

【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 17 年 8 月 11 日 (2005.8.11)

【公表番号】特表 2001-506630(P2001-506630A)

【公表日】平成 13 年 5 月 22 日 (2001.5.22)

【出願番号】特願 平 10-526844

【国際特許分類第 7 版】

C 0 7 D 401/06
A 6 1 K 31/4184
A 6 1 K 31/437
A 6 1 K 31/4709
A 6 1 K 31/4725
A 6 1 K 31/517
A 6 1 P 7/02
C 0 7 D 403/06
C 0 7 D 409/14
C 0 7 D 471/04
C 0 7 D 495/04

【F I】

C 0 7 D 401/06
A 6 1 K 31/4184
A 6 1 K 31/437
A 6 1 K 31/4709
A 6 1 K 31/4725
A 6 1 K 31/517
A 6 1 P 7/02
C 0 7 D 403/06
C 0 7 D 409/14
C 0 7 D 471/04 1 0 4 Z
C 0 7 D 471/04 1 0 8 Z
C 0 7 D 495/04 1 0 5 A

【手続補正書】

【提出日】平成 16 年 12 月 2 日 (2004.12.2)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】補正の内容のとおり

【補正方法】変更

【補正の内容】

手 続 補 正 書

16.12.-2

平成 年 月 日

特許庁長官 小 川 洋 殿



1. 事件の表示 平成10年特許願第526844号



2. 補正をする者

事件との関係 出 願 人

名 称 アヴェンティス ファーマシューティカルズ
インコーポレイテッド

3. 代 理 人

住 所 東京都千代田区丸の内3丁目3番1号
電話 (代) 3211-8741

氏 名 (5995) 弁理士 中 村 稔

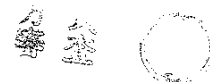


4. 補正命令の日付 自 発

5. 補正対象書類名 明細書

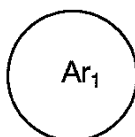
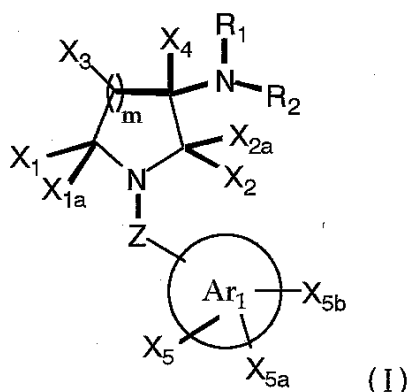
6. 補正対象項目名 請求の範囲

7. 補正の内容 別紙記載の通り



請求の範囲:

1. 式 I の化合物、又はその薬学的に許容しうる塩、N-オキシド、水和物又は溶媒和物。



(式中、はその末端環から Z に結合している近接環までに窒素原子を少なくとも 1 個含む 2 環ヘテロアリールであり；

Z はアルキレニルであり；

R₁ は水素、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアラルキル、置換されていてもよいヘテロアラルキル、R'O(CH₂)_x-、R'O₂C(CH₂)_x-、Y¹Y²NC(O)(CH₂)_x-又は Y¹Y²N(CH₂)_x-であり；

R' は水素、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアラルキル又は置換されていてもよいヘテロアラルキルであり；

R₂ は R₃S(O)_p-又は R₃R₄NS(O)_p-であり；

R₃ は置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキル、置換されていてもよいヘテロアラルキル、置換されていてもよいアラルケニル又は置換されていてもよいヘテロアラルケニルであるか又は R₁ と R₃ が結合している-N-S(O)_p-部分又は-N-S(O)_p-NR₄-部分と共に R₁ と R₃ が置換されていてもよい 5~7 員ヘテロシクリルを形成し；

R₄ は置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいシクロアルキル又は

置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキル又は置換されていてもよいヘテロアラルキルであるか又は R_3 と R_4 が結合している窒素原子と共に R_3 と R_4 が置換されていてもよい 4~7 員ヘテロシクリルを形成し;

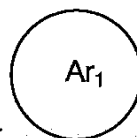
X_1 及び X_{1a} は独立して H、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいアラルキル、置換されていてもよいヘテロアリール又は置換されていてもよいヘテロアラルキルより選ばれるか又は X_1 と X_{1a} が共にオキソを形成し;

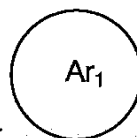
X_2 及び X_{2a} は H であるか又は共にオキソを形成し;

X_3 は H、ヒドロキシ、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキル又は置換されていてもよいヘテロアラルキルであるか又は X_3 と、 X_1 と X_{1a} の 1 つが共に 4~7 員シクロアルキルを形成し;

X_4 は H、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアラルキル又はヒドロキシアルキルであり;

X_5 、 X_{5a} 及び X_{5b} は独立して H、 R_5R_6N- 、(ヒドロキシ、アルコキシ又はアミノ)HN-、 R_7O- 、 R_5R_6NCO- 、 $R_5R_6NSO_2-$ 、 R_7CO- 、ハロ、シアノ、ニトロ又は $R_8(O)C(CH_2)_q-$ より



選ばれ、 X_5 、 X_{5a} と X_{5b} の 1 つは H、ヒドロキシ又は  の末端環を窒素に対して α 位で置換する (H、置換されていてもよい低級アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ又はアミノ)HN-であり;

Y^1 及び Y^2 は独立して水素、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいアラルキル又は置換されていてもよいヘテロアラルキルであるか又は Y^1 と Y^2 が結合している N と共に Y^1 と Y^2 が 4~7 員ヘテロシクリルを形成し;

R_5 及び R_6 は独立して H 又は置換されていてもよい低級アルキルであるか又は R_5 と R_6 の一方が H であり R_5 と R_6 のもう一方が $R_8(O)CCH_2-$ 又は低級アシルであり;

R_7 は H、置換されていてもよい低級アルキル、低級アシル又は $R_8(O)CCH_2-$ であ

り;

R_8 は H、置換されていてもよい低級アルキル、アルコキシ又はヒドロキシであり;

m は 0、1、2 又は 3 であり;

p は 1 又は 2 であり;

q は 0 又は 1 であり;

x は 1、2、3、4 又は 5 である。)

2. R_1 が H、置換されていてもよいヘテロアルキル、置換されていてもよいアルキル又は置換されていてもよいアルキルである、請求項 1 記載の化合物。

3. R_2 が $R_3S(0)_p$ -である、請求項 1 記載の化合物。

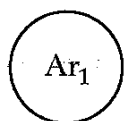
4. p が 2 である、請求項 3 記載の化合物。

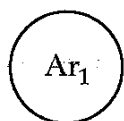
5. R_3 が置換されていてもよいフェニル、置換されていてもよいナフチル、置換されていてもよいチエニル、置換されていてもよいベンゾチエニル又は置換されていてもよいチエノピリジル、置換されていてもよいキノリニル又は置換されていてもよいイソキノリニルである、請求項 3 記載の化合物。

6. Z がメチレニルであり、 m が 1 である、請求項 1 記載の化合物。

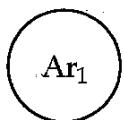
7. X_2 と X_{2a} が共に結合してオキソである、請求項 1 記載の化合物。

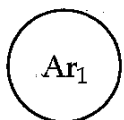
8. X_1 、 X_{1a} 、 X_3 及び X_4 が H である、請求項 1 記載の化合物。



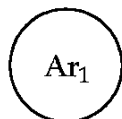
9.  が置換されていてもよいイソキノリニルである、請求項 1 記載の化合物。

10. 該イソキノリニルが 7 位で Z に結合している、請求項 9 記載の化合物。



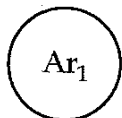
11.  が置換されていてもよいキノリニルである、請求項 1 記載の化合物。

12. 該キノリニルが 7 位で Z に結合している、請求項 11 記載の化合物。

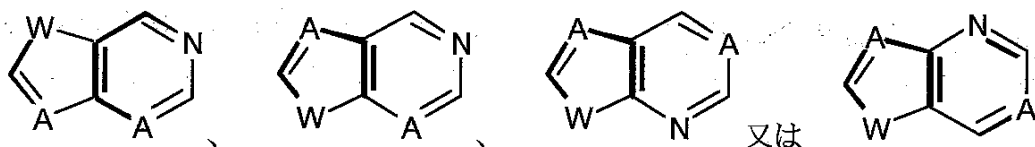


13. が置換されていてもよいキナゾリニルである、請求項 1 記載の化合物。

14. 該キナゾリニルが 7 位で Z に結合している、請求項 9 記載の化合物。



15. が式



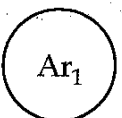
の置換されていてもよい部分であり、W が S、O 又は NR_{11} (R_{11} は H、アルキル、アラルキル、ヘテロアラルキル又は $\text{R}_8(0)\text{C}(\text{CH}_2)_q-$ である。)であり、A が CH 又は N である、請求項 1 記載の化合物。

16. 該部分が W を含む環を介して Z に結合している、請求項 15 記載の化合物。



17. X_5 、 X_{5a} 及び X_{5b} の 1 つが H、ヒドロキシ又はアミノであり、の隣接環に Z が結合している隣接環の位置に隣接している位置で置換されている、請求項 1 記載の化合物。

18. X_5 、 X_{5a} 及び X_{5b} の 1 つがヒドロキシ又はアミノである、請求項 17 記載の化合物。



19. の末端環を窒素に対して α 位で置換している X_5 、 X_{5a} 及び X_{5b} の 1 つが H 又は H(H、置換されていてもよい低級アルキル、ヒドロキシ又はアミノ)N-である、請求項 1 記載の化合物。

20. 下記の化合物である、請求項 1 記載の化合物。

7-メトキシナフタレン-2-スルホン酸[1-(1-アミノイソキノリン-7-イルメチル)-

2-オキソピロリジン-3-(R,S)-イル]アミドトリフルオロ酢酸塩;
7-メトキシナフタレン-2-スルホン酸[1-(1-アミノイソキノリン-7-イルメチル)-
2-オキソピロリジン-3-(S)-イル]アミド塩酸塩;
7-メトキシナフタレン-2-スルホン酸[1-(1-アミノイソキノリン-7-イルメチル)-
2-オキソピロリジン-3-(S)-イル]アミドトリフルオロ酢酸塩;
7-メトキシナフタレン-2-スルホン酸[1-(1-アミノイソキノリン-7-イルメチル)-
2-オキソピロリジン-3-(R)-イル]アミドトリフルオロ酢酸塩;
7-メトキシナフタレン-2-スルホン酸[1-(1-ヒドロキシイソキノリン-7-イルメチル)-
2-オキソピロリジン-3-(R,S)-イル]アミド;
7-メトキシナフタレン-2-スルホン酸[1-(1-アミノイソキノリン-7-イルメチル)-
2-オキソピロリジン-3-(R,S)-イル]メチルアミドトリフルオロ酢酸塩;
7-メトキシナフタレン-2-スルホン酸[1-(1-アミノイソキノリン-7-イルメチル)-
2-オキソピロリジン-3-(S)-イル]メチルアミドトリフルオロ酢酸塩;
ベンゾ[b]チオフェン-2-スルホン酸[1-(1-アミノイソキノリン-7-イルメチル)-
2-オキソピロリジン-3-(S)-イル]アミドトリフルオロ酢酸塩;
6-クロロベンゾ[b]チオフェン-2-スルホン酸[1-(1-アミノイソキノリン-7-イル
メチル)-2-オキソピロリジン-3-(S)-イル]アミドトリフルオロ酢酸塩;
7-メトキシナフタレン-2-スルホン酸[1-(1-アミノ-6-メトキシイソキノリン-7-
イルメチル)-2-オキソピロリジン-3-(S)-イル]アミド塩酸塩;
7-メトキシナフタレン-2-スルホン酸[1-(6-メトキシイソキノリン-7-イルメチ
ル)-2-オキソピロリジン-3-(S)-イル]アミドトリフルオロ酢酸塩;
4-(2-クロロ-6-ニトフェノキシ)ベンゼンスルホン酸[1-(1-アミノ-6-メトキシイ
ソキノリン-7-イルメチル)-2-オキソピロリジン-3-(S)-イル]アミドトリフルオ
ロ酢酸塩;
7-メトキシナフタレン-2-スルホン酸[1-(1,6-ジアミノイソキノリン-7-イルメチ
ル)-2-オキソピロリジン-3-(S)-イル]アミドトリフルオロ酢酸塩;
6-クロロベンゾ[b]チオフェン-2-スルホン酸[1-(1,6-ジアミノイソキノリン-7-
イルメチル)-2-オキソピロリジン-3-(S)-イル]アミドトリフルオロ酢酸塩;
7-メトキシナフタレン-2-スルホン酸[1-(2-アミノキノリン-7-イルメチル)-2-オ

キソピロリジン-3-(S)-イル]アミドトリフルオロ酢酸塩；
6-クロロベンゾ[b]チオフェン-2-スルホン酸[1-(2-アミノキノリン-7-イルメチル)-2-オキソピロリジン-3-(S)-イル]アミドトリフルオロ酢酸塩；
ベンゾ[b]チオフェン-2-スルホン酸[1-(2-アミノキノリン-7-イルメチル)-2-オキソピロリジン-3-(S)-イル]アミドトリフルオロ酢酸塩；
7-メトキシナフタレン-2-スルホン酸[1-(2-アミノキノリン-7-イルメチル)-2-オキソピロリジン-3-(S)-イル]メチルアミドトリフルオロ酢酸塩；
7-メトキシナフタレン-2-スルホン酸[1-(2-ヒドロキシキノリン-7-イルメチル)-2-オキソピロリジン-3-(S)-イル]メチルアミド；
7-メトキシナフタレン-2-スルホン酸[1-(2-アミノキノリン-5-イルメチル)-2-オキソピロリジン-3-(S)-イル]アミドトリフルオロ酢酸塩；
7-メトキシナフタレン-2-スルホン酸[1-(2-アミノキノリン-5-イルメチル)-2-オキソピロリジン-3-(S)-イル]メチルアミドトリフルオロ酢酸塩；
7-メトキシナフタレン-2-スルホン酸[1-(2-ヒドロキシキノリン-5-イルメチル)-2-オキソピロリジン-3-(S)-イル]メチルアミド；
7-メトキシナフタレン-2-スルホン酸[1-(2-アミノキノリン-6-イルメチル)-2-オキソピロリジン-3-(S)-イル]アミド；
7-メトキシナフタレン-2-スルホン酸[1-(2-ヒドロキシキノリン-6-イルメチル)-2-オキソピロリジン-3-(S)-イル]アミド；
7-メトキシナフタレン-2-スルホン酸[1-(1H-ベンズイミダゾール-5-イルメチル)-2-オキソピロリジン-3-(S)-イル]アミドトリフルオロ酢酸塩；
7-メトキシナフタレン-2-スルホン酸[2-(1H-ベンズイミダゾール-5-イルエチル)-2-オキソピロリジン-3-(S)-イル]アミドトリフルオロ酢酸塩；
7-メトキシナフタレン-2-スルホン酸[1-(4-アミノキナゾリン-6-イルメチル)-2-オキソピロリジン-3-(S)-イル]メチルアミドトリフルオロ酢酸塩；
7-メトキシナフタレン-2-スルホン酸[1-(4-アミノチエノ[2,3-d]ピリミジン-6-イルメチル)-2-オキソピロリジン-3-(S)-イル]アミドトリフルオロ酢酸塩；
7-メトキシナフタレン-2-スルホン酸[2-(6-アミノチエノ[2,3-d]ピリミジン-6-イルメチル)-2-オキソピロリジン-3-(S)-イル]アミドトリフルオロ酢酸塩；

7-メトキシナフタレン-2-スルホン酸[1-(7-アミノチエノ[2,3-c]ピリジン-3-イルメチル)-2-オキソピロリジン-3-(S)-イル]アミドトリフルオロ酢酸塩;

7-メトキシナフタレン-2-スルホン酸[1-(7-ヒドロキシチエノ[2,3-c]ピリジン-3-イルメチル)-2-オキソピロリジン-3-(S)-イル]アミドトリフルオロ酢酸塩;

7-メトキシナフタレン-2-スルホン酸[1-(4-アミノチエノ[3,2-c]ピリジン-3-イルメチル)-2-オキソピロリジン-3-(R,S)-イル]アミドトリフルオロ酢酸塩;

7-メトキシナフタレン-2-スルホン酸[1-(4-ヒドロキシチエノ[3,2-c]ピリジン-3-イルメチル)-2-オキソピロリジン-3-(R,S)-イル]アミドトリフルオロ酢酸塩;

ベンゾ[b]チオフェン-2-スルホン酸[1-(4-アミノチエノ[3,2-c]ピリジン-3-イルメチル)-2-オキソピロリジン-3-(R,S)-イル]アミドトリフルオロ酢酸塩;

5-ピリジン-4-イルチオフェン-2-スルホン酸[1-(1-アミノイソキノリン-7-イルメチル)-2-オキソピロリジン-3-(S)-イル]アミドトリフルオロ酢酸塩;

5-ピリジン-3-イルチオフェン-2-スルホン酸[1-(1-アミノイソキノリン-7-イルメチル)-2-オキソピロリジン-3-(S)-イル]アミドトリフルオロ酢酸塩;

ベンゾチオフェン-2-スルホン酸[1-(4-アミノキノリン-6-イルメチル)-2-オキソピロリジン-3-(S)-イル]アミドトリフルオロ酢酸塩;

6-クロロベンゾ[b]チオフェン-2-スルホン酸[1-(1-アミノイソキノリン-6-イルメチル)-2-オキソピロリジン-3-(S)-イル]アミドトリフルオロ酢酸塩;

6-クロロベンゾ[b]チオフェン-2-スルホン酸[2-オキソ-1-(1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-7-イルメチル)ピロリジン-3-(S)-イル]アミドトリフルオロ酢酸塩;

6-クロロベンゾ[b]チオフェン-2-スルホン酸[1-(4-クロロ-1H-ピロロ[3,2-c]ピリジン-2-イルメチル)-2-オキソピロリジン-3-(S)-イル]アミド;

6-クロロベンゾ[b]チオフェン-2-スルホン酸[2-オキソ-1-(1H-ピロロ[3,2-c]ピリジン-2-イルメチル)ピロリジン-3-(S)-イル]アミド;

7-メトキシナフタレン-2-スルホン酸[2-オキソ-1-(1H-ピロロ[3,2-b]ピリジン-2-イルメチル)-ピロリジン-3-(S)-イル]アミドトリフルオロ酢酸塩;

6-クロロベンゾ[b]チオフェン-2-スルホン酸(1-フロ[3,2-b]ピリジン-2-イルメチル-2-オキソピロリジン-3-(S)-イル]アミド;

6-クロロベンゾ[b]チオフェン-2-スルホン酸[1-フロ[3,2-b]ピリジン-2-イルメチル-2-オキソピロリジン-3-(S)-イル]アミド;

6-クロロベンゾ[b]チオフェン-2-スルホン酸[2-オキソ-1-(1H-ピロロ[3,2-b]ピリジン-2-イルメチル)ピロリジン-3-(S)-イル]アミドトリフルオロ酢酸塩;

6-クロロ-ベンゾ[b]チオフェン-2-スルホン酸[2-オキソ-1-(1H-ピロロ[2,3-c]ピリジン-2-イルメチル)ピロリジン-3-(S)-イル]アミドトリフルオロ酢酸塩;

チエノ[3,2-b]ピリジン-2-スルホン酸[2-オキソ-1-(1H-ピロロ[2,3-c]ピリジン-2-イルメチル)ピロリジン-3-(S)-イル]アミド二トリフルオロ酢酸塩;

ベンゾ[b]チオフェン-2-スルホン酸[2-オキソ-1-チエノ[3,2-b]ピリジン-2-イルメチル)ピロリジン-3-(S)-イル]アミドトリフルオロ酢酸塩;

7-メトキシナフタレン-2-スルホン酸[1-(1H-イミダゾ[4,5-c]ピリジン-2-イルメチル)-2-オキソピリジン-3-(S)-イル]アミドトリフルオロ酢酸塩;又は

7-メトキシナフタレン-2-スルホン酸[1-(2-アミノ-3H-ベンゾイミダゾール-5-メチル)-2-オキソピロリジン-(S)-イル]アミドトリフルオロ酢酸塩。

21. 7-メトキシナフタレン-2-スルホン酸[1-(1-アミノイソキノリン-7-イルメチル)-2-オキソピロリジン-3-(S)-イル]アミドトリフルオロ酢酸塩である、請求項1記載の化合物。

22. 7-メトキシナフタレン-2-スルホン酸[1-(1-アミノイソキノリン-7-イルメチル)-2-オキソピロリジン-3-(R)-イル]アミドトリフルオロ酢酸塩である、請求項1記載の化合物。

23. 7-メトキシナフタレン-2-スルホン酸[1-(1-アミノイソキノリン-7-イルメチル)-2-オキソピロリジン-3-(S)-イル]メチルアミドトリフルオロ酢酸塩である、請求項1記載の化合物。

24. ベンゾ[b]チオフェン-2-スルホン酸[1-(1-アミノイソキノリン-7-イルメチル)-2-オキソピロリジン-3-(S)-イル]アミドトリフルオロ酢酸塩である、請求項1記載の化合物。

25. 6-クロロベンゾ[b]チオフェン-2-スルホン酸[1-(1-アミノイソキノリン-7-イルメチル)-2-オキソピロリジン-3-(S)-イル]アミドトリフルオロ酢酸塩である、請求項1記載の化合物。

26. 7-メトキシナフタレン-2-スルホン酸[1-(1,6-ジアミノイソキノリン-7-イルメチル)-2-オキソピロリジン-3-(S)-イル]アミドトリフルオロ酢酸塩である、請求項1記載の化合物。

27. 6-クロロベンゾ[b]チオフェン-2-スルホン酸[1-(1,6-ジアミノイソキノリン-7-イルメチル)-2-オキソピロリジン-3-(S)-イル]アミドトリフルオロ酢酸塩である、請求項1記載の化合物。

28. 7-メトキシナフタレン-2-スルホン酸[1-(2-アミノキノリン-7-イルメチル)-2-オキソピロリジン-3-(S)-イル]アミドトリフルオロ酢酸塩である、請求項1記載の化合物。

29. 6-クロロベンゾ[b]チオフェン-2-スルホン酸[1-(2-アミノキノリン-7-イルメチル)-2-オキソピロリジン-3-(S)-イル]-アミドトリフルオロ酢酸塩である、請求項1記載の化合物。

30. ベンゾ[b]チオフェン-2-スルホン酸[1-(2-アミノキノリン-7-イルメチル)-2-オキソピロリジン-3-(S)-イル]アミドトリフルオロ酢酸塩である、請求項1記載の化合物。

31. 7-メトキシナフタレン-2-スルホン酸[1-(4-アミノチエノ[3,2-c]ピリジン-2-イルメチル)-2-オキソ-3-イル]アミドトリフルオロ酢酸塩である、請求項1記載の化合物。

32. ベンゾ[b]チオフェン-2-スルホン酸[1-(4-アミノチエノ[3,2-c]ピリジン-2-イルメチル)-2-オキソ-3-イル]アミドトリフルオロ酢酸塩である、請求項1記載の化合物。

33. 5-ピリジン-4-イルチオフェン-2-スルホン酸[1-(1-アミノイソキノリン-7-イルメチル)-2-オキソピロリジン-3-(S)-イル]アミドトリフルオロ酢酸塩である、請求項1記載の化合物。

34. 5-ピリジン-3-イルチオフェン-2-スルホン酸[1-(1-アミノイソキノリン-7-イルメチル)-2-オキソピロリジン-3-(S)-イル]アミドトリフルオロ酢酸塩である、請求項1記載の化合物。

35. ベンゾチオフェン-2-スルホン酸[1-(4-アミノキノリン-6-イルメチル)-2-オキソピロリジン-3-(S)-イル]アミドトリフルオロ酢酸塩である、請求項1記載の

化合物。

36. 6-クロロベンゾ[b]チオフェン-2-スルホン酸[2-オキソ-1-(1H-ピロロ[3,2-c]ピリジン-2-イルメチル)ピロリジン-3-(S)-イル]アミドである、請求項1記載の化合物。

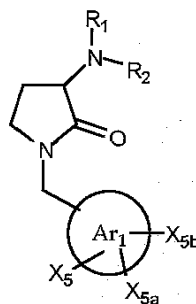
37. 7-メトキシナフタレン-2-スルホン酸[2-オキソ-1-(1H-ピロロ[3,2-b]ピリジン-2-イルメチル)ピロリジン-3-(S)-イル]アミドトリフルオロ酢酸塩である、請求項1記載の化合物。

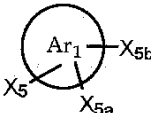
38. 6-クロロベンゾ[b]チオフェン-2-スルホン酸[2-オキソ-1-(1H-ピロロ[3,2-b]ピリジン-2-イルメチル)ピロリジン-3-(S)-イル]アミドトリフルオロ酢酸塩である、請求項1記載の化合物。

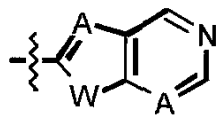
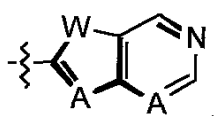
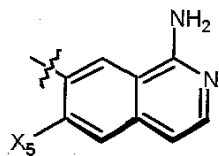
39. 6-クロロベンゾ[b]チオフェン-2-スルホン酸[2-オキソ-1-(1H-ピロロ[2,3-c]ピリジン-2-イルメチル)ピロリジン-3-(S)-イル]アミドトリフルオロ酢酸塩である、請求項1記載の化合物。

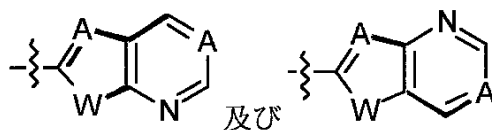
40. チエノ[3,2-b]ピリジン-2-スルホン酸[2-オキソ-1-(1H-ピロロ[2,3-c]ピリジン-2-イルメチル)ピロリジン-3-(S)-イル]アミドトリフルオロ酢酸塩である、請求項1記載の化合物。

41. 下記式の請求項1記載の化合物。



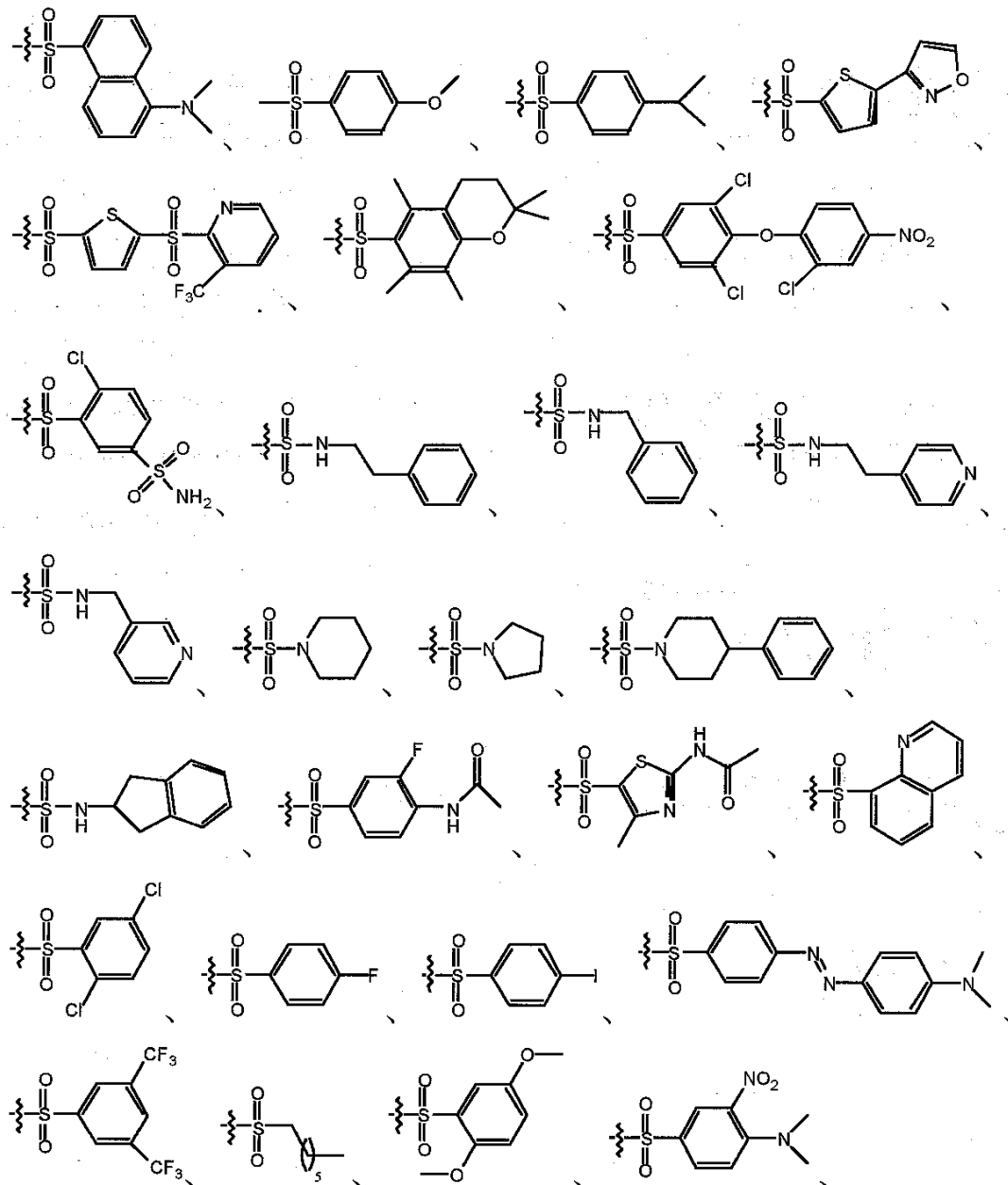
(式中、 は下記式





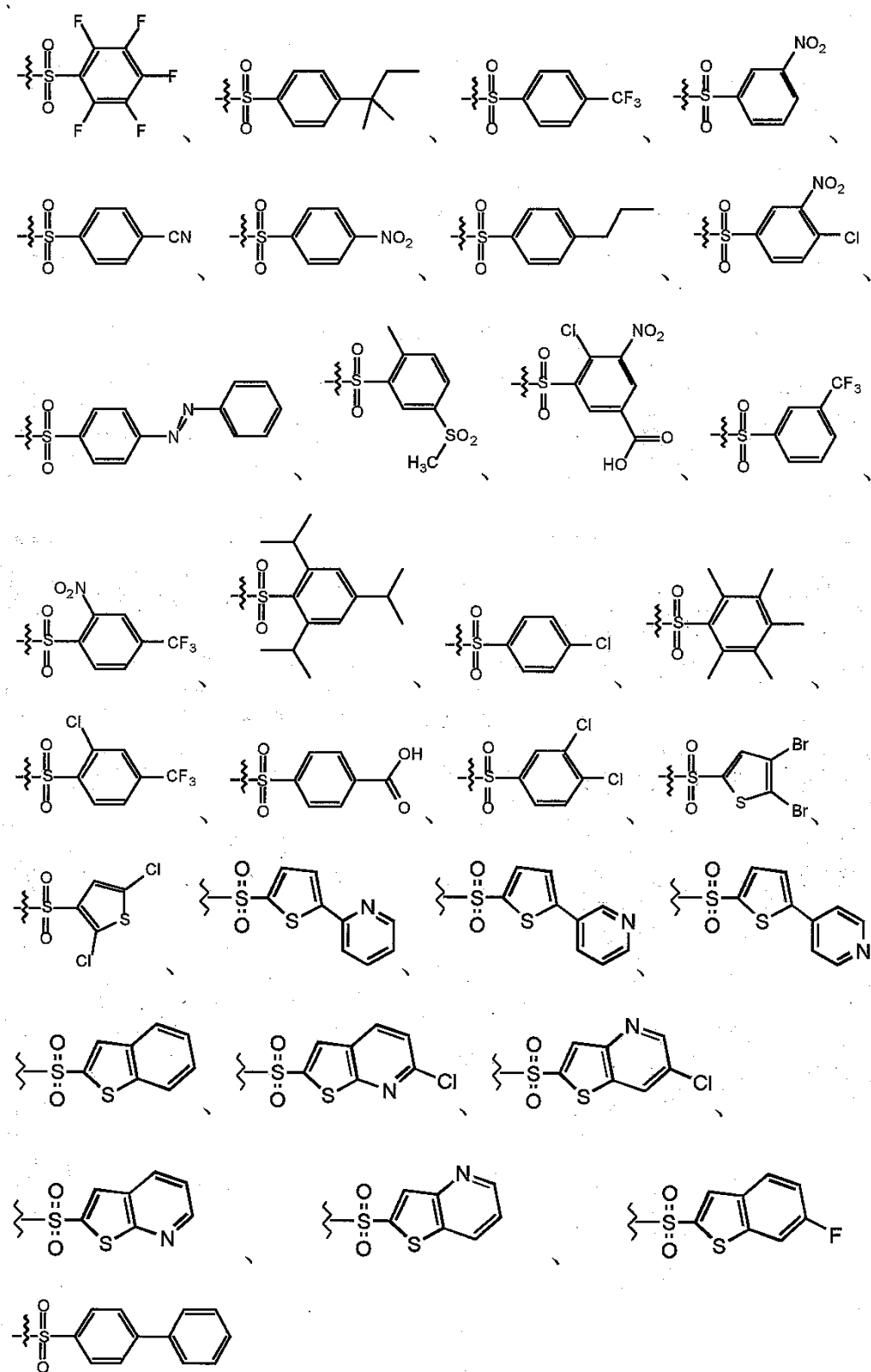
からなる群より選ばれ;

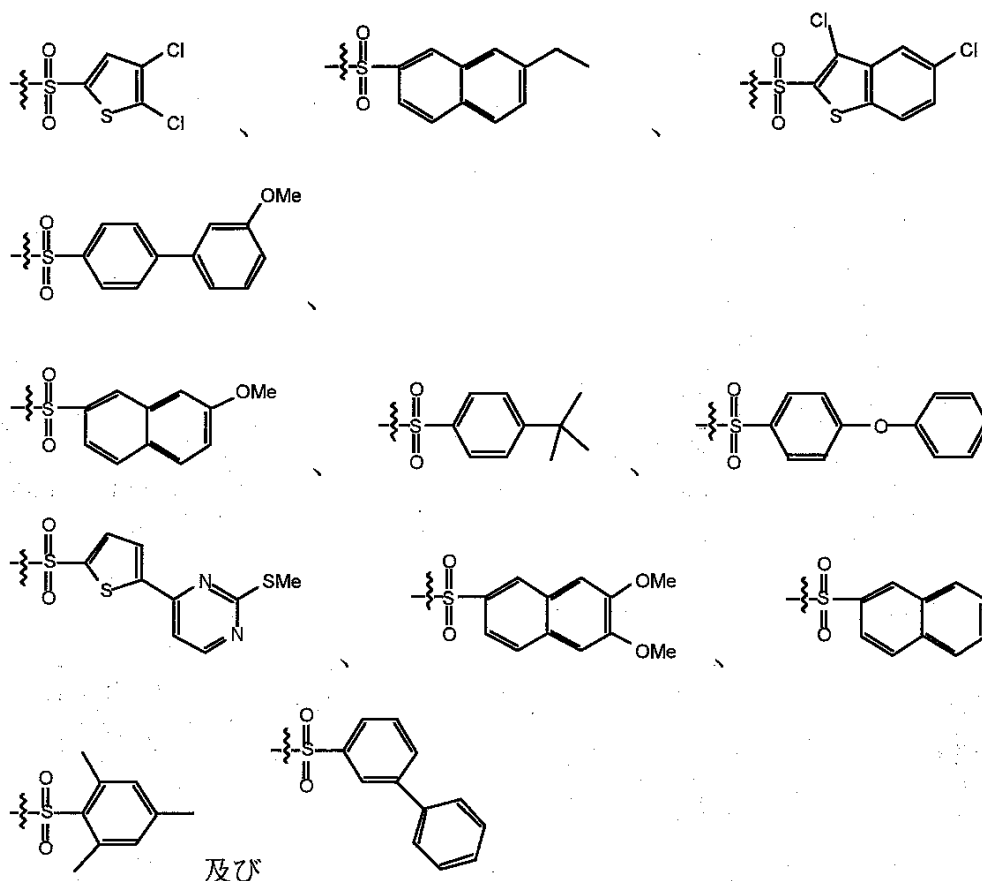
W は S、O 又は NR_{11} (R_{11} は H、アルキル、アラルキル、ヘテロアラルキル又は $\text{R}_8(\text{O})\text{C}(\text{CH}_2)_q$ -である。)であり; A は CH 又は N であり; R_2 は下記式











からなる群より選ばれる。)

42. 請求項 1 記載の化合物の薬学的に許容しうる量及び薬学的に許容しうる担体を含む医薬組成物。

43. Xa 因子活性を阻害することによりモジュレートすることができる生理的障害を治療する請求項 43 に記載の組成物。

44. 該生理的障害が静脈及び動脈血管系の血栓異常形成、急性心筋梗塞症、不安定狭心症、血栓塞栓症、血栓溶解療法や経皮的冠動脈形成術に伴う急性血管閉塞、一過性脳虚血発作、卒中、間欠性跛行症又は大動脈冠状動脈又は末梢動脈バイパス、血管腔の狭小化、冠動脈又は静脈形成術後の再狭窄、長期血液透析患者の血管の開通性の維持、腹部、膝や腰部の手術後の下肢の静脈に起こる病的血栓形成、肺血栓塞栓症の危険、又は敗血症性ショック、ある種のウイルス感染症又はがんの血管系に起こる全身性播種性血管内凝固症である、請求項 43 記載の組成物。

45. 該生理的障害が血栓異常形成、急性心筋梗塞症、不安定狭心症、血栓塞栓症、

血栓溶解療法に伴う急性血管閉塞、一過性脳虚血発作、間欠性跛行症又は大動脈冠状動脈又は末梢動脈バイパス、冠動脈又は静脈形成術後の再狭窄、腹部、膝や腰部の手術後の下肢の静脈に起こる病的血栓形成、又は肺血栓塞栓症の危険である、請求項 43 記載の組成物。

46. 該生理的障害が卒中、血管腔の狭小化、長期血液透析患者の血管の開通性の維持、又は敗血症性ショック、ある種のウイルス感染症又はがんの血管系に起こる全身性播種性血管内凝固症である、請求項 43 記載の組成物。