メチル、(メチルピロリジニル)エチル、(メチルピペリジニル)プロピル、(メチルピペラジニル)プロピル、フラニルメチルおよびインドリルエチルから選択される；ならびに

R_4 が、水素、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアリール、アルコキシ、シアノ、置換アミノ、カルバミル、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリール、置換されていてもよいN-ヘテロシクリル、またはトリフルオロメチルである、

のうちの1つ以上を含む、請求項2記載の化合物。

【請求項4】

以下：

R_1 が、エチル、プロピル、メトキシエチル、ナフチル、フェネチル、ベンジル、クロロベンジル、メチルベンジル、メトキシベンジル、シアノベンジル、ヒドロキシベンジル、ジクロロベンジル、ジメトキシベンジル、ナフチルメチル、および(エトキシカルボニル)エチルから選択される；

R_2 が、メチル、エチル、プロピル、ブチル、メチルチオエチル、メチルチオメチル、アミノブチル、(CBZ)アミノブチル、シクロヘキシルメチル、ベンジルオキシメチル、メチルスルフィニルエチル、メチルスルフィニルメチル、およびヒドロキシメチルから選択される；

R_6 が、フェニル、ハロフェニル、ジハロフェニル、シアノフェニル、ハロ(トリフルオロメチル)フェニル、ヒドロキシメチル-フェニル、メトキシメチルフェニル、メトキシフェニル、エトキシフェニル、カルボキシフェニル、ホルミルフェニル、エチルフェニル、トリル、メチレンジオキシフェニル、エチレンジオキシフェニル、メトキシクロロフェニル

ル、メチルハロフェニル、トリフルオロメチルフェニル、フラニル、 C_1 - C_4 アルキル置換フラニル、トリフルオロメチルフラニル、 C_1 - C_4 アルキル置換トリフルオロメチルフラニル、ベンゾフラニル、チオフェニル、 C_1 - C_4 アルキル置換チオフェニル、ベンゾチオフェニル、ベンゾチアジアゾリル、ピリジニル、インドリル、メチルピリジニル、トリフルオロメチルピリジニル、ピロリル、キノリニル、ピコリニル、ピラゾリル、 C_1 - C_4 アルキル置換ピラゾリル、 N -メチルピラゾリル、 C_1 - C_4 アルキル置換 N -メチルピラゾリル、 C_1 - C_4 アルキル置換ピラジニル、 C_1 - C_4 アルキル置換イソキサゾリル、ベンゾイソキサゾリル、モルホリノメチル、メチルチオメチル、メトキシメチル、 N -メチルイミダゾリル、およびイミダゾリルから選択される；

R_7 が R_{16} -アルキレン-である；ならびに

R_{16} が、アミノ、 C_1 - C_4 アルキルアミノ、ジ(C_1 - C_4 アルキル)アミノ、 C_1 - C_4 アルコキシ、ヒドロキシル、または N -ヘテロシクリルである、
のうちの1つ以上を含む、請求項3記載の化合物。

【請求項5】

以下：

R_1 が、ベンジル、クロロベンジル、メチルベンジル、メトキシベンジル、シアノベンジル、またはヒドロキシベンジルである；

R_2 が、エチルまたはプロピルである；

R_6 が、置換されていてもよいフェニル(特に、トリル、ハロフェニル、メチルハロフェニル、ヒドロキシメチル-フェニル、ハロ(トリフルオロメチル)フェニル、メチレンジオキシフェニル、ホルミルフェニルまたはシアノフェニル)である；および

R_{16} がアミノである、

のうちの1つ以上を含む、請求項4記載の化合物。

【請求項6】

以下：

T および T' の一方が存在せず、かつ他方が置換されていてもよいアルキレンである；

R_1 が、置換されていてもよい低級アルキル、置換されていてもよいアリール、または置換されていてもよいアラルキルから選択される；

R_2 が置換されていてもよい C_1 - C_4 アルキルである；

R_2 が、水素または置換されていてもよい C_1 - C_4 アルキルである；

R_3 が $-C(O)R_6$ である；

R_6 が、置換されていてもよい C_1 - C_8 アルキル、置換されていてもよいアリール- C_1 - C_4 -アルキル、置換されていてもよいヘテロアリール- C_1 - C_4 -アルキル、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアリール、 $R_{11}O$ -および $R_{12}-NH$ -から選択される；

R_{11} が、置換されていてもよい C_1 - C_8 アルキルおよび置換されていてもよいアリールから選択される；

R_{12} が、水素、置換されていてもよい C_1 - C_8 アルキルおよび置換されていてもよいアリールから選択される；

R_7 が、水素、 C_1 - C_4 アルキル；シクロヘキシル；ヒドロキシル、 C_1 - C_4 アルコキシまたは C_1 - C_4 アルキルで置換されたフェニル；ベンジル；および R_{16} -アルキレン-から選択される；

R_{16} が、それぞれが置換されていてもよいヒドロキシル、カルボキシ、(C_1 - C_4 アルコキシ)カルボニル、ジ(C_1 - C_4 アルキル)アミノ、(C_1 - C_4 アルキル)アミノ、アミノ、(C_1 - C_4 アルコキシ)カルボニルアミノ、 C_1 - C_4 アルコキシ、または置換されていてもよい N -ヘテロシクリル(特に、アゼチジニル、モルホリニル、ピリジニル、インドリル、フラニル、ピロリジニル、ペリジニルもしくはイミダゾリル)である；ならびに

R_4 および R_5 が共同して置換されていてもよい5から7員の窒素含有ヘテロ環を形成し、該環はそのヘテロ環中に N 、 O 、および S から選択される1から2個の追加のヘテロ原子を組み込んでいてもよい、

のうちの1つ以上を含む、請求項1記載の化合物。

【請求項7】

以下：

TおよびT'が存在しない；

R₁が、エチル、プロピル、メトキシエチル、ナフチル、フェニル、プロモフェニル、クロロフェニル、メトキシフェニル、エトキシフェニル、トリル、ジメチルフェニル、クロロフルオロフェニル、メチルクロロフェニル、エチルフェニル、フェネチル、ベンジル、クロロベンジル、メチルベンジル、メトキシベンジル、シアノベンジル、ヒドロキシベンジル、ジクロロベンジル、ジメトキシベンジル、ナフチルメチル、および(エトキシカルボニル)エチルから選択される；

R₂が水素である；

R₂が置換されていてもよいC₁-C₄アルキルである；

R₆が、フェニル；以下の置換基：ハロ；C₁-C₄アルキル；ヒドロキシで置換されたC₁-C₄アルキル(たとえば、ヒドロキシメチル)；C₁-C₄アルコキシ；C₁-C₄アルコキシ、ハロ、ニトロ、ホルミル、カルボキシ、シアノ、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、アシル(たとえば、アセチル)、-N-アシル(たとえば、N-アセチル)またはトリフルオロメチルで置換されたC₁-C₄アルキル；ベンジル；フェノキシメチル；ハロフェノキシメチル；フェニルビニル；ヘテロアリール；C₁-C₄-アルキルまたはハロで置換されたC₁-C₄アルキル(たとえば、CF₃)で置換されたヘテロアリール；C₁-C₄アルコキシで置換されたC₁-C₄アルキル；およびベンジルオキシメチル、のうちの1つ以上で置換されたフェニルから選択される；

R₇が、水素、メチル、エチル、プロピル、ブチル、シクロヘキシル、カルボキシエチル、カルボキシメチル、メトキシエチル、ヒドロキシエチル、ヒドロキシプロピル、ジメチルアミノエチル、ジメチルアミノプロピル、ジエチルアミノエチル、ジエチルアミノプロピル、アミノエチル、アミノブチル、アミノペンチル、アミノヘキシル、イソプロピルアミノプロピル、ジイソプロピルアミノエチル、1-メチル-4-(ジエチルアミノ)ブチル、(t-Boc)アミノプロピル、ヒドロキシフェニル、ベンジル、メトキシフェニル、メチルメトキシフェニル、ジメチルフェニル、トリル、エチルフェニル、(オキソピロリジニル)プロピル、(メトキシカルボニル)エチル、ベンジルピペリジニル、ピリジニルエチル、ピリジニルメチル、モルホリニルエチル、モルホリニルプロピル、ピペリジニル、アゼチジニルメチル、アゼチジニルエチル、アゼチジニルプロピル、ピロリジニルエチル、ピロリジニルプロピル、ピペリジニルメチル、ピペリジニルエチル、イミダゾリルプロピル、イミダゾリルエチル、(エチルピロリジニル)メチル、(メチルピロリジニル)エチル、(メチルピペリジニル)プロピル、(メチルピペラジニル)プロピル、フラニルメチルおよびインドリルエチルから選択される；ならびに

R₄およびR₅が共同して置換されていてもよいピリジニル、ピリダジニル、ピリミジニル、ピラジニル、ピペリジニル、ピペラジニル、ヘキサヒドロピリミジニル、ピペラジニル、モルホリニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、ジヒドロイソキサゾリル、またはジヒドロオキサゾリル環を形成する、
のうちの1つ以上を含む、請求項6記載の化合物。

【請求項8】

以下：

TおよびT'の一方が存在せず、かつ他方が置換されていてもよいアルキレンである；

R₁が、置換されていてもよい低級アルキル、置換されていてもよいアリール、または置換されていてもよいアラルキルから選択される；

R₂が置換されていてもよいC₁-C₄アルキルである；

R₂が、水素または置換されていてもよいC₁-C₄アルキルである；

R₃がR₇およびそれらが結合している窒素と共同して置換されていてもよいイミダゾリルを形成する；ならびに

R₄が、水素、ヒドロキシル、低級アルキル、低級アルコキシおよびシアノから選択され、かつR₅が、水素、低級アルキル、およびアラルキルから選択されるか、またはR₄および

R₅が共同して置換されていてもよい5から7員の窒素含有ヘテロ環を形成し、該環はそのヘテロ環中にN、O、およびSから選択される1から2個の追加のヘテロ原子を組み込んでいてもよい、

のうちの1つ以上を含む、請求項1記載の化合物。

【請求項9】

以下：

TおよびT'の一方が存在せず、かつ他方が置換されていてもよいアルキレンである；

R₁が、置換されていてもよい低級アルキル、置換されていてもよいアリール、または置換されていてもよいアラルキルから選択される；

R₂が置換されていてもよいC₁-C₄アルキルである；

R₂が、水素または置換されていてもよいC₁-C₄アルキルである；

R₃がR₇およびそれらが結合している窒素と共同して置換されていてもよいイミダゾリニルを形成する；ならびに

R₄が、水素、ヒドロキシル、低級アルキル、低級アルコキシおよびシアノから選択され、かつR₅が、水素、低級アルキル、およびアラルキルから選択されるか、またはR₄およびR₅が共同して置換されていてもよい5から7員の窒素含有ヘテロ環を形成し、該環はそのヘテロ環中にN、O、およびSから選択される1から2個の追加のヘテロ原子を組み込んでいてもよい、

のうちの1つ以上を含む、請求項1記載の化合物。

【請求項10】

以下：

TおよびT'の一方が存在せず、かつ他方が置換されていてもよいアルキレンである；

R₁が、置換されていてもよい低級アルキル、置換されていてもよいアリール、または置換されていてもよいアラルキルから選択される；

R₂が置換されていてもよいC₁-C₄アルキルである；

R₂が、水素または置換されていてもよいC₁-C₄アルキルである；

R₃がR₇およびそれらが結合している窒素と共同して置換されていてもよいジアゼピノン形成する；ならびに

R₄が、水素、ヒドロキシル、低級アルキル、低級アルコキシおよびシアノから選択され、かつR₅が、水素、低級アルキル、およびアラルキルから選択されるか、またはR₄およびR₅が共同して置換されていてもよい5から7員の窒素含有ヘテロ環を形成し、該環はそのヘテロ環中にN、O、およびSから選択される1から2個の追加のヘテロ原子を組み込んでいてもよい、

のうちの1つ以上を含む、請求項1記載の化合物。

【請求項11】

R₁が、ベンジル、クロロベンジル、メチルベンジル、メトキシベンジル、シアノベンジル、またはヒドロキシベンジルであり；

R₂が水素であり；

R₂が置換されていてもよいC₁-C₄アルキルであり；

R₃が-C(O)R₆であり；

R₆が置換されていてもよいフェニルであり；

R₇がR₁₆-アルキレン-であり；

R₁₆が、アミノ、C₁-C₄アルキルアミノ、ジ(C₁-C₄アルキル)アミノ、C₁-C₄アルコキシ、ヒドロキシル、またはN-ヘテロシクリルであり；

R₄が、水素、ヒドロキシル、低級アルキル(特に、メチル)、低級アルコキシ(特に、メトキシ)およびシアノから選択され；そして

R₅が、水素、低級アルキル(特に、メチル)、およびアラルキル(特に、ベンジル)から選択される、

請求項1記載の化合物。

【請求項12】

R_1 が、ベンジル、クロロベンジル、メチルベンジル、メトキシベンジル、シアノベンジル、またはヒドロキシベンジルであり；

R_2 が水素であり；

R_2 が置換されていてもよい C_1 - C_4 アルキルであり；

R_3 が $-C(O)R_6$ であり；

R_6 が $R_{12}NH-$ であり；

R_{12} が、水素、 C_1 - C_4 -アルキル；シクロヘキシル；および置換されていてもよいフェニルから選択され；

R_7 が R_{16} -アルキレン-であり、

R_{16} が、アミノ、 C_1 - C_4 アルキルアミノ、ジ(C_1 - C_4 アルキル)アミノ、 C_1 - C_4 アルコキシ、ヒドロキシル、またはN-ヘテロシクリルであり；

R_4 が、水素、ヒドロキシル、低級アルキル(特に、メチル)、低級アルコキシ(特に、メトキシ)およびシアノから選択され；そして

R_5 が、水素、低級アルキル(特に、メチル)、およびアラルキル(特に、ベンジル)から選択される、

請求項1記載の化合物。

【請求項13】

R_1 が、ベンジル、クロロベンジル、メチルベンジル、メトキシベンジル、シアノベンジル、またはヒドロキシベンジルであり；

R_2 が水素であり；

R_2 が置換されていてもよい C_1 - C_4 アルキルであり；

R_3 が $-C(O)R_6$ であり；

R_6 が $R_{11}O-$ であり；

R_{11} が、置換されていてもよい C_1 - C_8 アルキルおよび置換されていてもよいアリアルから選択され；

R_7 が R_{16} -アルキレン-であり、

R_{16} が、アミノ、 C_1 - C_4 アルキルアミノ、ジ(C_1 - C_4 アルキル)アミノ、 C_1 - C_4 アルコキシ、ヒドロキシル、またはN-ヘテロシクリルであり；

R_4 が、水素、ヒドロキシル、低級アルキル(特に、メチル)、低級アルコキシ(特に、メトキシ)およびシアノから選択され；そして

R_5 が、水素、低級アルキル(特に、メチル)、およびアラルキル(特に、ベンジル)から選択される、

請求項1記載の化合物。

【請求項14】

N-(3-アミノ-プロピル)-N-[1-(5-ベンジル-2-メチル-6-オキソ-1,6-ジヒドロ-ピリミジン-4-イル)-2-メチル-プロピル]-4-メチル-ベンズアミド；

N-(3-アミノ-プロピル)-N-[1-(5-ベンジル-1,2-ジメチル-6-オキソ-1,6-ジヒドロ-ピリミジン-4-イル)-2-メチル-プロピル]-4-メチル-ベンズアミド；

N-(3-アミノ-プロピル)-N-[1-(3-ベンジル-4-オキソ-4H-ピリド[1,2-a]ピリミジン-2-イル)-2-メチル-プロピル]-4-メチル-ベンズアミド；または

N-(3-アミノ-プロピル)-N-[1-(3-ベンジル-8-クロロ-4-オキソ-4H-ピリド[1,2-a]ピリミジン-2-イル)-2-メチル-プロピル]-4-メチル-ベンズアミド

である、請求項1記載の化合物。

【請求項15】

R_2 および $R_{2'}$ が結合している立体中心がR-配置をとる、請求項1~14のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項16】

医薬品添加物と、請求項1~14のいずれか1項に記載の化合物、その塩または溶媒和物とを含む組成物。

【請求項17】

前記組成物が、一般式Iの化合物またはその製薬用の塩もしくは溶媒和物以外の化学療法剤をさらに含む、請求項16記載の組成物。

【請求項18】

前記組成物がタキサンをさらに含む、請求項17記載の組成物。

【請求項19】

前記組成物がピンカルカロイドをさらに含む、請求項17記載の組成物。

【請求項20】

前記組成物がトポイソメラーゼI阻害剤をさらに含む、請求項17記載の組成物。

【請求項21】

キネシンと、有効量の請求項1～13のいずれか1項に記載の化合物、またはその製薬上許容される塩もしくは溶媒和物とを接触させることを含む、in vitroにおいてKSPキネシン活性をモジュレートする方法。

【請求項22】

キネシンと、有効量の請求項1～13のいずれか1項に記載の化合物、またはその製薬上許容される塩もしくは溶媒和物とを接触させることを含む、in vitroにおいてKSPを阻害する方法。

【請求項23】

請求項1～13のいずれか1項に記載の化合物、またはその製薬上許容される塩もしくは溶媒和物を含む、細胞増殖性疾患を治療するための医薬組成物。

【請求項24】

請求項16～20のいずれか1項に記載の組成物を含む、細胞増殖性疾患を治療するための医薬組成物。

【請求項25】

前記疾患が、癌、過形成、再狭窄、心肥大、免疫障害、および炎症からなる群より選択される、請求項23または24記載の医薬組成物。

【請求項26】

細胞増殖性疾患を治療するための薬物の製造における、請求項1～13のいずれか1項に記載の化合物、またはその製薬上許容される塩もしくは溶媒和物の使用。

【請求項27】

KSPキネシン活性に関連する障害を治療するための薬物の製造における、請求項26に記載の化合物の使用。