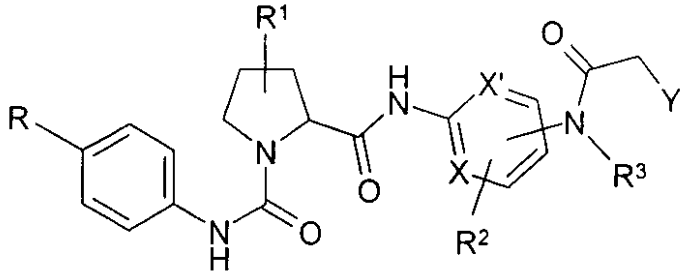
【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】平成20年1月17日(2008.1.17)

【公表番号】特表2007-513988(P2007-513988A)
【公表日】平成19年5月31日(2007.5.31)
【年通号数】公開・登録公報2007-020
【出願番号】特願2006-544256(P2006-544256)
【国際特許分類】
Ｃ０７Ｄ 207/16 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/401 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 7/02 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 43/00 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 9/10 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 29/00 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 25/06 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 35/00 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 35/04 (2006.01)
【ＦＩ】
Ｃ０７Ｄ 207/16 ＣＳＰ
Ａ６１Ｋ 31/401
Ａ６１Ｐ 7/02
Ａ６１Ｐ 43/00 １１１
Ａ６１Ｐ 9/10
Ａ６１Ｐ 9/10 １０１
Ａ６１Ｐ 29/00
Ａ６１Ｐ 25/06
Ａ６１Ｐ 35/00
Ａ６１Ｐ 35/04

【手続補正書】
【提出日】平成19年11月22日(2007.11.22)
【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
【化１】



Ｉ

式中、

Ｒは、Ｈａｌ、－Ｃ≡Ｃ－Ｈ、－Ｃ≡Ｃ－ＡまたはＯＡを示し、
$Ｒ^{1}$は、Ｈ、＝Ｏ、Ｈａｌ、Ａ、ＯＨ、ＯＡ、Ａ－ＣＯＯ－、Ｐｈ－$（ＣＨ_{2}）_{ｎ}$－ＣＯＯ－、シクロアルキル－$（ＣＨ_{2}）_{ｎ}$－ＣＯＯ－、Ａ－ＣＯＮＨ－、Ａ－ＣＯＮＡ－、Ｐｈ－ＣＯＮＡ－、$Ｎ_{3}$、$ＮＨ_{2}$、$ＮＯ_{2}$、ＣＮ、ＣＯＯＨ、ＣＯＯＡ、$ＣＯＮＨ_{2}$、ＣＯＮＨＡ、$ＣＯＮ（Ａ）_{2}$、Ｏ－アリル、Ｏ－プロパルギル、Ｏ－ベンジル、＝Ｎ－ＯＨ、＝Ｎ－ＯＡまたは$＝ＣＦ_{2}$を示し、
Ｘ、Ｘ’は、互いに独立して、ＣＨ、ＣＨａｌまたはＮを示し、
Ｙは、$Ｒ^{4}$またはＨａｌを示し、
Ｐｈは、置換されていないか、あるいはＡ、ＯＡ、ＯＨまたはＨａｌにより単置換、二置換または三置換されているフェニルを示し、
$Ｒ^{2}$は、Ｈ、ＨａｌまたはＡを示し、
$Ｒ^{3}$は、ＨまたはＡを示し、
$Ｒ^{4}$は、ＯＨ、ＯＡ、Ａ－ＣＯＯ－、ＮＨＡ、ＮＨＡｒ、ＮＡＡ’、Ｈｅｔまたは－ＮＨ－$ＣＨＲ^{5}$－$ＣＯＯＲ^{3}$を示し、
$Ｒ^{5}$は、Ｈ、Ａ、－$ＣＨＲ^{3}$－ＯＨ、$（ＣＨ_{2}）_{ｎ}$－Ｐｈ、$（ＣＨ_{2}）_{ｎ}$－ＣＯＯＨ、$（ＣＨ_{2}）_{ｎ}$－$ＣＯＮＨ_{2}$、$（ＣＨ_{2}）_{ｐ}$－$ＮＨ_{2}$、$（ＣＨ_{2}）_{ｎ}$－ＮＨ（＝ＮＨ）$ＮＨ_{2}$、$（ＣＨ_{2}）_{ｎ}$－$Ｈｅｔ^{1}$または$（ＣＨ_{2}）_{ｎ}$－$ＳＲ^{3}$を示し、
Ｈｅｔは、単環式または二環式で、飽和、不飽和または芳香族性の１～４個のＮ、Ｏおよび／またはＳ原子を有する複素環を示し、それは置換されていないか、あるいはＡ、ＯＨ、ＯＡ、ＣＮ、ＣＯＯＨ、ＣＯＯＡおよび／またはカルボニル酸素（＝Ｏ）により単置換、二置換または三置換されていてもよく、
$Ｈｅｔ^{1}$は、単環式または二環式で、芳香族性の１～４個のＮ、Ｏおよび／またはＳ原子を有する複素環を示し、それは置換されていないか、あるいはＡ、ＯＨ、ＯＡおよび／またはＣＮにより単置換、二置換または三置換されていてもよく、
Ａ、Ａ’は、互いに独立して、１～１２個のＣ原子を有する非分枝状、分枝状または環状アルキルを示し、加えて、１～７個のＨ原子がＦおよび／または塩素により置き換えられてもよく、
Ａｒは、ナフチル、ビフェニル、またはフェニルを示し、それは置換されていないか、あるいはＨａｌ、Ａ、$ＯＲ^{3}$、$Ｎ（Ｒ^{3}）_{2}$、$ＮＯ_{2}$、ＣＮ、$ＣＯＯＲ^{3}$、$ＣＯＮ（Ｒ^{3}）_{2}$、$ＮＲ^{3}$ＣＯＡ、$ＮＲ^{3}$$ＣＯＮ（Ｒ^{3}）_{2}$、$ＮＲ^{3}$$ＳＯ_{2}$Ａ、$ＣＯＲ^{3}$、$ＳＯ_{2}Ｎ（Ｒ^{3}）_{2}$、$Ｓ（Ｏ）_{ｎ}$Ａ、－$［Ｃ（Ｒ^{3}）_{2}］_{ｎ}$－$ＣＯＯＲ^{3}$または－Ｏ－$［Ｃ（Ｒ^{3}）_{2}］_{ｐ}$－$ＣＯＯＲ^{3}$により単置換、二置換または三置換されており、
Ｈａｌは、Ｆ、Ｃｌ、ＢｒまたはＩを示し、
ｎは、０、１、２または３を示し、
ｐは、１、２、３、４または５を示す、
で表される化合物、またはそれらの薬学的に使用できる誘導体、溶媒和物、塩もしくは立体異性体、あるいはそれらの全ての比率での混合物。

【請求項２】
Ｒが、Ｈａｌまたは－Ｃ≡Ｃ－Ｈを示す、
請求項１に記載の化合物、またはそれらの薬学的に使用できる誘導体、溶媒和物、塩もしくは立体異性体、あるいはそれらの全ての比率での混合物。

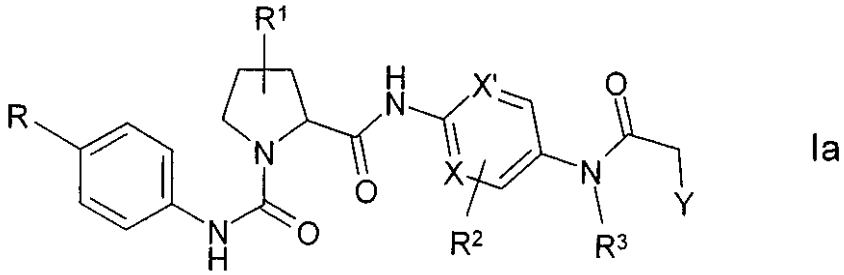
【請求項３】
$Ｒ^{1}$が、Ｈ、＝Ｏ、Ｈａｌ、Ａ、ＯＨまたはＯＡを示す、
請求項１または２に記載の化合物、またはそれらの薬学的に使用できる誘導体、溶媒和物、塩もしくは立体異性体、あるいはそれらの全ての比率での混合物。

【請求項４】
$Ｒ^{1}$が、ＯＨを示す、
請求項１～３のいずれかに記載の化合物、またはそれらの薬学的に使用できる誘導体、溶媒和物、塩もしくは立体異性体、あるいはそれらの全ての比率での混合物。

【請求項５】

Ｘが、ＣＨまたはＮを示し、
Ｘ’が、ＣＨを示す、
請求項１～４のいずれかに記載の化合物、またはそれらの薬学的に使用できる誘導体、溶媒和物、塩もしくは立体異性体、あるいはそれらの全ての比率での混合物。
【請求項６】
Ｒ^{2}が、ＨまたはＨａｌを示し、
請求項１～５のいずれかに記載の化合物、またはそれらの薬学的に使用できる誘導体、溶媒和物、塩もしくは立体異性体、あるいはそれらの全ての比率での混合物。
【請求項７】
Ｒ^{3}が、Ｈあるいは１、２、３、４、５または６個のＣ原子を有するアルキルを示す、
請求項１～６のいずれかに記載の化合物、またはそれらの薬学的に使用できる誘導体、溶媒和物、塩もしくは立体異性体、あるいはそれらの全ての比率での混合物。
【請求項８】
Ｈｅｔが、単環式で、飽和、不飽和または芳香族性の１～２個のＮおよび／またはＯ原子を有する複素環を示し、それは置換されていないか、あるいはＡ、ＯＨおよび／またはＯＡにより単置換、二置換または三置換されてもよい、
請求項１～７のいずれかに記載の化合物、またはそれらの薬学的に使用できる誘導体、溶媒和物、塩もしくは立体異性体、あるいはそれらの全ての比率での混合物。
【請求項９】
Ｈｅｔが、フリル、チエニル、ピロリル、イミダゾリル、ピリジル、ピリミジニル、ピラゾリル、チアゾリル、インドリル、ピロリジニル、ピペリジニル、モルホリニルまたはピペラジニルを示し、それぞれは、置換されていないか、あるいはＡ、ＯＨおよび／またはＯＡにより単置換、二置換または三置換されている、
請求項１～８のいずれかに記載の化合物、またはそれらの薬学的に使用できる誘導体、溶媒和物、塩もしくは立体異性体、あるいはそれらの全ての比率での混合物。
【請求項１０】
Ｈｅｔ^{1}が、無置換で、単環式または二環式の、芳香族性の１～２個のＮ、Ｏおよび／またはＳ原子を有する複素環を示す、
請求項１～９のいずれかに記載の化合物、またはそれらの薬学的に使用できる誘導体、溶媒和物、塩もしくは立体異性体、あるいはそれらの全ての比率での混合物。
【請求項１１】
Ｒ^{5}が、ＨまたはＡを示す、
請求項１～１０のいずれかに記載の化合物、またはそれらの薬学的に使用できる誘導体、溶媒和物、塩もしくは立体異性体、あるいはそれらの全ての比率での混合物。
【請求項１２】
Ａｒが、ナフチル、またはフェニルを示し、それは置換されていないか、あるいはＨａｌ、Ａ、ＯＲ^{3}、Ｎ（Ｒ^{3}）$_{2}$、ＮＯ$_{2}$、ＣＮ、ＣＯＯＲ^{3}またはＣＯＮ（Ｒ^{3}）$_{2}$により単置換、二置換または三置換されている、
請求項１～１１のいずれかに記載の化合物、またはそれらの薬学的に使用できる誘導体、溶媒和物、塩もしくは立体異性体、あるいはそれらの全ての比率での混合物。
【請求項１３】
Ａｒが、フェニルを示す、
請求項１～１２のいずれかに記載の化合物、またはそれらの薬学的に使用できる誘導体、溶媒和物、塩もしくは立体異性体、あるいはそれらの全ての比率での混合物。
【請求項１４】
Ｒが、Ｈａｌまたは－Ｃ≡Ｃ－Ｈを示し、
Ｒ^{1}が、ＯＨを示し、
Ｘが、ＣＨまたはＮを示し、
Ｘ’が、ＣＨを示し、
Ｙが、Ｒ^{4}またはＨａｌを示し、

R^2が、HまたはＨａｌを示し、
R^3が、１、２、３、４、５または６個のＣ原子を有するアルキルを示し、
R^4が、ＯＨ、ＯＡ、Ａ－ＣＯＯ－、ＮＨＡ、ＮＨＡｒ、ＮＡＡ’、Ｈｅｔ、－ＮＨ－ＣＨＲ^5－ＣＯＯＲ^{3}または－ＮＨ－ＣＨＲ^5－ＣＯＯＨを示し、
R^5が、HまたはＡを示し、
Ｈｅｔが、単環式で、飽和、不飽和または芳香族性の１～２個のＮおよび／またはＯ原子を有する複素環を示し、それは置換されていないか、あるいはＡ、ＯＨおよび／またはＯＡにより単置換、二置換または三置換されてもよく、
Ａ、Ａ’が、互いに独立して、１～１２個のＣ原子を有する非分枝状、分枝状または環状アルキルを示し、加えて、１～７個のＨ原子がＦおよび／または塩素により置き換えられてもよく、
Ｈａｌが、Ｆ、Ｃｌ、ＢｒまたはＩを示し、
ｎが、０、１、２または３を示し、
ｐが、１、２、３、４または５を示す、
請求項１～１３のいずれかに記載の化合物、またはそれらの薬学的に使用できる誘導体、溶媒和物、塩もしくは立体異性体、あるいはそれらの全ての比率での混合物。
【請求項１５】
式Ｉａ
【化２】



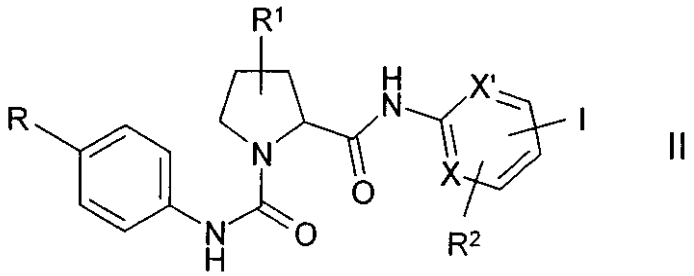
Ia

式中、
Ｒは、Ｈａｌまたは－Ｃ≡Ｃ－Ｈを示し、
R^1は、ＯＨを示し、
Ｘは、ＣＨまたはＮを示し、
Ｘ’は、ＣＨを示し、
Ｙは、R^4またはＨａｌを示し、
R^2は、HまたはＨａｌを示し、
R^3は、１、２、３、４、５または６個のＣ原子を有するアルキルを示し、
R^4は、ＯＨ、ＯＡ、Ａ－ＣＯＯ－、ＮＨＡ、ＮＡＡ’、Ｈｅｔ、－ＮＨ－ＣＨＲ^5－ＣＯＯＲ^{3}または－ＮＨ－ＣＨＲ^5－ＣＯＯＨを示し、
R^5は、HまたはＡを示し、
Ｈｅｔは、単環式で、飽和、不飽和または芳香族性の１～２個のＮおよび／またはＯ原子を有する複素環を示し、それは置換されていないか、あるいはＡ、ＯＨおよび／またはＯＡにより単置換、二置換または三置換されていてもよく、
Ａ、Ａ’は、互いに独立して、１～１２個のＣ原子を有する非分枝状、分枝状または環状アルキルを示し、加えて、１～７個のＨ原子がＦおよび／または塩素により置き換えられてもよく、
Ｈａｌは、Ｆ、Ｃｌ、ＢｒまたはＩを示し、
ｎは、０、１、２または３を示し、
ｐは、１、２、３、４または５を示す、
で表される請求項１～１４のいずれかに記載の化合物、またはそれらの薬学的に使用できる誘導体、溶媒和物、塩もしくは立体異性体、あるいはそれらの全ての比率での混合物。
【請求項１６】

群
１－Ｎ－（４－クロロフェニル）－２－Ｎ－｛４－［（２－ジメチルアミノエタノイル）メチルアミノ］フェニル｝－（２Ｒ，４Ｒ）－４－ヒドロキシピロリジン－１，２－ジカルボキサミド、
１－Ｎ－（４－クロロフェニル）－２－Ｎ－｛４－［（２－（Ｎ－メチル，Ｎ－ブチルアミノ）－エタノイル）メチルアミノ］フェニル｝－（２Ｒ，４Ｒ）－４－ヒドロキシピロリジン－１，２－ジカルボキサミド、
１－Ｎ－（４－クロロフェニル）－２－Ｎ－｛４－［（２－（モルホリン－４－イル）エタノイル）メチルアミノ］フェニル｝－（２Ｒ，４Ｒ）－４－ヒドロキシピロリジン－１，２－ジカルボキサミド、
１－Ｎ－（４－クロロフェニル）－２－Ｎ－｛４－［（２－（４－ヒドロキシピペリジン－１－イル）－エタノイル）メチルアミノ］フェニル｝－（２Ｒ，４Ｒ）－４－ヒドロキシピロリジン－１，２－ジカルボキサミド、
１－Ｎ－（４－クロロフェニル）－２－Ｎ－｛４－［（２－（２，６－ジメチルモルホリン－４－イル）－エタノイル）メチルアミノ］フェニル｝－（２Ｒ，４Ｒ）－４－ヒドロキシピロリジン－１，２－ジカルボキサミド、
１－Ｎ－（４－クロロフェニル）－２－Ｎ－｛４－［（２－（３－シクロヘキシルメチルピペリジン－１－イル）エタノイル）メチルアミノ］フェニル｝－（２Ｒ，４Ｒ）－４－ヒドロキシピロリジン－１，２－ジカルボキサミド、
１－Ｎ－（４－クロロフェニル）－２－Ｎ－｛４－［（２－ジエチルアミノエタノイル）メチルアミノ］フェニル｝－（２Ｒ，４Ｒ）－４－ヒドロキシピロリジン－１，２－ジカルボキサミド、
１－Ｎ－（４－クロロフェニル）－２－Ｎ－｛４－［（２－（Ｎ－メチル，Ｎ－エチルアミノ）エタノイル）メチルアミノ］フェニル｝－（２Ｒ，４Ｒ）－４－ヒドロキシピロリジン－１，２－ジカルボキサミド、
１－Ｎ－（４－クロロフェニル）－２－Ｎ－｛４－［（２－（２－メチルイミダゾール－１－イル）エタノイル）メチルアミノ］フェニル｝－（２Ｒ，４Ｒ）－４－ヒドロキシピロリジン－１，２－ジカルボキサミド、
１－Ｎ－（４－エチニルフェニル）－２－Ｎ－｛４－［（２－ジメチルアミノエタノイル）メチルアミノ］フェニル｝－（２Ｒ，４Ｒ）－４－ヒドロキシピロリジン－１，２－ジカルボキサミド、
１－Ｎ－（４－クロロフェニル）－２－Ｎ－｛２－フルオロ－４－［（２－ジメチルアミノエタノイル）メチルアミノ］フェニル｝－（２Ｒ，４Ｒ）－４－ヒドロキシピロリジン－１，２－ジカルボキサミド、
１－Ｎ－（４－クロロフェニル）－２－Ｎ－｛５－［（２－ジメチルアミノエタノイル）メチルアミノ］ピリジン－２－イル｝－（２Ｒ，４Ｒ）－４－ヒドロキシピロリジン－１，２－ジカルボキサミド、
１－Ｎ－（４－クロロフェニル）－２－Ｎ－｛４－［（２－アセトキシエタノイル）メチルアミノ］フェニル｝－（２Ｒ，４Ｒ）－４－ヒドロキシピロリジン－１，２－ジカルボキサミド、
メチル（２Ｒ，４Ｒ）－２－［（｛［４－（｛１－［１－（４－クロロフェニルカルバモイル）－４－ヒドロキシピロリジン－２－イル］メタノイル｝アミノ）フェニル］メチルカルバモイル｝メチル）アミノ］－４－メチルペンタノアート、
１－Ｎ－（４－クロロフェニル）－２－Ｎ－｛４－［（２－エチルアミノエタノイル）メチルアミノ］フェニル｝－（２Ｒ，４Ｒ）－４－ヒドロキシピロリジン－１，２－ジカルボキサミド、
１－Ｎ－（４－クロロフェニル）－２－Ｎ－｛４－［（２－クロロエタノイル）メチルアミノ］フェニル｝－（２Ｒ，４Ｒ）－４－ヒドロキシピロリジン－１，２－ジカルボキサミド、
１－Ｎ－（４－クロロフェニル）－２－Ｎ－｛４－［（２－シクロヘキシルアミノエタノ

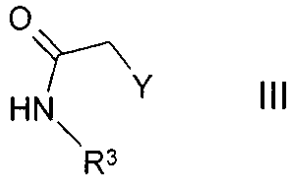
イル）メチルアミノ］フェニル｝－（２Ｒ，４Ｒ）－４－ヒドロキシピロリジン－１，２－ジカルボキサミド、
１－Ｎ－（４－クロロフェニル）－２－Ｎ－｛４－［（２－メチルアミノエタノイル）メチルアミノ］フェニル｝－（２Ｒ，４Ｒ）－４－ヒドロキシピロリジン－１，２－ジカルボキサミド、
１－Ｎ－（４－クロロフェニル）－２－Ｎ－｛４－［（２－イソプロピルアミノエタノイル）メチルアミノ］フェニル｝－（２Ｒ，４Ｒ）－４－ヒドロキシピロリジン－１，２－ジカルボキサミド、
１－Ｎ－（４－クロロフェニル）－２－Ｎ－｛４－［（２－ｔｅｒｔ－ブチルアミノエタノイル）メチルアミノ］フェニル｝－（２Ｒ，４Ｒ）－４－ヒドロキシピロリジン－１，２－ジカルボキサミド、
１－Ｎ－（４－クロロフェニル）－２－Ｎ－｛４－［（２－シクロペンチルアミノエタノイル）メチルアミノ］フェニル｝－（２Ｒ，４Ｒ）－４－ヒドロキシピロリジン－１，２－ジカルボキサミド、
１－Ｎ－（４－クロロフェニル）－２－Ｎ－｛４－［（２－シクロプロピルメチルアミノエタノイル）メチルアミノ］フェニル｝－（２Ｒ，４Ｒ）－４－ヒドロキシピロリジン－１，２－ジカルボキサミド、
１－Ｎ－（４－クロロフェニル）－２－Ｎ－｛４－［（２－ヒドロキシエタノイル）メチルアミノ］フェニル｝－（２Ｒ，４Ｒ）－４－ヒドロキシピロリジン－１，２－ジカルボキサミド、
１－Ｎ－（４－クロロフェニル）－２－Ｎ－｛４－［（２－メトキシエタノイル）メチルアミノ］フェニル｝－（２Ｒ，４Ｒ）－４－ヒドロキシピロリジン－１，２－ジカルボキサミド、
１－Ｎ－（４－クロロフェニル）－２－Ｎ－｛４－［（２－エトキシエタノイル）メチルアミノ］フェニル｝－（２Ｒ，４Ｒ）－４－ヒドロキシピロリジン－１，２－ジカルボキサミド、
１－Ｎ－（４－クロロフェニル）－２－Ｎ－｛４－［（２－プロポキシエタノイル）メチルアミノ］フェニル｝－（２Ｒ，４Ｒ）－４－ヒドロキシピロリジン－１，２－ジカルボキサミド、
１－Ｎ－（４－クロロフェニル）－２－Ｎ－｛４－［（２－ブトキシエタノイル）メチルアミノ］フェニル｝－（２Ｒ，４Ｒ）－４－ヒドロキシピロリジン－１，２－ジカルボキサミド、
１－Ｎ－（４－エチニルフェニル）－２－Ｎ－｛４－［（２－メトキシエタノイル）メチルアミノ］フェニル｝－（２Ｒ，４Ｒ）－４－ヒドロキシピロリジン－１，２－ジカルボキサミド、
１－Ｎ－（４－クロロフェニル）－２－Ｎ－｛２－フルオロ－４－［（２－メトキシエタノイル）メチルアミノ］フェニル｝－（２Ｒ，４Ｒ）－４－ヒドロキシピロリジン－１，２－ジカルボキサミド、
１－Ｎ－（４－クロロフェニル）－２－Ｎ－｛５－［（２－メトキシエタノイル）メチルアミノ］ピリジン－２－イル｝－（２Ｒ，４Ｒ）－４－ヒドロキシピロリジン－１，２－ジカルボキサミド、
から選択される請求項１に記載の化合物、またはそれらの薬学的に使用できる誘導体、溶媒和物、塩もしくは立体異性体、あるいはそれらの全ての比率での混合物。
【請求項１７】
請求項１～１６のいずれかに記載の式Ｉで表される化合物またはそれらの薬学的に使用できる誘導体、溶媒和物、塩もしくは立体異性体の製造方法であって、
ａ）式ＩＩ

【化３】



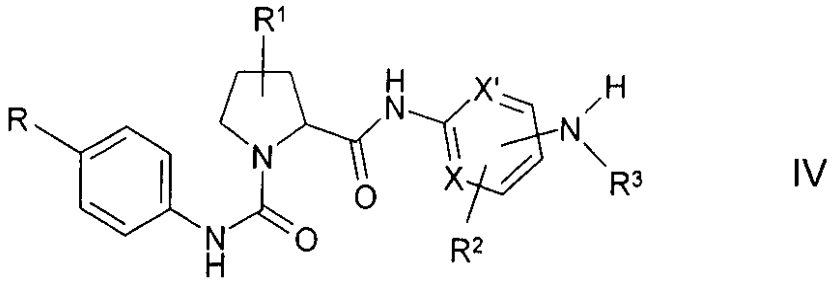
II

式中、Ｒ、Ｒ[1]、Ｒ[2]、ＸおよびＸ’は、請求項１に示した意味を有する、
で表される化合物を、
式ＩＩＩ
【化４】



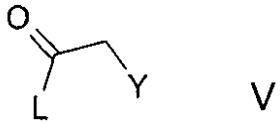
III

式中、ＹおよびＲ[3]は、請求項１に示した意味を有する、
で表される化合物と反応させること、
または
ｂ）式ＩＶ
【化５】



IV

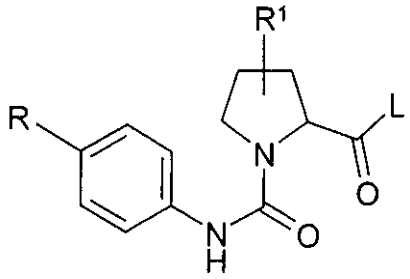
式中、Ｒ、Ｒ[1]、Ｒ[2]、Ｒ[3]、ＸおよびＸ’は、請求項１に示した意味を有する、
で表される化合物を、式Ｖ
【化６】



V

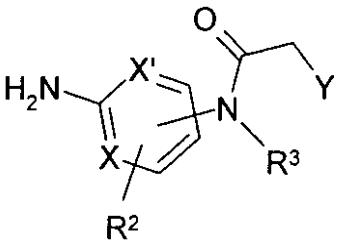
式中、Ｙは、請求項１に示した意味を有し、
Ｌは、Ｃｌ、Ｂｒ、Ｉもしくは遊離のまたは活性に官能基修飾されたＯＨ基を示す、
で表される化合物と反応させること、
または
ｃ）式ＶＩ

【化７】



VI

式中、ＲおよびＲ[1]は、請求項１に示した意味を有し、
Ｌは、Ｃｌ、Ｂｒ、Ｉもしくは遊離のまたは活性に官能基修飾されたＯＨ基を示す、
で表される化合物を、
式ＶＩＩ
【化８】



VII

式中、Ｒ[2]、Ｒ[3]、Ｘ、Ｘ’およびＹは、請求項１に示した意味を有する、
で表される化合物と反応させること、
および／または
式Ｉの塩基または酸を、その塩の１種に変換すること、
を特徴とする、前記製造方法。
【請求項１８】
凝固因子Ｘａの阻害剤としての、請求項１～１６のいずれかに記載の式Ｉで表される化合物。
【請求項１９】
凝固因子ＶＩＩａの阻害剤としての、請求項１～１６のいずれかに記載の式Ｉで表される化合物。
【請求項２０】
請求項１～１６のいずれかに記載の式Ｉで表される化合物の少なくとも１種および／またはそれらの薬学的に使用できる誘導体、溶媒和物もしくは立体異性体、またはそれらの全ての比率での混合物、あるいは任意に賦形剤および／または補助剤を含む医薬。
【請求項２１】
請求項１～１６のいずれかに記載の式Ｉで表される化合物の少なくとも１種および／またはそれらの薬学的に使用できる誘導体、溶媒和物もしくは立体異性体、またはそれらの全ての比率での混合物、あるいは少なくとも１種の更なる医薬活性成分を含む医薬。
【請求項２２】
請求項１～１６のいずれかに記載の化合物および／またはそれらの生理学的に許容しうる塩もしくは溶媒和物の使用であって、血栓症、心筋梗塞、動脈硬化症、炎症、卒中、狭心症、血管形成術後の再狭窄、間歇性跛行、偏頭痛、腫瘍、腫瘍疾患および／または腫瘍転移の処置に対する医薬の製造のための使用。
【請求項２３】
（ａ）有効量の請求項１～１６のいずれかに記載の化合物および／またはそれらの薬学的に使用できる誘導体、溶媒和物もしくは立体異性体、またはそれらの全ての比率での混合物
および

（ｂ）有効量の更なる医薬活性成分
の分離パックからなるセット（キット）。
【請求項２４】
請求項１～１６のいずれかに記載の式Ｉで表される化合物および／またはそれらの薬学的に使用できる誘導体、溶媒和物もしくは立体異性体、またはそれらの全ての比率での混合物の使用であって、血栓症、心筋梗塞、動脈硬化症、炎症、卒中、狭心症、血管形成術後の再狭窄、間歇性跛行、偏頭痛、腫瘍、腫瘍疾患および／または腫瘍転移の処置に対し、少なくとも１種の更なる医薬活性成分と組み合わせた医薬の製造のための使用。
【手続補正２】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】０００６
【補正方法】変更
【補正の内容】
【０００６】
Ｈａｌは、Ｆ、Ｃｌ、ＢｒまたはＩを示し、
ｎは、０、１、２または３を示し、
ｐは、１、２、３、４または５を示す、
で表される化合物、またはそれらの薬学的に使用できる誘導体、溶媒和物、塩もしくは立体異性体、あるいはそれらの全ての比率での混合物に関する。
【手続補正３】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】００２６
【補正方法】変更
【補正の内容】
【００２６】
本発明は、式Ｉの化合物およびそれらの塩に関し、ならびに請求項１～１６に記載の式Ｉの化合物またはそれらの薬学的に使用できる誘導体、溶媒和物、塩もしくは立体異性体の製造方法であって、
【手続補正４】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】００６０
【補正方法】変更
【補正の内容】
【００６０】
Ｈｅｔは、フリル、チエニル、ピロリル、イミダゾリル、ピリジル、ピリミジニル、ピラゾリル、チアゾリル、インドリル、ピロリジニル、ピペリジニル、モルホリニルまたはピペラジニルを示し、それぞれは、置換されていないか、あるいはＡ、ＯＨおよび／またはＯＡにより単置換、二置換または三置換されていて、
Ａ、Ａ’は、互いに独立して、１～１２個のＣ原子を有する非分枝状、分枝状または環状アルキルを示し、加えて、１～７個のＨ原子がＦおよび／または塩素、あるいはＦ、Ｃｌ、ＢｒまたはＩにより置き換えられてもよく、
Ｈａｌは、Ｆ、Ｃｌ、ＢｒまたはＩを示し、
ｎは、０、１、２または３を示し、
ｐは、１、２、３、４または５を示す、
で表される請求項１～１４のいずれかに記載の化合物、またはそれらの薬学的に使用できる誘導体、溶媒和物もしくは立体異性体、あるいはそれらの全ての比率での混合物である。