

【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27年5月21日(2015.5.21)

【公表番号】特表2014-510148(P2014-510148A)

【公表日】平成26年4月24日(2014.4.24)

【年通号数】公開・登録公報2014-021

【出願番号】特願2014-503994(P2014-503994)

【国際特許分類】

C 07 D 473/24 (2006.01)

A 61 P 25/00 (2006.01)

A 61 P 35/00 (2006.01)

A 61 K 31/52 (2006.01)

C 07 D 473/34 (2006.01)

【F I】

C 07 D 473/24 C S P

A 61 P 25/00

A 61 P 35/00

A 61 K 31/52

C 07 D 473/34 3 2 1

【手続補正書】

【提出日】平成27年4月2日(2015.4.2)

【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

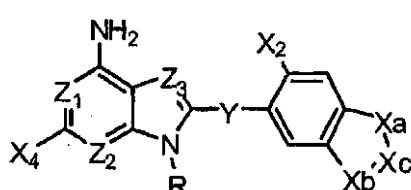
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

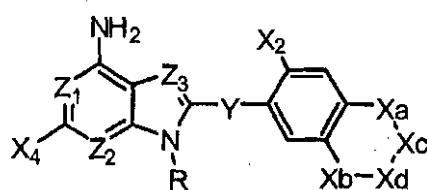
【請求項1】

式(I A)または(I B)：

【化48】



(IA)



(IB)

(式中、

(a) Z<sub>1</sub>、Z<sub>2</sub>、およびZ<sub>3</sub>の各々は、Nであり；

(b) Yは、CH<sub>2</sub>、O、またはSであり；

(c) X<sub>a</sub>、X<sub>b</sub>、X<sub>c</sub>、およびX<sub>d</sub>は、独立して、原子価を満足するように選択されるCH、CH<sub>2</sub>、O、N、NH、S、カルボニル、フルオロメチレン、およびジフルオロメチレンから選択され、ここでX基への各結合は、単結合または二重結合のいずれかであり；

(d) X<sub>2</sub>は、ハロゲン、アリール、アルキニル、またはアミノであり；

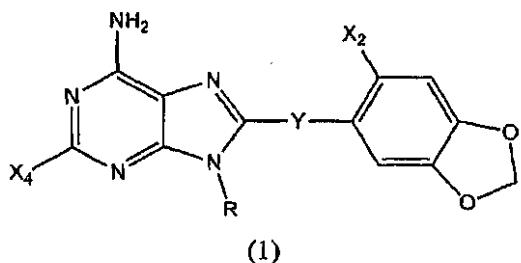
(e) X<sub>4</sub>は、水素またはハロゲンであり；そして

(f) R は、直鎖もしくは分枝鎖の置換もしくは非置換のアルキル、直鎖もしくは分枝鎖の置換もしくは非置換のアルケニル、直鎖もしくは分枝鎖の置換もしくは非置換のアルキニル、または置換もしくは非置換のシクロアルキルであり、ここで R 基は、1つ以上の -S( O )N( R<sub>A</sub>) - 、 -N R<sub>A</sub>S( O ) - 、 -SO<sub>2</sub>N( R<sub>A</sub>) - 、 -N R<sub>A</sub>SO<sub>2</sub> - 、 -C( O )N( R<sub>A</sub>) - 、 もしくは -N R<sub>A</sub>C( O ) - 基によって中断され、および/または -S( O )N R<sub>A</sub>R<sub>B</sub> 、 -N R<sub>A</sub>S( O )R<sub>B</sub> 、 -SO<sub>2</sub>N R<sub>A</sub>R<sub>B</sub> 、 -N R<sub>A</sub>SO<sub>2</sub>R<sub>B</sub> 、 -C( O )N R<sub>A</sub>R<sub>B</sub> 、 もしくは -N R<sub>A</sub>C( O )R<sub>B</sub> 基によって終端し、ここで各 R<sub>A</sub> および R<sub>B</sub> は、独立して、水素、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルケニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキニル、シクロアルキル、ヘテロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アルキルアリール、アリールアルキル、アルキルヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、およびアルキルヘテロアリールアルキルから選択される)の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩。

## 【請求項 2】

式(1)：

## 【化49】

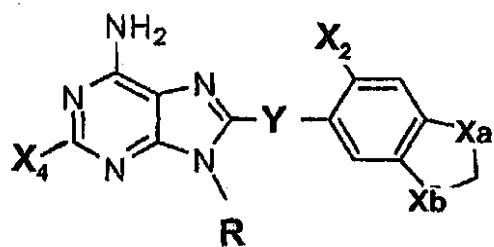
(式中、Y は、CH<sub>2</sub> または S である)

の化合物である、請求項 1 に記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩。

## 【請求項 3】

式(2)：

## 【化50】



(2)

(式中、

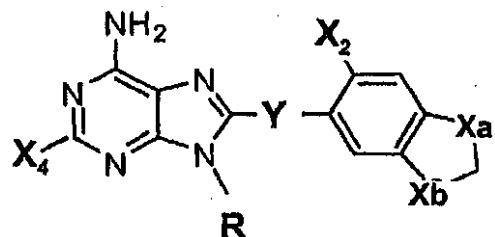
Xa および Xb のうちの 1 つは、O であり、他方は、CH<sub>2</sub> であり；そして  
Y は、CH<sub>2</sub>、または S である)

の化合物である、請求項 1 に記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩。

## 【請求項 4】

式(3)：

## 【化51】



(3)

(式中、

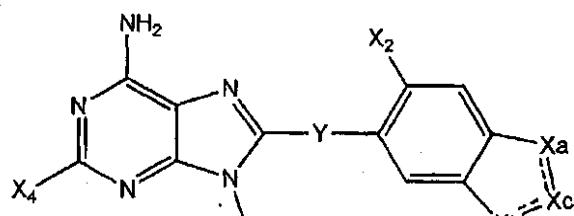
X<sub>a</sub> および X<sub>b</sub> のうちの 1 つは、 C (= O) であり、他方は、 C H<sub>2</sub> であり；そして Y は、 C H<sub>2</sub> 、または S である )

の化合物である、請求項 1 に記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩。

## 【請求項 5】

式(4)：

## 【化52】



(4)

(式中、

X<sub>a</sub> - X<sub>c</sub> - X<sub>b</sub> は、 C H<sub>2</sub> - C H<sub>2</sub> - C H<sub>2</sub> 、 C H = C H - C H<sub>2</sub> 、または C H<sub>2</sub> - C H = C H であり；そして

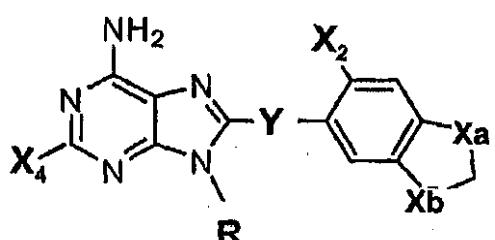
Y は、 C H<sub>2</sub> 、または S である )

の化合物である、請求項 1 に記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩。

## 【請求項 6】

式(5)：

## 【化53】



(5)

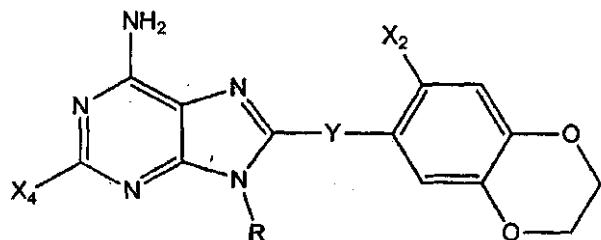
(式中、 X<sub>a</sub> および X<sub>b</sub> のうちの少なくとも 1 つは、 C H F または C F<sub>2</sub> であり、他方は、 C H F 、 C F<sub>2</sub> 、または C H<sub>2</sub> である )

の化合物である、請求項 1 に記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩。

## 【請求項 7】

式(6)：

## 【化54】



の化合物である、請求項1に記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩。

## 【請求項 8】

Rは、1つ以上の-S(O)N(R<sub>A</sub>)-、-NR<sub>A</sub>S(O)-、-SO<sub>2</sub>N(R<sub>A</sub>)-、-NR<sub>A</sub>SO<sub>2</sub>-、-C(O)N(R<sub>A</sub>)-、または-NR<sub>A</sub>C(O)-基によって中断される、請求項1～7のうちのいずれかに記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩。

## 【請求項 9】

Rは、-S(O)NR<sub>A</sub>R<sub>B</sub>、-NR<sub>A</sub>S(O)R<sub>B</sub>、-SO<sub>2</sub>NR<sub>A</sub>R<sub>B</sub>、-NR<sub>A</sub>SO<sub>2</sub>R<sub>B</sub>、-C(O)NR<sub>A</sub>R<sub>B</sub>、または-NR<sub>A</sub>C(O)R<sub>B</sub>基によって終端する、請求項1～8のうちのいずれかに記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩。

## 【請求項 10】

Rは、2-エタンスルホン酸イソプロピルアミド、2-エタンスルホン酸エチルアミド、2-エタンスルホン酸メチルアミド、2-エタンスルホン酸アミド、2-エタンスルホン酸t-ブチルアミド、2-エタンスルホン酸イソブチルアミド、2-エタンスルホン酸シクロプロピルアミド、イソプロパンスルホン酸2-エチルアミド、エタンスルホン酸2-エチルアミド、N-2エチルメタンスルホンアミド、2-メチル-プロパン-2-スルホン酸2-エチルアミド、2-メチル-プロパン-2-スルフィン酸2-エチルアミド、2-メチル-プロパン-1-スルホン酸2-エチルアミド、シクロプロパンスルホン酸2-エチルアミド、3-プロパン-1-スルホン酸イソプロピルアミド、3-プロパン-1-スルホン酸メチルアミド、3-プロパン-1-スルホン酸アミド、3-プロパン-1-スルホン酸t-ブチルアミド、3-プロパン-1-スルホン酸イソブチルアミド、3-プロパン-1-スルホン酸シクロプロピルアミド、プロパン-2-スルホン酸3-プロピルアミド、エタンスルホン酸3-プロピルアミド、N-3-プロピルメタンスルホンアミド、2-メチル-プロパン-2-スルホン酸3-プロピルアミド、2-メチル-プロパン-2-スルフィン酸3-プロピルアミド、2-メチル-プロパン-1-スルホン酸3-プロピルアミド、シクロプロパンスルホン酸3-プロピルアミド、3-N-イソプロピルプロピオンアミド、3-N-エチルプロピオンアミド、3-N-メチルプロピオンアミド、3-プロピオンアミド、3-N-t-ブチルプロピオンアミド、3-N-イソブチルプロピオンアミド、3-N-シクロプロピルプロピオンアミド、N-2-エチルイソブチルアミド、N-2-エチルプロピオンアミド、N-2-エチルアセトアミド、N-2-エチルホルムアミド、N-2-エチル2,2-ジメチル-プロピオンアミド、N-2-エチル3-メチルブチルアミド、またはシクロプロパンカルボン酸2-エチル-アミドである、請求項1～7のうちのいずれか1項に記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩。

## 【請求項 11】

Rは、シクロプロパンカルボン酸3-プロピル-アミド、N-3-プロピル2,2-ジメチル-プロピオンアミド、N-プロピル-2-メチル-プロパン-2-スルフィンアミド、t-ブタンスルホン酸3-プロピルアミド、またはシクロプロパンスルホン酸3-プロ

ロピルアミドである、請求項 1～7 のうちのいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩。

【請求項 1 2】

X<sub>4</sub> は、H または F である、請求項 1～11 のうちのいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩。

【請求項 1 3】

Y は S である、請求項 1～12 のうちのいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩。

【請求項 1 4】

Y は CH<sub>2</sub> である、請求項 1～12 のうちのいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩。

【請求項 1 5】

X<sub>2</sub> は、必要に応じて置換されたヘテロアリールである、請求項 1～14 のうちのいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩。

【請求項 1 6】

X<sub>2</sub> は、フラン-2-イル、フラン-3-イル、5-メチルフラン-2-イル、1H-ピラゾール-2-イル、1H-ピラゾール-3-イル、チアゾール-2-イル、5-メチルチアゾール-2-イル、オキサゾール-2-イル、または 5-メチルオキサゾール-2-イルである、請求項 15 に記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩。

【請求項 1 7】

X<sub>2</sub> は、アルキニルである、請求項 1～14 のうちのいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩。

【請求項 1 8】

X<sub>2</sub> は、エチニルである、請求項 17 に記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩。

【請求項 1 9】

X<sub>2</sub> は、ハロである、請求項 1～14 のうちのいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩。

【請求項 2 0】

X<sub>2</sub> は、I である、請求項 19 に記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩。

【請求項 2 1】

X<sub>2</sub> は、アミノである、請求項 1～14 のうちのいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩。

【請求項 2 2】

X<sub>2</sub> は、ジメチルアミノである、請求項 21 に記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩。

【請求項 2 3】

請求項 1～22 のうちの 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩、および薬学的に受容可能なキャリアを含む薬学的組成物。

【請求項 2 4】

がん、または神経変性障害を、処置または予防するための組成物であって、治療上有効な量の、請求項 1～22 のうちの 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩を含む、組成物。

【請求項 2 5】

がん、または神経変性障害の処置または予防のための薬学的組成物を製剤化することにおける、請求項 1～22 のうちの 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩の使用。

【請求項 2 6】

Hsp90 を阻害するための組成物であって、Hsp90 の機能を阻害する量の、請求項 1～22 のうちの 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩を含む、組成

物。

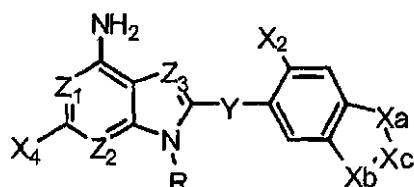
【請求項 27】

Hsp90の阻害のための薬学的組成物を製剤化することにおける、請求項1～22のうちの1項に記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩の使用。

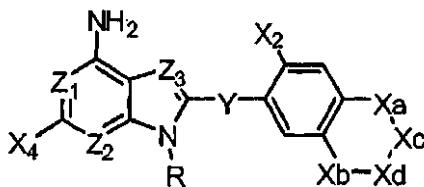
【請求項 28】

式(IA)または(IB)：

【化55】



(IA)



(IB)

(式中、

- (a)  $Z_1$ 、 $Z_2$ 、および $Z_3$ の各々は、独立してCHまたはNであり；
- (b) Yは、CH<sub>2</sub>、O、またはSであり；
- (c) Xa、Xb、Xc、およびXdは、独立して、原子価を満足するように選択されるCH、CH<sub>2</sub>、O、N、NH、S、カルボニル、フルオロメチレン、およびジフルオロメチレンから選択され、ここでX基への各結合は、単結合または二重結合のいずれかであり；
- (d) X<sub>2</sub>は、放射標識された原子の、構造への導入のための脱離基であり；
- (e) X<sub>4</sub>は、水素またはハロゲンであり；そして
- (f) Rは、直鎖もしくは分枝鎖の置換もしくは非置換のアルキル、直鎖もしくは分枝鎖の置換もしくは非置換のアルケニル、直鎖もしくは分枝鎖の置換もしくは非置換のアルキニル、または置換もしくは非置換のシクロアルキルであり、ここでR基は、1つ以上の-S(O)N(R<sub>A</sub>)<sub>2</sub>、-NR<sub>A</sub>S(O)<sub>2</sub>、-SO<sub>2</sub>N(R<sub>A</sub>)<sub>2</sub>、-NR<sub>A</sub>SO<sub>2</sub><sub>2</sub>、-C(O)N(R<sub>A</sub>)<sub>2</sub>、もしくは-NR<sub>A</sub>C(O)R基によって中断され、および/または-S(O)NR<sub>A</sub>R<sub>B</sub>、-R<sub>A</sub>S(O)R<sub>B</sub>、-SO<sub>2</sub>NR<sub>A</sub>R<sub>B</sub>、-NR<sub>A</sub>SO<sub>2</sub>R<sub>B</sub>、-C(O)NR<sub>A</sub>R<sub>B</sub>、もしくは-NR<sub>A</sub>C(O)R<sub>B</sub>基によって終端し、ここで各R<sub>A</sub>およびR<sub>B</sub>は、独立して、水素、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルキニル、シクロアルキル、ヘテロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アルキルアリール、アリールアルキル、アルキルヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、およびアルキルヘテロアリールアルキルから選択される)の化合物、またはその塩。

【請求項 29】

X<sub>2</sub>は、トリアルキルスズまたは-Sn(CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>(CF<sub>2</sub>)<sub>5</sub>CF<sub>3</sub>)<sub>3</sub>である、請求項28に記載の化合物、またはその塩。

【請求項 30】

放射標識された化合物の形成のための前駆体としての、請求項28または29に記載の化合物、またはその塩の使用。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

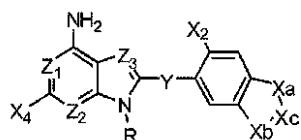
【補正対象項目名】0013

【補正方法】変更

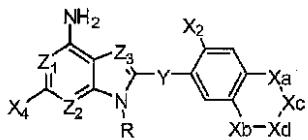
【補正の内容】

【0013】

【化2】



(IA)



(IB)

(式中、

(a)  $Z_1$ 、 $Z_2$ 、および $Z_3$ の各々は、独立してCHまたはNであり；  
 (b) Yは、CH<sub>2</sub>、O、またはSであり；  
 (c) Xa、Xb、Xc、およびXdは、独立して、原子価を満足するように選択されるCH、CH<sub>2</sub>、O、N、NH、S、カルボニル、フルオロメチレン、およびジフルオロメチレンから選択され、ここでX基への各結合は、単結合または二重結合のいずれかであり；

(d) X<sub>2</sub>は、ハロゲン、アリール、アルキニル、またはアミノであり；

(e) X<sub>4</sub>は、水素またはハロゲンであり；そして

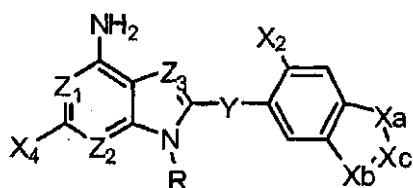
(f) Rは、直鎖もしくは分枝鎖の置換もしくは非置換のアルキル、直鎖もしくは分枝鎖の置換もしくは非置換のアルケニル、直鎖もしくは分枝鎖の置換もしくは非置換のアルキニル、または置換もしくは非置換のシクロアルキルであり、ここでR基は、-S(O)N(R<sub>A</sub>)<sub>2</sub>、-NR<sub>A</sub>S(O)<sub>2</sub>、-SO<sub>2</sub>N(R<sub>A</sub>)<sub>2</sub>、-NR<sub>A</sub>SO<sub>2</sub>、-C(O)N(R<sub>A</sub>)<sub>2</sub>、および-NR<sub>A</sub>C(O)R<sub>B</sub>から選択される1つ、2つ、もしくは3つの基によって中断され、ならびに/または-S(O)NR<sub>A</sub>R<sub>B</sub>、-NR<sub>A</sub>S(O)R<sub>B</sub>、-SO<sub>2</sub>NR<sub>A</sub>R<sub>B</sub>、-NR<sub>A</sub>SO<sub>2</sub>R<sub>B</sub>、-C(O)NR<sub>A</sub>R<sub>B</sub>、もしくは-NR<sub>A</sub>C(O)R<sub>B</sub>によって終端し、ここで各R<sub>A</sub>およびR<sub>B</sub>は、独立して、水素、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルキニル、シクロアルキル、ヘテロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アルキルアリール、アリールアルキル、アルキルヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、およびアルキルヘテロアリールアルキルから選択される)

の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩が、本明細書中に開示される。

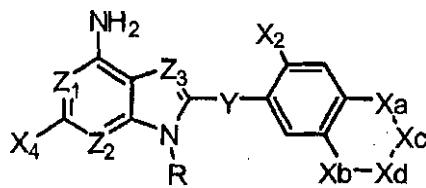
本発明の好ましい実施形態において、例えば以下の項目が提供される。

(項目1)式(IA)または(IB)：

【化48】



(IA)



(IB)

(式中、

(a)  $Z_1$ 、 $Z_2$ 、および $Z_3$ の各々は、Nであり；

(b) Yは、CH<sub>2</sub>、O、またはSであり；

(c) Xa、Xb、Xc、およびXdは、独立して、原子価を満足するように選択されるCH、CH<sub>2</sub>、O、N、NH、S、カルボニル、フルオロメチレン、およびジフルオロメ

チレンから選択され、ここで X 基への各結合は、単結合または二重結合のいずれかであり；

(d) X<sub>2</sub> は、ハロゲン、アリール、アルキニル、またはアミノであり；

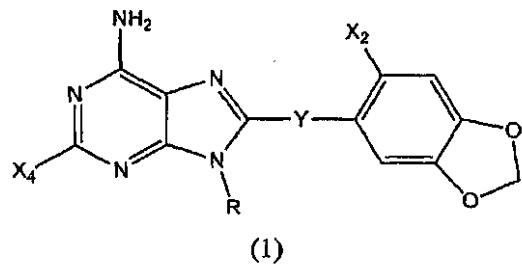
(e) X<sub>4</sub> は、水素またはハロゲンであり；そして

(f) R は、直鎖もしくは分枝鎖の置換もしくは非置換のアルキル、直鎖もしくは分枝鎖の置換もしくは非置換のアルケニル、直鎖もしくは分枝鎖の置換もしくは非置換のアルキニル、または置換もしくは非置換のシクロアルキルであり、ここで R 基は、1つ以上の -S( O )N( R<sub>A</sub>) - 、 -NR<sub>A</sub>S( O ) - 、 -SO<sub>2</sub>N( R<sub>A</sub>) - 、 -NR<sub>A</sub>SO<sub>2</sub> - 、 -C( O )N( R<sub>A</sub>) - 、 もしくは -NR<sub>A</sub>C( O ) - 基によって中断され、および／または -S( O )NR<sub>A</sub>R<sub>B</sub> 、 -NR<sub>A</sub>S( O )R<sub>B</sub> 、 -SO<sub>2</sub>NR<sub>A</sub>R<sub>B</sub> 、 -NR<sub>A</sub>S( O )R<sub>B</sub> 、 -C( O )NR<sub>A</sub>R<sub>B</sub> 、 もしくは -NR<sub>A</sub>C( O )R<sub>B</sub> 基によって終端し、ここで各 R<sub>A</sub> および R<sub>B</sub> は、独立して、水素、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルケニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキニル、シクロアルキル、ヘテロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アルキルアリール、アリールアルキル、アルキルヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、およびアルキルヘテロアリールアルキルから選択される) の化合物またはその薬学的に受容可能な塩。

(項目 2)

式(1) :

【化49】



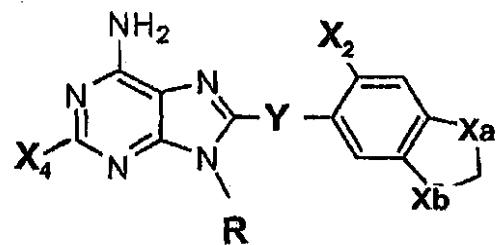
(式中、Y は、CH<sub>2</sub> または S である)

の化合物である、項目 1 に記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩。

(項目 3)

式(2) :

【化50】



(2)

(式中、

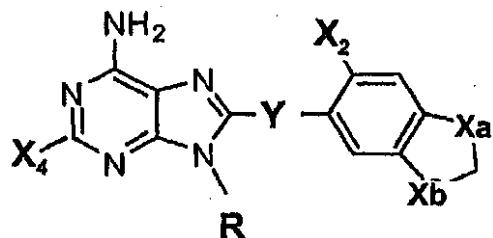
Xa および Xb のうちの 1 つは、O であり、他方は、CH<sub>2</sub> であり；そして

Y は、CH<sub>2</sub> 、または S である)

の化合物である、項目 1 に記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩。

(項目 4)

式(3) :  
【化51】



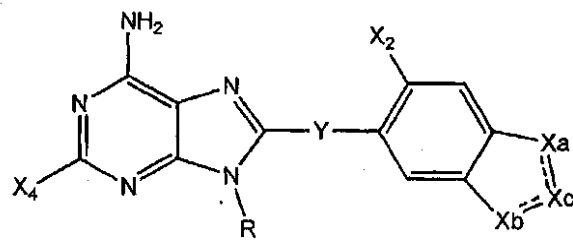
(3)

(式中、  
X<sub>a</sub>およびX<sub>b</sub>のうちの1つは、C(=O)であり、他方は、CH<sub>2</sub>であり；そして  
Yは、CH<sub>2</sub>、またはSである)  
の化合物である、項目1に記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩。

(項目5)

式(4) :

【化52】



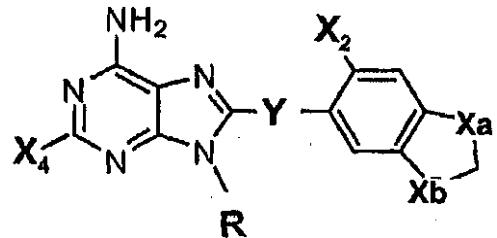
(4)

(式中、  
X<sub>a</sub>-X<sub>c</sub>-X<sub>b</sub>は、CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>、CH=CH-CH<sub>2</sub>、またはCH<sub>2</sub>-C  
H=CHであり；そして  
Yは、CH<sub>2</sub>、またはSである)  
の化合物である、項目1に記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩。

(項目6)

式(5) :

【化53】



(5)

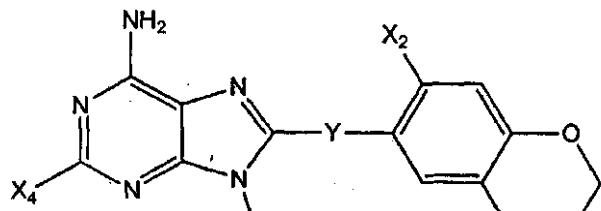
(式中、X<sub>a</sub>およびX<sub>b</sub>のうちの少なくとも1つは、CHFまたはCF<sub>2</sub>であり、他方はCHF、CF<sub>2</sub>、またはCH<sub>2</sub>である)

の化合物である、項目1に記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩。

(項目7)

式(6) :

【化54】



(6)

の化合物である、項目1に記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩。

(項目8)

Rは、1つ以上の-S(O)N(R<sub>A</sub>)-、-NR<sub>A</sub>S(O)-、-SO<sub>2</sub>N(R<sub>A</sub>)-、-NR<sub>A</sub>SO<sub>2</sub>-、-C(O)N(R<sub>A</sub>)-、または-NR<sub>A</sub>C(O)-基によって中断される、項目1～7のうちのいずれかに記載の化合物。

(項目9)

Rは、-S(O)NR<sub>A</sub>R<sub>B</sub>、-NR<sub>A</sub>S(O)R<sub>B</sub>、-SO<sub>2</sub>NR<sub>A</sub>R<sub>B</sub>、-NR<sub>A</sub>SO<sub>2</sub>R<sub>B</sub>、-C(O)NR<sub>A</sub>R<sub>B</sub>、または-NR<sub>A</sub>C(O)R<sub>B</sub>基によって終端する、項目1～8のうちのいずれかに記載の化合物。

(項目10)

Rは、2-エタンスルホン酸イソプロピルアミド、2-エタンスルホン酸エチルアミド、2-エタンスルホン酸メチルアミド、2-エタンスルホン酸アミド、2-エタンスルホン酸t-ブチルアミド、2-エタンスルホン酸イソブチルアミド、2-エタンスルホン酸シクロプロピルアミド、イソプロパンスルホン酸2-エチルアミド、エタンスルホン酸2-エチルアミド、N-2エチルメタンスルホンアミド、2-メチル-プロパン-2-スルホン酸2-エチルアミド、2-メチル-プロパン-2-スルフィン酸2-エチルアミド、2-メチル-プロパン-1-スルホン酸2-エチルアミド、シクロプロパンスルホン酸2-エチルアミド、3-プロパン-1-スルホン酸イソプロピルアミド、3-プロパン-1-スルホン酸エチルアミド、3-プロパン-1-スルホン酸アミド、3-プロパン-1-スルホン酸t-ブチルアミド、3-プロパン-1-スルホン酸イソブチルアミド、3-プロパン-1-スルホン酸シクロプロピルアミド、プロパン-2-スルホン酸3-プロピルアミド、エタンスルホン酸3-プロピルアミド、N-3-プロピルメタンスルホンアミド、2-メチル-プロパン-2-スルホン酸3-プロピルアミド、2-メチル-プロパン-1-スルホン酸3-プロピルアミド、シクロプロパンスルホン酸3-プロピルアミド、3-N-イソプロピルプロピオニアミド、3-N-エチルプロピオニアミド、3-N-メチルプロピオニアミド、3-プロピオニアミド、3-N-t-ブチルプロピオニアミド、3-N-イソブチルプロピオニアミド、3-N-シクロプロピルプロピオニアミド、N-2-エチルイソブチルアミド、N-2-エチルプロピオニアミド、N-2-エチルアセトアミド、N-2-エチルホルムアミド、N-2-エチル2,2-ジメチル-プロピオニアミド、N-2-エチル3-メチルブチルアミド、またはシクロプロパンカルボン酸2-エチル-アミドである、項目1～7のうちのいずれか1項に記載の化合物。

(項目11)

Rは、シクロプロパンカルボン酸3-プロピル-アミド、N-3-プロピル2,2-ジメチル-プロピオンアミド、N-プロピル-2-メチル-プロパン-2-スルフィンアミド、t-ブタンスルホン酸3-プロピルアミド、またはシクロプロパンスルホン酸3-プロピルアミドである、項目1~7のうちのいずれか1項に記載の化合物。

(項目12)

X<sub>4</sub>は、HまたはFである、項目1~11のうちのいずれか1項に記載の化合物。

(項目13)

YはSである、項目1~12のうちのいずれか1項に記載の化合物。

(項目14)

YはCH<sub>2</sub>である、項目1~12のうちのいずれか1項に記載の化合物。

(項目15)

X<sub>2</sub>は、必要に応じて置換されたヘテロアリールである、項目1~14のうちのいずれか1項に記載の化合物。

(項目16)

X<sub>2</sub>は、フラン-2-イル、フラン-3-イル、5-メチルフラン-2-イル、1H-ピラゾール-2-イル、1H-ピラゾール-3-イル、チアゾール-2-イル、5-メチルチアゾール-2-イル、オキサゾール-2-イル、または5-メチルオキサゾール-2-イルである、項目15に記載の化合物。

(項目17)

X<sub>2</sub>は、アルキニルである、項目1~14のうちのいずれか1項に記載の化合物。

(項目18)

X<sub>2</sub>は、エチニルである、項目17に記載の化合物。

(項目19)

X<sub>2</sub>は、ハロである、項目1~14のうちのいずれか1項に記載の化合物。

(項目20)

X<sub>2</sub>は、Iである、項目19に記載の化合物。

(項目21)

X<sub>2</sub>は、アミノである、項目1~14のうちのいずれか1項に記載の化合物。

(項目22)

X<sub>2</sub>は、ジメチルアミノである、項目21に記載の化合物。

(項目23)

項目1~22のうちの1つに記載の化合物、および薬学的に受容可能なキャリアを含む薬学的組成物。

(項目24)

がん、または神経変性障害を、処置または予防するための方法であって、該方法は、治療上有効な量の、項目1~22のうちの1つに記載の化合物を、それを必要としている患者に投与することを含む、方法。

(項目25)

がん、または神経変性障害の処置または予防のための薬学的組成物を製剤化することにおける、項目1~22のうちの1つに記載の化合物の使用。

(項目26)

Hsp90の阻害のための方法であって、該方法は、Hsp90を、Hsp90の機能を阻害する量の、項目1~22のうちの1つに記載の化合物に接触させることを含む、方法。

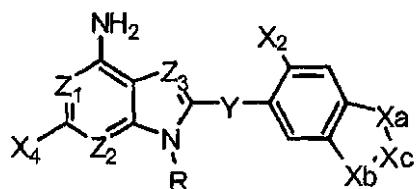
(項目27)

Hsp90の阻害のための薬学的組成物を製剤化することにおける、項目1~22のうちの1つに記載の化合物の使用。

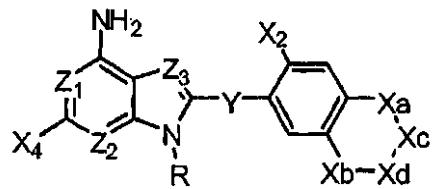
(項目28)

式(I A)または(I B)：

【化55】



(IA)



(IB)

(式中、

(a)  $Z_1$ 、 $Z_2$ 、および $Z_3$ の各々は、独立してCHまたはNであり；(b) Yは、CH<sub>2</sub>、O、またはSであり；(c) Xa、Xb、Xc、およびXdは、独立して、原子価を満足するように選択されるCH、CH<sub>2</sub>、O、N、NH、S、カルボニル、フルオロメチレン、およびジフルオロメチレンから選択され、ここでX基への各結合は、単結合または二重結合のいずれかであり；(d) X<sub>2</sub>は、放射標識された原子の、構造への導入のための脱離基であり；(e) X<sub>4</sub>は、水素またはハロゲンであり；そして(f) Rは、直鎖もしくは分枝鎖の置換もしくは非置換のアルキル、直鎖もしくは分枝鎖の置換もしくは非置換のアルケニル、直鎖もしくは分枝鎖の置換もしくは非置換のアルキニル、または置換もしくは非置換のシクロアルキルであり、ここでR基は、1つ以上の-S(O)N(R<sub>A</sub>)-、-NR<sub>A</sub>S(O)-、-SO<sub>2</sub>N(R<sub>A</sub>)-、-NR<sub>A</sub>SO<sub>2</sub>-、-C(O)N(R<sub>A</sub>)-、もしくは-NR<sub>A</sub>C(O)-基によって中断され、および/または-S(O)NR<sub>A</sub>R<sub>B</sub>、-R<sub>A</sub>S(O)R<sub>B</sub>、-SO<sub>2</sub>NR<sub>A</sub>R<sub>B</sub>、-NR<sub>A</sub>SO<sub>2</sub>R<sub>B</sub>、-C(O)NR<sub>A</sub>R<sub>B</sub>、もしくは-NR<sub>A</sub>C(O)R<sub>B</sub>基によって終端し、ここで各R<sub>A</sub>およびR<sub>B</sub>は、独立して、水素、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルキニル、シクロアルキル、ヘテロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アルキルアリール、アリールアルキル、アルキルヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、およびアルキルヘテロアリールアルキルから選択される)の化合物、またはその塩。

(項目29)

X<sub>2</sub>は、トリアルキルスズまたは-Sn(CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>(CF<sub>2</sub>)<sub>5</sub>CF<sub>3</sub>)<sub>3</sub>である、項目28に記載の化合物、またはその塩。

(項目30)

放射標識された化合物の形成のための前駆体としての、項目28または29に記載の化合物、またはその塩の使用。