【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7月13日(2006.7.13)

【公表番号】特表2005-538953(P2005-538953A)
【公表日】平成17年12月22日(2005.12.22)
【年通号数】公開・登録公報2005-050
【出願番号】特願2004-507462(P2004-507462)
【国際特許分類】
Ｃ０７Ｄ 333/38 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/381 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/404 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/41 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/4178 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/4184 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/4188 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/422 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/427 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/428 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/4436 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/4439 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/444 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/4535 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/4709 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/496 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/497 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/506 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/5377 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/662 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 1/04 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 3/10 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 5/14 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 5/48 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 7/00 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 7/06 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 7/08 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 7/10 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 9/00 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 9/10 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 11/00 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 11/06 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 13/02 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 13/12 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 17/00 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 17/02 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 17/06 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 19/02 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 19/10 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 21/04 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 25/00 (2006.01)

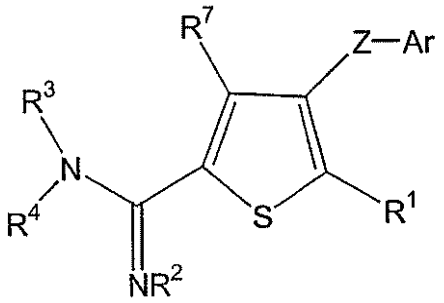
A61P 25/28 (2006.01)
A61P 29/00 (2006.01)
A61P 31/00 (2006.01)
A61P 31/04 (2006.01)
A61P 37/00 (2006.01)
A61P 37/06 (2006.01)
A61P 37/08 (2006.01)
A61P 41/00 (2006.01)
A61P 43/00 (2006.01)
C07D 333/54 (2006.01)
C07D 409/12 (2006.01)
C07D 409/14 (2006.01)
C07D 413/12 (2006.01)
C07D 413/14 (2006.01)
C07D 417/12 (2006.01)
C07D 495/04 (2006.01)
C07F 7/10 (2006.01)
C07F 9/6553 (2006.01)

【FI】
C07D 333/38 CSP
A61K 31/381
A61K 31/404
A61K 31/41
A61K 31/4178
A61K 31/4184
A61K 31/4188
A61K 31/422
A61K 31/427
A61K 31/428
A61K 31/4436
A61K 31/4439
A61K 31/444
A61K 31/4535
A61K 31/4709
A61K 31/496
A61K 31/497
A61K 31/506
A61K 31/5377
A61K 31/662
A61P 1/04
A61P 3/10
A61P 5/14
A61P 5/48
A61P 7/00
A61P 7/06
A61P 7/08
A61P 7/10
A61P 9/00
A61P 9/10
A61P 11/00

Ａ６１Ｐ　11/06
Ａ６１Ｐ　13/02
Ａ６１Ｐ　13/12
Ａ６１Ｐ　17/00
Ａ６１Ｐ　17/02
Ａ６１Ｐ　17/06
Ａ６１Ｐ　19/02
Ａ６１Ｐ　19/10
Ａ６１Ｐ　21/04
Ａ６１Ｐ　25/00
Ａ６１Ｐ　25/28
Ａ６１Ｐ　29/00
Ａ６１Ｐ　29/00　１０１
Ａ６１Ｐ　31/00
Ａ６１Ｐ　31/04
Ａ６１Ｐ　37/00
Ａ６１Ｐ　37/06
Ａ６１Ｐ　37/08
Ａ６１Ｐ　41/00
Ａ６１Ｐ　43/00　１０５
Ａ６１Ｐ　43/00　１１１
Ｃ０７Ｄ 333/54
Ｃ０７Ｄ 409/12
Ｃ０７Ｄ 409/14
Ｃ０７Ｄ 413/12
Ｃ０７Ｄ 413/14
Ｃ０７Ｄ 417/12
Ｃ０７Ｄ 495/04　１０３
Ｃ０７Ｆ　7/10　Ｖ
Ｃ０７Ｆ　9/6553
Ｃ０７Ｍ　7:00

【手続補正書】
【提出日】平成18年5月12日(2006.5.12)
【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の化合物、またはそれらの溶媒和物、水和物または薬学的に受容可能な塩：

【化１】



I

ここで：

Ｚは、－Ｓ（Ｏ）－または－Ｓ（Ｏ$_2$）－である；

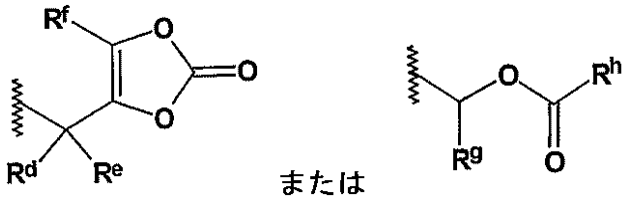
Ｒ^{1}は、Ｃ$_{1～4}$アルキル、ハロ、アミノ、Ｃ$_{1～6}$アルキルチオ、Ｃ$_{2～6}$アルケニルチオ、Ｃ$_{1～6}$アルコキシ、トリフルオロメチル、メチルスルホニルまたはベンジルチオである；

Ａｒは、フェニル、ナフチル、ピリジル、イミダゾリル、チアゾリル、フラニル、チエニル、ベンゾチアゾリル、ピラゾリル、ピリミジニル、ベンズイミダゾリル、ベンゾフラニル、インドリル、ベンゾチオフェニルまたはベンゾ［ｃ］クロメニルであり、それらのいずれかは、必要に応じて、置換されている；

Ｒ^2、Ｒ^{3}およびＲ^{4}は、別個に、水素、Ｃ$_{1～4}$アルキル、Ｃ$_{6～10}$アリール、Ｃ$_{1～4}$ヒドロキシアルキル、Ｃ$_{1～4}$アミノアルキル、モノ（Ｃ$_{1～4}$）アルキルアミノ（Ｃ$_{2～6}$）アルキル、ジ（Ｃ$_{1～4}$）アルキルアミノ（Ｃ$_{2～6}$）アルキル、カルボキシ（Ｃ$_{1～4}$）アルキル、シアノ、ニトロ、アミノ、Ｃ$_{1～4}$アルコキシ、ヒドロキシまたは－ＣＯ$_2$Ｒ^{w}であり、ここで、

Ｒ^{w}は、水素、ヒドロキシ、Ｃ$_{1～4}$アルコキシ、シアノ、Ｃ$_{1～4}$アルコキシカルボニル、Ｃ$_{1～4}$アルキル、Ｃ$_{3～8}$シクロアルキル、フェニル、ベンジル、

【化２】



である；

ここで、Ｒ^{d}およびＲ^{e}は、別個に、水素、Ｃ$_{1～6}$アルキル、Ｃ$_{2～6}$アルケニルまたはフェニルであり、

Ｒ^{f}は、水素、Ｃ$_{1～6}$アルキル、Ｃ$_{2～6}$アルケニルまたはフェニルであり、

Ｒ^{g}は、水素、Ｃ$_{1～6}$アルキル、Ｃ$_{2～6}$アルケニルまたはフェニルであり、そして

Ｒ^{h}は、Ｃ$_{6～10}$アル（Ｃ$_{1～4}$）アルキルまたはＣ$_{1～6}$アルキルである；そして

Ｒ^{7}は、水素、クロロ、フルオロまたはアミノである、

化合物。

【請求項２】

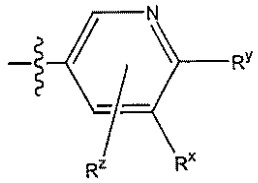
Ｒ^{1}が、ハロ、Ｃ$_{1～4}$アルキルチオまたはＣ$_{2～4}$アルケニルチオである、請求項１に記載の化合物。

【請求項３】

Ａｒが、ナフチルまたはフェニルであり、それらのいずれかが、Ｃ$_{1～6}$アルキル、Ｃ$_{1～6}$アルコキシ、Ｃ$_{2～6}$アルケニル、ハロ、ヒドロキシ、フェニル、フェノキシ、アミノまたはフェニルアミノの１個または２個で置換されている、請求項１に記載の化合物。

【請求項４】
Ａｒが、２－フェニルフェニル、ナフト－２－イル、２－メトキシフェニル、４－メトキシフェニル、４－クロロフェニル、２－ブロモフェニル、３，４－ジメチルフェニル、３－メトキシフェニル、３－ブロモフェニル、４－エチルフェニル、４－ブロモフェニル、４－フェニルフェニル、３，４－ジメトキシフェニル、２－イソプロピルフェニル、３，５－ジクロロフェニル、３－ヒドロキシフェニル、２－メチル－５－ｔ－ブチルフェニル、４－ｔ－ブチルフェニル、３－ブロモ－５－ｔ－ブトキシフェニル、３－ブロモ－５－ヒドロキシフェニル、３－ブロモ－５－メトキシフェニル、３－ブロモ－５－ビニルオキシフェニル、３－フェノキシフェニル、５－ブロモ－３－メチルフェニルまたは２－アミノフェニルである、請求項１に記載の化合物。
【請求項５】
Ａｒが、フェニルであり、該フェニルが、$C_{1\sim6}$アルキル、$C_{1\sim6}$アルコキシ、$C_{2\sim6}$アルケニル、ハロ、ヒドロキシ、フェニル、フェノキシ、アミノ、フェニルアミノ、ヒドロキシテトラヒドロピラニル、（$C_{1\sim4}$アルコキシ）－テトラヒドロピラニル、ヒドロキシピペリジニル、ヒドロキシ－Ｎ－（$C_{1\sim4}$アルキル）－ピペリジニル、ヒドロキシ－ピリジニル－（$C_{1\sim4}$）アルキルおよび（$C_{1\sim4}$アルコキシ）カルボニル（$C_{2\sim6}$）アルケニルの１個または２個で置換されている、請求項１に記載の化合物。
【請求項６】
Ａｒが、４－アミノ－３－ブロモフェニル、３－（４－ヒドロキシテトラヒドロピラン－４－イル）－フェニル、３－（４－ヒドロキシ－１－メチルピペリジン－４－イル）－フェニル、３－（４－メトキシテトラヒドロピラン－４－イル）－フェニル、３－（ヒドロキシ－ピリジン－２－イル－メチル）－フェニル、３－（１－エトキシカルボニル－プロペン－２－イル）－フェニル、３－クロロ－４－フルオロフェニルまたは３－ヨードフェニルである、請求項１に記載の化合物。
【請求項７】
Ａｒが、ピリジル、イミダゾリル、フラニル、チエニル、チアゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンゾフラニル、ベンゾチオフェニル、インドリルまたはベンズイミダゾリルであり、それらのいずれかが、必要に応じて、$C_{1\sim6}$アルキル、$C_{1\sim6}$アルコキシ、$C_{2\sim6}$アルケニル、ハロ、ヒドロキシ、フェニル、フェノキシ、アミノまたはトリルの１個または２個で置換されている、請求項１に記載の化合物。
【請求項８】
Ａｒが、ピリド－２－イル、ピリド－３－イル、イミダゾール－２－イル、１－メチルイミダゾール－２－イル、２－メチルフラン－２－イル、チエン－２－イル、チアゾール－２－イル、４－フェニルチアゾール－２－イル、５－エトキシベンゾチアゾール－２－イル、ベンズイミダゾール－２－イル、７－ブロモ－１－メチル－１Ｈ－ベンゾイミダゾリル、４－ブロモ－１－メチル－１Ｈ－ベンゾイミダゾリル、４－ブロモ－２－メチル－１Ｈ－ベンゾイミダゾリル、４－ブロモ－１Ｈ－ベンゾイミダゾリル、６－ブロモ－ベンズイミダゾリル、ピロール－２－イルまたはピペリジン－２－イルである、請求項１に記載の化合物。
【請求項９】
Ａｒが、ベンゾ［ｃ］クロメニルであり、該ベンゾ［ｃ］クロメニルが、必要に応じて、$C_{1\sim6}$アルキル、$C_{1\sim6}$アルコキシ、$C_{2\sim6}$アルケニル、ハロ、ヒドロキシ、フェニル、フェノキシまたはアミノの１個または２個で置換されている、請求項１に記載の化合物。
【請求項１０】
Ａｒが、式ＩＡを有する、請求項１に記載の化合物：

【化３】



IA

ここで：

R^xは、ハロまたはフェニルであり、該フェニルは、$C_{1\sim6}$アルキルまたは（$C_{1\sim4}$アルキル）オキシ（$C_{1\sim4}$）アルキルの１個または２個で置換されており、ここで、該$C_{1\sim4}$アルキル部分の１個は、必要に応じて、カルボキシで置換されている；

R^yは、水素、アミノ、ハロ、フェノキシまたは$C_{1\sim6}$アルキルアミノであり、ここで、該アルキル部分は、必要に応じて、フェニル、ピリジル、テトラヒドロフラニル、イミダゾリル、モルホリニル、（$C_{1\sim4}$ハロアルキル）－ピリジル、スルホンアミドフェニル、ヒドロキシ、（$C_{1\sim4}$アルキル）－チエニルまたはアミノピリミジニルの１個で置換されている；そして

R^zは、水素、ハロまたは$C_{1\sim4}$アルキルである、

化合物。

【請求項１１】

R^xが、２－メチルフェニル、２－カルボキシメトキシメチル－６－メチルフェニルまたはブロモである、請求項１０に記載の化合物。

【請求項１２】

R^yが、水素、クロロ、アミノ、フェノキシ、ベンジルアミノ、イソプロピルアミノ、ピリド－３－イルメチルアミノ、ピリド－４－イルメチルアミノ、ピリド－２－イルメチルアミノ、テトラヒドロフラン－２－イルメチルアミノ、３－（イミダゾール－１－イル）－プロピルアミノ、２－メチル－２－（モルホリン－４－イル）－プロピルアミノ、６－トリフルオロメチル－ピリド－３－イルメチルアミノ、２－（３Ｈ－イミダゾール－１－イル）－エチルアミノ、４－スルファモイルベンジルアミノ、２，２－ジメチル－３－ヒドロキシプロピルアミノ、３－メチルチエン－２－イルメチルアミノまたは４－アミノピリミジン－５－イルメチルアミノである、請求項１０に記載の化合物。

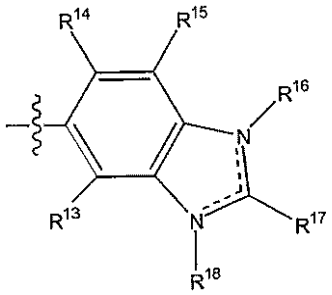
【請求項１３】

R^zが、水素、メチルまたはエチルである、請求項１０に記載の化合物。

【請求項１４】

Ａｒが、式ＩＢを有する、請求項１に記載の化合物：

【化４】



IB

ここで：

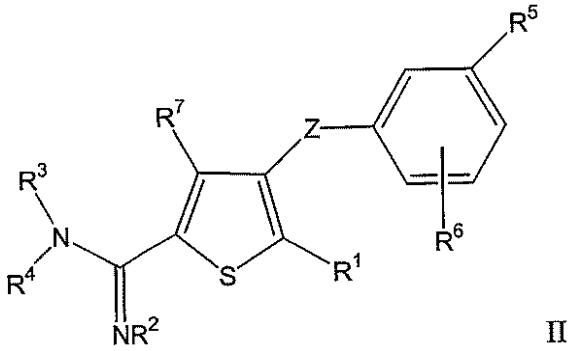
R^{13}およびR^{14}は、別個に、水素、ハロまたは$C_{1\sim4}$アルキルである；

R^{15}は、水素、ハロまたはトリルである；

R^{17}は、水素または$C_{1\sim4}$アルキルである；そして

R^{16}およびR^{18}の一方は、電子対であり、そして他方は、水素、$C_{1\sim6}$アルキル、$C_{2\sim6}$アルケニル、シクロプロピルメチル、フェニル、ベンジル、１－フェニルエチ

ル、ピリジルメチルまたはイソキサゾリルメチルであり、該イソキサゾリルメチルは、必要に応じて、１個または２個のメチル基で置換されており、ここで、該ベンジルは、非置換であるか、またはハロ、ニトロ、アミノまたは（２－カルボキシエチル）－スルファニルアセチルアミノの１個または２個で置換されている、
化合物。
【請求項１５】
R^{13}およびR^{14}が、別個に、水素、メチルまたはエチルである、請求項１４に記載の化合物。
【請求項１６】
R^{15}が、水素、ブロモ、クロロまたはｏ－トリルである、請求項１４に記載の化合物。
【請求項１７】
R^{17}が、水素、メチルまたはエチルである、請求項１４に記載の化合物。
【請求項１８】
R^{16}およびR^{18}の一方が、電子対であり、そして他方が、水素、メチル、シクロプロピルメチル、アリル、３－メチルブト－２－エニル、ピリド－２－イルメチル、３，５－ジメチルイソキサゾール－４－イルメチル、フェニル、１－フェニルエチル、ベンジル、２，６－ジクロロベンジル、２，５－ジフルオロベンジル、２，６－ジフルオロベンジル、２－フルオロ－５－ニトロベンジル、２－フルオロ－４－ニトロベンジル、２－フルオロ－５－アミノベンジルまたは５－［（２－カルボキシエチル）－スルファニルアセチルアミノ］－２－フルオロベンジルである、請求項１４に記載の化合物。
【請求項１９】
一般式ＩＩを有する、請求項１に記載の化合物、またはそれらの溶媒和物、水和物または薬学的に受容可能な塩：
【化５】



II

ここで：
R^1、R^2、R^3、R^4、R^7およびＺは、別個に、請求項１で定義したとおりである；
R^5は、フェニル、ナフチル、チエニル、フラニル、イミダゾリル、オキサゾリル、イソキサゾリル、ピリジル、ピリミジニル、ベンゾチエニル、ベンゾフラニル、ベンズイミダゾリル、キノリニル、イソキノリニル、ピラジニル、ピペリジニルまたはピペラジニルであり、それらのいずれかは、必要に応じて、置換されている；そして
R^6は、水素、$C_{1\sim4}$アルキル、ヒドロキシ、$C_{1\sim4}$アルコキシ、$C_{2\sim4}$アルケニルオキシ、フェノキシ、ベンジルオキシ、ハロ、アミノまたはニトロである、
化合物。
【請求項２０】
R^5が、ナフチル、フェニルまたは置換フェニルであり、該置換フェニルが、$C_{1\sim4}$アルキル、$C_{1\sim4}$アルコキシ、$C_{1\sim4}$ヒドロキシアルキル、$C_{1\sim4}$ハロアルキル、$C_{2\sim4}$アルケニル、（$C_{1\sim4}$アルキル）カルボニル、シアノ、アミノ、モノ（$C_{1\sim4}$）アルキルアミノ、ジ（$C_{1\sim4}$）アルキルアミノ、ホルミル、（$C_{1\sim4}$アルコキシ）

カルボニル、ハロ（$C_{1\sim4}$アルコキシ）カルボニル、フェニル、フェノキシ、フェノキシフェニル、ビフェニル、ハロ、$C_{1\sim4}$ハロアルコキシ、カルボキシ、ニトロ、メチレンジオキソ（－Ｏ－CH_2－Ｏ－）、エチレンジオキソ、$C_{1\sim4}$アルキルスルホニル、$C_{1\sim4}$アルキルスルフィニル、$C_{1\sim4}$アルキルチオ、ヒドロキシ、アミノカルボニル、モノ（$C_{1\sim4}$アルキル）アミノカルボニル、ジ（$C_{1\sim4}$アルキル）アミノカルボニルおよびハロゲン化$C_{1\sim4}$ヒドロキシアルキルからなる群から別個に選択される１個～５個の基で置換されている、請求項１９に記載の化合物。

【請求項２１】

R^5が、フェニル、２－メトキシフェニル、２－メチルフェニル、２－ビニルフェニル、２－ヒドロキシメチルフェニル、２－（１－ヒドロキシエチル）フェニル、２－トリフルオロメチルフェニル、２－ホルミルフェニル、２－ヒドロキシフェニル、２－クロロメチルフェニル、２－アミノ、２－クロロフェニル、３－メトキシフェニル、３－メチルフェニル、３－ホルミルフェニル、３－ヒドロキシメチルフェニル、３－アミノフェニル、３－イソプロピルフェニル、３－エトキシフェニル、３－エトキシカルボニルフェニル、３－メチルカルボニルフェニル、３－カルボキシフェニル、３－ヒドロキシフェニル、３－ニトロフェニル、３－ジメチルアミノカルボニルフェニル、３－トリフルオロメチルフェニル、３－トリフルオロメトキシカルボニルフェニル、４－ビニルフェニル、４－トリフルオロメトキシフェニル、４－メトキシカルボニルフェニル、４－メチルフェニル、４－ヒドロキシメチルフェニル、４－トリフルオロメチルフェニル、４－シアノフェニル、４－エトキシフェニル、４－ジメチルアミノフェニル、ビフェニル、４－フェノキシフェニル、４－クロロメチル、４－メチルスルホニル）フェニル、４－ヒドロキシフェニル、４－フルオロフェニル、２，５－ジメチルフェニル、２，３－ジクロロフェニル、２，３－ジメチルフェニル、２，５－ジクロロフェニル、３，５－ジクロロフェニル、３－ヒドロキシ－４－フェニルフェニル、３，５－ビストリフルオロメチルフェニル、２－ヒドロキシ－５－フェニルフェニル、４－メチル－３－ニトロフェニル、３，４－メチレンジオキソフェニル、３，５－ジメチルフェニル、２，４－ジメトキシフェニル、２－エトキシ－６－メチルフェニル、３－イソプロポキシカルボニル－２－メチルフェニル、３－フルオロ－４－フェニルフェニル、４－ホルミルフェニル、２－カルボキシ－６－メチルフェニル、３－ホルミル－２－メチルフェニル、３－ヒドロキシ－６－メチルフェニル、３－ホルミル－６－メチルフェニル、３－ホルミル－６－ヒドロキシフェニル、３－ホルミル－６－メトキシフェニル、２－アミノ－６－メチルフェニル、３，４－ジメトキシフェニル、３－［（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシ）エチル］フェニル、４－ニトロフェニル、２－フルオロ－４－フェニルフェニル、２，４－ジメトキシフェニル、４－ヒドロキシ－３－ホルミルフェニル、２－トリル－５－モルホリンフェニル、４－メトキシフェニル、３－ヒドロキシアミノメチルフェニル、４－フェニル－アセトアミド、４－ベンズアミド、２，６－ジメチルフェニル、フェノキシフェニル、２－メチル－６－ヒドロキシメチルフェニル、２－メチル－５－ヒドロキシメチルフェニル、２－ヒドロキシ－３－フェニルフェニル、ナフチルまたは４－エトキシカルボニルフェニルである、請求項２０に記載の化合物。

【請求項２２】

R^5が、フェニルであり、該フェニルが、$C_{1\sim4}$アルキル、$C_{1\sim4}$アルコキシ、$C_{1\sim4}$ヒドロキシアルキル、$C_{1\sim4}$ハロアルキル、$C_{2\sim4}$アルケニル、（$C_{1\sim4}$アルキル）カルボニル、シアノ、アミノ、モノ（$C_{1\sim4}$）アルキルアミノ、ジ（$C_{1\sim4}$）アルキルアミノ、ホルミル、（$C_{1\sim4}$アルコキシ）カルボニル、ハロ（$C_{1\sim4}$アルコキシ）カルボニル、フェニル、フェノキシ、フェノキシフェニル、ビフェニル、ハロ、$C_{1\sim4}$ハロアルコキシ、カルボキシ、ニトロ、メチレンジオキソ（－Ｏ－CH_2－Ｏ－）、エチレンジオキソ、$C_{1\sim4}$アルキルスルホニル、$C_{1\sim4}$アルキルスルフィニル、$C_{1\sim4}$アルキルチオ、ヒドロキシ、アミノカルボニル、モノ（$C_{1\sim4}$アルキル）アミノカルボニル、ジ（$C_{1\sim4}$アルキル）アミノカルボニル、ハロゲン化$C_{1\sim4}$ヒドロキシアルキル、カルボキシ（$C_{1\sim4}$）アルコキシ（$C_{1\sim4}$）アルキル、カルボキシ（C_1

～４）アルコキシ、Ｃ１～４アルキルチオ（Ｃ１～４）アルキル、ホスホノ（Ｃ２～４）アルケニル、ホスホノ（Ｃ１～４）アルキルアミノ、Ｃ１～４）ハロアルキルスルホニルアミノ、ホスホノ（Ｃ１～４）アルコキシ、Ｃ１～４アルキルスルホニルアミノ、カルボキシ（Ｃ１～４アルキルアミノ、モルホリニル（Ｃ１～４）アルキル、モルホリニル、モルホリニル（Ｃ１～４）アルキルアミノカルボニル、ピペラジニル（Ｃ１～４）アルキルまたはピペラジニル、ホルミルアミノ、モルホリニル（Ｃ１～４）アルキルアミノ、必要に応じて置換したアルキルカルボニルアミノ、必要に応じて置換したウレイドおよび必要に応じて置換したグアニジノからなる群から別個に選択される１個～３個の基で置換されており、ここで、Ｃ１～４アルキルチオの該アルキル部分が、必要に応じて、１個または２個のカルボキシ基で置換されており、ここで、該ピペラジニル（Ｃ１～４）アルキルまたはピペラジニルのいずれかが、必要に応じて、メチルまたはエチルでＮ－置換されており、ここで、該必要に応じて置換したアルキルカルボニルアミノが、式－Ｎ（Ｈ）－Ｃ（Ｏ）－Ｃ（Ｈ）（Ｗ^{1}）－Ｙ^{1a}－Ｘ^{1}－Ｙ^{1b}－Ｚ^{1}を有する、請求項１９に記載の化合物であって、ここで：

Ｗ^{1}は、水素またはアミノである；

Ｙ^{1a}は、直接共有結合、またはＣ１～１０直鎖または分枝アルカンのα，ω－ジラジカルである；

Ｘ^{1}は、ＯまたはＳであるか、または直接共有結合である；

ｙ^{1b}は、Ｃ１～１０直鎖または分枝アルカンのα，ω－ジラジカルであり、必要に応じて、カルボキシ基またはアミノ基で置換されている；そして

Ｚ^{1}は、カルバモイル、カルボキシ、Ｃ１～６アルキルスルホニル、（Ｃ１～６アルコキシ）カルボニル、Ｃ２～６アルカノイルアミノ、スルホ、ホスホノ、フェニル、アミノスルホニル、アミノ、Ｃ１～６ハロアルキルスルホニルアミノ、ホルミルアミノ、Ｃ１～６アルキルアミノ、Ｃ１～６アルキルアミノスルホニル、Ｃ１～６アルキルスルホニルアミノまたは２－オキソ－ヘキサヒドロ－チエノ［３，４－ｄ］イミダゾール－６－イル－（Ｃ１～６アルキル）カルボニルアミノである；または

Ｗ^{1}は、水素であり、そしてＹ^{1a}－Ｘ^{1}－Ｙ^{1b}－Ｚ^{1}は、水素、ハロ、アミノまたはトリ－（Ｃ１～４アルキル）アンモニオである；

但し、もし、Ｙ^{1a}が直接共有結合であり、そしてＸが、ＯまたはＳであるなら、Ｗ^{1}は、水素である；

ここで、該必要に応じて置換したウレイドは、式－Ｎ（Ｌ^{1}）－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（Ｌ^{2}）－Ｙ^{2a}－Ｘ^{2}－Ｙ^{2b}－Ｚ^{2}を有し、ここで：

Ｌ^{1}およびＬ^{2}は、両方とも水素であるか、またはＬ^{1}およびＬ^{2}は、一緒になって、エチレンまたはトリメチレンを表わす；

Ｙ^{2a}は、直接共有結合、またはＣ１～１０直鎖または分枝アルカンのα，ω－ジラジカルである；

Ｘ^{2}は、ＯまたはＳであるか、または直接共有結合である；

Ｙ^{2b}は、Ｃ１～１０直鎖または分枝アルカンのα，ω－ジラジカルであり、必要に応じて、カルボキシ基で置換されている；そして

Ｚ^{2}は、カルボキシ、（Ｃ１～６アルコキシ）カルボニル、フェノキシ、カルボキシフェノキシ、Ｃ１～６アルキルスルホニル、フェニル、ベンジルオキシカルボニルアミノ、アミノ、Ｃ１～４アルキルアミノ、ハロフェニル、インドリル、ジフェニルメチル、フェニルスルホニルアミノ、Ｎ’－（カルボキシ（Ｃ１～４）アルキル）ウレイド、テトラゾリル、ホスホノまたはフェニルアミノである；または、

Ｙ^{2a}－Ｘ^{2}－Ｙ^{2b}－Ｚ^{2}は、Ｃ１～４アルキルスルホニルまたは－（ＣＨ$_{2}$ＣＨ$_{2}$－Ｏ－）$_{m}$－（ＣＨ$_{2}$）$_{n}$－Ｃ（Ｏ）ＯＲを表わし、ここで、ｍは、２～６の整数であり、ｎは、２～４の整数であり、そしてＲは、水素またはＣ１～４アルキルである；そして

ここで、該必要に応じて置換したグアニジノは、式－Ｎ（Ｌ^{3}）－Ｃ（＝ＮＬ^{4}）－Ｎ（Ｌ^{5}）－Ｚ^{3}を有し、ここで：

Ｌ^{3}は、水素またはＣ１～４アルキルである；

L^4およびL^5は、両方とも水素であるか、またはL^4およびL^5は、一緒になって、エチレンを表わす；そして

Z^3は、水素、$C_{1\sim6}$アルキル、フェニル（$C_{1\sim6}$）アルキル、カルボキシ（$C_{1\sim6}$）アルキル、$C_{1\sim4}$アルコキシ、（$C_{1\sim4}$アルキル）カルボニルまたは$C_{1\sim4}$アルキルスルホニル（$C_{1\sim6}$）アルキルである、

化合物。

【請求項２３】

R^5が、フェニルであり、該フェニルが、２’－位置で、メチルで置換されており、そして４’－位置で、必要に応じて置換したグアニジノで置換されている、請求項２２に記載の化合物。

【請求項２４】

R^5が、フェニルであり、該フェニルが、２’－位置で、メチルで置換されており、４’－位置で、必要に応じて置換したグアニジノで置換されており、そして６’－位置で、必要に応じて置換したアルキルカルボニルアミノまたは必要に応じて置換したウレイドで置換されている、請求項２２に記載の化合物。

【請求項２５】

R^5が、フェニルであり、該フェニルが、２’－位置で、メチルで置換されており、そして６’－位置で、必要に応じて置換したアルキルカルボニルアミノまたは必要に応じて置換したウレイドで置換されている、請求項２２に記載の化合物。

【請求項２６】

R^2、R^3およびR^4が、水素である、請求項２２に記載の化合物。

【請求項２７】

R^6が、水素である、請求項２２に記載の化合物。

【請求項２８】

R^7が、水素である、請求項２２に記載の化合物。

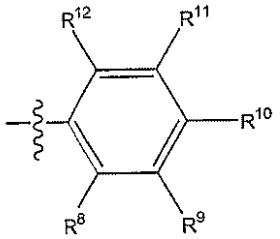
【請求項２９】

Zが、－SO_2－である、請求項２２に記載の化合物。

【請求項３０】

R^5が、式ＩＩＡを有する、請求項２２に記載の化合物：

【化６】



ここで：

R^8は、水素またはメチルである；

R^9は、水素、ホルミルアミノまたはカルバモイルである；

R^{10}は、メトキシ、ヒドロキシ、カルボキシメトキシ、ホスホノメチルアミノ、トリフルオロメタンスルホニルアミノ、ホスホノメトキシ、カルボキシメチルアミノ、アミノ、クロロ、フルオロ、２－（モルホリン－４－イル）－エチルアミノ、カルボキシ、カルバモイル、（１，２－ジカルボキシエチル）－スルファニルアセチルアミノ、カルボキシメトキシアセチルアミノ、４－アミノ－４－カルボキシブチリルアミノ、６－［５－（２－オキソ－ヘキサヒドロ－チエノ［３，４－ｄ］イミダゾール－６－イル）－ペンタノイルアミノ］－ヘキサノイルアミノ、ブロモアセチルアミノ、２－アミノ－４－カルボキシブチリルアミノ、トリエチルアンモニオアセチルアミノ、２－アミノ－４－メタンスルホニルブチリルアミノ、アミノアセチルアミノ、カルバモイルメチルスルファニルアセチル

アミノ、３－ホスホノプロピオニルアミノ、ウレイド、Ｎ’－（５－カルボキシペンチル）－ウレイド、Ｎ’－（５－エトキシカルボニルペンチル）－ウレイド、Ｎ’－（３－メタンスルホニルプロピル）－ウレイド、グアニジノ、Ｎ’－（３－フェニルプロピル）－グアニジノ、Ｎ’－（２－フェニルエチル）－グアニジノ、Ｎ’－（３－メチルブチル）－グアニジノ、Ｎ’－アセチルグアニジノ、Ｎ’－（４－メタンスルホニルブチル）－グアニジノ、Ｎ’－（３－メタンスルホニルプロピル）グアニジノ、Ｎ’－（６－メタンスルホニルヘキシル）－グアニジノ、Ｎ’－（５－メタンスルホニルペンチル）－グアニジノ、Ｎ’－メトキシグアニジノ、Ｎ－メチルグアニジノ、Ｎ’－ヘキシルグアニジノ、Ｎ’－（５－カルボキシペンチル）－グアニジノまたは４，５－ジヒドロ－１Ｈ－イミダゾール－２－イルアミノである；

R^{11}は、水素、３－（モルホリン－４－イル）－プロピルアミノカルボニルまたはカルボキシメトキシメチルである；そして

R^{12}は、カルボキシメトキシメチル、２－カルボキシエトキシメチル、ニトロ、アミノ、メチル、（１，２－ジカルボキシエチル）－スルファニルメチル、２－ホスホノビニル、モルホリン－４－イルメチル、４－メチルピペラジン－１－イルメチル、モルホリン－４－イル、ホルミルアミノ、メタンスルホニルアミノ、カルボキシメチルアミノ、３－（モルホリン－４－イル）－プロピルアミノカルボニル、クロロ、アセチルアミノ、カルバモイルメチルスルファニルアセチルアミノ、（２－カルボキシエチル）－スルファニルアセチルアミノ、４－メタンスルホニルブチリルアミノ、（１，２－ジカルボキシエチル）－スルファニルアセチルアミノ、メトキシカルボニルメトキシアセチルアミノ、カルボキシメトキシアセチルアミノ、ブロモアセチルアミノ、４－カルボキシブチリルアミノ、カルバモイルメトキシアセチルアミノ、（２－アセチルアミノ－２－カルボキシ－１，１－ジメチルエチル）－スルファニルアセチルアミノ、（２－スルホエチル）－スルファニルアセチルアミノ、（２－メトキシカルボニルエチル）－スルファニルアセチルアミノ、（２－アセチルアミノ－２－カルボキシエチル）－スルファニルアセチルアミノ、メタンスルホニルアセチルアミノ、６－メタンスルホニルヘキサノイルアミノ、３－メタンスルホニルプロピオニルアミノ、２－メタンスルホニルプロピオニルアミノ、ベンジルスルファニルアセチルアミノ、４－アミノスルホニルブチリルアミノ、１１－アミノウンデカノイルアミノ、４－トリフルオロメタンスルホニルアミノブチリルアミノ、５－カルボキシバレリルアミノ、カルボキシアセチルアミノ、３－カルボキシプロピオニルアミノ、１１－カルボキシウンデカノイルアミノ、５－メトキシカルボニルバレリルアミノ、Ｎ’－エトキシカルボニルメチルウレイド、Ｎ’－カルボキシメチルウレイド、Ｎ’－［５－（４－カルボキシフェノキシ）－ペンチル］－ウレイド、Ｎ’－（２－メタンスルホニルエチル）－ウレイド、Ｎ’－（５－カルボキシペンチル）－ウレイド、Ｎ’－（２－［２－｛２－（２－カルボキシエトキシ）－エトキシ｝－エトキシ］－エトキシエチル）－ウレイド、Ｎ’－メタンスルホニルウレイド、Ｎ’－（４－メタンスルホニルブチル）－ウレイド、Ｎ’－（３－フェニルプロピル）－ウレイド、Ｎ’－ベンジルウレイド、Ｎ’－（１－カルボキシ－２－フェニルエチル）－ウレイド、Ｎ’－（５－ベンジルオキシカルボニルアミノ－５－カルボキシペンチル）－ウレイド、Ｎ’－（２－フェニルエチル）－ウレイド、Ｎ’－（５－アミノ－５－カルボキシペンチル）－ウレイド、Ｎ－［２－（４－ブロモフェニル）－エチル］－ウレイド、Ｎ’－［２－（インドール－３－イル）－エチル］－ウレイド、Ｎ’－（３，３－ジフェニルプロピル）－ウレイド、Ｎ’－（２－フェニルスルホニルアミノエチル）－ウレイド、Ｎ’－（２－メタンスルホニルアミノエチル）－ウレイド、Ｎ’－［２－（Ｎ’－カルボキシメチルウレイド）－エチル］－ウレイド、Ｎ’－［２－（２Ｈ－テトラゾール－５－イル）－エチル］－ウレイド、Ｎ’－［４－（２Ｈ－テトラゾール－５－イル）－ブチル］－ウレイド、Ｎ’－［５－（２Ｈ－テトラゾール－５－イル）－ペンチル］－ウレイド、Ｎ’－（５－ホスホノペンチル）－ウレイド、Ｎ’－（５－エトキシカルボニルペンチル）－ウレイド、Ｎ’－（３－メタンスルホニルプロピル）－ウレイド、Ｎ’－（２－フェニルアミノエチル）－ウレイドまたは２－オキソ－イミダゾリジン－１－イルである、

化合物。
【請求項３１】
R^5が、チエニル、フラニル、イミダゾリル、オキサゾリル、イソキサゾリル、ピリジル、ピリミジニル、ベンゾチエニル、ベンゾフラニル、ジベンゾフラニル、ベンズイミダゾリル、キノリニル、イソキノリニル、インドリルまたはピラジニルであり、必要に応じて、$C_{1\sim4}$アルキル、$C_{1\sim4}$アルコキシ、$C_{1\sim4}$ヒドロキシアルキル、$C_{1\sim4}$ハロアルキル、$C_{2\sim4}$アルケニル、ホルミル、（$C_{1\sim4}$アルコキシ）カルボニル、フェニル、$C_{1\sim4}$アルキルフェニル、フェノキシ、ハロ、$C_{1\sim4}$ハロアルコキシ、カルボキシ、ヒドロキシ、ニトロ、アミノ、$C_{1\sim4}$アルキルスルホニル（$C_{1\sim4}$アルキル）ウレイド、スルホ（$C_{1\sim4}$）アルキル、トリメチルシラニル（$C_{1\sim4}$）アルコキシ（$C_{1\sim4}$）アルキルおよび$C_{1\sim4}$アルコキシ（$C_{1\sim4}$）アルキルからなる群から選択される１個または２個の基で置換されている、請求項１９に記載の化合物。
【請求項３２】
R^5が、チエン－３－イル、キノリン－７－イル、３，５－ジメチルイソキサゾール－４－イル、５－クロロチエン－２－イル、ピリド－３－イル、ピリミジン－４－イル、キノリン－３－イル、ベンゾチエン－２－イル、ベンゾフラン－２－イル、フラン－２－イル、フラン－３－イル、４－メチルピリド－３－イル、３－メチル－ピリド－２－イル、６－メチルベンズイミダゾール－５－イル、ベンズイミダゾール－６－イル、１－メチル－４－（２’－メチルフェニル）ベンズイミダゾール－６－イル、２－メチル－４－（２’－メチルフェニル）ベンズイミダゾール－６－イル、ジベンゾフラン－２－イル、２－メチルイミダゾリル、６－エトキシ－ベンゾチアゾリル、６－メチル－ピリド－３－イル、６－クロロ－ピリド－３－イルまたは３－クロロ－ピリド－２－イルである、請求項３１に記載の化合物。
【請求項３３】
R^5が、３－メチル－５－ニトロピリド－２－イル、５－アミノ－３－メチルピリド－２－イル、４－メチルピリミジン－５－イル、３－メチルピリド－２－イル、２－クロロピリド－３－イル、６－ホルミルピリド－２－イル、３－メチル－５－［Ｎ’－（３－メタンスルホニルプロプ－１－イル）］－ウレイドピリド－２－イル、３－メチル－ピリド－４－イル、３－アミノ－５－メチル－ピリド－４－イル、３－クロロ－５－トリフルオロメチルピリド－２－イル、１Ｈ－ベンズイミダゾール－２－イル、１－メチル－１Ｈ－ベンズイミダゾール－２－イル、３－メチル－３Ｈ－イミダゾール－４－イル、１Ｈ－イミダゾール－２－イル、１－メチル－１Ｈ－イミダゾール－２－イル、１－エチル－１Ｈ－ベンズイミダゾール－２－イル、２，５－ジメチル－１Ｈ－イミダゾール－４－イル、１－（３－スルホプロプ－１－イル）－１Ｈ－ベンズイミダゾール－２－イル、３－メチルピラジン－２－イル、５－メチル－１－（２－トリメチルシラニル－エトキシメチル）－１Ｈ－ベンズイミダゾール－４－イル、５－メチル－１Ｈ－ベンズイミダゾール－４－イル、１－メチル－１Ｈ－ベンズイミダゾール－５－イル、２－メトキシメチル－６－メチル－１Ｈ－ベンズイミダゾール－５－イル、２，６－ジメチル－１Ｈ－ベンズイミダゾール－５－イルまたは１，６－ジメチル－１Ｈ－ベンズイミダゾール－５－イルである、請求項３１に記載の化合物。
【請求項３４】
R^5が、－ＮＲ^{a}Ｒ^{b}であり、ここで、Ｒ^{a}およびＲ^{b}が、別個に、$C_{1\sim6}$アルキルであるか、またはＲ^{a}およびＲ^{b}が、それらが結合する窒素原子と一緒になって、環を形成し、該環が、ピペリジニル、ピロリジニル、ピペラジニル、イミダゾリジニル、ピラゾリジニルおよびモルホリニルからなる群から選択され、ここで、該環が、必要に応じて、１個または２個の$C_{1\sim4}$アルキル基で置換されている、請求項１９に記載の化合物。
【請求項３５】
R^5が、ピペリジン－１－イルまたは４－メチルピペラジン－１－イルである、請求項３４に記載の化合物。
【請求項３６】

R^6が、水素、メチル、ハロ、アミノ、メトキシ、エトキシ、ビニルオキシ、ヒドロキシまたはベンジルオキシである、請求項１に記載の化合物。
【請求項３７】
R^1が、ブロモ、メチルチオ、エチルチオまたはプロプ－２－エン－１－イルチオである、請求項１に記載の化合物。
【請求項３８】
R^1が、ブロモまたはメチルチオである、請求項３７に記載の化合物。
【請求項３９】
R^1が、メチルチオである、請求項３８に記載の化合物。
【請求項４０】
Ｚが、SO_2である、請求項１に記載の化合物。
【請求項４１】
Ｚが、ＳＯである、請求項１に記載の化合物。
【請求項４２】
R^2、R^3およびR^4が、別個に、水素、$C_{1\sim6}$アルキル、アミノ、シアノ、ニトロ、$C_{1\sim4}$アルコキシまたはヒドロキシである、請求項１に記載の化合物。
【請求項４３】
R^2、R^3およびR^4が、全て、水素である、請求項４２に記載の化合物。
【請求項４４】
R^2、R^3およびR^4が、別個に、水素、メチル、エチル、プロピル、ｎ－ブチル、ヒドロキシ、メトキシまたはエトキシである、請求項４２に記載の化合物。
【請求項４５】
R^2、R^3およびR^4が、$-CO_2R^w$であり、ここで、R^wが、各場合において、好ましくは、$C_{1\sim4}$アルキル、$C_{4\sim7}$シクロアルキルまたはベンジルである、請求項１に記載の化合物。
【請求項４６】
R^2、R^3およびR^4が、別個に、水素、メチル、エチル、プロピル、ｎ－ブチル、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、シアノ、$-CO_2CH_3$、$-CO_2CH_2CH_3$または$-CO_2CH_2CH_2CH_3$である、請求項４５に記載の化合物。
【請求項４７】
R^7が、水素である、請求項１に記載の化合物。
【請求項４８】
以下からなる群から選択される化合物；およびそれらの薬学的に受容可能な塩またはプロドラッグ：
４－［４’－（Ｎ’－ヘキシル－グアニジノ）－２’－メチル－ビフェニル－３－スルホニル］－５－メチルスルファニル－チオフェン－２－カルボキサミジントリフルオロアセテート；
４－｛４’－［Ｎ’－（４－メタンスルホニル－ブチル）－グアニジノ］－２’－メチル－ビフェニル－３－スルホニル｝－５－メチルスルファニル－チオフェン－２－カルボキサミジントリフルオロアセテート；
４－｛４’－［Ｎ’－（３－メタンスルホニル－プロピル）－グアニジノ］－２’－メチル－ビフェニル－３－スルホニル｝－５－メチルスルファニル－チオフェン－２－カルボキサミジントリフルオロアセテート；
４－｛４’－［Ｎ’－（６－メタンスルホニル－ヘキシル）－グアニジノ］－２’－メチル－ビフェニル－３－スルホニル｝－５－メチルスルファニル－チオフェン－２－カルボキサミジントリフルオロアセテート；
４－｛４’－［Ｎ’－（５－メタンスルホニル－ペンチル）－グアニジノ］－２’－メチル－ビフェニル－３－スルホニル｝－５－メチルスルファニル－チオフェン－２－カルボキサミジントリフルオロアセテート；
４－［４’－（Ｎ'－アセチル－グアニジノ）－２’－メチル－ビフェニル－３－スル

ホニル］－５－メチルスルファニル－チオフェン－２－カルボキサミジントリフルオロアセテート；
４－｛４’－グアニジノ－２’－［３－（４－メタンスルホニル－ブチル）－ウレイド］－６’－メチル－ビフェニル－３－スルホニル｝－５－メチルスルファニル－チオフェン－２－カルボキサミジントリフルオロアセテート；
４－［４’－（４，５－ジヒドロ－１Ｈ－イミダゾール－２－イルアミノ）－２’－メチル－ビフェニル－３－スルホニル］－５－メチルスルファニル－チオフェン－２－カルボキサミジンビス－トリフルオロアセテート；
４－（４’－グアニジノ－２’－メチル－６’－ニトロ－ビフェニル－３－スルホニル）－５－メチルスルファニル－チオフェン－２－カルボキサミジンビス－トリフルオロアセテート；
４－（６’－アミノ－４’－グアニジノ－２’－メチル－ビフェニル－３－スルホニル）－５－メチルスルファニル－チオフェン－２－カルボキサミジンビス－トリフルオロアセテート；
３－｛［３’－（５－カルバムイミドイル－２－メチルスルファニル－チオフェン－３－スルホニル）－４－グアニジノ－６－メチル－ビフェニル－２－イルカルバモイル］－メチルスルファニル｝－プロピオン酸メチルエステルビス－トリフルオロアセテート；
３－｛［３’－（５－カルバムイミドイル－２－メチルスルファニル－チオフェン－３－スルホニル）－４－グアニジノ－６－メチル－ビフェニル－２－イルカルバモイル］－メチルスルファニル｝－プロピオン酸ビス－トリフルオロアセテート；
６－｛３－［３’－（５－カルバムイミドイル－２－メチルスルファニル－チオフェン－３－スルホニル）－４－グアニジノ－ビフェニル－２－イル］－ウレイド｝－ヘキサン酸；
Ｎ－［３’－（５－カルバムイミドイル－２－メチルスルファニル－チオフェン－３－スルホニル）－４－グアニジノ－６－メチル－ビフェニル－２－イル］－４－メタンスルホニル－ブチルアミドビス－トリフルオロアセテート；
５－［３’－（５－カルバムイミドイル－２－メチルスルファニル－チオフェン－３－スルホニル）－４－グアニジノ－６－メチル－ビフェニル－２－イルカルバモイル］－ペンタン酸ビス－トリフルオロアセテート；
４－［２’－メチル－４’－（Ｎ－メチル－グアニジノ）－ビフェニル－３－スルホニル］－５－メチルスルファニル－チオフェン－２－カルボキサミジンビス－トリフルオロアセテート；
６－｛Ｎ’－［３’－（５－カルバムイミドイル－２－メチルスルファニル－チオフェン－３－スルホニル）－２－メチル－ビフェニル－４－イル］－グアニジノ｝－ヘキサン酸；
４－｛２’－メチル－４’－［Ｎ’－（３－フェニル－プロピル）－グアニジノ］－ビフェニル－３－スルホニル｝－５－メチルスルファニル－チオフェン－２－カルボキサミジンビストリフルオロアセテート；
４－［２’－メチル－４’－（Ｎ’－フェネチル－グアニジノ）－ビフェニル－３－スルホニル］－５－メチルスルファニル－チオフェン－２－カルボキサミジンビストリフルオロアセテート；
４－｛２’－メチル－４’－［Ｎ’－（３－メチル－ブチル）－グアニジノ］－ビフェニル－３－スルホニル｝－５－メチルスルファニル－チオフェン－２－カルボキサミジンビストリフルオロアセテート；
４－（５－｛３－［３’－（５－カルバムイミドイル－２－メチルスルファニル－チオフェン－３－スルホニル）－４－グアニジノ－６－メチル－ビフェニル－２－イル］－ウレイド｝－ペンチルオキシ）－安息香酸ビストリフルオロアセテート；
１１－［３’－（５－カルバムイミドイル－２－メチルスルファニル－チオフェン－３－スルホニル）－４－グアニジノ－６－メチル－ビフェニル－２－イルカルバモイル］－ウンデカン酸ビス－トリフルオロアセテート；

４－（４’－グアニジノ－２’－メチル－ビフェニル－３－スルホニル）－５－メチルスルファニル－チオフェン－２－カルボキサミジンビス－トリフルオロアセテート；
４－［２’－メチル－４’－（Ｎ'－メトキシ１－グアニジノ）－ビフェニル－３－スルホニル］－５－メチルスルファニル－チオフェン－２－カルボキサミジンビス－トリフルオロアセテート。