

【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25年1月10日(2013.1.10)

【公表番号】特表2012-510467(P2012-510467A)

【公表日】平成24年5月10日(2012.5.10)

【年通号数】公開・登録公報2012-018

【出願番号】特願2011-538209(P2011-538209)

【国際特許分類】

C 07 D 277/82	(2006.01)
A 61 P 43/00	(2006.01)
A 61 P 35/00	(2006.01)
A 61 P 35/04	(2006.01)
A 61 K 31/428	(2006.01)
A 61 K 31/496	(2006.01)
C 07 D 417/12	(2006.01)
A 61 K 31/4439	(2006.01)
C 12 N 15/09	(2006.01)

【F I】

C 07 D 277/82	C S P
A 61 P 43/00	1 1 1
A 61 P 35/00	
A 61 P 43/00	1 2 3
A 61 P 35/04	
A 61 K 31/428	
A 61 K 31/496	
C 07 D 417/12	
A 61 K 31/4439	
C 12 N 15/00	Z N A A

【手続補正書】

【提出日】平成24年11月15日(2012.11.15)

【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

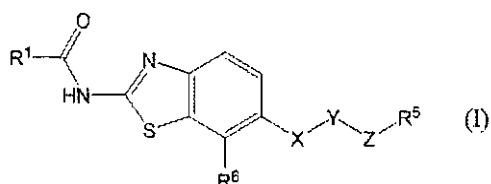
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式

【化1】



【式中、

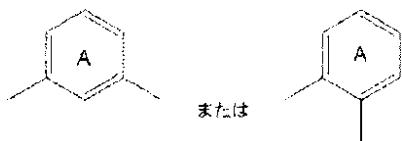
R<sup>1</sup>は、置換基を有していてもよいC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、置換基を有していてもよいC<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>シクロアルキル基、または置換基を有していてもよい複素環基を；

Xは、-O-または-NR<sup>2</sup>-（式中、R<sup>2</sup>は、水素原子またはC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基を示

す)を;

Yは、

【化2】



(式中、環Aは、さらに置換されていてもよいベンゼン環を示す)を;

Zは、

- (1)  $-\text{NR}^3\text{CO}-$ 、
- (2)  $-\text{NR}^3\text{CO}-\text{W}^1-$ 、
- (3)  $-\text{NR}^3\text{CO}-\text{W}^1-\text{O}-$ 、
- (4)  $-\text{NR}^3\text{CO}-\text{W}^1-\text{O}-\text{W}^2-$ 、
- (5)  $-\text{NR}^3\text{CO}-\text{W}^1-\text{S}-$ 、
- (6)  $-\text{NR}^3\text{CO}-\text{W}^1-\text{NR}^4-$ 、
- (7)  $-\text{NR}^3\text{COO}-$ 、
- (8)  $-\text{NR}^3\text{CO}-\text{CO}-$ 、
- (9)  $-\text{NR}^3\text{CONR}^4-$ 、
- (10)  $-\text{NR}^3\text{CONR}^4-\text{W}^1-$ 、
- (11)  $-\text{NR}^3\text{CONR}^4-\text{W}^1-\text{O}-$ 、または
- (12)  $-\text{CONR}^3-$

(式中、 $\text{R}^3$ および $\text{R}^4$ は、独立して、水素原子または $\text{C}_{1-6}$ アルキル基を示し、 $\text{W}^1$ および $\text{W}^2$ は、独立して、置換基を有していてもよい $\text{C}_{1-6}$ アルキレン基、置換基を有していてもよい $\text{C}_{2-6}$ アルケニレン基、置換基を有していてもよい $\text{C}_{2-6}$ アルキニレン基、または置換基を有していてもよい $\text{C}_{3-6}$ シクロアルキレン基を示す)で表される基を;

$\text{R}^5$ は、置換基を有していてもよい5または6員環基を;および

$\text{R}^6$ は、

- (1) ハロゲン原子、
- (2) シアノ基、
- (3) ニトロ基、
- (4) ヒドロキシ基、
- (5) カルボキシ基、
- (6)  $\text{C}_{1-6}$ アルコキシ-カルボニル基、
- (7) アミノ基、
- (8) モノ $\text{C}_{1-6}$ アルキルアミノ基、
- (9) ジ $\text{C}_{1-6}$ アルキルアミノ基、または
- (10)(i) ハロゲン原子、  
(ii) シアノ基、  
(iii) ニトロ基、  
(iv) ヒドロキシ基、  
(v) カルボキシ基、  
(vi)  $\text{C}_{1-6}$ アルコキシ-カルボニル基、  
(vii) アミノ基、  
(viii) モノ $\text{C}_{1-6}$ アルキルアミノ基、および  
(ix) ジ $\text{C}_{1-6}$ アルキルアミノ基、

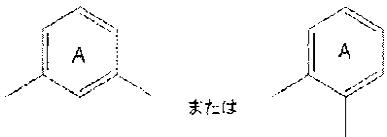
から選ばれる1ないし3個の置換基を有していてもよい $\text{C}_{1-6}$ アルキル基を示す。]で表される化合物またはその塩。

【請求項2】

$\text{R}^1$ が、

- (1) 置換基を有していてもよい、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル基、
- (2) 置換基を有していてもよい、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> シクロアルキル基、または
- (3) 置換基を有していてもよい、3ないし8員の単環式非芳香族複素環基であり、  
Xが、-O-、-NH-または-N(CH<sub>3</sub>)-であり、  
Yが、

## 【化3】



[式中、環Aは、

- (1) C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、および
- (2) ハロゲン原子

から選ばれる1ないし3個の置換基を有していてもよいベンゼン環を示す。]であり、  
Zが、

- (1) -N R<sup>3</sup> CO-、
- (2) -N R<sup>3</sup> CO-W<sup>1</sup>-、
- (3) -N R<sup>3</sup> CON R<sup>4</sup>-、または
- (4) -CON R<sup>3</sup>-

(式中、各記号は請求項1記載と同意義を示す)であり、  
R<sup>5</sup>が、

- (1) 置換基を有していてもよいフェニル、または
- (2) 置換基を有していてもよい5または6員の単環式芳香族複素環基であり、  
R<sup>6</sup>が、

- (1) ハロゲン原子、
- (2) シアノ基、
- (3) ニトロ基、
- (4) カルボキシ基、
- (5) C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルコキシ-カルボニル基、
- (6) アミノ基、
- (7) ジC<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキルアミノ基、または
- (8) ヒドロキシ基を1ないし3個有していてもよいC<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル基

である請求項1記載の化合物。

## 【請求項3】

R<sup>1</sup>が、

- (1) C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル基を1ないし3個有していてもよい、3ないし8員の単環式非芳香族複素環基を1個有していてもよい、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル基、または
- (2) C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> シクロアルキル基

である請求項2記載の化合物。

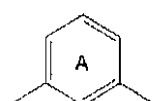
## 【請求項4】

Xが、-O-である請求項2記載の化合物。

## 【請求項5】

Yが、

## 【化4】



[式中、環Aは、

- (1) C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、および
- (2) ハロゲン原子

から選ばれる 1 ないし 3 個の置換基を有していてもよい、ベンゼン環を示す。】  
である請求項 2 記載の化合物。

【請求項 6】

Z が、

- (1) - N H C O - 、
- (2) - N H C O - W<sup>1 b</sup> -  
(式中、W<sup>1 b</sup> は、C<sub>1 - 6</sub> アルキレン基を示す。)、
- (3) - N H C O N H - 、または
- (4) - C O N H -

である請求項 2 記載の化合物。

【請求項 7】

R<sup>5</sup> が、

- (1)(a) ハロゲン原子、
- (b)(i) ハロゲン原子、および  
(ii) シアノ

から選ばれる置換基を 1 ないし 3 個有していてもよい C<sub>1 - 6</sub> アルキル、

- (c)(i) ハロゲン原子、および  
(ii) シアノ

から選ばれる置換基を 1 ないし 3 個有していてもよい C<sub>1 - 6</sub> アルコキシ、

- (d) シアノを 1 ないし 3 個有していてもよい C<sub>3 - 8</sub> シクロアルキル、および  
(e) C<sub>2 - 6</sub> アルキニル

から選ばれる 1 ないし 3 個の置換基を有していてもよいフェニル、または

- (2)(a) ハロゲン原子、
- (b) ハロゲン原子を 1 ないし 3 個有していてもよい C<sub>1 - 6</sub> アルキル、
- (c) C<sub>3 - 8</sub> シクロアルキル、および
- (d) フェニル

から選ばれる 1 ないし 3 個の置換基を有していてもよい 5 または 6 員の単環式芳香族複素環基

である請求項 2 記載の化合物。

【請求項 8】

R<sup>6</sup> が、シアノ基である請求項 2 記載の化合物。

【請求項 9】

2 - クロロ - N - [ 3 - ( { 7 - シアノ - 2 - [ ( シクロプロピルカルボニル ) アミノ ] - 1 , 3 - ベンゾチアゾール - 6 - イル } オキシ ) フェニル ] - 3 - ( 1 - シアノ - 1 - メチルエチル ) ベンズアミド、またはその塩。

【請求項 10】

2 - クロロ - N - [ 3 - ( { 7 - シアノ - 2 - [ ( シクロプロピルカルボニル ) アミノ ] - 1 , 3 - ベンゾチアゾール - 6 - イル } オキシ ) フェニル ] - 3 - ( 1 - シアノ - 1 - メチルエチル ) ベンズアミド。

【請求項 11】

N - { 7 - シアノ - 6 - [ 4 - フルオロ - 3 - ( { [ 4 - ( トリフルオロメチル ) フェニル ] カルバモイル } アミノ ) フェノキシ ] - 1 , 3 - ベンゾチアゾール - 2 - イル } シクロプロパンカルボキサミド、またはその塩。

【請求項 12】

N - { 7 - シアノ - 6 - [ 4 - フルオロ - 3 - ( { [ 4 - ( トリフルオロメチル ) フェニル ] カルバモイル } アミノ ) フェノキシ ] - 1 , 3 - ベンゾチアゾール - 2 - イル } シクロプロパンカルボキサミド。

【請求項 13】

N - { 7 - シアノ - 6 - [ 3 - ( { [ 3 - ( トリフルオロメチル ) フェニル ] アセチル } アミノ ) フェノキシ ] - 1 , 3 - ベンゾチアゾール - 2 - イル } シクロプロパンカルボ

キサミド、またはその塩。

【請求項 1 4】

N - { 7 - シアノ - 6 - [ 3 - ( { [ 3 - ( トリフルオロメチル ) フェニル ] アセチル } アミノ ) フェノキシ ] - 1 , 3 - ベンゾチアゾール - 2 - イル } シクロプロパンカルボキサミド。

【請求項 1 5】

N - { 7 - シアノ - 6 - [ 3 - ( { [ 6 - ( トリフルオロメチル ) ピリジン - 3 - イル ] カルバモイル } アミノ ) フェノキシ ] - 1 , 3 - ベンゾチアゾール - 2 - イル } シクロプロパンカルボキサミド、またはその塩。

【請求項 1 6】

N - { 7 - シアノ - 6 - [ 3 - ( { [ 6 - ( トリフルオロメチル ) ピリジン - 3 - イル ] カルバモイル } アミノ ) フェノキシ ] - 1 , 3 - ベンゾチアゾール - 2 - イル } シクロプロパンカルボキサミド。

【請求項 1 7】

N - { 7 - シアノ - 6 - [ 4 - フルオロ - 3 - ( { [ 3 - ( トリフルオロメチル ) フェニル ] アセチル } アミノ ) フェノキシ ] - 1 , 3 - ベンゾチアゾール - 2 - イル } シクロプロパンカルボキサミド、またはその塩。

【請求項 1 8】

N - { 7 - シアノ - 6 - [ 4 - フルオロ - 3 - ( { [ 3 - ( トリフルオロメチル ) フェニル ] アセチル } アミノ ) フェノキシ ] - 1 , 3 - ベンゾチアゾール - 2 - イル } シクロプロパンカルボキサミド。

【請求項 1 9】

請求項 1 記載の化合物のプロドラッグ。

【請求項 2 0】

請求項 1 記載の化合物またはそのプロドラッグを含有してなる医薬。

【請求項 2 1】

R a f 阻害薬である請求項 2 0 記載の医薬。

【請求項 2 2】

癌の予防または治療薬である請求項 2 0 記載の医薬。

【請求項 2 3】

R a f 阻害薬を製造するための、請求項 1 記載の化合物またはそのプロドラッグの使用。

【請求項 2 4】

癌の予防または治療薬を製造するための、請求項 1 記載の化合物またはそのプロドラッグの使用。