

【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5月18日(2006.5.18)

【公表番号】特表2005-523312(P2005-523312A)

【公表日】平成17年8月4日(2005.8.4)

【年通号数】公開・登録公報2005-030

【出願番号】特願2003-585656(P2003-585656)

【国際特許分類】

C 0 7 D 311/22 (2006.01)
A 6 1 K 31/337 (2006.01)
A 6 1 K 31/352 (2006.01)
A 6 1 K 31/36 (2006.01)
A 6 1 K 31/381 (2006.01)
A 6 1 K 31/4025 (2006.01)
A 6 1 K 31/4155 (2006.01)
A 6 1 K 31/4178 (2006.01)
A 6 1 K 31/422 (2006.01)
A 6 1 K 31/433 (2006.01)
A 6 1 K 31/4433 (2006.01)
A 6 1 K 45/00 (2006.01)
A 6 1 P 9/00 (2006.01)
A 6 1 P 9/10 (2006.01)
A 6 1 P 29/00 (2006.01)
A 6 1 P 31/10 (2006.01)
A 6 1 P 35/00 (2006.01)
A 6 1 P 37/00 (2006.01)
A 6 1 P 43/00 (2006.01)
C 0 7 D 405/06 (2006.01)
C 0 7 D 405/12 (2006.01)
C 0 7 D 407/12 (2006.01)
C 0 7 D 409/12 (2006.01)
C 0 7 D 413/12 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 311/22
 A 6 1 K 31/337
 A 6 1 K 31/352
 A 6 1 K 31/36
 A 6 1 K 31/381
 A 6 1 K 31/4025
 A 6 1 K 31/4155
 A 6 1 K 31/4178
 A 6 1 K 31/422
 A 6 1 K 31/433
 A 6 1 K 31/4433
 A 6 1 K 45/00
 A 6 1 P 9/00
 A 6 1 P 9/10
 A 6 1 P 29/00
 A 6 1 P 31/10

A 6 1 P 35/00
 A 6 1 P 37/00
 A 6 1 P 43/00 1 0 5
 A 6 1 P 43/00 1 1 1
 A 6 1 P 43/00 1 2 1
 C 0 7 D 405/06 C S P
 C 0 7 D 405/12
 C 0 7 D 407/12
 C 0 7 D 409/12
 C 0 7 D 413/12
 C 0 7 M 7:00

【手続補正書】

【提出日】平成18年3月23日(2006.3.23)

【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

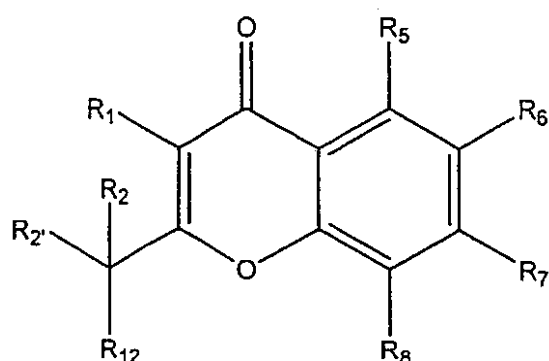
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

下記的一般式I：

【化1】



〔式中、

R_1 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；

R_2 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ルコキシ、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_2 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；

R_{12} は、置換されていてもよいイミダゾリル、置換されていてもよいイミダゾリニル、 $-NHR_4$ 、 $-N(R_4)(COR_3)$ 、 $-N(R_4)(SO_2R_{3a})$ 、および $-N(R_4)(CH_2R_{3b})$ からなる群より選択され；

R_3 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、 $R_{15}O$ -および $R_{17}-NH$ -から選択され；

R_{3a} 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、置換されていてもよいヘテロアラルキルおよび $R_{17}-NH$ -から選択され；

R_{3b} 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；

R_4 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環基、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；

R_5 、 R_6 、 R_7 および R_8 は独立して水素、アシル、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、ハロゲン、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、カルボキシアミド、アミノカルボニル、置換されていてもよいアリー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；

R_{15} 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；

R_{17} 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、または置換されていてもよいヘテロアラルキルであり、

単一の立体異性体および立体異性体の混合物を含む。]

を有する化合物；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の製薬上許容される溶媒和物；または一般式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】

R_2 または $R_{2'}$ の一方が水素である場合、他方は水素ではない、請求項 1 記載の化合物。

【請求項 3】

R_2 及び $R_{2'}$ が水素であり、 R_1 が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-、及び置換されていてもよいヘテロアラルキル-から選択されるが、 R_1 は置換フェニルではない、請求項 1 記載の化合物。

【請求項 4】

R_5 、 R_6 、 R_7 及び R_8 がそれぞれ独立して水素、アミノ、アルキルアミノ、ヒドロキシル、ハロゲン、 C_1 - C_4 アルキル、 C_1 - C_4 ハロアルキル、 C_1 - C_4 アルコキシ、 C_1 - C_4 ハロアルコキシ及びシアノから選択される、請求項 1、2 または 3 記載の化合物。

【請求項 5】

R_5 、 R_6 、 R_7 及び R_8 がそれぞれ独立して水素、シアノ、メトキシ、及びハロゲンから選択される、請求項 4 記載の化合物。

【請求項 6】

R_5 、 R_6 及び R_8 がそれぞれ水素であり、 R_7 がシアノ、メトキシまたはハロゲンである、請求項 5 記載の化合物。

【請求項 7】

R_2 が置換されていてもよい C_1 - C_4 アルキルであり、 $R_{2'}$ 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、請求項 1 または 2 記載の化合物。

【請求項 8】

$R_{2'}$ が水素であり、 R_2 が置換されていてもよい C_1 - C_4 アルキルである、請求項 7 記載の化合物。

【請求項 9】

$R_{2'}$ が水素であり、 R_2 がエチルまたはプロピルである、請求項 8 記載の化合物。

【請求項 10】

R₂がi-プロピルである、請求項9記載の化合物。

【請求項11】

R₁が水素、置換されていてもよいC₁-C₄アルキル、置換されていてもよいフェニル-C₁-C₄-アルキル-、置換されていてもよいナフタレニルメチル、置換されていてもよいフェニル、またはナフチルである、請求項1または2記載の化合物。

【請求項12】

R₁が置換されていてもよいフェニル-C₁-C₄-アルキル-または置換されていてもよいナフタレニルメチル-である、請求項11記載の化合物。

【請求項13】

R₁がナフチル、フェニル、ブロモフェニル、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、またはナフタレニルメチルである、請求項11記載の化合物。

【請求項14】

R₁がベンジル-、シアノベンジル-、メトキシベンジル-、またはナフタレニルメチルである、請求項13記載の化合物。

【請求項15】

R₁がベンジルである、請求項14記載の化合物。

【請求項16】

R₁が置換されていてもよいアリール-C₁-C₄-アルキル-または置換されていてもよいヘテロアリール-C₁-C₄-アルキル-である、請求項1または3記載の化合物。

【請求項17】

R₁が置換されていてもよいフェニル-C₁-C₄-アルキル-または置換されていてもよいナフタレニルメチルである、請求項16記載の化合物。

【請求項18】

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、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、またはナフタレニルメチルである、請求項16記載の化合物。

【請求項19】

R₁がベンジル-、シアノベンジル-、メトキシベンジル-、またはナフタレニルメチルである、請求項18記載の化合物。

【請求項20】

R₁がベンジルである、請求項19記載の化合物。

【請求項21】

R₁₂が-N(R₄)(COR₃)であり、R₃が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ラルキル-、置換されていてもよいヘテロアラルキル-、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アリール-、R₁₅O-及びR₁₇-NH-から選択され、R₁₅は置換されていてもよいアルキル及び置換されていてもよいアリールから選択され、R₁₇は水素、置換されていてもよいアルキル及び置換されていてもよいアリールから選択される、請求項1、2または3記載の化合物。

【請求項22】

R₃がフェニル；以下の置換基：ハロ、C₁-C₄アルキル、ヒドロキシルで置換されたC₁-C₄アルキル、C₁-C₄アルコキシ、C₁-C₄アルコキシで置換されたC₁-C₄アルキル、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、-N-アシル、またはトリフルオロメチルの1以上で置換されたフェニル；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；ハロで置換されたC₁-C₄アルキル若しくはC₁-C₄アルキル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アルキル及びベンジルオキシメチル-から選択される、請求項21記載の化合物。

【請求項 2 3】

R_3 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、メトキシフェニル、エトキシフェニル、カルボキシフェニル、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、ジヒドロ-ベンゾジオキシニル、メチルハロフェニル、トリフルオロメチルフェニル、ビス（トリフルオロメチル）フェニルベンジル、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、及びイミダゾリルから選択される、請求項 2 2 記載の化合物。

【請求項 2 4】

R_3 がトリル、ハロフェニル、ハロメチルフェニル、ヒドロキシメチルフェニル、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、請求項 2 3 記載の化合物。

【請求項 2 5】

R_{12} が $-N(R_4)(SO_2R_{3a})$ であり、 R_{3a} が C_1 - C_{13} アルキル；フェニル；ナフチル；ハロ、 C_1 - C_4 アルキル、 C_1 - C_4 アルコキシ、シアノ、ニトロ、メチレンジオキシ、若しくはトリフルオロメチルで置換されたフェニル；ビフェニリル；及びヘテロアリールから選択される、請求項 1、2 または 3 記載の化合物。

【請求項 2 6】

R_{3a} が、ハロ、 C_1 - C_4 アルキル-、 C_1 - C_4 アルコキシ、シアノ、ニトロ、メチレンジオキシ、またはトリフルオロメチルで置換されたフェニル、及びナフチルから選択される、請求項 2 5 記載の化合物。

【請求項 2 7】

R_{12} が $-N(R_4)(CH_2R_{3b})$ であり、 R_{3b} が C_1 - C_{13} アルキル；置換された C_1 - C_4 アルキル；フェニル；ナフチル；カルボキシ、アルコキシカルボニル、シアノ、ハロ、 C_1 - C_4 アルキル-、 C_1 - C_4 アルコキシ、ニトロ、メチレンジオキシ、若しくはトリフルオロメチルで置換されたフェニル；ビフェニリル；ベンジル；及びヘテロシクリルから選択される、請求項 1、2 または 3 記載の化合物。

【請求項 2 8】

R_{3b} が、1 以上のハロ、メチル、メトキシ、シアノ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、カルボキシ、及び／またはメトキシカルボニル基で置換されたフェニル；ピペリジニル；及びナフチルから選択される、請求項 2 7 記載の化合物。

【請求項 2 9】

R_{3b} が、ハロフェニル、ポリハロフェニル、トリル、ジメチルフェニル、メトキシフェニル、ジメトキシフェニル、シアノフェニル、トリフルオロメチルフェニル、トリフルオロメトキシフェニル、ビス（トリフルオロメチル）フェニル、カルボキシフェニル、 t -ブチルフェニル、メトキシカルボニルフェニル、ピペリジニル及びナフチルから選択される、請求項 2 8 記載の化合物。

【請求項 3 0】

R_{12} が $-N(R_4)(CH_2R_{3b})$ であり、 R_4 が水素、置換されていてもよい C_1 - C_{13} 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リール- C_1 - C_4 -アルキル-、置換されていてもよいヘテロシクリル、及び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-（好ましくは水素または置換されていてもよい C_1 - C_{13} アルキル）から選択される、請求項 1、2 または 3 記載の化合物。

【請求項 3 1】

R₄が水素；C₁-C₄アルキル；シクロヘキシル；ヒドロキシル、C₁-C₄アルコキシ若しくはC₁-C₄アルキルで置換されたフェニル；ベンジル；ヘテロアリールメチル-；ヘテロアリールエチル-；ヘテロアリールプロピル-；及びR₁₆-アルキレン-から選択され、ここでR₁₆はヒドロキシル、ジ(C₁-C₄アルキル)アミノ-、(C₁-C₄アルキル)アミノ-、アミノ、C₁-C₄アルコキシ-、またはN-ヘテロシクリル-であり、特にピロリジノ、ピペリジノまたはイミダゾリルである、請求項30記載の化合物。

【請求項32】

R₄がR₁₆-アルキレン-であり、ここでR₁₆はヒドロキシル、ジ(C₁-C₄アルキル)アミノ-、(C₁-C₄アルキル)アミノ-、アミノ、C₁-C₄アルコキシ、またはN-ヘテロシクリルである、請求項31記載の化合物。

【請求項33】

R₁₂が-NH(R₄)であり、R₄が水素、置換されていてもよいC₁-C₁₃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リール-C₁-C₄-アルキル-、置換されていてもよいヘテロシクリル、及び置換されていてもよいヘテロアリール-C₁-C₄-アルキル-（好ましくは水素または置換されていてもよいC₁-C₁₃アルキル）から選択される、請求項1、2または3記載の化合物。

【請求項34】

R₄がR₁₆-アルキレン-であり、ここでR₁₆はヒドロキシル、ジ(C₁-C₄アルキル)アミノ-、(C₁-C₄アルキル)アミノ-、アミノ、C₁-C₄アルコキシ、またはN-ヘテロシクリルである、請求項33記載の化合物。

【請求項35】

R₁₂が-N(R₄)(COR₃)であり、R₄が水素、C₁-C₄アルキル；シクロヘキシル；ヒドロキシル、C₁-C₄アルコキシ若しくはC₁-C₄アルキルで置換されたフェニル；ベンジル；ヘテロアリールメチル-；ヘテロアリールエチル-；ヘテロアリールプロピル-；及びR₁₆-アルキレン-（ここでR₁₆はヒドロキシル、ジ(C₁-C₄アルキル)アミノ-、(C₁-C₄アルキル)アミノ-、アミノ、C₁-C₄アルコキシ-、またはN-ヘテロシクリルであり、特にピロリジノ、ピペリジノまたはイミダゾリルである）から選択される、請求項1、2または3記載の化合物。

【請求項36】

R₄がR₁₆-アルキレン-であり、R₁₆がC₁-C₄アルコキシ、ニトロ、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヒドロキシル、またはN-ヘテロシクリルである、請求項35記載の化合物。

【請求項37】

R₄がR₁₆-アルキレン-であり、R₁₆がアミノである、請求項36記載の化合物。

【請求項38】

R₄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、1-シクロヘキシル-4-(ジエチルアミノ)ブチル、アミノエチル、アミノプロピル、アミノブチル、アミノペンチル、アミノヘキシル、アミノエトキシエチル、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、(オキシピロリジニル)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、フラニルメチル及びインドリルエチルから選択される、請求項36記載の化合物。

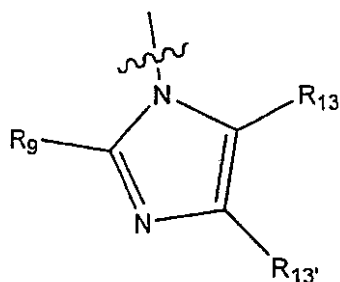
【請求項 39】

R_4 がアミノエチル-、アミノプロピル-、アミノブチル-、アミノペンチル-、アミノヘキシル-、メチルアミノエチル-、メチルアミノプロピル-、メチルアミノブチル-、メチルアミノペンチル-、メチルアミノヘキシル-、ジメチルアミノエチル-、ジメチルアミノプロピル-、ジメチルアミノブチル-、ジメチルアミノペンチル-、ジメチルアミノヘキシル-、エチルアミノエチル-、エチルアミノプロピル-、エチルアミノブチル-、エチルアミノペンチル-、エチルアミノヘキシル-、ジエチルアミノエチル-、ジエチルアミノプロピル-、ジエチルアミノブチル-、ジエチルアミノペンチル-、またはジエチルアミノヘキシルである、請求項 38 記載の化合物。

【請求項 40】

R_{12} がイミダゾールであり、 R_{12} が以下の式：

【化 2】



[式中、

R_9 は水素、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-、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アリール- C_1 - C_4 -アルコキシ、置換されていてもよいヘテロアリール- C_1 - C_4 -アルコキシ、置換されていてもよいヘテロアリールから選択され；そして

R_{13} 及び $R_{13'}$ は独立して水素、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-、または置換されていてもよいアリール- C_1 - C_4 -アルキルである。]

を有する、請求項 1、2 または 3 記載の化合物。

【請求項 41】

R_9 が C_1 - C_4 -アルキル、 C_1 - C_4 -アルコキシ-、及び／若しくはハロで置換されたフェニル；フェニル；またはベンジルである、請求項 40 記載の化合物。

【請求項 42】

R_9 がトリル、ハロフェニル、またはハロメチルフェニルである、請求項 41 記載の化合物。

【請求項 43】

R_{13} が水素であり、 $R_{13'}$ が置換 C_1 - C_4 アルキルである、請求項 40 記載の化合物。

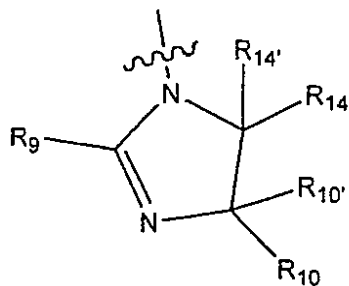
【請求項 44】

R_{13} が水素であり、 $R_{13'}$ がアミノメチル-、アミノエチル-、アミノプロピル-、アセチルアミノ-メチル-、アセチルアミノエチル-、ベンジルオキシカルボニルアミノ-メチル-またはベンジルオキシカルボニルアミノ-エチル-である、請求項 43 記載の化合物。

【請求項 45】

R_{12} がイミダゾリンであり、 R_{12} が式：

【化 3】



[式中、

R₉は水素、置換されていてもよいC₁-C₈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リール-C₁-C₄-アルキル-、及び置換されていてもよいヘテロアリールから選択され；そして

R₁₀、R_{10'}、R₁₄、及びR_{14'}は独立して水素、置換されていてもよいC₁-C₈アルキル-、置換されていてもよいアリール-、及び置換されていてもよいアリール-C₁-C₄-アルキルから選択される。]

を有する、請求項 1、2 または 3 記載の化合物。

【請求項 4 6】

R₉がメチレンジオキシフェニル；フェニル；C₁-C₄アルキル-、C₁-C₄アルコキシ-、及び／若しくはハロ-置換フェニル；またはベンジルである、請求項 4 5 記載の化合物。

【請求項 4 7】

R₉がメチレンジオキシフェニル；フェニル；トリル；メトキシフェニル；ハロフェニル；またはハロメチルフェニルである、請求項 4 6 記載の化合物。

【請求項 4 8】

R₁₀、R_{10'}、R₁₄、及びR_{14'}が独立して水素または置換されていてもよいC₁-C₄アルキルである、請求項 4 5 記載の化合物。

【請求項 4 9】

R₁₄、及びR_{14'}が水素である、請求項 4 8 記載の化合物。

【請求項 5 0】

R₁がベンジル、ハロベンジル、メトキシベンジル、シアノベンジル、またはナフタレニルメチルであり；

R₂がエチルまたはプロピルであり；

R_{2'}が水素であり；

R₅が水素であり；

R₆が水素であり；

R₇がハロ、シアノ、メトキシまたは水素であり；

R₈が水素であり；そして

R₁₂が-NR₄(COR₃)であり、ここでR₃が置換されていてもよいアリールであり、R₄がR₁₆-アルキレンであり、R₁₆がヒドロキシル、ジ(C₁-C₄)アルキルアミノ、(C₁-C₄アルキル)アミノ、アミノ、ピロリジノ、ピペリジノ、イミダゾリル及びモルホリノである、請求項 1 記載の化合物。

【請求項 5 1】

R₁がベンジル、ハロベンジル、メトキシベンジル、シアノベンジル、またはナフタレニルメチルであり；

R₂がプロピルであり；

R_{2'}が水素であり；

R₅が水素であり；

R₆が水素であり；

R₇がハロ、シアノ、メトキシまたは水素であり；

R₈が水素であり；そして

R₁₂が-NR₄(COR₃)であり、R₄がアミノプロピルであり、R₃がトリルである、

請求項50記載の化合物。

【請求項52】

R₁がベンジル、ハロベンジル、メトキシベンジル、シアノベンジル、またはナフタレニルメチルであり；

R₂がエチルまたはプロピルであり；

R₂'が水素であり；

R₅が水素であり；

R₆が水素であり；

R₇がハロ、シアノ、メトキシまたは水素であり；

R₈が水素であり；そして

R₁₂が置換されていてもよいイミダゾリニルであり、R₁₀、R₁₀'、R₁₄及びR₁₄'が独立して水素または置換されていてもよいC₁-C₄アルキルであり、R₉が置換されていてもよいフェニルである、

請求項1または2記載の化合物。

【請求項53】

R₁がベンジル、ハロベンジル、メトキシベンジル、シアノベンジル、またはナフタレニルメチルであり；

R₂がエチルまたはプロピルであり；

R₂'が水素であり；

R₅が水素であり；

R₆が水素であり；

R₇がハロ、シアノ、メトキシまたは水素であり；

R₈が水素であり；

R₁₂が置換されていてもよいイミダゾールであり、R₁₃が水素であり、R₁₃'が水素または置換されていてもよいアルキルであり、R₉が置換されていてもよいアリールである、

請求項1または2記載の化合物。

【請求項54】

R₂及びR₂'がそれぞれR-配置を有する立体中心（stereogenic center）に結合している請求項1～47のいずれか1項記載の化合物、またはその製薬上許容される塩若しくは溶媒和物。

【請求項55】

塩酸塩、リン酸塩、またはシュウ酸塩である、請求項1～48のいずれか1項記載の化合物。

【請求項56】

薬学的賦形剤、及び請求項1～47のいずれか1項記載の化合物、その塩または溶媒和物を含有する組成物。

【請求項57】

上記組成物が更に一般式Iの化合物以外の化学療法剤、または製薬上許容されるその塩若しくは溶媒和物を含有する、請求項50記載の組成物。

【請求項58】

上記組成物が更にタキサンを含有する、請求項51記載の組成物。

【請求項59】

上記組成物が更にビンカアルカロイドを含有する、請求項51記載の組成物。

【請求項60】

上記組成物が更にトポイソメラーゼI阻害剤を含有する、請求項51記載の組成物。

【請求項61】

KSPキネシン活性をモジュレートするための医薬の製造における、請求項1～55のいずれか1項記載の化合物、または製薬上許容されるその塩若しくは溶媒和物の使用。

【請求項 6 2】

KSPを阻害するための医薬の製造における、請求項 1 ～ 5 5 のいずれか 1 項記載の化合物、または製薬上許容されるその塩若しくは溶媒和物の使用。

【請求項 6 3】

細胞増殖性疾患を治療するための医薬の製造における、請求項 1 ～ 5 5 のいずれか 1 項記載の化合物、または製薬上許容されるその塩若しくは溶媒和物の使用。

【請求項 6 4】

細胞増殖性疾患の治療するための医薬の製造における、請求項 5 6 ～ 6 0 のいずれか 1 項記載の組成物の使用。

【請求項 6 5】

上記疾患が癌、過形成、再狭窄、心肥大、免疫障害、及び炎症からなる群から選択される、請求項 6 3 または 6 4 記載の使用。

【請求項 6 6】

KSPキネシン活性に関連する障害を治療するための医薬の製造における、請求項 1 ～ 5 5 のいずれか 1 項記載の化合物、または製薬上許容されるその塩若しくは溶媒和物の使用
。