

【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24年3月8日(2012.3.8)

【公表番号】特表2010-515689(P2010-515689A)

【公表日】平成22年5月13日(2010.5.13)

【年通号数】公開・登録公報2010-019

【出願番号】特願2009-544989(P2009-544989)

【国際特許分類】

C 07 D 401/10	(2006.01)
C 07 D 409/12	(2006.01)
A 61 K 31/496	(2006.01)
A 61 P 43/00	(2006.01)
A 61 P 9/10	(2006.01)
A 61 P 7/02	(2006.01)
C 07 D 409/14	(2006.01)
A 61 K 31/506	(2006.01)
A 61 K 31/501	(2006.01)
A 61 K 31/551	(2006.01)
A 61 K 31/4192	(2006.01)
A 61 K 31/4439	(2006.01)
C 07 D 413/14	(2006.01)
A 61 K 31/444	(2006.01)
A 61 K 31/4178	(2006.01)
A 61 K 31/497	(2006.01)
A 61 K 31/4545	(2006.01)
A 61 K 31/5377	(2006.01)
C 07 D 473/04	(2006.01)
A 61 K 31/522	(2006.01)
A 61 K 31/538	(2006.01)
A 61 K 31/55	(2006.01)

【F I】

C 07 D 401/10			
C 07 D 409/12	C S P		
A 61 K 31/496			
A 61 P 43/00	1 1 1		
A 61 P 43/00	1 2 3		
A 61 P 9/10	1 0 3		
A 61 P 9/10			
A 61 P 7/02			
C 07 D 409/14			
A 61 K 31/506			
A 61 K 31/501			
A 61 K 31/551			
A 61 K 31/4192			
A 61 K 31/4439			
C 07 D 413/14			
A 61 K 31/444			
A 61 K 31/4178			
A 61 K 31/497			

A 6 1 K 31/4545  
A 6 1 K 31/5377  
C 0 7 D 473/04  
A 6 1 K 31/522  
A 6 1 K 31/538  
A 6 1 K 31/55

## 【手続補正書】

【提出日】平成22年12月28日(2010.12.28)

## 【手続補正1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0045

【補正方法】変更

## 【補正の内容】

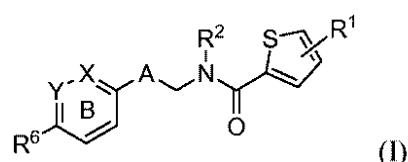
## 【0045】

本発明はさらに、血液試料を本発明の化合物に接触させることを含む前記血液試料の凝固を阻止する方法を提供する。

本発明は、例えば以下の項目を提供する。

(項目1)

式(I)の化合物または薬剤として許容されるその塩、エステルもしくはプロドラッグ

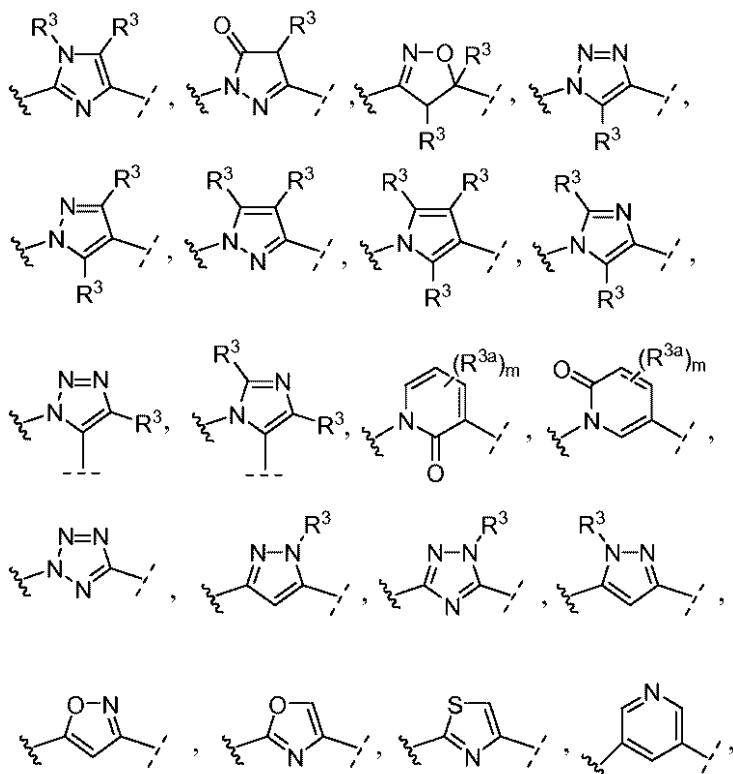
【化104】(式中、

R<sup>1</sup>は、ハロゲン、C<sub>1</sub>～<sub>8</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～<sub>8</sub>アルケニルおよびC<sub>2</sub>～<sub>8</sub>アルキニルからなる群から選択され、

R<sup>2</sup>は水素またはC<sub>1</sub>～<sub>4</sub>アルキルであり、

Aは

【化 1 0 5】



からなる群から選択され、ここで、波線は環 B との結合点を示し、点線は分子の残りの部分との結合点を示し、

$R^3$  は、独立に、水素または  $R^3$  a であり、

$R^3$  は、ハロゲン、 $C_{1\sim 8}$  アルキル、 $C_{2\sim 8}$  アルケニルおよび $C_{2\sim 8}$  アルキニルからなる群から独立に選択され、

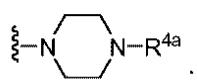
m は、0、1、2 または 3 であり、

XはC-R<sup>4</sup>もしくはNであるか、またはXとYはCであり、縮合して6員のアリール、ヘテロアリールまたは複素環を形成しており、

YはC-R<sup>5</sup>またはNであり、ただし、XとYはどちらもがNであることはなく、

R<sup>4</sup> は、水素、八日根、および

【化 1 0 6】



からなる群から選択され、

$R^4$  は水素または  $C_{1-8}$  アルキルであり、

R<sup>5</sup> は、水素、ハロゲンおよび C<sub>1</sub>~。アルコキシからなる群から選択されるか、または

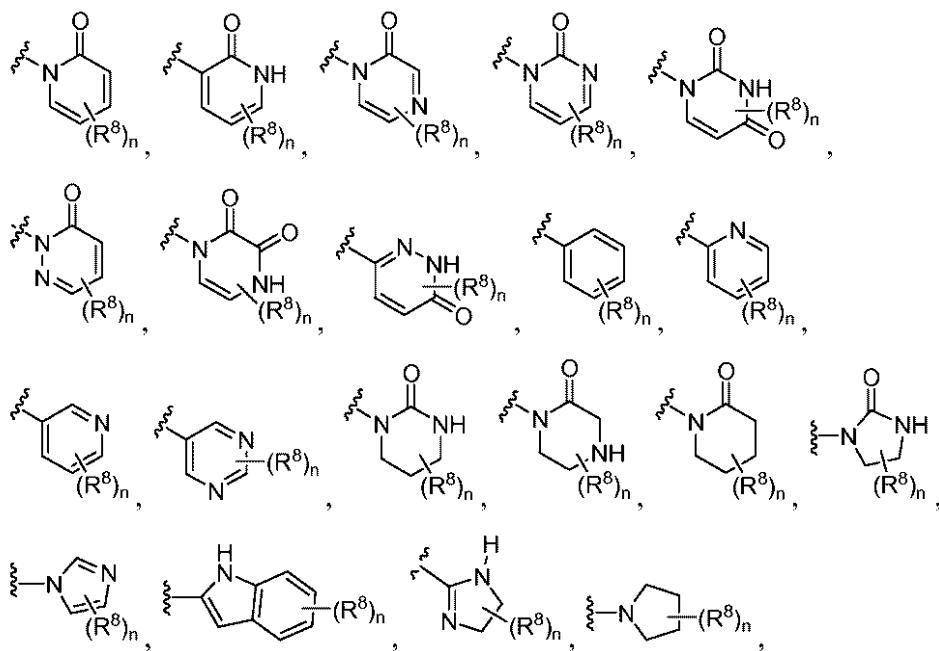
$R^5$  と  $R^6$  は一緒に結合して環 B と縮合した 6 員のアリール、ヘテロアリールまたは複素環を形成しており、

R<sup>6</sup> は、 - R<sup>6</sup><sub>a</sub>、 - N R<sup>7</sup><sub>a</sub> R<sup>7</sup><sub>b</sub>、 - N R<sup>7</sup><sub>a</sub> C (O) R<sup>7</sup><sub>c</sub>、 - N R<sup>7</sup><sub>a</sub> C (O)  
 OR<sup>7</sup><sub>c</sub>、 - C O N R<sup>8</sup><sub>a</sub> R<sup>8</sup><sub>b</sub>、 - O R<sup>7</sup><sub>c</sub>、 - S R<sup>7</sup><sub>c</sub>、 - C (= N R<sup>7</sup><sub>a</sub>) N R<sup>8</sup>

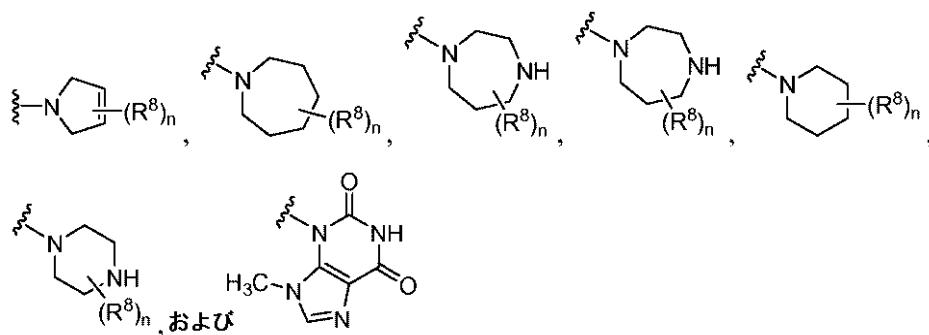
<sup>a</sup> R<sup>8</sup><sup>b</sup>、- S(0)<sub>2</sub>NR<sup>8</sup><sup>a</sup>R<sup>8</sup><sup>b</sup>および-S(0)<sub>2</sub>R<sup>7</sup><sup>c</sup>からなる群から選択され、

R<sup>6</sup>a は

## 【化107】



## 【化108】



からなる群から選択され、ここで、R<sup>8</sup>は置換基に適した任意の位置であってよく、R<sup>8</sup>が窒素原子と結合している場合、R<sup>8</sup>は該窒素原子に結合している水素原子を置換し、R<sup>7a</sup>およびR<sup>7b</sup>は、水素、C<sub>1~8</sub>アルキル、および1~3個のR<sup>9</sup>で置換されたC<sub>1~8</sub>アルキルからなる群から独立に選択され、

R<sup>7c</sup>は、アリール、ヘテロアリール、C<sub>1~8</sub>アルキル、1~3個のR<sup>9</sup>で置換されたC<sub>1~8</sub>アルキルからなる群から選択され、

R<sup>8</sup>は、ニトロ、ヒドロキシ、-CO<sub>2</sub>H、-C(O)R<sup>8c</sup>、-C(O)NR<sup>8a</sup>R<sup>8b</sup>、-NR<sup>8a</sup>R<sup>8b</sup>、-SO<sub>2</sub>NR<sup>8a</sup>R<sup>8b</sup>、ハロゲン、C<sub>1~8</sub>アルキルおよびC<sub>1~8</sub>アルコキシからなる群から独立に選択され、前記C<sub>1~8</sub>アルキルおよびC<sub>1~8</sub>アルコキシは1~3個のR<sup>9</sup>で任意選択で置換されており、

R<sup>8a</sup>およびR<sup>8b</sup>は、水素、C<sub>1~8</sub>アルキル、および1~3個のR<sup>9</sup>で置換されたC<sub>1~8</sub>アルキルからなる群から独立に選択されるか、またはR<sup>8a</sup>とR<sup>8b</sup>は一緒に、1~3個のR<sup>9</sup>で任意選択で置換されかつN、OもしくはSから選択される1つの追加の環ヘテロ原子を任意選択で有する5~7員複素環を形成しており、

R<sup>8c</sup>は、C<sub>1~8</sub>アルキル、および1~3個のR<sup>9</sup>で置換されたC<sub>1~8</sub>アルキルからなる群から選択され、

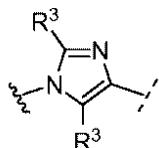
R<sup>9</sup>は、ハロゲン、複素環、ヘテロアリール、-OH、-R<sup>10</sup>、-OR<sup>10</sup>、-SR<sup>10</sup>、-S(O)R<sup>10</sup>、-S(O)<sub>2</sub>R<sup>10</sup>、-SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、-C(O)NH<sub>2</sub>、-C

(O) R<sup>1</sup>、-C(NH)R<sup>1</sup>、-NHC(O)R<sup>1</sup>、-NHC(NH)R<sup>1</sup>、-NHC(O)NH<sub>2</sub>、-CO<sub>2</sub>H、-NH<sub>2</sub>、-NHR<sup>1</sup>、-N(R<sup>1</sup>)<sub>2</sub> および -N(R<sup>1</sup>)<sub>3</sub> からなる群から独立に選択され、

各 R<sup>1</sup> は、独立に、C<sub>1</sub>~<sub>6</sub> アルキルであり、

n は、0、1、2 または 3 であり、

ただし、X が C-R<sup>4</sup> であり、Y が C-R<sup>5</sup> であり、R<sup>6</sup> が R<sup>6a</sup> であり、A が  
【化109】



である場合、R<sup>6a</sup> は炭素原子を介して環Bと結合している)。

(項目2)

R<sup>1</sup> が 2-クロロである、項目1に記載の化合物。

(項目3)

R<sup>2</sup> が水素である、項目1に記載の化合物。

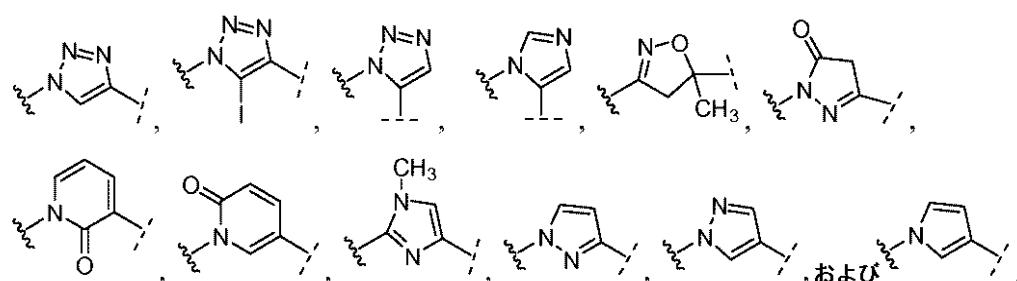
(項目4)

X および Y が CH である、項目1に記載の化合物。

(項目5)

A が

【化110】



からなる群から選択される、項目1に記載の化合物。

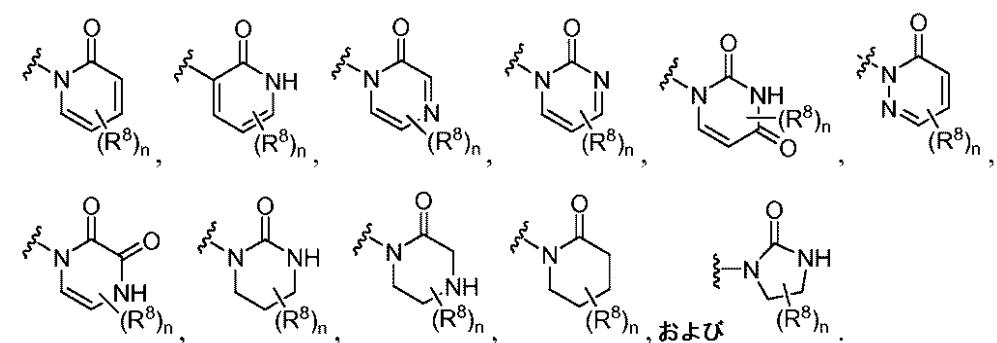
(項目6)

R<sup>6</sup> が R<sup>6a</sup> である、項目1に記載の化合物。

(項目7)

R<sup>6a</sup> が

【化111】

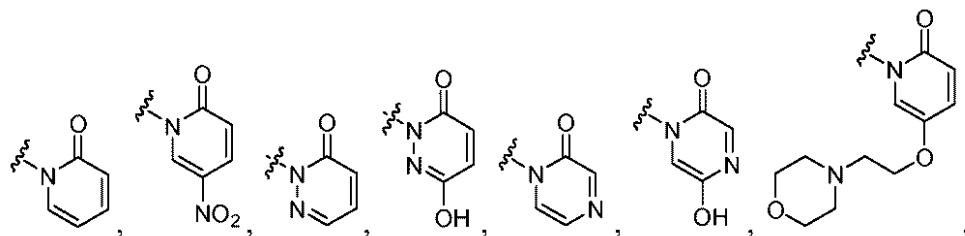


からなる群から選択される、項目6に記載の化合物。

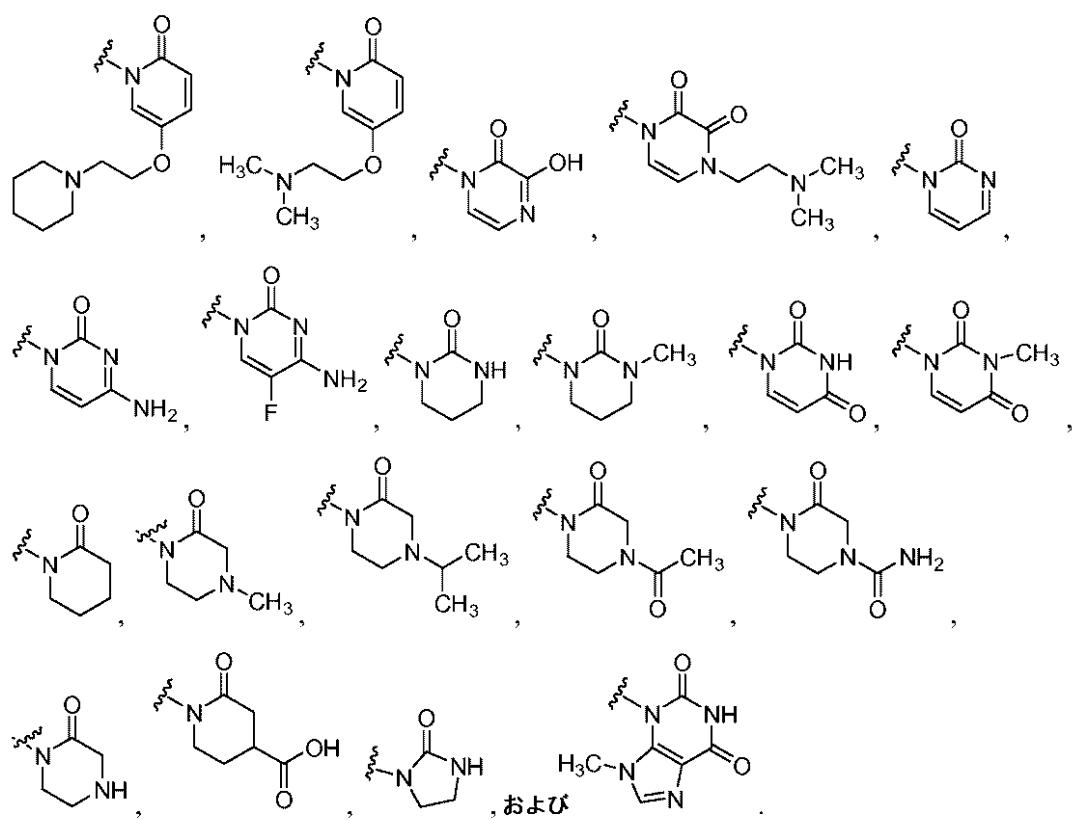
### (項目8)

R<sup>6</sup> が

【化 1 1 2 】



【化 1 1 3】

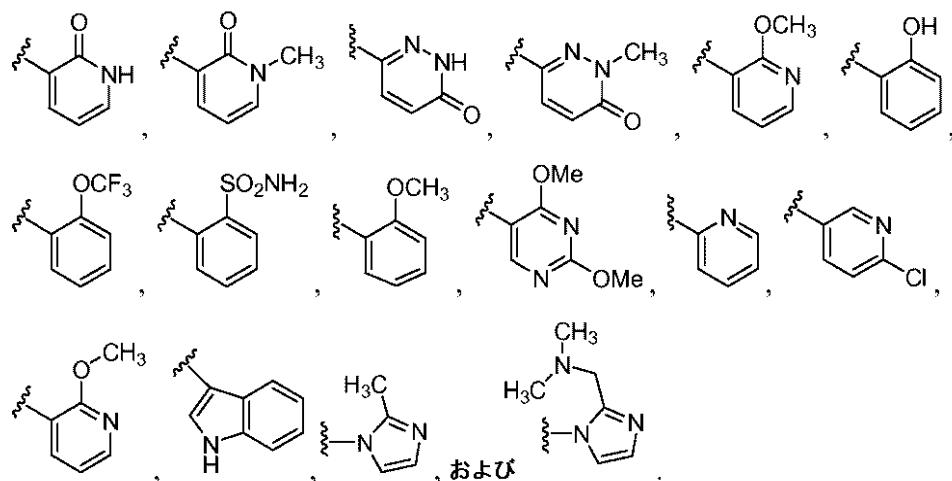


からなる群から選択される、項目 1 に記載の化合物。

( 項目 9 )

R<sup>6</sup> が

## 【化114】

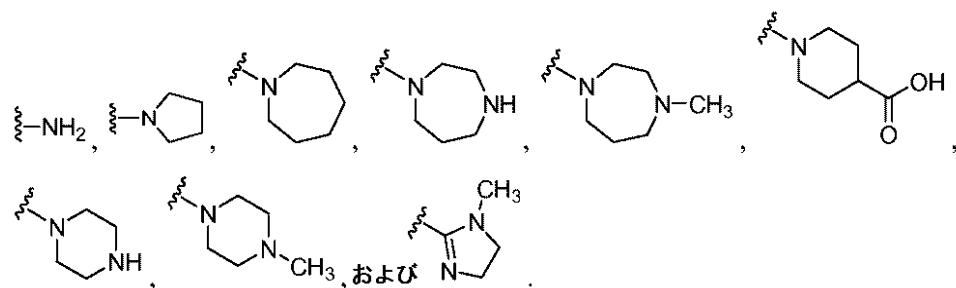


からなる群から選択される、項目1に記載の化合物。

(項目10)

R<sup>6</sup>が

## 【化115】

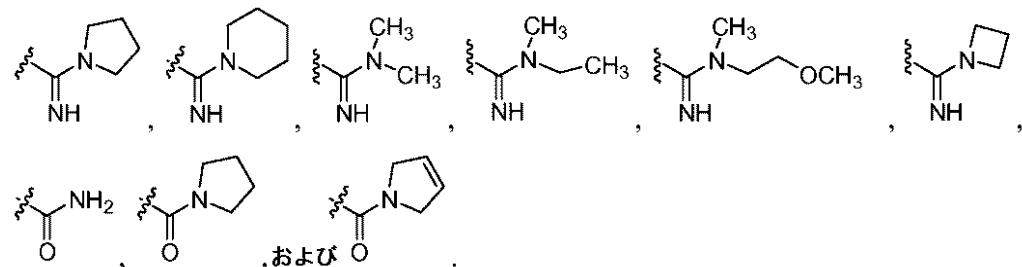


からなる群から選択される、項目1に記載の化合物。

(項目11)

R<sup>6</sup>が

## 【化116】

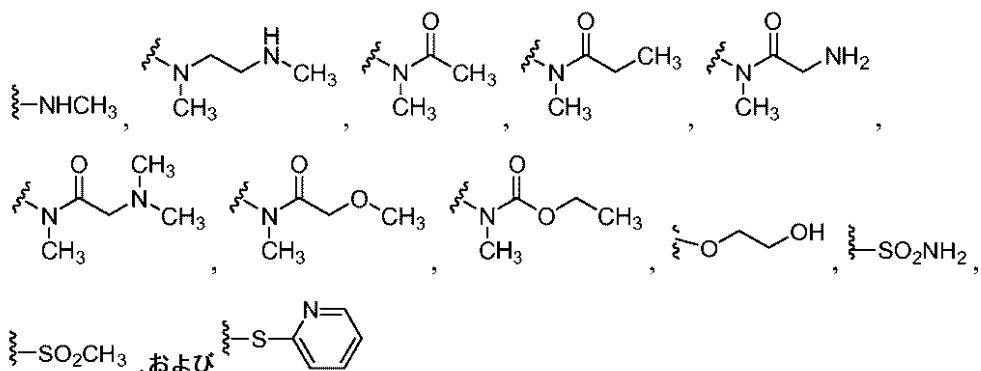


からなる群から選択される、項目1に記載の化合物。

(項目12)

R<sup>6</sup>が

## 【化117】

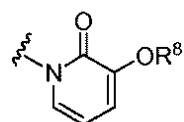


からなる群から選択される、項目1に記載の化合物。

(項目13)

R<sup>6</sup>が

## 【化118】

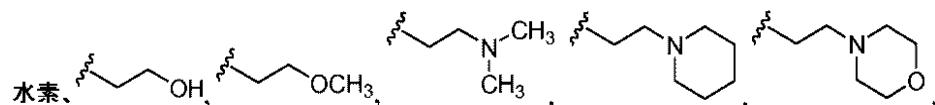


であり、R<sup>8</sup>が上記定義の通りである、項目1に記載の化合物。

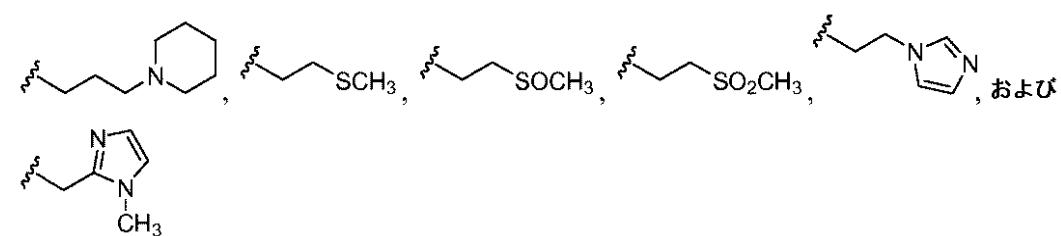
(項目14)

R<sup>8</sup>が

## 【化119】



## 【化120】



からなる群から選択される、項目13に記載の化合物。

(項目15)

5-クロロ-N-((1-(4-(2-オキソピリジン-1(2H)-イル)-2-(ピペラジン-1-イル)フェニル)-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル)メチル)チオフェン-2-カルボキサミド、

5-クロロ-N-((1-(2-(4-エチルピペラジン-1-イル)-4-オキソピリジン-1(2H)-イル)フェニル)-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル)メチル)チオフェン-2-カルボキサミド、

5-クロロ-N-((1-(2-(4-イソプロピルピペラジン-1-イル)-4-オキソピリジン-1(2H)-イル)フェニル)-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル)メチル)チオフェン-2-カルボキサミド、

5 - クロ口 - N - ( ( 1 - ( 4 - ( 2 - オキソピリミジン - 1 ( 2 H ) - イル ) フェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) チオフェン - 2 - カルボキサミド、

5 - クロ口 - N - ( ( 1 - ( 4 - ( 1 - メチル - 6 - オキソ - 1 , 6 - ジヒドロピリダジン - 3 - イル ) フェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) チオフェン - 2 - カルボキサミド、

5 - クロ口 - N - ( ( 1 - ( 4 - ( 2 , 4 - ジメトキシピリミジン - 5 - イル ) フェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) チオフェン - 2 - カルボキサミド、

5 - クロ口 - N - ( ( 1 - ( 4 - ( 2 - ( ( ジメチルアミノ ) メチル ) - 1 H - イミダゾール - 1 - イル ) - 2 - フルオロフェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) チオフェン - 2 - カルボキサミド、

5 - クロ口 - N - ( ( 1 - ( 4 - ( 2 - メチル - 1 H - イミダゾール - 1 - イル ) フェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) チオフェン - 2 - カルボキサミド、

5 - クロ口 - N - ( ( 1 - ( 4 - ( 4 - メチル - 1 , 4 - ジアゼパン - 1 - イル ) フェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) チオフェン - 2 - カルボキサミド、

5 - クロ口 - N - ( ( 1 - ( 4 - ( 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル ) フェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) チオフェン - 2 - カルボキサミド、

5 - クロ口 - N - ( ( 1 - ( 2 ' - メトキシビフェニル - 4 - イル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) チオフェン - 2 - カルボキサミド、

5 - クロ口 - N - ( ( 1 - ( 2 ' - ヒドロキシビフェニル - 4 - イル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) チオフェン - 2 - カルボキサミド、

5 - クロ口 - N - ( ( 1 - ( 2 ' - ( トリフルオロメトキシ ) ビフェニル - 4 - イル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) チオフェン - 2 - カルボキサミド、

5 - クロ口 - N - ( ( 1 - ( 4 - ( 6 - クロロピリジン - 3 - イル ) フェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) チオフェン - 2 - カルボキサミド、

N - ( ( 1 - ( 4 - ( 1 H - インドール - 2 - イル ) フェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) - 5 - クロロチオフェン - 2 - カルボキサミド、

5 - クロ口 - N - ( ( 1 - ( 4 - ( メチルスルホニル ) フェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) チオフェン - 2 - カルボキサミド、

5 - クロ口 - N - ( ( 1 - ( 3 - フルオロ - 2 ' - スルファモイルビフェニル - 4 - イル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) チオフェン - 2 - カルボキサミド、

5 - クロ口 - N - ( ( 1 - ( 4 - ( ピロリジン - 1 - カルボニル ) フェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) チオフェン - 2 - カルボキサミド、

5 - クロ口 - N - ( ( 1 - ( 4 - ( 2 , 5 - ジヒドロ - 1 H - ピロール - 1 - カルボニル ) フェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) チオフェン - 2 - カルボキサミド、

N - ( ( 1 - ( 4 - カルバモイルフェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) - 5 - クロロチオフェン - 2 - カルボキサミド、

N - ( ( 1 - ( 4 - ( 2 - アミノ - N - メチルアセトアミド ) フェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) - 5 - クロロチオフェン - 2 - カルボキサミド、

5 - クロ口 - N - ( ( 1 - ( 4 - ( メチル ( 2 - ( メチルアミノ ) エチル ) アミノ ) フェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) チオフェン - 2 - カルボキサミド、

5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 4 - ( メチルアミノ ) フェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリ  
 アゾール - 4 - イル ) メチル ) チオフェン - 2 - カルボキサミド、  
 5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 4 - ( N - メチルプロピオニアミド ) フェニル ) - 1 H - 1  
 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) チオフェン - 2 - カルボキサミド、 4 - ( 4 - ( ( 5 - クロロチオフェン - 2 - カルボキサミド ) メチル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - ト  
 リアゾール - 1 - イル ) フェニル ( メチル ) カルバミン酸エチル、  
 5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 4 - ( 2 - メトキシ - N - メチルアセトアミド ) フェニル )  
 - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) チオフェン - 2 - カルボキサミ  
 ド、  
 5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 4 - ( 2 - ( ジメチルアミノ ) - N - メチルアセトアミド )  
 フェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) チオフェン - 2 - カ  
 ルボキサミド、  
 5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 4 - ( N - メチルアセトアミド ) フェニル ) - 1 H - 1 , 2  
 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) チオフェン - 2 - カルボキサミド、  
 5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 4 - ( 2 - ヒドロキシエトキシ ) フェニル ) - 1 H - 1 , 2  
 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) チオフェン - 2 - カルボキサミド、  
 5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 4 - ( 6 - オキソ - 1 , 6 - ジヒドロピリダジン - 3 - イル  
 ) フェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) チオフェン - 2 -  
 カルボキサミド、  
 5 - クロロ - N - ( ( 3 - ( 2 - フルオロ - 4 - ( 2 - オキソピリジン - 1 ( 2 H ) - イ  
 ル ) フェニル ) - 5 - メチル - 4 , 5 - ジヒドロイソオキサゾール - 5 - イル ) メチル )  
 チオフェン - 2 - カルボキサミド、  
 5 - クロロ - N - ( ( 5 - オキソ - 1 - ( 4 - ( 2 - オキソピリジン - 1 ( 2 H ) - イル  
 ) フェニル ) - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾール - 3 - イル ) メチル ) チオフェン -  
 2 - カルボキサミド、  
 5 - クロロ - N - ( ( 2 - オキソ - 1 - ( 4 - ( 2 - オキソピリジン - 1 ( 2 H ) - イル  
 ) フェニル ) - 1 , 2 - ジヒドロピリジン - 3 - イル ) メチル ) チオフェン - 2 - カルボ  
 キサミド、  
 5 - クロロ - N - ( ( 6 - オキソ - 1 - ( 4 - ( 2 - オキソピリジン - 1 ( 2 H ) - イル  
 ) フェニル ) - 1 , 6 - ジヒドロピリジン - 3 - イル ) メチル ) チオフェン - 2 - カルボ  
 キサミド、  
 5 - クロロ - N - ( ( 1 - メチル - 2 - ( 4 - ( 2 - オキソピリジン - 1 ( 2 H ) - イル  
 ) フェニル ) - 1 H - イミダゾール - 4 - イル ) メチル ) チオフェン - 2 - カルボキサミ  
 ド、  
 5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 4 - ヨードフェニル ) - 1 H - イミダゾール - 4 - イル ) メ  
 チル ) チオフェン - 2 - カルボキサミド、  
 5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 4 - ( 1 - メチル - 6 - オキソ - 1 , 6 - ジヒドロピリダジ  
 ン - 3 - イル ) フェニル ) - 1 H - イミダゾール - 4 - イル ) メチル ) チオフェン - 2 -  
 カルボキサミド、  
 5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 4 - ( 2 - メトキシピリジン - 3 - イル ) フェニル ) - 1 H  
 - イミダゾール - 4 - イル ) メチル ) チオフェン - 2 - カルボキサミド、  
 5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 4 - ( 2 - オキソ - 1 , 2 - ジヒドロピリジン - 3 - イル )  
 フェニル ) - 1 H - イミダゾール - 4 - イル ) メチル ) チオフェン - 2 - カルボキサミド  
 、  
 5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 4 - ( 1 - メチル - 2 - オキソ - 1 , 2 - ジヒドロピリジン  
 - 3 - イル ) フェニル ) - 1 H - イミダゾール - 4 - イル ) メチル ) チオフェン - 2 - カ  
 ルボキサミド、  
 N - ( ( 1 - ( 4 - アミノフェニル ) - 1 H - イミダゾール - 4 - イル ) メチル ) - 5 -  
 クロロチオフェン - 2 - カルボキサミド、  
 5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 4 - ( 2 , 5 - ジヒドロ - 1 H - ピロール - 1 - カルボニル

) フェニル) - 1H - イミダゾール - 4 -イル) メチル) チオフェン - 2 - カルボキサミド、  
 4 - クロロ - N - ((1 - (4 - (2 - オキソピリジン - 1 (2H) - イル) フェニル)  
 - 1H - イミダゾール - 4 - イル) メチル) ベンズアミド、  
 N - ((1 - (4 - (2 - オキソピリジン - 1 (2H) - イル) フェニル) - 1H - イミダゾール - 4 - イル) メチル) アセトアミド、  
 5 - クロロ - N - ((1 - (5 - (2 - オキソピリジン - 1 (2H) - イル) ピリジン -  
 2 - イル) - 1H - イミダゾール - 4 - イル) メチル) チオフェン - 2 - カルボキサミド  
 、  
 5 - クロロ - N - ((1 - (6 - (2 - オキソピリジン - 1 (2H) - イル) ピリジン -  
 3 - イル) - 1H - イミダゾール - 4 - イル) メチル) チオフェン - 2 - カルボキサミド  
 、  
 5 - クロロ - N - ((2, 5 - ジプロモ - 1 - (4 - (N, N - ジメチルカルバムイミド  
 イル) フェニル) - 1H - イミダゾール - 4 - イル) メチル) チオフェン - 2 - カルボキサミド、  
 5 - クロロ - N - ((2, 5 - ジプロモ - 1 - (4 - (イミノ(ピロリジン - 1 - イル)  
 メチル) フェニル) - 1H - イミダゾール - 4 - イル) メチル) チオフェン - 2 - カルボキサミド、  
 5 - クロロ - N - ((2, 5 - ジプロモ - 1 - (4 - (1 - メチル - 4, 5 - ジヒドロ -  
 1H - イミダゾール - 2 - イル) フェニル) - 1H - イミダゾール - 4 - イル) メチル)  
 チオフェン - 2 - カルボキサミド、  
 5 - クロロ - N - ((1 - (4 - (9 - メチル - 2, 6 - ジオキソ - 1H - プリン - 3 (2H,  
 6H, 9H) - イル) フェニル) - 1H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 4 - イル) メチル)  
 チオフェン - 2 - カルボキサミド、  
 5 - クロロ - N - ((1 - (4 - (1 - メチル - 6 - オキソ - 1, 6 - ジヒドロピリダジ  
 ン - 3 - イル) フェニル) - 1H - イミダゾール - 5 - イル) メチル) チオフェン - 2 -  
 カルボキサミド、  
 5 - クロロ - N - ((4 - メチル - 1 - (4 - (2 - オキソピリジン - 1 (2H) - イル)  
 フェニル) - 1H - イミダゾール - 5 - イル) メチル) チオフェン - 2 - カルボキサミ  
 ド、  
 5 - クロロ - N - ((1 - (4 - (2 - オキソピラジン - 1 (2H) - イル) フェニル)  
 - 1H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 4 - イル) メチル) チオフェン - 2 - カルボキサミ  
 ド、  
 5 - クロロ - N - ((1 - (2 - フルオロ - 4 - (2 - オキソピラジン - 1 (2H) - イ  
 ル) フェニル) - 1H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 4 - イル) メチル) チオフェン - 2  
 - カルボキサミド、  
 5 - クロロ - N - ((1 - (2 - フルオロ - 4 - (2 - オキソピリミジン - 1 (2H) - イ  
 ル) フェニル) - 1H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 4 - イル) メチル) チオフェン - 2  
 - カルボキサミド、  
 5 - クロロ - N - ((1 - (4 - (2 - オキソテトラヒドロピリミジン - 1 (2H) - イ  
 ル) フェニル) - 1H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 4 - イル) メチル) チオフェン - 2  
 - カルボキサミド、  
 5 - クロロ - N - ((1 - (2 - フルオロ - 4 - (2 - オキソ - テトラヒドロピリミジ  
 - 1 (2H) - イル) フェニル) - 1H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 4 - イル) メチル  
 ) チオフェン - 2 - カルボキサミド、  
 5 - クロロ - N - ((1 - (2 - フルオロ - 4 - (3 - メチル - 2 - オキソ - テトラヒド  
 ロピリミジン - 1 (2H) - イル) フェニル) - 1H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 4 -  
 イル) メチル) チオフェン - 2 - カルボキサミド、  
 5 - クロロ - N - ((1 - (2 - フルオロ - 4 - (2 - オキソピペリジン - 1 - イル) フ  
 ェニル) - 1H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 4 - イル) メチル) チオフェン - 2 - カル

ボキサミド、

5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 3 - フルオロ - 4 - ( 2 - オキソピリジン - 1 ( 2 H ) - イル ) フェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) チオフェン - 2 - カルボキサミド、

5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 4 - ( 3 - ヒドロキシ - 2 - オキソピリジン - 1 ( 2 H ) -  
イル ) フェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) チオフェン -  
2 - カルボキサミド、

5 - クロ口 - N - ( ( 1 - ( 4 - ( 3 - ( 2 - ヒドロキシエトキシ ) - 2 - オキソピリジン - 1 ( 2 H ) - イル ) フェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) チオフェン - 2 - カルボキサミド、

5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 4 - ( 3 - ( 2 - メトキシエトキシ ) - 2 - オキソピリジン  
- 1 ( 2 H ) - イル ) フェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル  
) チオフェン - 2 - カルボキサミド、

5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 4 - ( 3 - ( 2 - ( ジメチルアミノ ) エトキシ ) - 2 - オキソピリジン - 1 ( 2 H ) -イル ) フェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) チオフェン - 2 - カルボキサミド、

5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 4 - ( 3 - ( 2 - ( ジメチル ( ジメチルアミノ ) アミノ ) エトキシ ) - 2 - オキソピリジン - 1 ( 2 H ) -イル ) フェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 -イル ) メチル ) チオフェン - 2 -カルボキサミド、

5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 4 - ( 2 - オキソ - 3 - ( 2 - ( ピペリジン - 1 - イル ) エ  
トキシ ) ピリジン - 1 ( 2 H ) - イル ) フェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール -  
4 - イル ) メチル ) チオフェン - 2 - カルボキサミド、

5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 4 - ( 2 - オキソ - 3 - ( 3 - ( ピペリジン - 1 - イル ) プ  
ロポキシ ) ピリジン - 1 ( 2 H ) - イル ) フェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール  
- 4 - イル ) メチル ) チオフェン - 2 - カルボキサミド、

5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 4 - ( 3 - ( 2 - ( メチルチオ ) エトキシ ) - 2 - オキソピ  
リジン - 1 ( 2 H ) - イル ) フェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル )  
メチル ) チオフェン - 2 - カルボキサミド、

5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 4 - ( 3 - ( 2 - ( メチルスルフィニル ) エトキシ ) - 2 -  
オキソピリジン - 1 ( 2 H ) - イル ) フェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4  
- イル ) メチル ) チオフェン - 2 - カルボキサミド、

5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 4 - ( 3 - ( 2 - ( メチルスルホニル ) エトキシ ) - 2 - オキソピリジン - 1 ( 2 H ) - イル ) フェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) チオフェン - 2 - カルボキサミド、

5 - クロ口 - N - ( ( 1 - ( 4 - ( 3 - ( 2 - モルホリノエトキシ ) - 2 - オキソピリジン - 1 ( 2 H ) - イル ) フェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) チオフェン - 2 - カルボキサミド、

N - ( ( 1 - ( 4 - ( 3 - ( 2 - ( 1 H - イミダゾール - 1 - イル ) エトキシ ) - 2 - オキソピリジン - 1 ( 2 H ) - イル ) フェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) - 5 - クロロチオフェン - 2 - カルボキサミド、

5 - クロ口 - N - ( ( 1 - ( 4 - ( 3 - ( ( 1 - メチル - 1 H - イミダゾール - 2 - イル ) メトキシ ) - 2 - オキソピリジン - 1 ( 2 H ) - イル ) フェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) チオフェン - 2 - カルボキサミド、

5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 4 - ( 5 - ヒドロキシ - 2 - オキソピリジン - 1 ( 2 H ) -  
イル ) フェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) チオフェン -  
2 - カルボキサミド、

5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 4 - ( 5 - ( 2 - ( ジメチルアミノ ) エトキシ ) - 2 - オキソピリジン - 1 ( 2 H ) -イル ) フェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) チオフェン - 2 - カルボキサミド、

5 - クロ口 - N - ( ( 1 - ( 4 - ( 2 - オキソ - 5 - ( 2 - ( ピペリジン - 1 - イル ) エ

トキシ) ピリジン - 1 ( 2 H ) - イル ) フェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール -  
 4 - イル ) メチル ) チオフェン - 2 - カルボキサミド、  
 5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 4 - ( 5 - ( 2 - モルホリノエトキシ ) - 2 - オキソピリジ  
 ン - 1 ( 2 H ) - イル ) フェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチ  
 ル ) チオフェン - 2 - カルボキサミド、  
 5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 4 - ( 5 - ニトロ - 2 - オキソピリジン - 1 ( 2 H ) - イル  
 ) フェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) チオフェン - 2 -  
 カルボキサミド、  
 N - ( ( 1 - ( 4 - ( 4 - アミノ - 2 - オキソピリミジン - 1 ( 2 H ) - イル ) フェニル  
 ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) - 5 - クロロチオフェン - 2  
 - カルボキサミド、  
 5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 4 - ( 2 , 4 - ジオキソ - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 1  
 ( 2 H ) - イル ) フェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) チ  
 オフェン - 2 - カルボキサミド、  
 N - ( ( 1 - ( 4 - ( 4 - アミノ - 5 - フルオロ - 2 - オキソピリミジン - 1 ( 2 H ) -  
 イル ) フェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) - 5 - クロロ  
 チオフェン - 2 - カルボキサミド、  
 5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 4 - ( 3 - メチル - 2 , 4 - ジオキソ - 3 , 4 - ジヒドロピ  
 リミジン - 1 ( 2 H ) - イル ) フェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル  
 ) メチル ) チオフェン - 2 - カルボキサミド、  
 5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 4 - ( 2 - オキソピペラジン - 1 - イル ) フェニル ) - 1 H  
 - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) チオフェン - 2 - カルボキサミド、  
 5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 4 - ( 4 - メチル - 2 - オキソピペラジン - 1 - イル ) フェニル  
 ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) チオフェン - 2 - カルボ  
 キサミド、  
 5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 4 - ( 4 - イソプロピル - 2 - オキソピペラジン - 1 - イル  
 ) フェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) チオフェン - 2 -  
 カルボキサミド、  
 4 - ( 4 - ( 4 - ( ( 5 - クロロチオフェン - 2 - カルボキサミド ) メチル ) - 1 H - 1  
 , 2 , 3 - トリアゾール - 1 - イル ) フェニル ) - 3 - オキソピペラジン - 1 - カルボキ  
 サミド、  
 5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 4 - ( 3 - ヒドロキシ - 2 - オキソピラジン - 1 ( 2 H ) -  
 イル ) フェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) チオフェン -  
 2 - カルボキサミド、  
 5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 4 - ( 4 - ( 2 - ( ジメチルアミノ ) エチル ) - 2 , 3 - ジ  
 オキソ - 3 , 4 - ジヒドロピラジン - 1 ( 2 H ) - イル ) フェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3  
 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) チオフェン - 2 - カルボキサミド、  
 5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 4 - ( 3 - ヒドロキシ - 6 - オキソピリダジン - 1 ( 6 H )  
 - イル ) フェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) チオフェン  
 - 2 - カルボキサミド、  
 2 - ( ( 1 - ( 4 - ( 2 - オキソピリジン - 1 ( 2 H ) - イル ) フェニル ) - 1 H - 1 ,  
 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチルカルバモイル ) 安息香酸、  
 N - ( ( 1 - ( 2 - ( 3 - オキソピペラジン - 1 - イル ) - 4 - ( 2 - オキソピリジン -  
 1 ( 2 H ) - イル ) フェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル )  
 チオフェン - 2 - カルボキサミド、  
 5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 4 - ( 1 - メチル - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - イミダゾール  
 - 2 - イル ) フェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 5 - イル ) メチル ) チオフ  
 ェン - 2 - カルボキサミド、  
 5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 4 - ( N , N - ジメチルカルバムイミドイル ) フェニル ) -  
 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 5 - イル ) メチル ) チオフェン - 2 - カルボキサミド

5 - クロロ - N - ((1 - (4 - (イミノ(ピロリジン - 1 - イル)メチル)フェニル) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 5 - イル)メチル)チオフェン - 2 - カルボキサミド、

5 - クロロ - N - ((1 - (4 - (イミノ(ピペリジン - 1 - イル)メチル)フェニル) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 5 - イル)メチル)チオフェン - 2 - カルボキサミド、

N - ((1 - (4 - カルバモイルフェニル) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 5 - イル)メチル) - 5 - クロロチオフェン - 2 - カルボキサミド、

5 - クロロ - N - ((1 - (4 - (メチルスルホニル)フェニル) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 5 - イル)メチル)チオフェン - 2 - カルボキサミド、

5 - クロロ - N - ((1 - (4 - (2 - オキソピリジン - 1 (2 H) - イル)フェニル) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 5 - イル)メチル)チオフェン - 2 - カルボキサミド、

5 - クロロ - N - ((1 - (4 - (ピリジン - 2 - イルチオ)フェニル) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 5 - イル)メチル)チオフェン - 2 - カルボキサミド、

5 - クロロ - N - ((1 - (6 - (ピロリジン - 1 - イル)ピリジン - 3 - イル) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル)メチル)チオフェン - 2 - カルボキサミド、

1 - (5 - (4 - ((5 - クロロチオフェン - 2 - カルボキサミド)メチル) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 1 - イル)ピリジン - 2 - イル)ピペリジン - 4 - カルボン酸

N - ((1 - (6 - (アゼパン - 1 - イル)ピリジン - 3 - イル) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル)メチル) - 5 - クロロチオフェン - 2 - カルボキサミド、

5 - クロロ - N - ((1 - (6 - (4 - メチル - 1 , 4 - ディアゼパン - 1 - イル)ピリジン - 3 - イル) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 5 - イル)メチル)チオフェン - 2 - カルボキサミド、

N - ((1 - (6 - (1 , 4 - ディアゼパン - 1 - イル)ピリジン - 3 - イル) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 5 - イル)メチル) - 5 - クロロチオフェン - 2 - カルボキサミド、

5 - クロロ - N - ((1 - (6 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル)ピリジン - 3 - イル) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 5 - イル)メチル)チオフェン - 2 - カルボキサミド、

5 - クロロ - N - ((1 - (6 - (ピペラジン - 1 - イル)ピリジン - 3 - イル) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 5 - イル)メチル)チオフェン - 2 - カルボキサミド、

5 - クロロ - N - (4 - (4 - ((5 - クロロチオフェン - 2 - カルボキサミド)メチル) - 1 H - イミダゾール - 1 - イル)ベンジル)チオフェン - 2 - カルボキサミド、

5 - クロロ - N - ((1 - (4 - (2 - オキソピリジン - 1 (2 H) - イル)フェニル) - 1 H - ピロール - 3 - イル)メチル)チオフェン - 2 - カルボキサミド、

5 - クロロ - N - ((1 - (4 - (2 - オキソピリジン - 1 (2 H) - イル)フェニル) - 1 H - ピラゾール - 4 - イル)メチル)チオフェン - 2 - カルボキサミド、

5 - クロロ - N - ((1 - (4 - (4 - メチル - 1 , 4 - ディアゼパン - 1 - イル)フェニル) - 1 H - ピラゾール - 4 - イル)メチル)チオフェン - 2 - カルボキサミド、

5 - クロロ - N - ((1 - (4 - (2 - オキソピラジン - 1 (2 H) - イル)フェニル) - 1 H - ピラゾール - 4 - イル)メチル)チオフェン - 2 - カルボキサミド、

5 - クロロ - N - ((1 - (4 - (2 - オキソピリジン - 1 (2 H) - イル)フェニル) - 1 H - ピラゾール - 3 - イル)メチル)チオフェン - 2 - カルボキサミド、

5 - クロロ - N - ((1 - (3 - (2 - オキソピリジン - 1 (2 H) - イル)フェニル) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル)メチル)チオフェン - 2 - カルボキサミド、

5 - クロロ - N - ((1 - (4 - メチル - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - ベンゾ

[ [ 1 , 4 ] オキサジン - 7 - イル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) チオフェン - 2 - カルボキサミド、

5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 3 - メトキシ - 4 - ( 2 - オキソピリジン - 1 ( 2 H ) - イル ) フェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) チオフェン - 2 - カルボキサミド、および

5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 5 - ( 2 - オキソピリジン - 1 ( 2 H ) - イル ) キノリン - 8 - イル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) チオフェン - 2 - カルボキサミド

からなる群から選択される化合物または薬剤として許容されるその塩、エステルもしくはプロドラッグ。

( 項目 16 )

薬剤として許容される賦形剤および項目 1 または 15 に記載の化合物を含む組成物。

( 項目 17 )

哺乳動物における望ましくない血栓を特徴とする状態を予防または治療するための方法であって、該哺乳動物に治療有効量の項目 1 に記載の化合物を投与するステップを含む、方法。

( 項目 18 )

前記状態が、急性冠症候群、心筋梗塞症、不安定狭心症、難治性の狭心症、血栓溶解治療後もしくは冠動脈血管形成術後に起こる冠動脈内血栓性閉塞、血栓により媒介される脳血管症候群、塞栓性脳卒中、血栓性脳卒中、一過性脳虚血発作、静脈血栓症、深部静脈血栓症、肺動脈塞栓、凝血障害、播種性血管内凝固症候群、血栓性血小板減少性紫斑病、閉塞性血栓血管炎、ヘパリン起因性血小板減少症に付随する血栓症、体外循環に付随する血栓性合併症、心臓もしくは他の血管内カテーテル、大動脈内バルーンポンプ、冠状動脈ステントまたは心臓弁などの器具の使用に付随する血栓性合併症、および人工器官の取付けを要する状態からなる群から選択される、項目 17 に記載の方法。

( 項目 19 )

血液試料の凝固を阻止する方法であって、該試料を項目 1 または 15 に記載の化合物と接触させることを含む、方法。

## 【手続補正 2】

【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

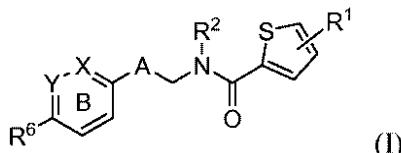
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 ( I ) の化合物または薬剤として許容されるその塩、エステルもしくはプロドラッグ。

【化 104】



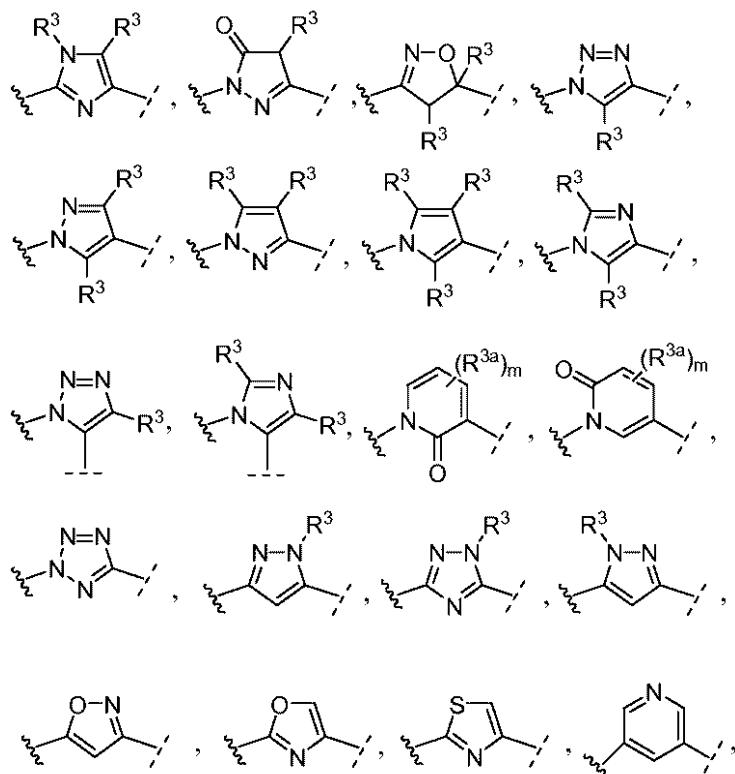
( 式中、

R<sup>1</sup> は、ハロゲン、C<sub>1</sub> ~ 8 アルキル、C<sub>2</sub> ~ 8 アルケニルおよび C<sub>2</sub> ~ 8 アルキニルからなる群から選択され、

R<sup>2</sup> は水素または C<sub>1</sub> ~ 4 アルキルであり、

A は

【化 1 0 5】



からなる群から選択され、ここで、波線は環 B との結合点を示し、点線は分子の残りの部分との結合点を示す。

$R^3$  は、独立に、水素または  $R^3a$  であり、

$R^3$  は、ハロゲン、 $C_{1 \sim 8}$  アルキル、 $C_{2 \sim 8}$  アルケニルおよび $C_{2 \sim 8}$  アルキニルからなる群から独立に選択され、

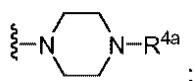
mは、0、1、2または3であり、

XはC-R<sup>4</sup>もしくはNであるか、またはXとYはCであり、縮合して6員のアリール、ヘテロアリールまたは複素環を形成しており、

YはC-R<sup>5</sup>をもつてNである。ただし、XとYはどちらもがNである」とはなく、

B<sup>4</sup>は、水素、八日根、および

【化 1 0 6】



からなる群から選択され、

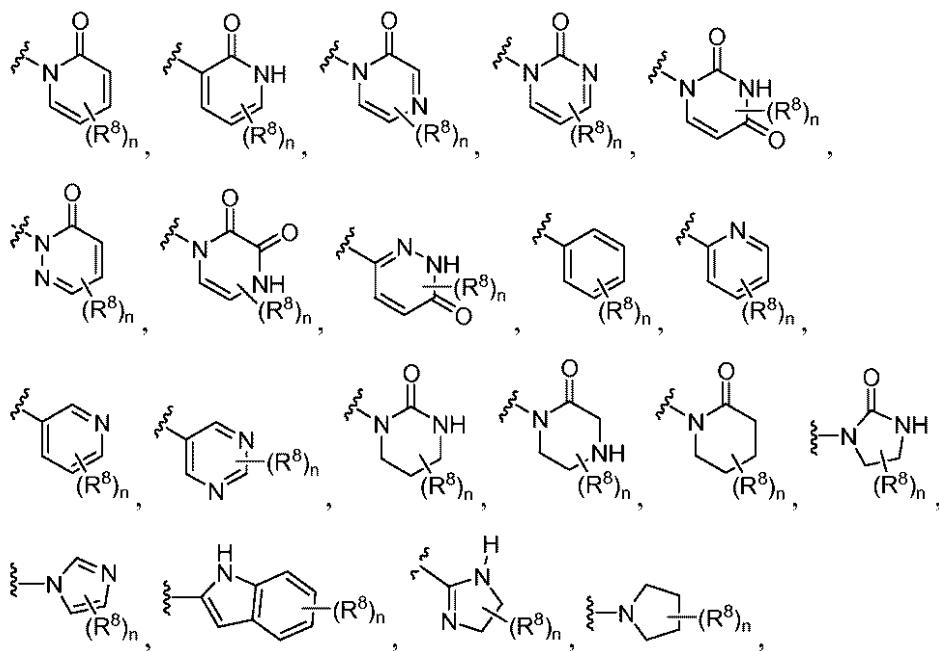
$R^4$  は水素または  $C_{1 \sim 8}$  アルキルであり、

$R^5$  は、水素、ハロゲンおよび  $C_{1 \sim 8}$  アルコキシからなる群から選択されるか、または  $R^5$  と  $R^6$  は一緒に結合して環 B と縮合した 6 員のアリール、ヘテロアリールまたは複素環を形成してあり。

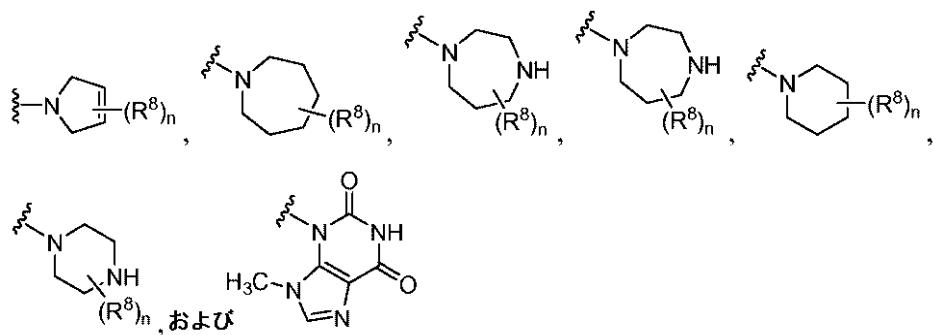
$R^6$  は、 $-R^{6a}$ 、 $-NR^{7a}R^{7b}$ 、 $-NR^{7a}C(O)R^{7c}$ 、 $-NR^{7a}C(O)$   
 $OR^{7c}$ 、 $-CONR^{8a}R^{8b}$ 、 $-OR^{7c}$ 、 $-SR^{7c}$ 、 $-C(=NR^{7a})NR^{8a}R^{8b}$ 、 $-S(O)_2NR^{8a}R^{8b}$  および  $-S(O)_2R^{7c}$  からなる群から選択され。

R 6 a け

【化 1 0 7】



【化 1 0 8 】



からなる群から選択され、ここで、R<sup>8</sup>は置換基に適した任意の位置であってよく、R<sup>8</sup>が窒素原子と結合している場合、R<sup>8</sup>は該窒素原子に結合している水素原子を置換し、R<sup>7a</sup>およびR<sup>7b</sup>は、水素、C<sub>1~8</sub>アルキル、および1~3個のR<sup>9</sup>で置換されたC<sub>1~8</sub>アルキルからなる群から独立に選択され、

$R^7C$  は、アリール、ヘテロアリール、 $C_{1-8}$  アルキル、1~3個の $R^9$  で置換された $C_{1-8}$  アルキルからなる群から選択され、

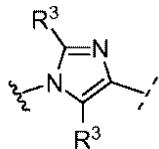
$R^8$  は、ニトロ、ヒドロキシ、 $-CO_2H$ 、 $-C(O)R^8c$ 、 $-C(O)NR^{8a}R^{8b}$ 、 $-NR^{8a}R^{8b}$ 、 $-SO_2NR^{8a}R^{8b}$ 、ハロゲン、 $C_{1-8}$  アルキルおよび $C_{1-8}$  アルコキシからなる群から独立に選択され、前記 $C_{1-8}$  アルキルおよび $C_{1-8}$  アルコキシは 1 ~ 3 個の  $R^9$  で任意選択で置換されており、

$R^8a$  および  $R^8b$  は、水素、 $C_{1-8}$  アルキル、および 1 ~ 3 個の  $R^9$  で置換された  $C_{1-8}$  アルキルからなる群から独立に選択されるか、または  $R^8a$  と  $R^8b$  は一緒に、1 ~ 3 個の  $R^9$  で任意選択で置換されかつ N、O もしくは S から選択される 1 つの追加の環へテロ原子を任意選択で有する 5 ~ 7 員複素環を形成しており、

$R^8C$  は、 $C_{1\sim 8}$  アルキル、および 1 ~ 3 個の  $R^9$  で置換された  $C_{1\sim 8}$  アルキルからなる群から選択され、

R<sup>9</sup>は、ハロゲン、複素環、ヘテロアリール、-OH、-R<sup>1~0</sup>、-OR<sup>1~0</sup>、-SR<sup>1~0</sup>、-S(O)R<sup>1~0</sup>、-S(O)<sub>2</sub>R<sup>1~0</sup>、-SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、-C(O)NH<sub>2</sub>、-C(O)R<sup>1~0</sup>、-C(NH)R<sup>1~0</sup>、-NHC(O)R<sup>1~0</sup>、-NHC(NH)R<sup>1~0</sup>、-NHC(O)NH<sub>2</sub>、-CO<sub>2</sub>H、-NH<sub>2</sub>、-NHR<sup>1~0</sup>、-N(R<sup>1~0</sup>)<sub>2</sub>および

- N ( R<sup>1</sup> R<sup>0</sup> )<sub>3</sub><sup>+</sup> からなる群から独立に選択され、各 R<sup>1</sup> R<sup>0</sup> は、独立に、 C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキルであり、n は、 0、 1、 2 または 3 であり、ただし、 X が C - R<sup>4</sup> であり、 Y が C - R<sup>5</sup> であり、 R<sup>6</sup> が R<sup>6-a</sup> であり、 A が【化 109】



である場合、 $R^6$  は炭素原子を介して環 B と結合している)。

【請求項2】

R<sup>1</sup> が 2 - クロロである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項3】

R<sup>2</sup> が水素である、請求項 1 に記載の化合物。

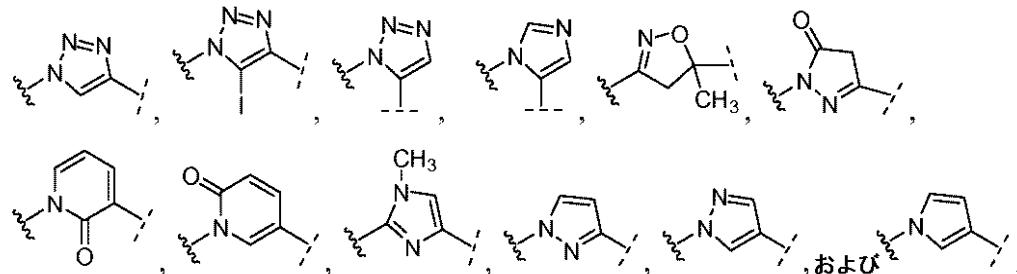
## 【請求項4】

X および Y が CH である、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 5】

A が

【化 1 1 0】



からなる群から選択される、請求項 1 に記載の化合物。

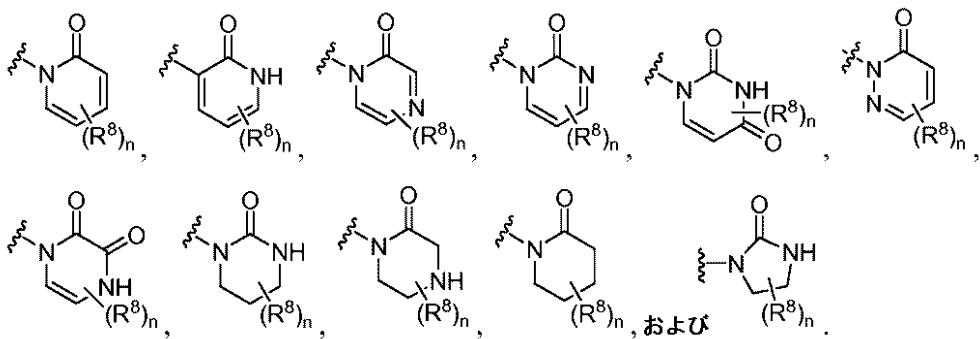
## 【請求項 6】

R<sup>6</sup> が R<sup>6-a</sup> である、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 7】

R 6 a が

【化 1 1 1】

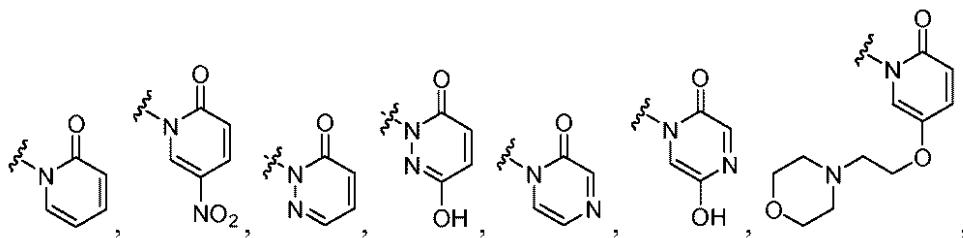


からなる群から選択される、請求項 6 に記載の化合物。

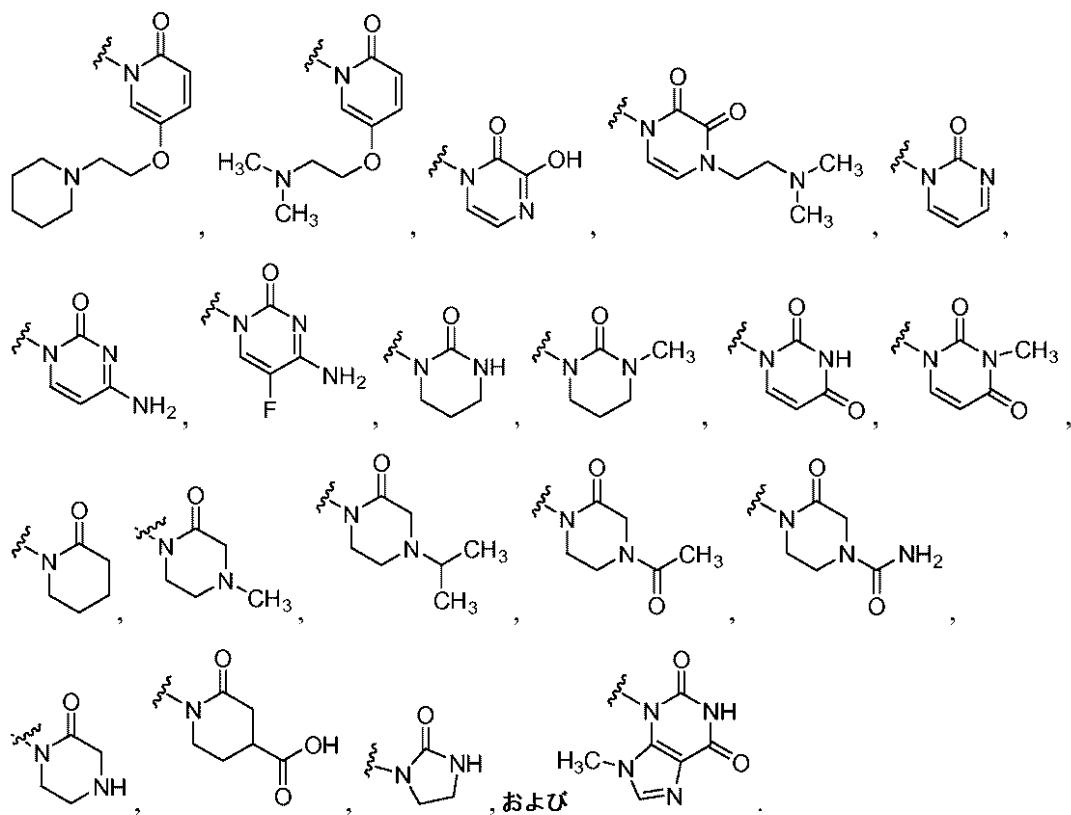
### 【請求項8】

R<sup>6</sup> が

【化 1 1 2】



【化 1 1 3】

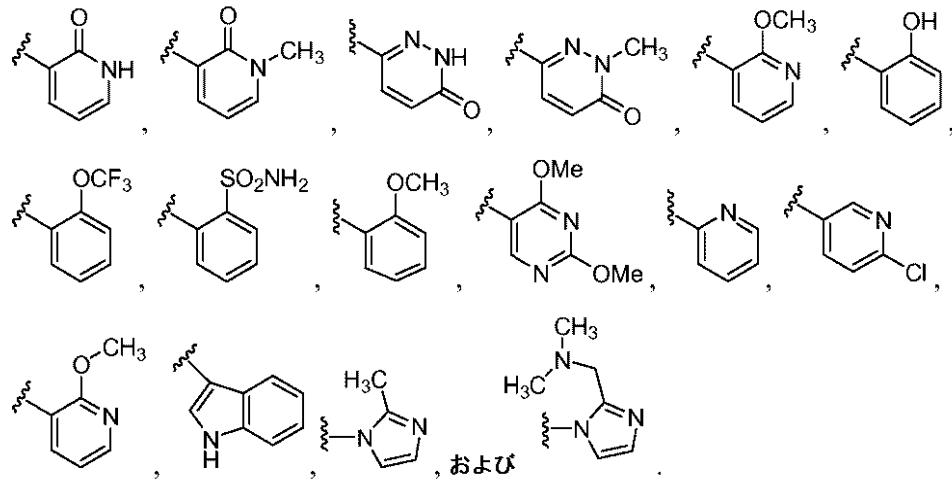


からなる群から選択される、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 9】

R<sup>6</sup> が

【化 1 1 4】

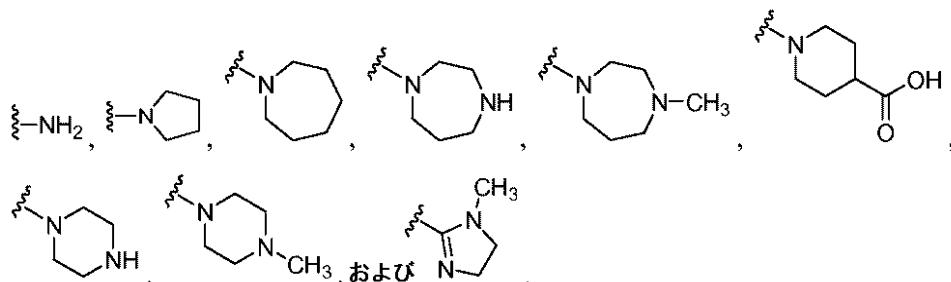


からなる群から選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 10】

R<sup>6</sup> が

【化 115】

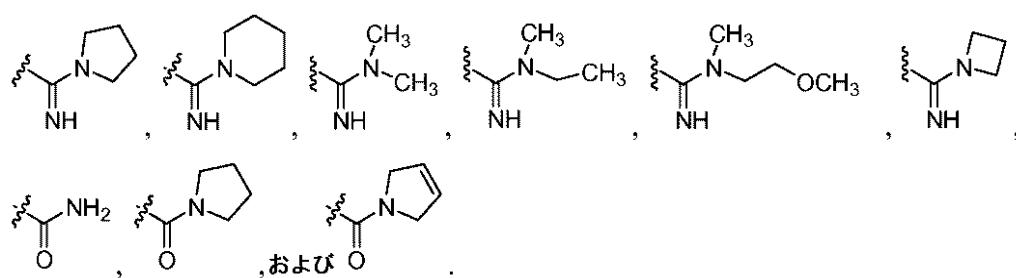


からなる群から選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 11】

R<sup>6</sup> が

【化 116】

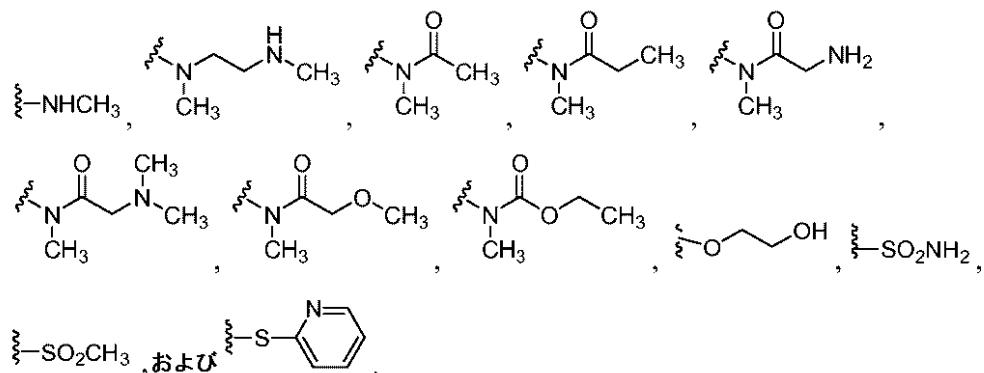


からなる群から選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 12】

R<sup>6</sup> が

【化 117】

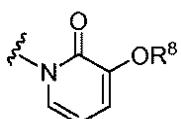


からなる群から選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 13】

R<sup>6</sup> が

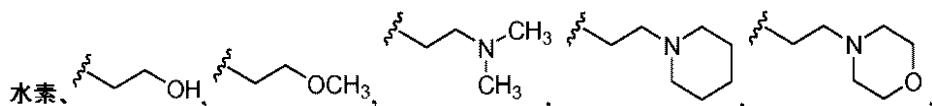
【化 118】

であり、R<sup>8</sup> が上記定義の通りである、請求項 1 に記載の化合物。

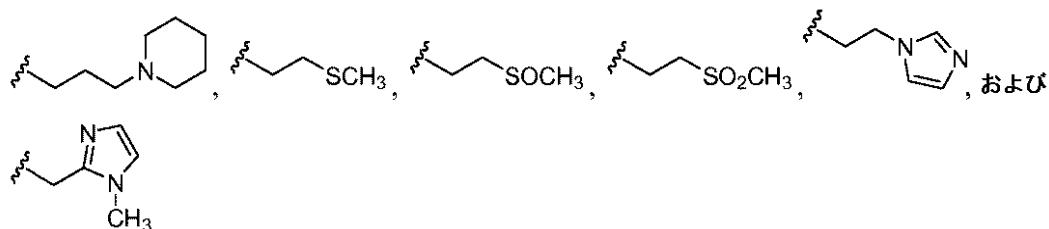
【請求項 14】

R<sup>8</sup> が

【化119】



【化120】



からなる群から選択される、請求項13に記載の化合物。

【請求項15】

5 - クロロ - N - ((1 - (4 - (2 - オキソピリジン - 1 (2H) - イル) - 2 - (ピペラジン - 1 - イル) フェニル) - 1H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル) メチル) チオフェン - 2 - カルボキサミド、  
 5 - クロロ - N - ((1 - (2 - (4 - エチルピペラジン - 1 - イル) - 4 - (2 - オキソピリジン - 1 (2H) - イル) フェニル) - 1H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル) メチル) チオフェン - 2 - カルボキサミド、  
 5 - クロロ - N - ((1 - (2 - (4 - イソプロピルピペラジン - 1 - イル) - 4 - (2 - オキソピリジン - 1 (2H) - イル) フェニル) - 1H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル) メチル) チオフェン - 2 - カルボキサミド、  
 5 - クロロ - N - ((1 - (4 - (2 - オキソピリミジン - 1 (2H) - イル) フェニル) - 1H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル) メチル) チオフェン - 2 - カルボキサミド、  
 5 - クロロ - N - ((1 - (4 - (1 - メチル - 6 - オキソ - 1 , 6 - ジヒドロピリダジン - 3 - イル) フェニル) - 1H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル) メチル) チオフェン - 2 - カルボキサミド、  
 5 - クロロ - N - ((1 - (4 - (2 , 4 - ジメトキシピリミジン - 5 - イル) フェニル) - 1H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル) メチル) チオフェン - 2 - カルボキサミド、  
 5 - クロロ - N - ((1 - (4 - (2 - ((ジメチルアミノ) メチル) - 1H - イミダゾール - 1 - イル) - 2 - フルオロフェニル) - 1H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル) メチル) チオフェン - 2 - カルボキサミド、  
 5 - クロロ - N - ((1 - (4 - (2 - メチル - 1H - イミダゾール - 1 - イル) フェニル) - 1H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル) メチル) チオフェン - 2 - カルボキサミド、  
 5 - クロロ - N - ((1 - (4 - (4 - メチル - 1 , 4 - ジアゼパン - 1 - イル) フェニル) - 1H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル) メチル) チオフェン - 2 - カルボキサミド、  
 5 - クロロ - N - ((1 - (4 - (2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル) フェニル) - 1H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル) メチル) チオフェン - 2 - カルボキサミド、  
 5 - クロロ - N - ((1 - (2 ' - メトキシビフェニル - 4 - イル) - 1H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル) メチル) チオフェン - 2 - カルボキサミド、  
 5 - クロロ - N - ((1 - (2 ' - ヒドロキシビフェニル - 4 - イル) - 1H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル) メチル) チオフェン - 2 - カルボキサミド、  
 5 - クロロ - N - ((1 - (2 ' - (トリフルオロメトキシ) ピフェニル - 4 - イル) -

1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル) メチル) チオフェン - 2 - カルボキサミド  
、  
5 - クロロ - N - ((1 - (4 - (6 - クロロピリジン - 3 - イル) フェニル) - 1 H -  
1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル) メチル) チオフェン - 2 - カルボキサミド、  
N - ((1 - (4 - (1 H - インドール - 2 - イル) フェニル) - 1 H - 1 , 2 , 3 - ト  
リアゾール - 4 - イル) メチル) - 5 - クロロチオフェン - 2 - カルボキサミド、  
5 - クロロ - N - ((1 - (4 - (メチルスルホニル) フェニル) - 1 H - 1 , 2 , 3 -  
トリアゾール - 4 - イル) メチル) チオフェン - 2 - カルボキサミド、  
5 - クロロ - N - ((1 - (3 - フルオロ - 2 ' - スルファモイルビフェニル - 4 - イル  
) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル) メチル) チオフェン - 2 - カルボキサ  
ミド、  
5 - クロロ - N - ((1 - (4 - (ピロリジン - 1 - カルボニル) フェニル) - 1 H - 1  
, 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル) メチル) チオフェン - 2 - カルボキサミド、  
5 - クロロ - N - ((1 - (4 - (2 , 5 - ジヒドロ - 1 H - ピロール - 1 - カルボニル  
) フェニル) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル) メチル) チオフェン - 2 -  
カルボキサミド、  
N - ((1 - (4 - カルバモイルフェニル) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イ  
ル) メチル) - 5 - クロロチオフェン - 2 - カルボキサミド、  
N - ((1 - (4 - (2 - アミノ - N - メチルアセトアミド) フェニル) - 1 H - 1 , 2  
, 3 - トリアゾール - 4 - イル) メチル) - 5 - クロロチオフェン - 2 - カルボキサミ  
ド、  
5 - クロロ - N - ((1 - (4 - (メチル(2 - (メチルアミノ) エチル) アミノ) フ  
ェニル) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル) メチル) チオフェン - 2 - カルボ  
キサミド、  
5 - クロロ - N - ((1 - (4 - (メチルアミノ) フェニル) - 1 H - 1 , 2 , 3 - ト  
リアゾール - 4 - イル) メチル) チオフェン - 2 - カルボキサミド、  
5 - クロロ - N - ((1 - (4 - (N - メチルプロピオニアミド) フェニル) - 1 H - 1  
, 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル) メチル) チオフェン - 2 - カルボキサミド、 4 -  
(4 - ((5 - クロロチオフェン - 2 - カルボキサミド) メチル) - 1 H - 1 , 2 , 3 - ト  
リアゾール - 1 - イル) フェニル(メチル) カルバミン酸エチル、  
5 - クロロ - N - ((1 - (4 - (2 - メトキシ - N - メチルアセトアミド) フェニル)  
- 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル) メチル) チオフェン - 2 - カルボキサミ  
ド、  
5 - クロロ - N - ((1 - (4 - (2 - (ジメチルアミノ) - N - メチルアセトアミド) フ  
ェニル) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル) メチル) チオフェン - 2 - カ  
ルボキサミド、  
5 - クロロ - N - ((1 - (4 - (N - メチルアセトアミド) フェニル) - 1 H - 1 , 2  
, 3 - トリアゾール - 4 - イル) メチル) チオフェン - 2 - カルボキサミド、  
5 - クロロ - N - ((1 - (4 - (2 - ヒドロキシエトキシ) フェニル) - 1 H - 1 , 2  
, 3 - トリアゾール - 4 - イル) メチル) チオフェン - 2 - カルボキサミド、  
5 - クロロ - N - ((1 - (4 - (6 - オキソ - 1 , 6 - ジヒドロピリダジン - 3 - イル  
) フェニル) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル) メチル) チオフェン - 2 -  
カルボキサミド、  
5 - クロロ - N - ((3 - (2 - フルオロ - 4 - (2 - オキソピリジン - 1 (2 H) - イ  
ル) フェニル) - 5 - メチル - 4 , 5 - ジヒドロイソオキサゾール - 5 - イル) メチル)  
チオフェン - 2 - カルボキサミド、  
5 - クロロ - N - ((5 - オキソ - 1 - (4 - (2 - オキソピリジン - 1 (2 H) - イル  
) フェニル) - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾール - 3 - イル) メチル) チオフェン -  
2 - カルボキサミド、  
5 - クロロ - N - ((2 - オキソ - 1 - (4 - (2 - オキソピリジン - 1 (2 H) - イル

) フェニル) - 1 , 2 - ジヒドロピリジン - 3 -イル) メチル) チオフェン - 2 - カルボキサミド、  
5 - クロロ - N - ((6 - オキソ - 1 - (4 - (2 - オキソピリジン - 1 (2H) - イル)  
フェニル) - 1 , 6 - ジヒドロピリジン - 3 -イル) メチル) チオフェン - 2 - カルボキサミド、  
5 - クロロ - N - ((1 - メチル - 2 - (4 - (2 - オキソピリジン - 1 (2H) - イル)  
フェニル) - 1H - イミダゾール - 4 -イル) メチル) チオフェン - 2 - カルボキサミド、  
5 - クロロ - N - ((1 - (4 - ヨードフェニル) - 1H - イミダゾール - 4 -イル) メチル)  
チオフェン - 2 - カルボキサミド、  
5 - クロロ - N - ((1 - (4 - (1 - メチル - 6 - オキソ - 1 , 6 - ジヒドロピリダジ  
ン - 3 -イル) フェニル) - 1H - イミダゾール - 4 -イル) メチル) チオフェン - 2 -  
カルボキサミド、  
5 - クロロ - N - ((1 - (4 - (2 - メトキシピリジン - 3 -イル) フェニル) - 1H  
- イミダゾール - 4 -イル) メチル) チオフェン - 2 - カルボキサミド、  
5 - クロロ - N - ((1 - (4 - (2 - オキソ - 1 , 2 - ジヒドロピリジン - 3 -イル)  
フェニル) - 1H - イミダゾール - 4 -イル) メチル) チオフェン - 2 - カルボキサミド、  
5 - クロロ - N - ((1 - (4 - (1 - メチル - 2 - オキソ - 1 , 2 - ジヒドロピリジン  
- 3 -イル) フェニル) - 1H - イミダゾール - 4 -イル) メチル) チオフェン - 2 - カルボキサミド、  
N - ((1 - (4 - アミノフェニル) - 1H - イミダゾール - 4 -イル) メチル) - 5 -  
クロロチオフェン - 2 - カルボキサミド、  
5 - クロロ - N - ((1 - (4 - (2 , 5 - ジヒドロ - 1H - ピロール - 1 - カルボニル)  
フェニル) - 1H - イミダゾール - 4 -イル) メチル) チオフェン - 2 - カルボキサミド、  
4 - クロロ - N - ((1 - (4 - (2 - オキソピリジン - 1 (2H) - イル) フェニル)  
- 1H - イミダゾール - 4 -イル) メチル) ベンズアミド、  
N - ((1 - (4 - (2 - オキソピリジン - 1 (2H) - イル) フェニル) - 1H - イミ  
ダゾール - 4 -イル) メチル) アセトアミド、  
5 - クロロ - N - ((1 - (5 - (2 - オキソピリジン - 1 (2H) - イル) ピリジン -  
2 -イル) - 1H - イミダゾール - 4 -イル) メチル) チオフェン - 2 - カルボキサミド、  
5 - クロロ - N - ((1 - (6 - (2 - オキソピリジン - 1 (2H) - イル) ピリジン -  
3 -イル) - 1H - イミダゾール - 4 -イル) メチル) チオフェン - 2 - カルボキサミド、  
5 - クロロ - N - ((2 , 5 - ジブロモ - 1 - (4 - (N , N - ジメチルカルバムイミド  
イル) フェニル) - 1H - イミダゾール - 4 -イル) メチル) チオフェン - 2 - カルボキ  
サミド、  
5 - クロロ - N - ((2 , 5 - ジブロモ - 1 - (4 - (イミノ(ピロリジン - 1 -イル)  
メチル) フェニル) - 1H - イミダゾール - 4 -イル) メチル) チオフェン - 2 - カルボ  
キサミド、  
5 - クロロ - N - ((2 , 5 - ジブロモ - 1 - (4 - (1 - メチル - 4 , 5 - ジヒドロ -  
1H - イミダゾール - 2 -イル) フェニル) - 1H - イミダゾール - 4 -イル) メチル)  
チオフェン - 2 - カルボキサミド、  
5 - クロロ - N - ((1 - (4 - (9 - メチル - 2 , 6 - ジオキソ - 1H - プリン - 3 (2H , 6H , 9H) - イル) フェニル) - 1H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 -イル)  
メチル) チオフェン - 2 - カルボキサミド、  
5 - クロロ - N - ((1 - (4 - (1 - メチル - 6 - オキソ - 1 , 6 - ジヒドロピリダジ  
ン - 3 -イル) フェニル) - 1H - イミダゾール - 5 -イル) メチル) チオフェン - 2 -

カルボキサミド、

5 - クロロ - N - ( ( 4 - メチル - 1 - ( 4 - ( 2 - オキソピリジン - 1 ( 2 H ) - イル ) フェニル ) - 1 H - イミダゾール - 5 - イル ) メチル ) チオフェン - 2 - カルボキサミド、

5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 4 - ( 2 - オキソピラジン - 1 ( 2 H ) -イル ) フェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 -イル ) メチル ) チオフェン - 2 -カルボキサミド、

5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 2 - フルオロ - 4 - ( 2 - オキソピラジン - 1 ( 2 H ) - イル ) フェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) チオフェン - 2 - カルボキサミド、

5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 2 - フルオロ - 4 - ( 2 - オキソピリミジン - 1 ( 2 H ) - イル ) フェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) チオフェン - 2 - カルボキサミド、

5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 4 - ( 2 - オキソテトラヒドロピリミジン - 1 ( 2 H ) - イル ) フェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) チオフェン - 2 - カルボキサミド、

5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 2 - フルオロ - 4 - ( 2 - オキソ - テトラヒドロピリミジン - 1 ( 2 H ) - イル ) フェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) チオフェン - 2 - カルボキサミド、

5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 2 - フルオロ - 4 - ( 3 - メチル - 2 - オキソ - テトラヒドロピリミジン - 1 ( 2 H ) - イル ) フェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) チオフェン - 2 - カルボキサミド、

5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 2 - フルオロ - 4 - ( 2 - オキソピペリジン - 1 - イル ) フエニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) チオフェン - 2 - カルボキサミド、

5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 3 - フルオロ - 4 - ( 2 - オキソピリジン - 1 ( 2 H ) - イル ) フェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) チオフェン - 2 - カルボキサミド、

5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 4 - ( 3 - ヒドロキシ - 2 - オキソピリジン - 1 ( 2 H ) - イル ) フェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) チオフェン - 2 - カルボキサミド、

5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 4 - ( 3 - ( 2 - ヒドロキシエトキシ ) - 2 - オキソピリジン - 1 ( 2 H ) - イル ) フェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) チオフェン - 2 - カルボキサミド、

5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 4 - ( 3 - ( 2 - メトキシエトキシ ) - 2 - オキソピリジン - 1 ( 2 H ) - イル ) フェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) チオフェン - 2 - カルボキサミド、

5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 4 - ( 3 - ( 2 - ( ジメチルアミノ ) エトキシ ) - 2 - オキソピリジン - 1 ( 2 H ) - イル ) フェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) チオフェン - 2 - カルボキサミド、

5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 4 - ( 3 - ( 2 - ( ジメチル ( ジメチルアミノ ) アミノ ) エトキシ ) - 2 - オキソピリジン - 1 ( 2 H ) -イル ) フェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 -イル ) メチル ) チオフェン - 2 -カルボキサミド、

5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 4 - ( 2 - オキソ - 3 - ( 2 - ( ピペリジン - 1 - イル ) エトキシ ) ピリジン - 1 ( 2 H ) - イル ) フェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) チオフェン - 2 - カルボキサミド、

5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 4 - ( 2 - オキソ - 3 - ( 3 - ( ピペリジン - 1 - イル ) プロポキシ ) ピリジン - 1 ( 2 H ) - イル ) フェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) チオフェン - 2 - カルボキサミド、

5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 4 - ( 3 - ( 2 - ( メチルチオ ) エトキシ ) - 2 - オキソピ

リジン - 1 ( 2 H ) - イル ) フェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) チオフェン - 2 - カルボキサミド、  
5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 4 - ( 3 - ( 2 - ( メチルスルフィニル ) エトキシ ) - 2 - オキソピリジン - 1 ( 2 H ) - イル ) フェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) チオフェン - 2 - カルボキサミド、  
5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 4 - ( 3 - ( 2 - ( メチルスルホニル ) エトキシ ) - 2 - オキソピリジン - 1 ( 2 H ) - イル ) フェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) チオフェン - 2 - カルボキサミド、  
5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 4 - ( 3 - ( 2 - モルホリノエトキシ ) - 2 - オキソピリジン - 1 ( 2 H ) - イル ) フェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) チオフェン - 2 - カルボキサミド、  
N - ( ( 1 - ( 4 - ( 3 - ( 2 - ( 1 H - イミダゾール - 1 - イル ) エトキシ ) - 2 - オキソピリジン - 1 ( 2 H ) - イル ) フェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) - 5 - クロロチオフェン - 2 - カルボキサミド、  
5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 4 - ( 3 - ( ( 1 - メチル - 1 H - イミダゾール - 2 - イル ) メトキシ ) - 2 - オキソピリジン - 1 ( 2 H ) - イル ) フェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) チオフェン - 2 - カルボキサミド、  
5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 4 - ( 5 - ヒドロキシ - 2 - オキソピリジン - 1 ( 2 H ) - イル ) フェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) チオフェン - 2 - カルボキサミド、  
5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 4 - ( 5 - ( 2 - ( ジメチルアミノ ) エトキシ ) - 2 - オキソピリジン - 1 ( 2 H ) - イル ) フェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) チオフェン - 2 - カルボキサミド、  
5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 4 - ( 2 - オキソ - 5 - ( 2 - ( ピペリジン - 1 - イル ) エトキシ ) ピリジン - 1 ( 2 H ) - イル ) フェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) チオフェン - 2 - カルボキサミド、  
5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 4 - ( 5 - ( 2 - モルホリノエトキシ ) - 2 - オキソピリジン - 1 ( 2 H ) - イル ) フェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) チオフェン - 2 - カルボキサミド、  
5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 4 - ( 5 - ニトロ - 2 - オキソピリジン - 1 ( 2 H ) - イル ) フェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) チオフェン - 2 - カルボキサミド、  
N - ( ( 1 - ( 4 - ( 4 - アミノ - 2 - オキソピリミジン - 1 ( 2 H ) - イル ) フェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) - 5 - クロロチオフェン - 2 - カルボキサミド、  
5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 4 - ( 2 , 4 - ジオキソ - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 1 ( 2 H ) - イル ) フェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) チオフェン - 2 - カルボキサミド、  
N - ( ( 1 - ( 4 - ( 4 - アミノ - 5 - フルオロ - 2 - オキソピリミジン - 1 ( 2 H ) - イル ) フェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) - 5 - クロロチオフェン - 2 - カルボキサミド、  
5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 4 - ( 3 - メチル - 2 , 4 - ジオキソ - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 1 ( 2 H ) - イル ) フェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) チオフェン - 2 - カルボキサミド、  
5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 4 - ( 2 - オキソピペラジン - 1 - イル ) フェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) チオフェン - 2 - カルボキサミド、  
5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 4 - ( 4 - メチル - 2 - オキソピペラジン - 1 - イル ) フェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) チオフェン - 2 - カルボキサミド、  
5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 4 - ( 4 - イソプロピル - 2 - オキソピペラジン - 1 - イル

) フェニル) - 1H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 4 - イル) メチル) チオフェン - 2 - カルボキサミド、  
 4 - ( 4 - ( 4 - ( ( 5 - クロロチオフェン - 2 - カルボキサミド) メチル) - 1H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 1 - イル) フェニル) - 3 - オキソピペラジン - 1 - カルボキサミド、  
 5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 4 - ( 3 - ヒドロキシ - 2 - オキソピラジン - 1 ( 2H ) - イル) フェニル) - 1H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル) メチル) チオフェン - 2 - カルボキサミド、  
 5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 4 - ( 2 - ( ジメチルアミノ) エチル) - 2 , 3 - ジオキソ - 3 , 4 - ジヒドロピラジン - 1 ( 2H ) - イル) フェニル) - 1H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル) メチル) チオフェン - 2 - カルボキサミド、  
 5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 4 - ( 3 - ヒドロキシ - 6 - オキソピリダジン - 1 ( 6H ) - イル) フェニル) - 1H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル) メチル) チオフェン - 2 - カルボキサミド、  
 2 - ( ( 1 - ( 4 - ( 2 - オキソピリジン - 1 ( 2H ) - イル) フェニル) - 1H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル) メチルカルバモイル) 安息香酸、  
 N - ( ( 1 - ( 2 - ( 3 - オキソピペラジン - 1 - イル) - 4 - ( 2 - オキソピリジン - 1 ( 2H ) - イル) フェニル) - 1H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル) メチル) チオフェン - 2 - カルボキサミド、  
 5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 4 - ( 1 - メチル - 4 , 5 - ジヒドロ - 1H - イミダゾール - 2 - イル) フェニル) - 1H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 5 - イル) メチル) チオフェン - 2 - カルボキサミド、  
 5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 4 - ( N , N - ジメチルカルバムイミドイル) フェニル) - 1H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 5 - イル) メチル) チオフェン - 2 - カルボキサミド、  
 5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 4 - ( イミノ( ピロリジン - 1 - イル) メチル) フェニル) - 1H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 5 - イル) メチル) チオフェン - 2 - カルボキサミド、  
 5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 4 - ( イミノ( ピペリジン - 1 - イル) メチル) フェニル) - 1H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 5 - イル) メチル) チオフェン - 2 - カルボキサミド、  
 N - ( ( 1 - ( 4 - カルバモイルフェニル) - 1H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 5 - イル) メチル) - 5 - クロロチオフェン - 2 - カルボキサミド、  
 5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 4 - ( メチルスルホニル) フェニル) - 1H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 5 - イル) メチル) チオフェン - 2 - カルボキサミド、  
 5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 4 - ( 2 - オキソピリジン - 1 ( 2H ) - イル) フェニル) - 1H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 5 - イル) メチル) チオフェン - 2 - カルボキサミド、  
 5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 4 - ( ピリジン - 2 - イルチオ) フェニル) - 1H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 5 - イル) メチル) チオフェン - 2 - カルボキサミド、  
 5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 6 - ( ピロリジン - 1 - イル) ピリジン - 3 - イル) - 1H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル) メチル) チオフェン - 2 - カルボキサミド、  
 1 - ( 5 - ( 4 - ( ( 5 - クロロチオフェン - 2 - カルボキサミド) メチル) - 1H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 1 - イル) ピリジン - 2 - イル) ピペリジン - 4 - カルボン酸、  
 N - ( ( 1 - ( 6 - ( アゼパン - 1 - イル) ピリジン - 3 - イル) - 1H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル) メチル) - 5 - クロロチオフェン - 2 - カルボキサミド、  
 5 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 6 - ( 4 - メチル - 1 , 4 - ジアゼパン - 1 - イル) ピリジン - 3 - イル) - 1H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 5 - イル) メチル) チオフェン - 2 - カルボキサミド、

N - ((1 - (6 - (1, 4 - ディアゼパン - 1 - イル) ピリジン - 3 - イル) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 5 - イル) メチル) - 5 - クロロチオフェン - 2 - カルボキサミド、

5 - クロロ - N - ((1 - (6 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) ピリジン - 3 - イル) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 5 - イル) メチル) チオフェン - 2 - カルボキサミド、

5 - クロロ - N - ((1 - (6 - (ピペラジン - 1 - イル) ピリジン - 3 - イル) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 5 - イル) メチル) チオフェン - 2 - カルボキサミド、

5 - クロロ - N - (4 - (4 - ((5 - クロロチオフェン - 2 - カルボキサミド) メチル) - 1 H - イミダゾール - 1 - イル) ベンジル) チオフェン - 2 - カルボキサミド、

5 - クロロ - N - ((1 - (4 - (2 - オキソピリジン - 1 (2 H) - イル) フェニル) - 1 H - ピロール - 3 - イル) メチル) チオフェン - 2 - カルボキサミド、

5 - クロロ - N - ((1 - (4 - (2 - オキソピリジン - 1 (2 H) - イル) フェニル) - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) メチル) チオフェン - 2 - カルボキサミド、

5 - クロロ - N - ((1 - (4 - (4 - メチル - 1 , 4 - ディアゼパン - 1 - イル) フェニル) - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) メチル) チオフェン - 2 - カルボキサミド、

5 - クロロ - N - ((1 - (4 - (2 - オキソピラジン - 1 (2 H) - イル) フェニル) - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) メチル) チオフェン - 2 - カルボキサミド、

5 - クロロ - N - ((1 - (4 - (2 - オキソピリジン - 1 (2 H) - イル) フェニル) - 1 H - ピラゾール - 3 - イル) メチル) チオフェン - 2 - カルボキサミド、

5 - クロロ - N - ((1 - (3 - (2 - オキソピリジン - 1 (2 H) - イル) フェニル) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル) メチル) チオフェン - 2 - カルボキサミド、

5 - クロロ - N - ((1 - (4 - メチル - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - ベンゾ [ ] [1 , 4] オキサジン - 7 - イル) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル) メチル) チオフェン - 2 - カルボキサミド、

5 - クロロ - N - ((1 - (3 - メトキシ - 4 - (2 - オキソピリジン - 1 (2 H) - イル) フェニル) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル) メチル) チオフェン - 2 - カルボキサミド、および

5 - クロロ - N - ((1 - (5 - (2 - オキソピリジン - 1 (2 H) - イル) キノリン - 8 - イル) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル) メチル) チオフェン - 2 - カルボキサミド

からなる群から選択される化合物または薬剤として許容されるその塩、エステルもしくはプロドラッグ。

#### 【請求項 16】

薬剤として許容される賦形剤および請求項 1 または 15 に記載の化合物を含む組成物。

#### 【請求項 17】

哺乳動物における望ましくない血栓を特徴とする状態を予防または治療するための組成物であって、治療有効量の請求項 1 に記載の化合物を含む、組成物。

#### 【請求項 18】

前記状態が、急性冠症候群、心筋梗塞症、不安定狭心症、難治性の狭心症、血栓溶解治療後もしくは冠動脈血管形成術後に起こる冠動脈内血栓性閉塞、血栓により媒介される脳血管症候群、塞栓性脳卒中、血栓性脳卒中、一過性脳虚血発作、静脈血栓症、深部静脈血栓症、肺動脈塞栓、凝血障害、播種性血管内凝固症候群、血栓性血小板減少性紫斑病、閉塞性血栓血管炎、ヘパリン起因性血小板減少症に付随する血栓症、体外循環に付随する血栓性合併症、心臓もしくは他の血管内カテーテル、大動脈内バルーンポンプ、冠状動脈ステントまたは心臓弁などの器具の使用に付随する血栓性合併症、および人工器官の取付けを要する状態からなる群から選択される、請求項 17 に記載の組成物。

#### 【請求項 19】

血液試料の凝固を阻止する方法であって、該試料を請求項 1 または 15 に記載の化合物

と接触させることを含む、方法。