

【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28年9月23日(2016.9.23)

【公開番号】特開2016-145262(P2016-145262A)

【公開日】平成28年8月12日(2016.8.12)

【年通号数】公開・登録公報2016-048

【出願番号】特願2016-101964(P2016-101964)

【国際特許分類】

C 0 7 D 473/34 (2006.01)

A 6 1 K 31/52 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/538 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 473/34 3 2 1

C 0 7 D 473/34 C S P

A 6 1 K 31/52

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 25/00

A 6 1 K 31/538

【手続補正書】

【提出日】平成28年7月22日(2016.7.22)

【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

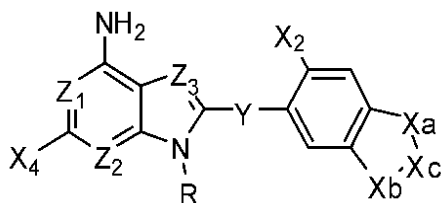
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

下記式の化合物

【化1】



[式中、

(a) Z_1 、 Z_2 及び Z_3 はそれぞれ独立して C H 又は N であり、

(b) X_a 及び X_b の一方は O であり、 X_c 並びに X_a 及び X_b の他方は - C H₂ - であり、

(c) Y は - C H₂ - 又は - S - であり、

(d) X_4 は水素又はハロゲンであり、

(e) X_2 及び R は組み合わせて、以下からなる群から選択され、すなわち

(i) X_2 はハロゲンであり、R は第1級アミノ-アルキル、第2級若しくは第3級アルキル-アミノ-アルキル、アリール-アルキル、又は非芳香族複素環-アルキルであり、但し、R はピペリジノ部分を含めないという条件であり、或いは

(i i) X_2 はアリール、アルキニル、アミノ、シクロアルキル又はシクロアルケニルであり、 R は、

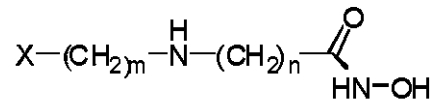
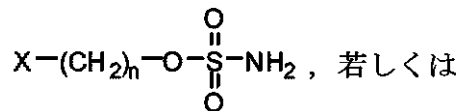
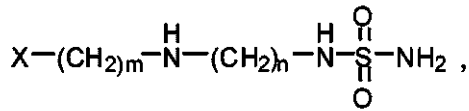
(a) 水素、

(b) 直鎖若しくは分岐鎖の C_1 から C_{10} アルキル、 C_2 から C_{10} アルケニル、又は C_2 から C_{10} アルキニル (これらの基は、非置換でも、置換されてもよい)、

(c) 第 1 級アミノアルキル、第 2 級若しくは第 3 級アルキル - アミノ - アルキル、又はトリアルキルアンモニオアルキル基 (各アルキル基は、独立して、直鎖、環式若しくは分枝であってよい)、

(d)

【化 2】



(各式中、 m は 2 ~ 3 であり、 n は 1 ~ 6 であり、 X は 9 N 結合の部位である。) である。

【請求項 2】

Z_1 、 Z_2 、及び Z_3 がそれぞれ窒素である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

Z_2 又は Z_3 が CH である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 4】

Z_1 及び Z_3 が窒素であり、 Z_2 が CH である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 5】

Z_3 が CH である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 6】

X_2 がハロゲンである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 7】

以下の群から選択される、請求項 6 に記載の化合物：

【表 1 - 1】

| 番号 | 名称 |
|-------|--|
| 1A-1 | 8-((6-ヨード-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-5-イル)チオ)-9-(3-(イソプロピルアミノ)プロピル)-9H-プリン-6-アミン |
| 1A-2 | 8-((6-ヨード-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-5-イル)チオ)-9-(2-(イソブチルアミノ)エチル)-9H-プリン-6-アミン |
| 1A-3 | 1-(6-アミノ-8-((6-ヨード-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-5-イル)チオ)-9H-プリン-9-イル)-3-(tert-ブチルアミノ)プロパン-2-オール |
| 1A-4 | 2-フルオロ-8-((6-ヨード-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-5-イル)メチル)-9-(2-(イソブチルアミノ)エチル)-9H-プリン-6-アミン |
| 1A-6 | 2-フルオロ-8-((6-ヨード-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-5-イル)メチル)-9-(3-(イソプロピルアミノ)プロピル)-9H-プリン-6-アミン |
| 1A-11 | 8-((6-ヨード-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-5-イル)チオ)-9-(2-(イソブチルアミノ)エチル)-9H-プリン-6-アミン |
| 1A-18 | 2-フルオロ-8-((6-ヨード-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-5-イル)チオ)-9-(3-(イソプロピルアミノ)プロピル)-9H-プリン-6-アミン |
| 1A-19 | 2-クロロ-8-((6-ヨード-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-5-イル)メチル)-9-(2-(イソブチルアミノ)エチル)-9H-プリン-6-アミン |
| 1A-20 | 9-(2-アミノエチル)-2-フルオロ-8-((6-ヨード-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-5-イル)メチル)-9H-プリン-6-アミン |
| 1A-21 | 9-(3-アミノプロピル)-8-((6-ヨード-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-5-イル)チオ)-9H-プリン-6-アミン |
| 1A-22 | 9-(2-アミノエチル)-8-((6-ヨード-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-5-イル)チオ)-9H-プリン-6-アミン |
| 1A-23 | 9-(3-(tert-ブチルアミノ)プロピル)-8-((6-ヨード-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-5-イル)チオ)-9H-プリン-6-アミン |
| 1A-24 | 1-(6-アミノ-8-((6-ヨード-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-5-イル)チオ)-9H-プリン-9-イル)-3-(イソプロピルアミノ)プロパン-2-オール |

【表 1 - 2】

| | |
|-------|--|
| 1A-25 | 1-(3-(6-アミノ-2-フルオロ-8-(6-ヨード-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-5-イル)メチル)-9H-プリン-9-イル)プロピル)ピロリジン-3-オン |
| 1A-26 | 1-(3-(6-アミノ-8-(6-ヨード-2, 3-(ジヒドロベンゾフラン-5-イルチオ)-9H-プリン-9-イル)プロピル)ピロリジン-3-オン |
| 1A-27 | 5-(6-アミノ-8-(6-ヨード-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-5-イルチオ)-9H-プリン-9-イル)ペンタン-1-スルホンアミド |
| 1A-28 | 1-(6-アミノ-2-フルオロ-8-(6-ヨード-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-5-イル)メチル)-9H-プリン-9-イル)-3-(イソプロピルアミノ)プロパン-2-オール |
| 1A-30 | 2-フルオロ-8-(6-ヨード-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-5-イル)メチル)-9-(2-(1-(メチルスルホニル)ピロリジン-3-イル)エチル)-9H-プリン-6-アミン |
| 1A-31 | N-(4-(6-アミノ-2-フルオロ-8-(6-ヨード-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-5-イル)メチル)-9H-プリン-9-イル)ブチル)メタンスルホンアミド |
| 1A-49 | 1-(2-(3-(6-アミノ-8-(6-ヨード-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-5-イルチオ)-9H-プリン-9-イル)プロピル)ピロリジン-1-イル)エタノン |
| 1B-1 | 8-(5-ヨード-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-6-イル)チオ)-9-(2-(イソブチルアミノ)エチル)-9H-プリン-6-アミン |
| 1B-2 | 8-(5-ヨード-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-6-イル)チオ)-9-(3-(イソプロピルアミノ)プロピル)-9H-プリン-6-アミン |
| 1B-3 | 2-フルオロ-8-(5-ヨード-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-6-イル)メチル)-9-(2-(イソブチルアミノ)エチル)-9H-プリン-6-アミン |
| 1B-4 | 2-フルオロ-8-(5-ヨード-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-6-イル)メチル)-9-(3-(イソプロピルアミノ)プロピル)-9H-プリン-6-アミン |
| 1B-5 | 2-クロロ-8-(5-ヨード-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-6-イル)メチル)-9-(3-(イソプロピルアミノ)プロピル)-9H-プリン-6-アミン |
| 1B-18 | 3-(3-(6-アミノ-8-(5-ヨード-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-6-イルチオ)-9H-プリン-9-イル)プロピル)-2-オキソイミダゾリジン-1-カルバルデヒド |
| 1B-23 | 1-(3-(6-アミノ-8-(5-ヨード-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-6-イルチオ)-9H-プリン-9-イル)プロピル)ピロリジン-3-オン |

【表 1 - 3】

| | |
|-----------|--|
| 1 B - 2 4 | 8 - ((5 - ヨード - 2 , 3 - ジヒドロベンゾフラン - 6 - イル) チオ) - 9 - (2 - (ネオペンチルアミノ) エチル) - 9 H - プリン - 6 - アミン |
| 1 B - 2 5 | 2 - フルオロ - 8 - ((5 - ヨード - 2 , 3 - ジヒドロベンゾフラン - 6 - イル) メチル) - 9 - (2 - (ネオペンチルアミノ) エチル) - 9 H - プリン - 6 - アミン |
| 1 B - 2 9 | 9 - (3 - アミノプロピル) - 8 - ((5 - ヨード - 2 , 3 - ジヒドロベンゾフラン - 6 - イル) チオ) - 9 H - プリン - 6 - アミン |
| 1 B - 3 0 | 9 - (2 - アミノエチル) - 2 - フルオロ - 8 - ((5 - ヨード - 2 , 3 - ジヒドロベンゾフラン - 6 - イル) メチル) - 9 H - プリン - 6 - アミン |
| 1 B - 3 1 | 9 - (2 - アミノエチル) - 8 - ((5 - ヨード - 2 , 3 - ジヒドロベンゾフラン - 6 - イル) チオ) - 9 H - プリン - 6 - アミン |
| 1 B - 3 2 | 9 - ((3 - (tert - ブチルアミノ) プロピル) - 8 - ((5 - ヨード - 2 , 3 - ジヒドロベンゾフラン - 6 - イル) チオ) - 9 H - プリン - 6 - アミン |
| 1 B - 3 4 | 1 - (3 - (6 - アミノ - 8 - (5 - ヨード - 2 , 3 - ジヒドロベンゾフラン - 6 - イルチオ) - 9 H - プリン - 9 - イル) プロピル) - 4 - ヒドロキシピロリジン - 2 - オン |
| 1 B - 3 5 | N - (3 - (6 - アミノ - 8 - (5 - ヨード - 2 , 3 - ジヒドロベンゾフラン - 6 - イル) チオ) - 9 H - プリン - 9 - イル) プロピル) メタンスルホンアミド |
| 1 B - 3 7 | 8 - (5 - ヨード - 2 , 3 - ジヒドロベンゾフラン - 6 - イルチオ) - 9 - (2 - (1 - (メチルスルホニル) ピロリジン - 3 - イル) エチル) - 9 H - プリン - 6 - アミン |
| 1 B - 4 9 | 1 - (6 - アミノ - 8 - ((5 - ヨード - 2 , 3 - ジヒドロベンゾフラン - 6 - イル) チオ) - 9 H - プリン - 9 - イル) - 3 - (イソプロピルアミノ) プロパン - 2 - オール |
| 1 B - 5 2 | 3 - (3 - (6 - アミノ - 8 - (5 - ヨード - 2 , 3 - ジヒドロベンゾフラン - 6 - イルチオ) - 9 H - プリン - 9 - イル) プロピル) ピロリジン - 1 - スルホンアミド |
| 1 B - 5 6 | 6 - (6 - アミノ - 8 - (5 - ヨード - 2 , 3 - ジヒドロベンゾフラン - 6 - イルチオ) - 9 H - プリン - 9 - イル) ヘキサニアミド |
| 1 B - 5 7 | 5 - (6 - アミノ - 8 - (5 - ヨード - 2 , 3 - ジヒドロベンゾフラン - 6 - イルチオ) - 9 H - プリン - 9 - イル) ペンタン - 1 - スルホンアミド |

【請求項 8】

8 - (5 - ヨード - 2 , 3 - ジヒドロベンゾフラン - 6 - イルチオ) - 9 - (2 - (イソブチルアミノ) エチル) - 9 H - プリン - 6 - アミン、8 - (5 - ヨード - 2 , 3 - ジヒドロベンゾフラン - 6 - イルチオ) - 9 - (3 - (イソプロピルアミノ) プロピル) - 9 H - プリン - 6 - アミン、8 - ((6 - ヨード - 2 , 3 - ジヒドロベンゾフラン - 5 - イル) チオ) - 9 - (3 - (イソプロピルアミノ) プロピル) - 9 H - プリン - 6 - アミン、2 - フルオロ - 8 - ((5 - ヨード - 2 , 3 - ジヒドロベンゾフラン - 6 - イル) メ

チル) - 9 - (2 - (イソブチルアミノ) エチル) - 9 H - プリン - 6 - アミン、 2 - フルオロ - 8 - ((5 - ヨード - 2 , 3 - ジヒドロベンゾフラン - 6 - イル) メチル) - 9 - (3 - (イソプロピルアミノ) プロピル) - 9 H - プリン - 6 - アミン、 8 - (5 - ヨード - 2 , 3 - ジヒドロベンゾフラン - 6 - イルチオ) - 9 - (2 - (ネオペンチルアミノ) エチル) - 9 H - プリン - 6 - アミン、 及び 2 - フルオロ - 8 - ((5 - ヨード 2 , 3 - ジヒドロベンゾフラン - 6 - イル) メチル) - 9 - (2 - (ネオペンチルアミノ) エチル) - 9 H - プリン - 6 - アミンからなる群から選択される、請求項 6 に記載の化合物

°
【請求項 9】

X₂ がアミノである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 10】

X₂ が NH₂、アルキルアミノ又はアルケニルアミノである、請求項 9 に記載の化合物

°
【請求項 11】

9 - (3 - (tert - ブチルアミノ) プロピル) - 8 - ((6 - (ジメチルアミノ) - 2 , 3 - ジヒドロベンゾフラン - 5 - イル) チオ) - 9 H - プリン - 6 - アミン、

1 - (4 - (2 - (6 - アミノ - 8 - ((6 - (ジメチルアミノ) - 2 , 3 - ジヒドロベンゾフラン - 5 - イル) チオ) - 9 H - プリン - 9 - イル) エチル) ピペリジン - 1 - イル) エタノン、

8 - ((6 - (ジメチルアミノ) - 2 , 3 - ジヒドロベンゾフラン - 5 - イル) チオ) - 9 - (2 - (1 - (メチルスルホニル) ピペリジン - 3 - イル) エチル) - 9 H - プリン - 6 - アミン、

8 - ((6 - (ジメチルアミノ) - 2 , 3 - ジヒドロベンゾフラン - 5 - イル) メチル) - 2 - フルオロ - 9 - (2 - (イソブチルアミノ) エチル) - 9 H - プリン - 6 - アミン、

8 - ((6 - (ジメチルアミノ) - 2 , 3 - ジヒドロベンゾフラン - 5 - イル) チオ) - 9 - (2 - (ネオペンチルアミノ) エチル) - 9 H - プリン - 6 - アミン、

8 - ((5 - (ジメチルアミノ) - 2 , 3 - ジヒドロベンゾフラン - 6 - イル) メチル) - 2 - フルオロ - 9 - (2 - (ネオペンチルアミノ) エチル) - 9 H - プリン - 6 - アミン、

2 - クロロ - 8 - ((5 - (ジメチルアミノ) - 2 , 3 - ジヒドロベンゾフラン - 6 - イル) メチル) - 9 - (2 - (ネオペンチルアミノ) エチル) - 9 H - プリン - 6 - アミン、 及び

9 - (3 - (tert - ブチルアミノ) プロピル) - 8 - ((5 - (ジメチルアミノ) - 2 , 3 - ジヒドロベンゾフラン - 6 - イル) チオ) - 9 H - プリン - 6 - アミンからなる群から選択される請求項 9 の化合物。

【請求項 12】

X₂ がアリールである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 13】

X₂ がヘテロアリールである、請求項 12 に記載の化合物。

【請求項 14】

X₂ がフラニルである、請求項 13 に記載の化合物。

【請求項 15】

X₂ がチオフェニルである、請求項 13 に記載の化合物。

【請求項 16】

X₂ がアルキニルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 17】

X₂ がシクロアルキルである、請求項 1 に記載の化合物。

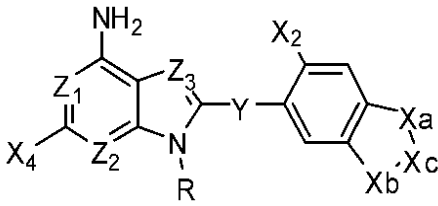
【請求項 18】

X₂ がシクロアルケニルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 19】

下記式の化合物

【化 3】



[式中、

(a) Z_1 、 Z_2 及び Z_3 はそれぞれ独立して CH 又は N であり、(b) $X_a - X_b - X_c$ は、 $CH_2 - CH_2 - CH_2$ 、 $CH = CH - CH_2$ 、又は $CH_2 - CH = CH$ であり、(c) Y は $-CH_2-$ 又は $-S-$ であり、(d) X_4 は水素又はハロゲンであり、(e) X_2 及び R は組み合わせて、以下からなる群から選択され、すなわち、(i) X_2 はハロゲンであり、R は第 1 級アミノ - アルキル、第 2 級若しくは第 3 級アルキル - アミノ - アルキル、アリール - アルキル、又は非芳香族複素環 - アルキルであり、ここで、アミンの窒素及び複素環のヘテロ原子は原子価を満たすために置換されており、但し、R はピペリジノ部分ではないという条件であり、(ii) X_2 は、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、シクロアルキル、シクロアルケニル、飽和若しくは不飽和複素環、アリール、アリールオキシ、アルコキシ、ハロゲン化アルコキシ、アルケニルオキシ、ヒドロキシアルキル、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アシルアミノ、カルバミル、アミド、ジアルキルアミド、アルキルアミド、アルキルスルホンアミド、スルホンアミド、トリハロカーボン、-チオアルキル、 SO_2 - アルキル、 $-C(=O)O$ - アルキル、 $-C(=O)$ - アルキル、OH、及びアルキル - CN からなる群から選択され、或いは X_2 及び R によって形成される環の一部であり、R は、

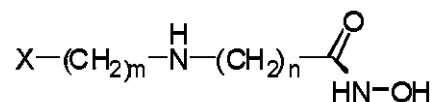
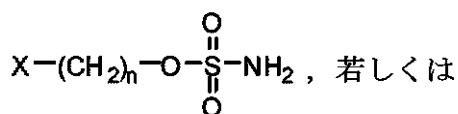
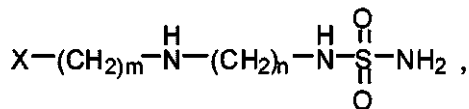
(a) 水素、

(b) 直鎖若しくは分岐鎖の C_1 から C_{10} アルキル、 C_2 から C_{10} アルケニル、又は C_2 から C_{10} アルキニル (これらの基は、非置換でも、置換されてもよい)、

(c) 第 1 級アミノアルキル、第 2 級若しくは第 3 級アルキル - アミノ - アルキル、又はトリアルキルアンモニオアルキル基 (各アルキル基は、独立して、直鎖、環式若しくは分枝であってよい)、又は

(d)

【化 4】

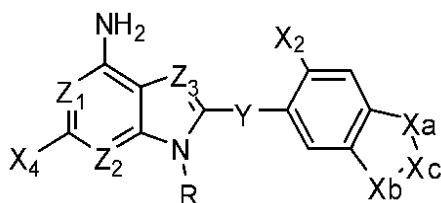


(各式中、m は 2 ~ 3 であり、n は 1 ~ 6 であり、X は 9 N 結合の部位である) である、化合物。

【請求項 20】

下記式の化合物

【化 5】



[式中、

(a) Z_1 、 Z_2 及び Z_3 はそれぞれ独立して CH 又は N であり、(b) X_a 及び X_b の一方は S 、 $C(=O)$ 、 $C(=S)$ 、 NH 又は置換若しくは非置換の N であり、 X_c 並びに X_a 及び X_b の他方は CH_2 であり、(c) Y は $-CH_2-$ 又は $-S-$ であり、(d) X_4 は水素又はハロゲンであり、(e) X_2 は、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、シクロアルキル、シクロアルケニル、飽和複素環、不飽和複素環、ハロゲン、アリールオキシ、アルコキシ、ハロゲン化アルコキシ、アルケニルオキシ、ヒドロキシアルキル、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アシルアミノ、カルバミル、アミド、アルキルアミド、ジアルキルアミド、スルホンアミド、アルキルスルホンアミド、トリハロカーボン、 $-チオアルキル$ 、 $-SO_2-$ アルキル、 $-C(=O)O-$ アルキル、 $-C(=O)$ アルキル、 OH 、 NO_2 、 CN 、及びアルキル- CN からなる群から選択されるか、或いは X_2 及び R によって形成される環の一部であり、(f) R は、

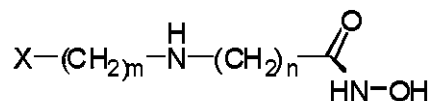
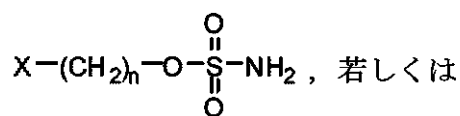
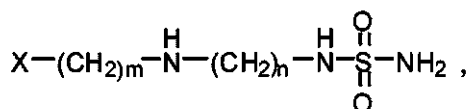
(a) 水素、

(b) 直鎖若しくは分岐鎖の C_1 から C_{10} アルキル、 C_2 から C_{10} アルケニル、又は C_2 から C_{10} アルキニル (これらの基は、非置換でも、置換されてもよい)、

(c) 第 1 級アミノアルキル、第 2 級若しくは第 3 級アルキル-アミノ-アルキル、又はトリアルキルアンモニオアルキル基 (各アルキル基は、独立して、直鎖、環式若しくは分枝であってよい)、又は

(d)

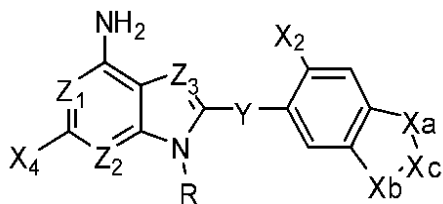
【化 6】

(各式中、 m は 2 ~ 3 であり、 n は 1 ~ 6 であり、 X は 9 N 結合の部位である) である。]。

【請求項 21】

下記式の化合物

【化7】



[式中、

(a) Z_1 、 Z_2 及び Z_3 はそれぞれ独立して CH 又は N であり、(b) $X_a - X_b - X_c$ は、CH = CH - O、CH = CH - NH、CH = CH - S、O - CH = CH、NH - CH = CH、S - CH = CH、N = CH - O、N = CH - S、NH - CH = N、O - CH = N、S - CH = N、N = N - O、N = N - S、N = N - CH₂、O - N = N、NH - N = N、S - N = N、又は CH₂ - N = N であり、(c) Y は - CH₂ - 又は - S - であり、(d) X_4 は水素又はハロゲンであり、(e) X_2 は、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、シクロアルキル、シクロアルケニル、飽和若しくは不飽和複素環、ハロゲン、アリーロキシ、アルコキシ、ハロゲン化アルコキシ、アルケニルオキシ、ヒドロキシアルキル、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アシルアミノ、カルバミル、アミド、アルキルアミド、ジアルキルアミド、スルホンアミド、アルキルスルホンアミド、トリハロカーボン、-チオアルキル、SO₂-アルキル、-C(=O)O-アルキル、-C(=O)-アルキル、-OH、-NO₂、-CN 及びアルキル-CN からなる群から選択されるか、或いは X_2 及び R によって形成される環の一部であり、R は、

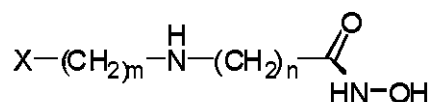
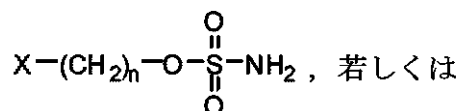
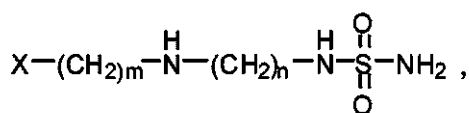
(a) 水素、

(b) 直鎖若しくは分岐鎖の C₁ から C₁₀ アルキル、C₂ から C₁₀ アルケニル、又は C₂ から C₁₀ アルキニル (これらの基は、非置換でも、置換されてもよい)、

(c) 第 1 級アミノアルキル、第 2 級若しくは第 3 級アルキル-アミノ-アルキル、又はトリアルキルアンモニオアルキル基 (各アルキル基は、独立して、直鎖、環式若しくは分枝であってよい)、又は

(d)

【化8】

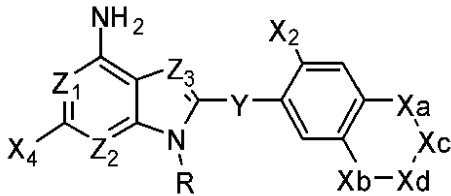


(各式中、mは2～3であり、nは1～6であり、Xは9N結合の部位である)である、化合物。

【請求項22】

下記式の化合物

【化 9】



[式中、(a) Z_1 、 Z_2 及び Z_3 はそれぞれ独立して CH 又は N であり、

(b) X_a 及び X_b は O であり、 X_c 及び X_d は CH_2 であり、

(c) Y は $-CH_2-$ 、 $-O-$ 又は $-S-$ であり、

(d) X_4 は水素又はハロゲンであり、

(e) X_2 及び R は、以下から選択される組合せであり、すなわち、

(i) X_2 はハロゲン又はシアノであり、R は第 1 級アミノアルキル、第 2 級若しくは第 3 級アルキル - アミノ - アルキル、トリアルキルアンモニオアルキル基、アリール - アルキル、又は非芳香族複素環 - アルキルであり、但し、R はピペリジノ部分を含めないという条件であり、或いは

(ii) X_2 は、アリール、アルキニル、シクロアルキル及びシクロアルケニルからなる群から選択され、R は、

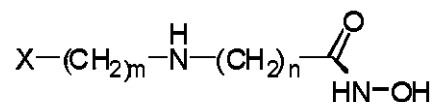
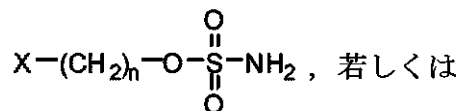
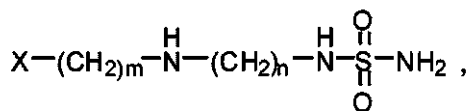
(a) 水素、

(b) 直鎖若しくは分岐鎖の C_1 から C_{10} アルキル、 C_2 から C_{10} アルケニル、又は C_2 から C_{10} アルキニル (これらの基は、非置換でも、置換されてもよい)、

(c) 第 1 級アミノアルキル、第 2 級若しくは第 3 級アルキル - アミノ - アルキル、又はトリアルキルアンモニオアルキル基 (各アルキル基は、独立して、直鎖、環式若しくは分枝であってよい)、又は

(d)

【化 10】

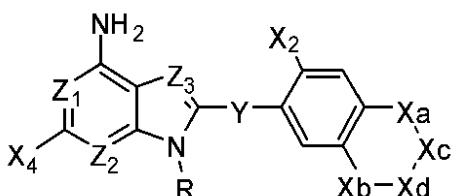


(各式中、 m は 2 ~ 3 であり、 n は 1 ~ 6 であり、 X は 9 N 結合の部位である) である。

【請求項 23】

下記式の化合物

【化 11】



[式中、

(a) Z_1 、 Z_2 及び Z_3 はそれぞれ独立して CH 又は N であり、

(b) X_a 、 X_c 、 X_d 及び X_b は全て、単結合又は二重結合によって連結されている炭素であり、

(c) Y は $-CH_2-$ 、 $-O-$ 又は $-S-$ であり、

(d) X_4 は水素又はハロゲンであり、

(e) X_2 は、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、シクロアルキル、シクロアルケニル、飽和複素環、不飽和複素環、ハロゲン、アリールオキシ、アルコキシ、ハロゲン化アルコキシ、アルケニルオキシ、ヒドロキシアルキル、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アシルアミノ、カルバミル、アミド、アルキルアミド、ジアルキルアミド、スルホンアミド、アルキルスルホンアミド、トリハロカーボン、-チオアルキル、-SO₂-アルキル、-C(=O)O-アルキル、-C(=O)アルキル、 OH 、 NO_2 、 CN 、又はアルキル- CN からなる群から選択され、

(f) R は、

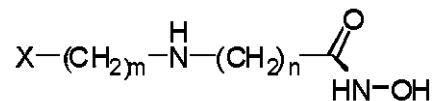
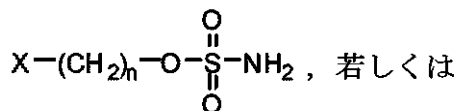
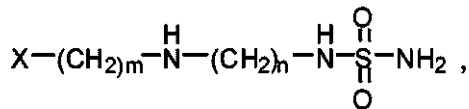
(a) 水素、

(b) 直鎖若しくは分岐鎖の C_1 から C_{10} アルキル、 C_2 から C_{10} アルケニル、又は C_2 から C_{10} アルキニル (これらの基は、非置換でも、置換されてもよい)、

(c) 第 1 級アミノアルキル、第 2 級若しくは第 3 級アルキル-アミノ-アルキル、又はトリアルキルアンモニオアルキル基 (各アルキル基は、独立して、直鎖、環式若しくは分枝であってよい)、又は

(d)

【化 1 2】



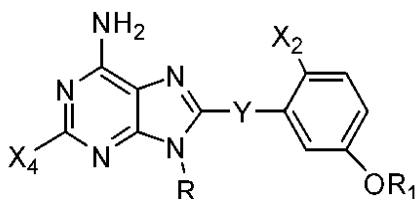
(各式中、 m は 2 ~ 3 であり、 n は 1 ~ 6 であり、 X は $9N$ 結合の部位である) である。

】。

【請求項 2 4】

下記式の化合物

【化 1 3】



[式中、

(a) R_1 はアルキルであり、

(b) Y は S 又は CH_2 であり、

(c) X_4 は H 又はハロゲンであり、

(d) X_2 は飽和若しくは不飽和の非芳香族炭素環若しくは複素環、アリール、アルキ

ルアミノ、ジアルキルアミノ、又はアルキニルであるか、或いは X_2 及びRによって形成される環の一部であり、

(e) Rは水素、アルキル、アルケニル又はアルキニルであり、直鎖、分枝又は環式であり、任意選択によりN、S又はOを含み、任意選択により X_2 及びRによって形成される8員環から10員環の一部である。】。

【請求項25】

Rが、第2級若しくは第3級アルキル-アミノ-アルキルである、請求項1から24までのいずれか一項に記載の化合物。

【請求項26】

2-(メチル, t-ブチル-アミノ)エチル、2-(メチル, イソプロピルアミノ)エチル、3-(ネオペンチルアミノ)プロピル、2-(イソブチル-アミノ)エチル、2-(エチル, イソプロピルアミノ)エチル、3-(イソプロピルアミノ)プロピル、3-(t-ブチル-アミノ)プロピル、2-(イソプロピルアミノ)エチル、2-(ヒドロキシエチル, イソプロピルアミノ)エチル、3-(シクロペンチルアミノ)-プロピル、3-(シクロペンチル, メチルアミノ)プロピル、3-(エチルアミノ)プロピル、3-(エチル, メチルアミノ)プロピル、2-(ネオペンチルアミノ)エチル、3-(メチル, イソプロピルアミノ)プロピル、3-(エチル, イソプロピルアミノ)プロピル、3-(ヒドロキシエチル, イソプロピルアミノ)プロピル、3-(メチル, プロパルギルアミノ)プロピル、2-(メチル, プロパルギルアミノ)エチル、3-(アリル, メチルアミノ)プロピル、3-(プロピル, シクロプロピルメチルアミノ)プロパン、3-(ヒドロキシエチル, シクロヘキシルアミノ)プロピル、2-(シクロプロピルメチルアミノ)エチル、及び2-(メチル, イソブチルアミノ)エチルからなる群から選択される、請求項25に記載の化合物。

【請求項27】

Rが、3-(イソプロピルアミノ)プロピル、2-(イソブチルアミノ)エチル、又は2-(ネオペンチルアミノ)エチルである、請求項25に記載の化合物。

【請求項28】

YがSであり、 X_4 がHであり、 X_2 が、アセチレニル、2-フラニル、3-フラニル、5-メチル-2-フラニル、2-ピラゾリル、3-ピラゾリル、2-チアゾリル、5-メチル-2-チアゾリル、2-オキサゾリル、5-メチル-2-オキサゾリル、又は任意選択で置換されたイミダゾールである、請求項26又は27に記載の化合物。

【請求項29】

YがSであり、 X_4 がHであり、 X_2 が、アセチレニル、2-フラニル、3-フラニル、5-メチル-2-フラニル、2-ピラゾリル、3-ピラゾリル、2-チアゾリル、5-メチル-2-チアゾリル、2-オキサゾリル、又は5-メチル-2-オキサゾリルである、請求項26又は27に記載の化合物。

【請求項30】

hsp90を阻害するための医薬組成物の製剤化における、請求項1から29までのいずれか一項に記載の化合物の使用。

【請求項31】

癌又は神経変性疾患を治療するための医薬組成物の製剤化における、請求項1から29までのいずれか一項に記載の化合物の使用。

【請求項32】

請求項1から29までのいずれか一項に記載の化合物を含む、医薬組成物。

【請求項33】

請求項1から29までのいずれか一項に記載の化合物を含む、hsp90を阻害するための医薬組成物。

【請求項34】

請求項1から29までのいずれか一項に記載の化合物を含む、癌又は神経変性疾患を治療するための医薬組成物。

