

【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 0 7 D 277/82 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/428 (2006.01)

A 6 1 K 31/496 (2006.01)

C 0 7 D 417/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/4439 (2006.01)

C 1 2 N 15/09 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 277/82 C S P

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 43/00 1 2 3

A 6 1 P 35/04

A 6 1 K 31/428

A 6 1 K 31/496

C 0 7 D 417/12

A 6 1 K 31/4439

C 1 2 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

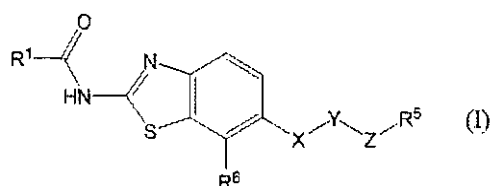
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式

【化 1】



〔式中、

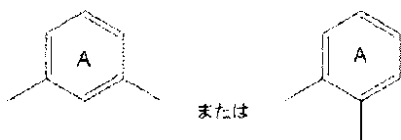
R¹ は、置換基を有していてもよい C₁ - C₆ アルキル基、置換基を有していてもよい C₃ - C₈ シクロアルキル基、または置換基を有していてもよい複素環基を；

X は、- O - または - N R² - (式中、R² は、水素原子または C₁ - C₆ 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) $-NR^3CO-$ 、
- (2) $-NR^3CO-W^1-$ 、
- (3) $-NR^3CO-W^1-O-$ 、
- (4) $-NR^3CO-W^1-O-W^2-$ 、
- (5) $-NR^3CO-W^1-S-$ 、
- (6) $-NR^3CO-W^1-NR^4-$ 、
- (7) $-NR^3COO-$ 、
- (8) $-NR^3CO-CO-$ 、
- (9) $-NR^3CONR^4-$ 、
- (10) $-NR^3CONR^4-W^1-$ 、
- (11) $-NR^3CONR^4-W^1-O-$ 、または
- (12) $-CONR^3-$

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

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

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) C_{1-6} アルコキシ-カルボニル基、
- (7) アミノ基、
- (8) モノ C_{1-6} アルキルアミノ基、
- (9) ジ 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) C_{1-6} アルコキシ-カルボニル基、
- (vii) アミノ基、
- (viii) モノ C_{1-6} アルキルアミノ基、および
- (ix) ジ C_{1-6} アルキルアミノ基、

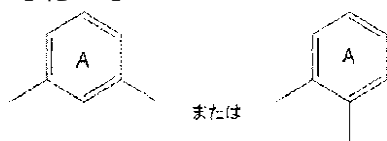
から選ばれる1ないし3個の置換基を有していてもよい C_{1-6} アルキル基を示す。]で表される化合物またはその塩。

【請求項2】

R^1 が、

- (1) 置換基を有していてもよい、 $C_1 - 6$ アルキル基、
 (2) 置換基を有していてもよい、 $C_3 - 8$ 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 $-N(CH_3)-$ であり、
 Y が、

【化 3】



[式中、環 A は、

- (1) $C_1 - 6$ 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) $-NR^3CO-$ 、
 (2) $-NR^3CO-W^1-$ 、
 (3) $-NR^3CONR^4-$ 、または
 (4) $-CONR^3-$

(式中、各記号は請求項 1 記載と同意義を示す) であり、

R^5 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^6 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) $C_1 - 6$ アルコキシ - カルボニル基、
 (6) アミノ基、
 (7) ジ $C_1 - 6$ 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 $C_1 - 6$ アルキル基
 である請求項 1 記載の化合物。

【請求項 3】

R^1 が、

- (1) $C_1 - 6$ 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、 $C_1 - 6$ アルキル基、または

- (2) $C_3 - 8$ シクロアルキル基

である請求項 2 記載の化合物。

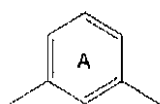
【請求項 4】

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) $C_1 - 6$ 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) -NHCO-、

(2) -NHCO-W^{1b}-

(式中、W^{1b} は、C₁-₆ アルキレン基を示す。)、

(3) -NHCONH-、または

(4) -CONH-

である請求項 2 記載の化合物。

【請求項 7】

R⁵ 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 C₁-₆ 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 C₁-₆ アルコキシ、

(d) シアノを 1 ないし 3 個有していてもよい C₃-₈ シクロアルキル、および

(e) C₂-₆ 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 C₁-₆ アルキル、

(c) C₃-₈ 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】

R⁶ 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 14】

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 15】

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 16】

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 17】

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 18】

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 19】

請求項 1 記載の化合物のプロドラッグ。

【請求項 20】

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 21】

R a f 阻害薬である請求項 20 記載の医薬。

【請求項 22】

癌の予防または治療薬である請求項 20 記載の医薬。

【請求項 23】

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 24】

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。