

【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】令和2年7月9日(2020.7.9)

【公開番号】特開2017-218449(P2017-218449A)

【公開日】平成29年12月14日(2017.12.14)

【年通号数】公開・登録公報2017-048

【出願番号】特願2017-111066(P2017-111066)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/444 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 7/02 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 K 31/519 (2006.01)

A 6 1 K 31/437 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/444

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 7/02

A 6 1 P 11/00

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 9/10

A 6 1 K 31/519

A 6 1 K 31/437

【手続補正書】

【提出日】令和2年5月25日(2020.5.25)

【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

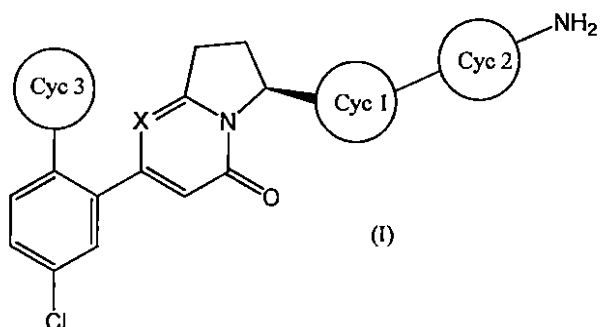
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

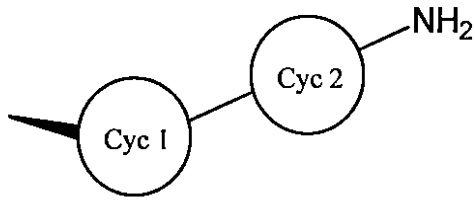
【請求項1】

一般式(I)

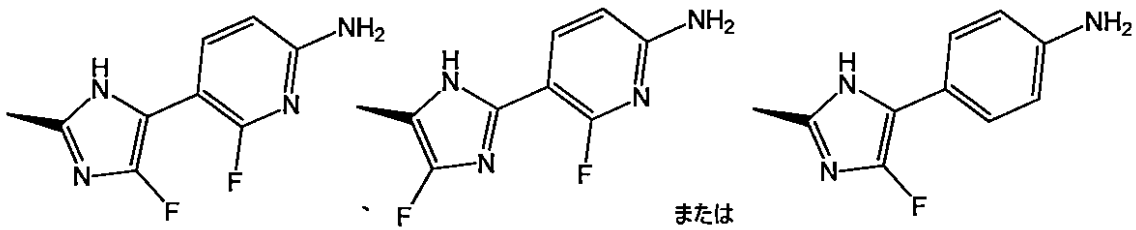
【化1】



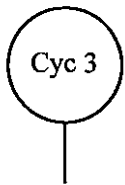
[式中、
【化 2】



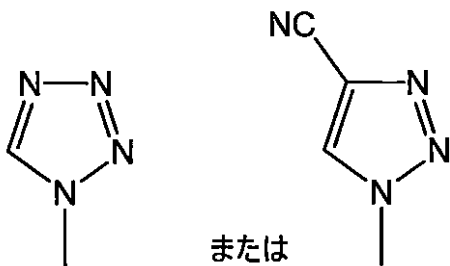
は、
【化 3】



を表し、
【化 4】



は、
【化 5】



を表し、

XはCHまたはNを表す。]

で示される化合物、その塩、その溶媒和物、またはそのN-オキシド体を含有する経口剤

。

【請求項 2】

(3S) - 3 - [5 - (6 - アミノ - 2 - フルオロ - 3 - ピリジニル) - 4 - フルオロ

- 1 H - イミダゾール - 2 - イル] - 7 - [5 - クロロ - 2 - (1 H - テトラゾール - 1 - イル) フェニル] - 2 , 3 - ジヒドロ - 5 (1 H) - インドリジノン、 (6 S) - 6 - [2 - (6 - アミノ - 2 - フルオロ - 3 - ピリジニル) - 4 - フルオロ - 1 H - イミダゾール - 5 - イル] - 2 - [5 - クロロ - 2 - (1 H - テトラゾール - 1 - イル) フェニル] - 7 , 8 - ジヒドロピロロ [1 , 2 - a] ピリミジン - 4 (6 H) - オン、もしくは 1 - (2 - { (3 S) - 3 - [5 - (4 - アミノフェニル) - 4 - フルオロ - 1 H - イミダゾール - 2 - イル] - 5 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 5 - テトラヒドロ - 7 - インドリジニル } - 4 - クロロフェニル) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - カルボニトリル、その塩、その溶媒和物、またはその N - オキシド体を含有する経口剤。

【請求項 3】

(3 S) - 3 - [5 - (6 - アミノ - 2 - フルオロ - 3 - ピリジニル) - 4 - フルオロ - 1 H - イミダゾール - 2 - イル] - 7 - [5 - クロロ - 2 - (1 H - テトラゾール - 1 - イル) フェニル] - 2 , 3 - ジヒドロ - 5 (1 H) - インドリジノン、 (6 S) - 6 - [2 - (6 - アミノ - 2 - フルオロ - 3 - ピリジニル) - 4 - フルオロ - 1 H - イミダゾール - 5 - イル] - 2 - [5 - クロロ - 2 - (1 H - テトラゾール - 1 - イル) フェニル] - 7 , 8 - ジヒドロピロロ [1 , 2 - a] ピリミジン - 4 (6 H) - オン、または 1 - (2 - { (3 S) - 3 - [5 - (4 - アミノフェニル) - 4 - フルオロ - 1 H - イミダゾール - 2 - イル] - 5 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 5 - テトラヒドロ - 7 - インドリジニル } - 4 - クロロフェニル) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - カルボニトリルを活性成分とする、経口剤。

【請求項 4】

(3 S) - 3 - [2 - (6 - アミノ - 2 - フルオロ - 3 - ピリジニル) - 4 - フルオロ - 1 H - イミダゾール - 5 - イル] - 7 - [5 - クロロ - 2 - (1 H - テトラゾール - 1 - イル) フェニル] - 2 , 3 - ジヒドロ - 5 (1 H) - インドリジノン、その塩、その溶媒和物、またはその N - オキシド体を含有する経口剤。

【請求項 5】

(3 S) - 3 - [2 - (6 - アミノ - 2 - フルオロ - 3 - ピリジニル) - 4 - フルオロ - 1 H - イミダゾール - 5 - イル] - 7 - [5 - クロロ - 2 - (1 H - テトラゾール - 1 - イル) フェニル] - 2 , 3 - ジヒドロ - 5 (1 H) - インドリジノンを活性成分とする経口剤。

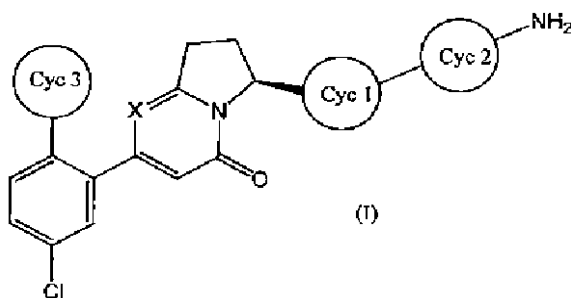
【請求項 6】

F X I a 阻害剤である請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の経口剤。

【請求項 7】

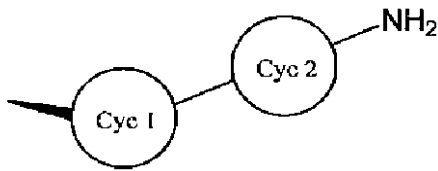
一般式 (I)

【化 6】



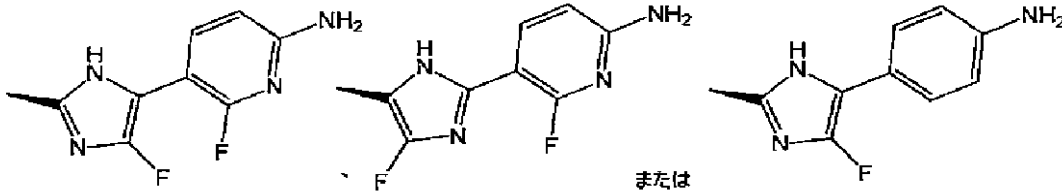
[式中、

【化 7】



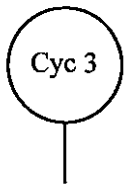
は、

【化 8】



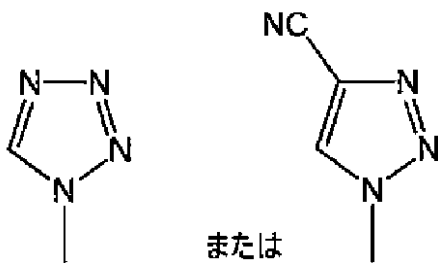
を表し、

【化 9】



は、

【化 10】



を表し、

XはCHまたはNを表す。]

で示される化合物、その塩、その溶媒和物、またはそのN-オキシド体を含有する、血栓塞栓性疾患の予防および/または治療剤。

【請求項 8】

(3S) - 3 - [5 - (6 - アミノ - 2 - フルオロ - 3 - ピリジニル) - 4 - フルオロ - 1H - イミダゾール - 2 - イル] - 7 - [5 - クロロ - 2 - (1H - テトラゾール - 1 - イル) フェニル] - 2 , 3 - ジヒドロ - 5 (1H) - インドリジノン、(6S) - 6 - [2 - (6 - アミノ - 2 - フルオロ - 3 - ピリジニル) - 4 - フルオロ - 1H - イミダゾール - 5 - イル] - 2 - [5 - クロロ - 2 - (1H - テトラゾール - 1 - イル) フェニル]

- 7, 8 - ジヒドロピロロ[1, 2 - a]ピリミジン - 4 (6 H) - オン、もしくは 1 - (2 - { (3 S) - 3 - [5 - (4 - アミノフェニル) - 4 - フルオロ - 1 H - イミダゾール - 2 - イル] - 5 - オキソ - 1, 2, 3, 5 - テトラヒドロ - 7 - インドリジニル} - 4 - クロロフェニル) - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 4 - カルボニトリル、その塩、その溶媒和物、またはその N - オキシド体を含む、血栓塞栓性疾患の予防および/または治療剤。

【請求項 9】

(3 S) - 3 - [5 - (6 - アミノ - 2 - フルオロ - 3 - ピリジニル) - 4 - フルオロ - 1 H - イミダゾール - 2 - イル] - 7 - [5 - クロロ - 2 - (1 H - テトラゾール - 1 - イル) フェニル] - 2, 3 - ジヒドロ - 5 (1 H) - インドリジノン、(6 S) - 6 - [2 - (6 - アミノ - 2 - フルオロ - 3 - ピリジニル) - 4 - フルオロ - 1 H - イミダゾール - 5 - イル] - 2 - [5 - クロロ - 2 - (1 H - テトラゾール - 1 - イル) フェニル] - 7, 8 - ジヒドロピロロ[1, 2 - a]ピリミジン - 4 (6 H) - オン、もしくは 1 - (2 - { (3 S) - 3 - [5 - (4 - アミノフェニル) - 4 - フルオロ - 1 H - イミダゾール - 2 - イル] - 5 - オキソ - 1, 2, 3, 5 - テトラヒドロ - 7 - インドリジニル} - 4 - クロロフェニル) - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 4 - カルボニトリルを活性成分とする、血栓塞栓性疾患の予防および/または治療剤。

【請求項 10】

(3 S) - 3 - [2 - (6 - アミノ - 2 - フルオロ - 3 - ピリジニル) - 4 - フルオロ - 1 H - イミダゾール - 5 - イル] - 7 - [5 - クロロ - 2 - (1 H - テトラゾール - 1 - イル) フェニル] - 2, 3 - ジヒドロ - 5 (1 H) - インドリジノン、その塩、その溶媒和物、またはその N - オキシド体を含む、血栓塞栓性疾患の予防および/または治療剤。

【請求項 11】

(3 S) - 3 - [2 - (6 - アミノ - 2 - フルオロ - 3 - ピリジニル) - 4 - フルオロ - 1 H - イミダゾール - 5 - イル] - 7 - [5 - クロロ - 2 - (1 H - テトラゾール - 1 - イル) フェニル] - 2, 3 - ジヒドロ - 5 (1 H) - インドリジノンを活性成分とする、血栓塞栓性疾患の予防および/または治療剤。

【請求項 12】

血栓塞栓性疾患が、静脈血栓塞栓症、動脈血栓塞栓症、虚血性脳卒中、または人工物表面に血液が暴露される治療を施行された患者における血栓塞栓性疾患である、請求項 7 ~ 11 のいずれか 1 項に記載の剤。

【請求項 13】

血栓塞栓性疾患が、深部静脈血栓症、肺塞栓症、急性冠症候群、冠動脈疾患、末梢動脈疾患、心房細動患者における虚血性脳卒中もしくは全身性塞栓症、人工心臓弁置換術施行患者における虚血性脳卒中もしくは全身性塞栓症、または下肢整形外科手術施行患者における静脈血栓塞栓症である、請求項 7 ~ 11 のいずれか 1 項に記載の剤。

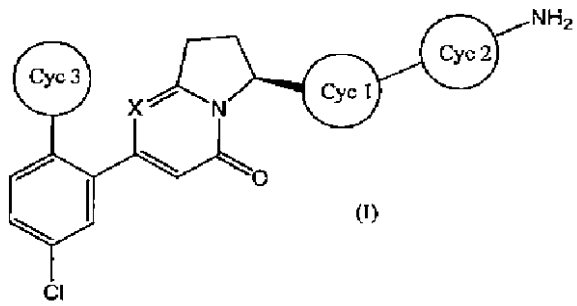
【請求項 14】

血栓塞栓性疾患が、深部静脈血栓症または門脈血栓症である請求項 7 ~ 11 のいずれか 1 項に記載の剤。

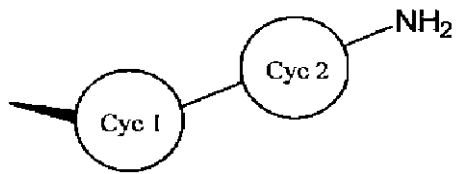
【請求項 15】

一般式 (I)

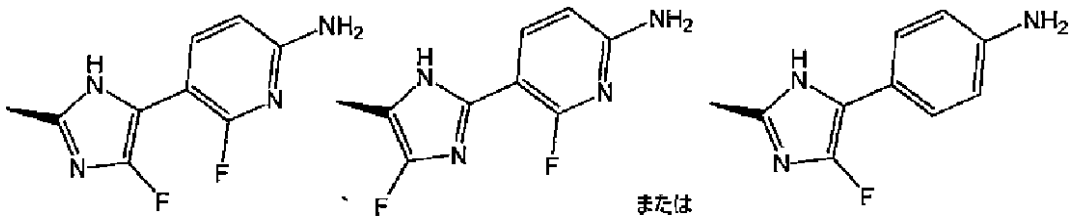
【化 1 1】



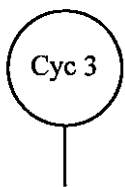
[式中、
【化 1 2】



は、
【化 1 3】

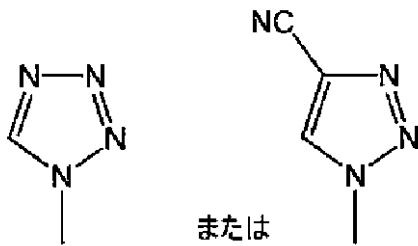


を表し、
【化 1 4】



は、

【化 15】



を表し、

XはC HまたはNを表す。]

で示される化合物、その塩、その溶媒和物、またはそのN - オキシド体を含む、遺伝性血管浮腫の予防および/または治療剤。

【請求項 16】

(3S) - 3 - [5 - (6 - アミノ - 2 - フルオロ - 3 - ピリジニル) - 4 - フルオロ - 1 H - イミダゾール - 2 - イル] - 7 - [5 - クロロ - 2 - (1 H - テトラゾール - 1 - イル) フェニル] - 2 , 3 - ジヒドロ - 5 (1 H) - インドリジノン、(6 S) - 6 - [2 - (6 - アミノ - 2 - フルオロ - 3 - ピリジニル) - 4 - フルオロ - 1 H - イミダゾール - 5 - イル] - 2 - [5 - クロロ - 2 - (1 H - テトラゾール - 1 - イル) フェニル] - 7 , 8 - ジヒドロピロロ [1 , 2 - a] ピリミジン - 4 (6 H) - オン、もしくは 1 - (2 - { (3 S) - 3 - [5 - (4 - アミノフェニル) - 4 - フルオロ - 1 H - イミダゾール - 2 - イル] - 5 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 5 - テトラヒドロ - 7 - インドリジニル } - 4 - クロロフェニル) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - カルボニトリル、その塩、その溶媒和物、またはそのN - オキシド体を含む、遺伝性血管浮腫の予防および/または治療剤。

【請求項 17】

(3S) - 3 - [5 - (6 - アミノ - 2 - フルオロ - 3 - ピリジニル) - 4 - フルオロ - 1 H - イミダゾール - 2 - イル] - 7 - [5 - クロロ - 2 - (1 H - テトラゾール - 1 - イル) フェニル] - 2 , 3 - ジヒドロ - 5 (1 H) - インドリジノン、(6 S) - 6 - [2 - (6 - アミノ - 2 - フルオロ - 3 - ピリジニル) - 4 - フルオロ - 1 H - イミダゾール - 5 - イル] - 2 - [5 - クロロ - 2 - (1 H - テトラゾール - 1 - イル) フェニル] - 7 , 8 - ジヒドロピロロ [1 , 2 - a] ピリミジン - 4 (6 H) - オン、もしくは 1 - (2 - { (3 S) - 3 - [5 - (4 - アミノフェニル) - 4 - フルオロ - 1 H - イミダゾール - 2 - イル] - 5 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 5 - テトラヒドロ - 7 - インドリジニル } - 4 - クロロフェニル) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - カルボニトリルを活性成分とする、遺伝性血管浮腫の予防および/または治療剤。

【請求項 18】

(3S) - 3 - [2 - (6 - アミノ - 2 - フルオロ - 3 - ピリジニル) - 4 - フルオロ - 1 H - イミダゾール - 5 - イル] - 7 - [5 - クロロ - 2 - (1 H - テトラゾール - 1 - イル) フェニル] - 2 , 3 - ジヒドロ - 5 (1 H) - インドリジノン、その塩、その溶媒和物、またはそのN - オキシド体を含む、遺伝性血管浮腫の予防および/または治療剤。

【請求項 19】

(3S) - 3 - [2 - (6 - アミノ - 2 - フルオロ - 3 - ピリジニル) - 4 - フルオロ - 1 H - イミダゾール - 5 - イル] - 7 - [5 - クロロ - 2 - (1 H - テトラゾール - 1 - イル) フェニル] - 2 , 3 - ジヒドロ - 5 (1 H) - インドリジノンを活性成分とする、遺伝性血管浮腫の予防および/または治療剤。

【請求項 20】

経口剤である、請求項 7 ~ 19 のいずれか 1 項に記載の剤。

【請求項 2 1】

一日一回から三回経口投与されるように用いられることを特徴とする、請求項 2 0 に記載の 剤。