

【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19年11月8日(2007.11.8)

【公表番号】特表2007-507519(P2007-507519A)

【公表日】平成19年3月29日(2007.3.29)

【年通号数】公開・登録公報2007-012

【出願番号】特願2006-534084(P2006-534084)

【国際特許分類】

**C 0 7 D 409/12 (2006.01)**

**C 0 7 D 409/14 (2006.01)**

**A 6 1 K 31/4725 (2006.01)**

**A 6 1 K 45/00 (2006.01)**

**A 6 1 K 31/616 (2006.01)**

**A 6 1 K 31/727 (2006.01)**

**A 6 1 K 31/353 (2006.01)**

**A 6 1 P 9/10 (2006.01)**

**A 6 1 P 9/04 (2006.01)**

**A 6 1 P 7/02 (2006.01)**

**A 6 1 P 43/00 (2006.01)**

【F I】

C 0 7 D 409/12 C S P

C 0 7 D 409/14

A 6 1 K 31/4725

A 6 1 K 45/00

A 6 1 K 31/616

A 6 1 K 31/727

A 6 1 K 31/353

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 9/04

A 6 1 P 7/02

A 6 1 P 9/10 1 0 1

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 43/00 1 2 1

【手続補正書】

【提出日】平成19年9月20日(2007.9.20)

【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

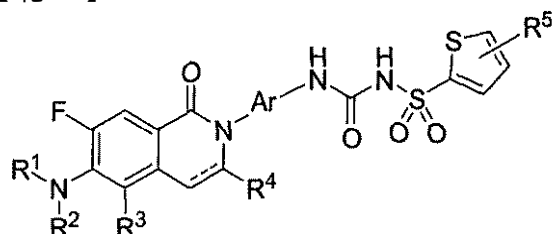
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

次式

## 【化 1】



を有する化合物またはそれらの薬学的に受容可能な塩であって、

ここで、該点線は、任意の二重結合を表わす；

$R^1$  は、 $C_1 \sim 6$  アルキル、 $C_1 \sim 6$  ハロアルキル、 $C_3 \sim 5$  シクロアルキル、 $C_3 \sim 5$  シクロアルキル - アルキルおよびベンジルからなる群より選択されるメンバーである；

$R^2$  は、H、 $C_1 \sim 6$  アルキルおよび  $C_1 \sim 6$  ハロアルキルからなる群より選択されるメンバーである；

$R^3$  は、H、 $C_1 \sim 6$  アルキル、 $C_2 \sim 6$  アルケニル、 $C_2 \sim 6$  アルキニル、 $C_3 \sim 5$  シクロアルキル、 $C_3 \sim 5$  シクロアルキル - アルキル、 $C_1 \sim 6$  ハロアルキル、 $C_1 \sim 6$  ヒドロキシアルキル、シアノおよび  $-C(O)R^{3a}$  からなる群より選択されるメンバーであり、ここで、 $R^{3a}$  は、H、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 6$  アルキル、 $C_1 \sim 6$  アルコキシ、アミノ、 $C_1 \sim 6$  アルキルアミノおよびジ -  $C_1 \sim 6$  アルキルアミノからなる群より選択されるメンバーである；

$R^4$  は、Hおよび  $C_1 \sim 6$  アルキルからなる群より選択されるメンバーである；

$R^5$  は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim 6$  アルキル、 $C_2 \sim 6$  アルケニル、 $C_2 \sim 6$  アルキニル、 $C_1 \sim 6$  ハロアルキル、 $C_1 \sim 6$  アルコキシ、シアノおよび  $-C(O)R^{5a}$  からなる群より選択されるメンバーであり、ここで、 $R^{5a}$  は、 $C_1 \sim 6$  アルコキシ、アミノ、 $C_1 \sim 6$  アルキルアミノおよびジ -  $C_1 \sim 6$  アルキルアミノからなる群より選択されるメンバーである；そして

Ar は、芳香環であり、該芳香環は、ベンゼン、ピリジンおよびピリミジンからなる群より選択され、各々は、必要に応じて、1個～2個の  $R^6$  置換基で置換されており、

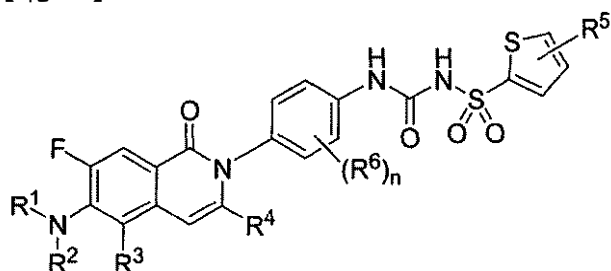
ここで、各  $R^6$  は、別個に、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 6$  アルキル、 $C_2 \sim 6$  アルケニル、 $C_2 \sim 6$  アルキニル、 $C_1 \sim 6$  アルコキシ、 $C_1 \sim 6$  ハロアルキル、 $C_1 \sim 6$  ハロアルコキシ、 $C_3 \sim 5$  シクロアルキル、 $C_3 \sim 5$  シクロアルキル - アルキル、 $C_3 \sim 5$  シクロアルキル - アルコキシ、アミノ、 $C_1 \sim 6$  アルキルアミノ、ジ -  $C_1 \sim 6$  アルキルアミノ、 $-C(O)R^{6a}$ 、 $-O(CH_2)_mOR^{6b}$ 、 $-(CH_2)_mOR^{6b}$ 、 $-O(CH_2)_mN(R^{6b})_2$  および  $-(CH_2)_mN(R^{6b})_2$  からなる群より選択され、

ここで、該下付き文字 m は、1～3の整数であり、各  $R^{6a}$  は、別個に、H、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 6$  アルキル、 $C_1 \sim 6$  アルコキシ、アミノ、 $C_1 \sim 6$  アルキルアミノおよびジ -  $C_1 \sim 6$  アルキルアミノからなる群より選択されるメンバーであり、そして各  $R^{6b}$  は、別個に、H、 $C_1 \sim 4$  アルキルおよび  $C_1 \sim 4$  アルカノイルからなる群より選択されるメンバーであり、必要に応じて、窒素に結合した2個の  $R^{6b}$  基は、該窒素原子と結合して、アゼチジン環、ピロリジン環またはピペリジン環を形成する、化合物。

## 【請求項 2】

次式

## 【化 2】

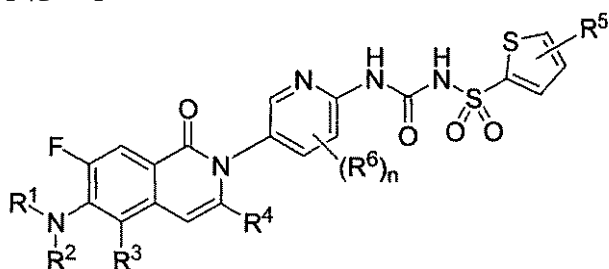


を有する、請求項 1 に記載の化合物であって、  
ここで、該下付き文字  $n$  が、0 ~ 2 の整数である、  
化合物。

## 【請求項 3】

次式

## 【化 3】

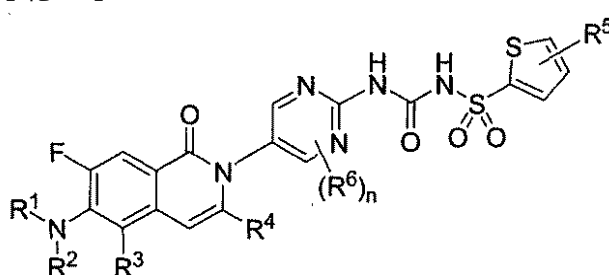


を有する、請求項 1 に記載の化合物であって、  
ここで、該下付き文字  $n$  が、0 ~ 2 の整数である、  
化合物。

## 【請求項 4】

次式

## 【化 4】



を有する、請求項 1 に記載の化合物であって、  
ここで、該下付き文字  $n$  が、0 ~ 2 の整数である、  
化合物。

## 【請求項 5】

$n$  が、0 ~ 2 の整数である； $R^1$  が、 $C_{1-4}$  アルキル、 $C_{3-5}$  シクロアルキルまたは  $C_{3-5}$  シクロアルキル - アルキルである； $R^2$  が、H である； $R^3$  が、H、 $C_{1-4}$  アルキル、 $C_{2-4}$  アルケニル、 $C_{2-4}$  アルキニル、 $C_{3-5}$  シクロアルキル、 $C_{3-5}$  シクロアルキル - アルキル、 $C_{1-4}$  ハロアルキル、シアノまたは  $-C(O)R^{3a}$  である； $R^4$  が、H または  $C_{1-4}$  アルキルである； $R^5$  が、ハロゲン、 $C_{1-4}$  アルキル、 $C_{1-4}$  アルコキシ、 $C_{1-4}$  ハロアルキル、 $-CN$ 、 $-C \equiv CH$  または  $-CONH_2$  で

ある；そして $R^6$ は、存在する場合には、 $C_1 \sim 4$  アルキル、 $C_1 \sim 4$  アルコキシ、 $C_3 \sim 5$  シクロアルキル - アルコキシ、 $-O(CH_2)_m OR^{6b}$  および  $-O(CH_2)_m N(R^{6b})_2$  からなる群より選択され、ここで、該下付き文字 $m$ が、1または2であり、そして各 $R^{6b}$ が、別個に、 $H$ 、 $C_1 \sim 4$  アルキルおよび $C_1 \sim 4$  アルカノイルからなる群より選択される、請求項2に記載の化合物。

【請求項6】

$R^1$ が、 $C_1 \sim 4$  アルキルである； $R^4$ が、 $H$ または $CH_3$ である； $R^5$ が、ハロゲンまたは $C_1 \sim 4$  アルキルである；そして $R^6$ は、存在する場合には、 $C_1 \sim 4$  アルキル、 $-O(CH_2)_m OR^{6b}$  および  $-O(CH_2)_m N(R^{6b})_2$  から選択される、請求項5に記載の化合物。

【請求項7】

$R^1$ が、メチルである； $R^5$ が、クロロであり、そして前記チエニル環の5位に結合されている；そして $R^6$ は、存在する場合には、 $CH_3$ 、 $-OCH_2CH_2OH$ 、 $-OCH_2CH_2OCH_3$ 、 $-OCH_2OCH_3$ 、 $-OCH_2CH_2OC(O)CH_3$  および  $-O(CH_2)_2N(CH_3)_2$  からなる群より選択される、請求項6に記載の化合物。

【請求項8】

$n$ が、0である、請求項7に記載の化合物。

【請求項9】

$n$ が、1である、請求項7に記載の化合物。

【請求項10】

$n$ が、2である、請求項7に記載の化合物。

【請求項11】

$n$ が、0または1である； $R^1$ が、 $C_1 \sim 4$  アルキル、 $C_3 \sim 5$  シクロアルキルまたは $C_3 \sim 5$  シクロアルキル - アルキルである； $R^2$ が、 $H$ である； $R^3$ が、 $H$ 、 $C_1 \sim 4$  アルキル、 $C_2 \sim 4$  アルケニル、 $C_2 \sim 4$  アルキニル、 $C_3 \sim 5$  シクロアルキル、 $C_3 \sim 5$  シクロアルキル - アルキル、 $C_1 \sim 4$  ハロアルキル、シアノまたは $-C(O)R^{3a}$  である； $R^4$ が、 $H$ または $C_1 \sim 4$  アルキルである； $R^5$ が、ハロゲン、 $C_1 \sim 4$  アルキル、 $C_1 \sim 4$  アルコキシ、 $C_1 \sim 4$  ハロアルキル、 $-CN$ 、 $-CCH$ または $-CONH_2$  である；そして $R^6$ は、存在する場合には、 $C_1 \sim 4$  アルキル、 $C_1 \sim 4$  アルコキシ、 $C_3 \sim 5$  シクロアルキル - アルコキシ、 $-O(CH_2)_m OR^{6b}$  および  $-O(CH_2)_m N(R^{6b})_2$  からなる群より選択され、ここで、該下付き文字 $m$ が、1または2であり、そして各 $R^{6b}$ が、別個に、 $H$ 、 $C_1 \sim 4$  アルキルおよび $C_1 \sim 4$  アルカノイルからなる群より選択される、請求項3に記載の化合物。

【請求項12】

$R^1$ が、 $C_1 \sim 4$  アルキルである； $R^4$ が、 $H$ または $CH_3$ である； $R^5$ が、ハロゲンまたは $C_1 \sim 4$  アルキルである；そして $R^6$ は、存在する場合には、 $C_1 \sim 4$  アルキル、 $-O(CH_2)_m OR^{6b}$  および  $-O(CH_2)_m N(R^{6b})_2$  から選択される、請求項11に記載の化合物。

【請求項13】

$R^1$ が、メチルである； $R^3$ が、 $H$ 、 $C_1 \sim 4$  アルキル、 $C_2 \sim 4$  アルケニル、 $C_2 \sim 4$  アルキニル、 $C_3 \sim 5$  シクロアルキルまたは $C_3 \sim 5$  シクロアルキル - アルキルである； $R^4$ が、 $H$ または $CH_3$ である； $R^5$ が、クロロであり、そして前記チエニル環の5位に結合されている；そして $R^6$ は、存在する場合には、 $C_1 \sim 4$  アルキル、 $-O(CH_2)_m OR^{6b}$  および  $-O(CH_2)_m N(R^{6b})_2$  からなる群より選択され、ここで、該下付き文字 $m$ が、1または2であり、そして各 $R^{6b}$ が、別個に、 $H$ 、 $C_1 \sim 4$  アルキルおよび $C_1 \sim 4$  アルカノイルからなる群より選択される、請求項12に記載の化合物。

【請求項14】

$n$ が、0または1である； $R^1$ が、 $C_1 \sim 4$  アルキル、 $C_3 \sim 5$  シクロアルキルまたは $C_3 \sim 5$  シクロアルキル - アルキルである； $R^2$ が、 $H$ である； $R^3$ が、 $H$ 、 $C_1 \sim 4$  アルキル、 $C_2 \sim 4$  アルケニル、 $C_2 \sim 4$  アルキニル、 $C_3 \sim 5$  シクロアルキル、 $C_3 \sim 5$  シ

クロアルキル - アルキル、 $C_1 \sim 4$  ハロアルキル、シアノまたは  $-C(O)R^{3a}$  である； $R^4$  が、H または  $C_1 \sim 4$  アルキルである； $R^5$  が、ハロゲン、 $C_1 \sim 4$  アルキル、 $C_1 \sim 4$  アルコキシ、 $C_1 \sim 4$  ハロアルキル、 $-CN$ 、 $-CCH$  または  $-CONH_2$  である；そして  $R^6$  は、存在する場合には、 $C_1 \sim 4$  アルキル、 $C_1 \sim 4$  アルコキシ、 $C_3 \sim 5$  シクロアルキル - アルコキシ、 $-O(CH_2)_mOR^{6b}$  および  $-O(CH_2)_mN(R^{6b})_2$  からなる群より選択され、ここで、該下付き文字  $m$  が、1 または 2 であり、そして各  $R^{6b}$  が、別個に、H、 $C_1 \sim 4$  アルキルおよび  $C_1 \sim 4$  アルカノイルからなる群より選択される、請求項 4 に記載の化合物。

【請求項 15】

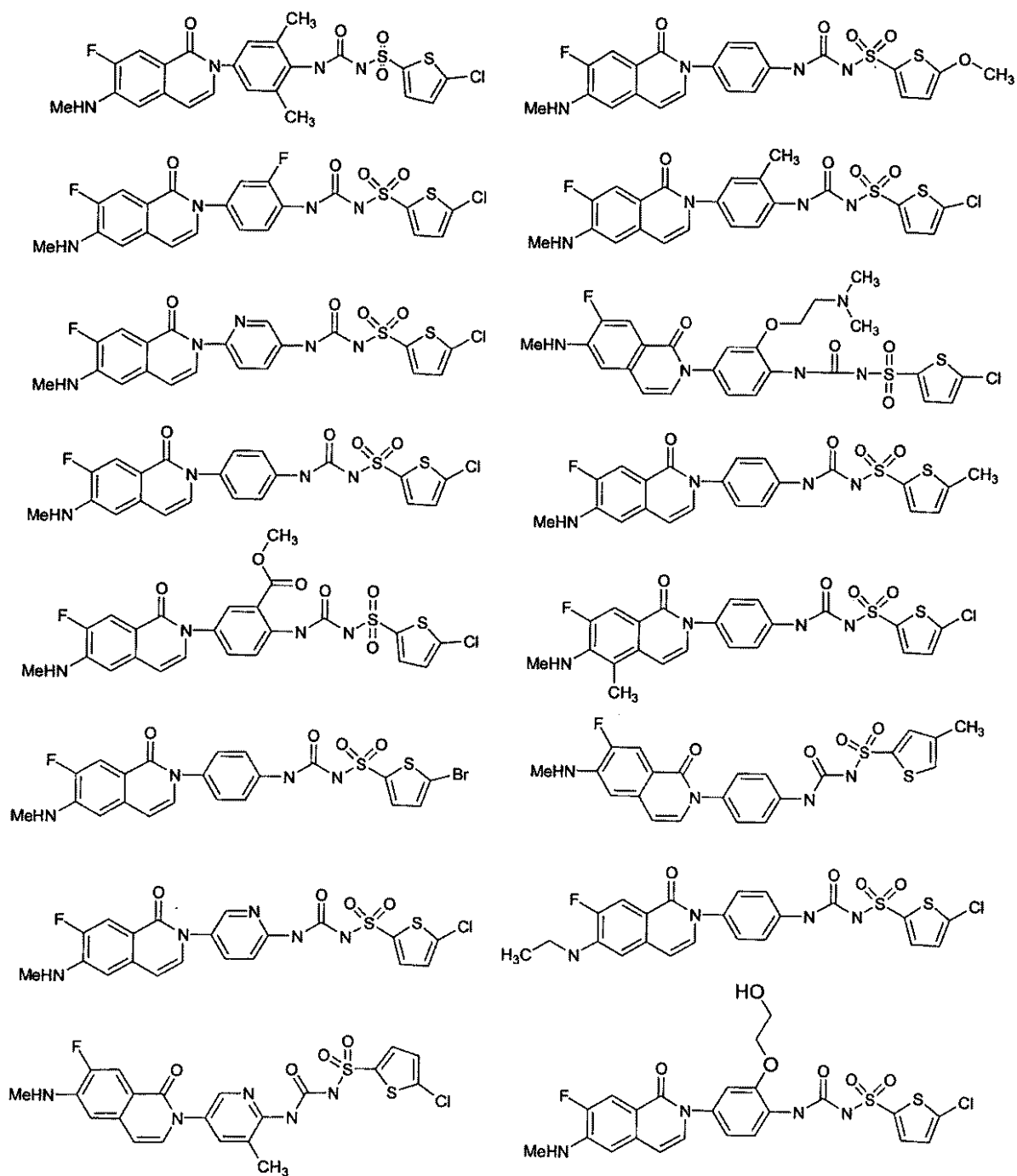
$R^1$  が、 $C_1 \sim 4$  アルキルである； $R^4$  が H または  $CH_3$  である； $R^5$  が、ハロゲンまたは  $C_1 \sim 4$  アルキルである；そして  $R^6$  は、存在する場合には、 $C_1 \sim 4$  アルキル、 $-O(CH_2)_mOR^{6b}$  および  $-O(CH_2)_mN(R^{6b})_2$  から選択される、請求項 14 に記載の化合物。

【請求項 16】

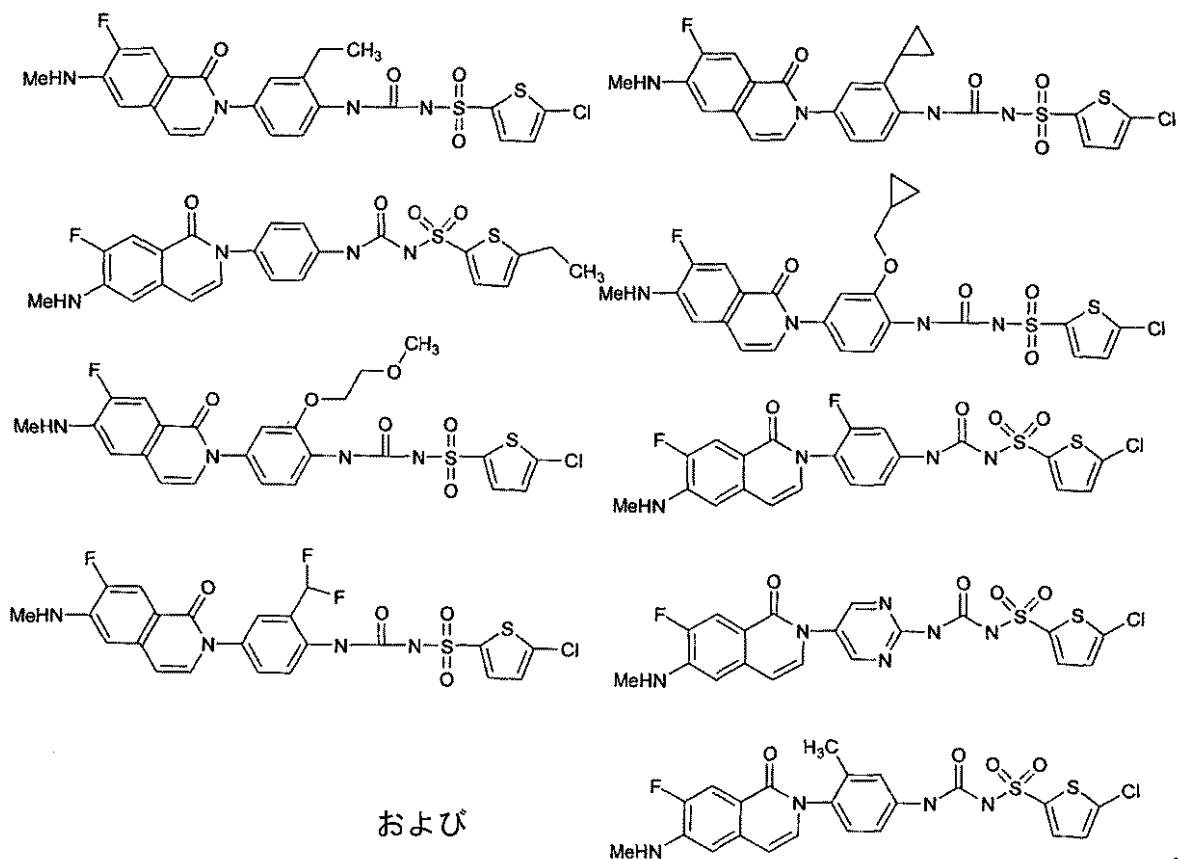
$R^1$  が、メチルである； $R^3$  が、H、 $C_1 \sim 4$  アルキル、 $C_2 \sim 4$  アルケニル、 $C_2 \sim 4$  アルキニル、 $C_3 \sim 5$  シクロアルキルまたは  $C_3 \sim 5$  シクロアルキル - アルキルである； $R^4$  が、H または  $CH_3$  である； $R^5$  が、クロロであり、そして前記チエニル環の 5 位に結合されている；そして  $R^6$  は、存在する場合には、 $C_1 \sim 4$  アルキル、 $-O(CH_2)_mOR^{6b}$  および  $-O(CH_2)_mN(R^{6b})_2$  からなる群より選択され、ここで、該下付き文字  $m$  が、1 または 2 であり、そして各  $R^{6b}$  が、別個に、H、 $C_1 \sim 4$  アルキルおよび  $C_1 \sim 4$  アルカノイルからなる群より選択される、請求項 15 に記載の化合物。

【請求項 17】

## 【化 5】



## 【化 6】

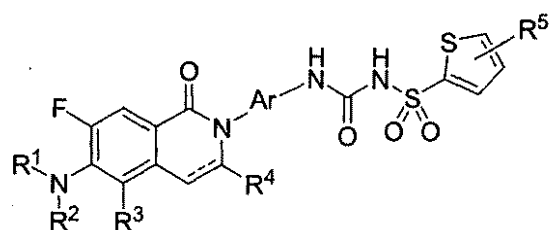


からなる群より選択される、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 18】

薬学的に受容可能な賦形剤と、次式

## 【化 7】



を有する化合物またはそれらの薬学的に受容可能な塩とを含有する、薬学的組成物であって、

ここで、該点線は、任意の二重結合を表わす；

$R^1$  は、 $C_1 \sim 6$  アルキル、 $C_1 \sim 6$  ハロアルキル、 $C_3 \sim 5$  シクロアルキル、 $C_3 \sim 5$  シクロアルキル - アルキルおよびベンジルからなる群より選択されるメンバーである；

$R^2$  は、H、 $C_1 \sim 6$  アルキルおよび  $C_1 \sim 6$  ハロアルキルからなる群より選択されるメンバーである；

$R^3$  は、H、 $C_1 \sim 6$  アルキル、 $C_2 \sim 6$  アルケニル、 $C_2 \sim 6$  アルキニル、 $C_3 \sim 5$  シクロアルキル、 $C_3 \sim 5$  シクロアルキル - アルキル、 $C_1 \sim 6$  ハロアルキル、 $C_1 \sim 6$  ヒドロキシアルキル、シアノおよび  $-C(O)R^{3a}$  からなる群より選択されるメンバーであり、ここで、 $R^{3a}$  は、H、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 6$  アルキル、 $C_1 \sim 6$  アルコキシ、アミノ、 $C_1 \sim 6$  アルキルアミノおよびジ -  $C_1 \sim 6$  アルキルアミノからなる群より選択されるメンバーである；

$R^4$  は、H および  $C_1 \sim 6$  アルキルからなる群より選択されるメンバーである；

$R^5$  は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim 6$  アルキル、 $C_2 \sim 6$  アルケニル、 $C_2 \sim 6$  アルキニル、 $C_1 \sim 6$  ハロアルキル、 $C_1 \sim 6$  アルコキシ、シアノおよび  $-C(O)R^{5a}$  からなる群より選択されるメンバーであり、ここで、 $R^{5a}$  は、 $C_1 \sim 6$  アルコキシ、アミノ、 $C_1 \sim 6$  アルキルアミノおよびジ- $C_1 \sim 6$  アルキルアミノからなる群より選択されるメンバーである；そして

Ar は、芳香環であり、該芳香環は、ベンゼン、ピリジンおよびピリミジンからなる群より選択され、各々は、必要に応じて、1個～2個の  $R^6$  置換基で置換されており、

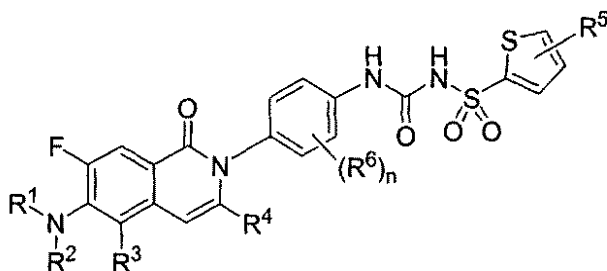
ここで、各  $R^6$  は、別個に、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 6$  アルキル、 $C_2 \sim 6$  アルケニル、 $C_2 \sim 6$  アルキニル、 $C_1 \sim 6$  アルコキシ、 $C_1 \sim 6$  ハロアルキル、 $C_1 \sim 6$  ハロアルコキシ、 $C_3 \sim 5$  シクロアルキル、 $C_3 \sim 5$  シクロアルキル-アルキル、 $C_3 \sim 5$  シクロアルキル-アルコキシ、アミノ、 $C_1 \sim 6$  アルキルアミノ、ジ- $C_1 \sim 6$  アルキルアミノ、 $-C(O)R^{6a}$ 、 $-O(CH_2)_mOR^{6b}$ 、 $-(CH_2)_mOR^{6b}$ 、 $-O(CH_2)_mN(R^{6b})_2$  および  $-(CH_2)_mN(R^{6b})_2$  からなる群より選択され、

ここで、該下付き文字 m は、1～3の整数であり、各  $R^{6a}$  は、別個に、H、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 6$  アルキル、 $C_1 \sim 6$  アルコキシ、アミノ、 $C_1 \sim 6$  アルキルアミノおよびジ- $C_1 \sim 6$  アルキルアミノからなる群より選択されるメンバーであり、そして各  $R^{6b}$  は、別個に、H、 $C_1 \sim 4$  アルキルおよび  $C_1 \sim 4$  アルカノイルからなる群より選択されるメンバーであり、必要に応じて、窒素に結合した2個の  $R^{6b}$  基は、該窒素原子と結合して、アゼチジン環、ピロリジン環またはピペリジン環を形成する、組成物。

#### 【請求項 19】

前記化合物が、次式

#### 【化 8】



を有する、請求項 18 に記載の薬学的組成物であって、

ここで、n は、0 または 1 である； $R^1$  は、 $C_1 \sim 4$  アルキル、 $C_3 \sim 5$  シクロアルキルまたは  $C_3 \sim 5$  シクロアルキル-アルキルである； $R^2$  は、H である； $R^3$  は、H、 $C_1 \sim 4$  アルキル、 $C_2 \sim 4$  アルケニル、 $C_2 \sim 4$  アルキニル、 $C_3 \sim 5$  シクロアルキル、 $C_3 \sim 5$  シクロアルキル-アルキル、 $C_1 \sim 4$  ハロアルキル、シアノおよび  $-C(O)R^3a$  である； $R^4$  は、H または  $C_1 \sim 4$  アルキルである； $R^5$  は、ハロゲン、 $C_1 \sim 4$  アルキル、 $C_1 \sim 4$  アルコキシ、 $C_1 \sim 4$  ハロアルキル、 $-CN$ 、 $-CCH$  または  $-CONH_2$  である；そして  $R^6$  は、存在する場合には、 $C_1 \sim 4$  アルキル、 $C_1 \sim 4$  アルコキシ、 $C_3 \sim 5$  シクロアルキル-アルコキシ、 $-O(CH_2)_mOR^{6b}$  および  $-O(CH_2)_mN(R^{6b})_2$  からなる群より選択され、ここで、該下付き文字 m は、1 または 2 であり、そして各  $R^{6b}$  は、別個に、H、 $C_1 \sim 4$  アルキルおよび  $C_1 \sim 4$  アルカノイルからなる群より選択される、

組成物。

#### 【請求項 20】

$R^1$  が、メチルである； $R^3$  が、H、 $C_1 \sim 4$  アルキル、 $C_2 \sim 4$  アルケニル、 $C_2 \sim 4$  アルキニル、 $C_3 \sim 5$  シクロアルキルまたは  $C_3 \sim 5$  シクロアルキル-アルキルである；

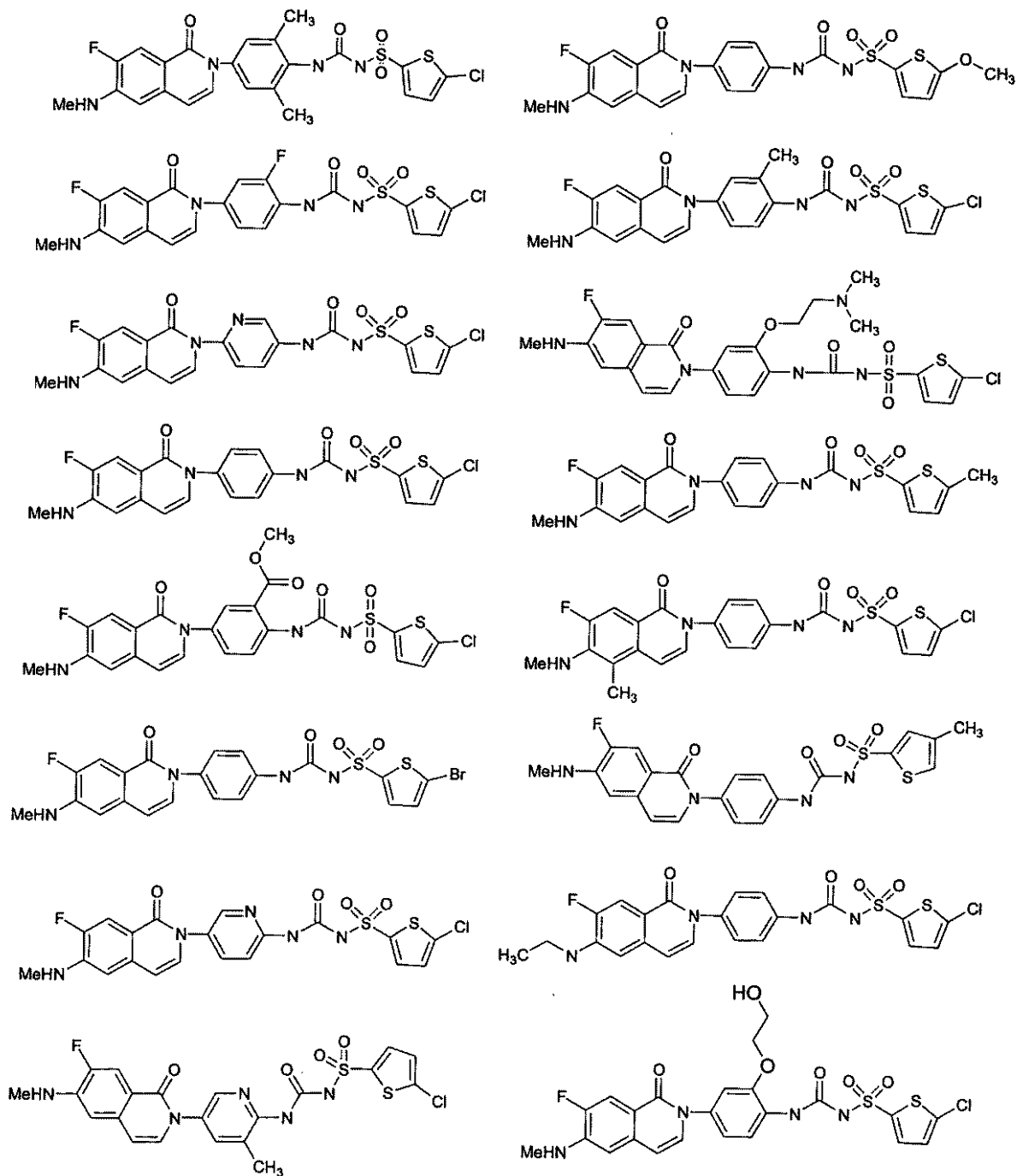


$R^4$  が、Hまたは $CH_3$ である； $R^5$  が、クロロであり、そして前記チエニル環の5位に結合されている；そして $R^6$  は、存在する場合には、 $C_{1-4}$  アルキル、 $-O(CH_2)_mOR^{6b}$  および  $-O(CH_2)_mN(R^{6b})_2$  からなる群より選択され、ここで、該下付き文字mが、1または2であり、そして各 $R^{6b}$  が、別個に、H、 $C_{1-4}$  アルキルおよび $C_{1-4}$  アルカノイルからなる群より選択される、請求項19に記載の薬学的組成物。

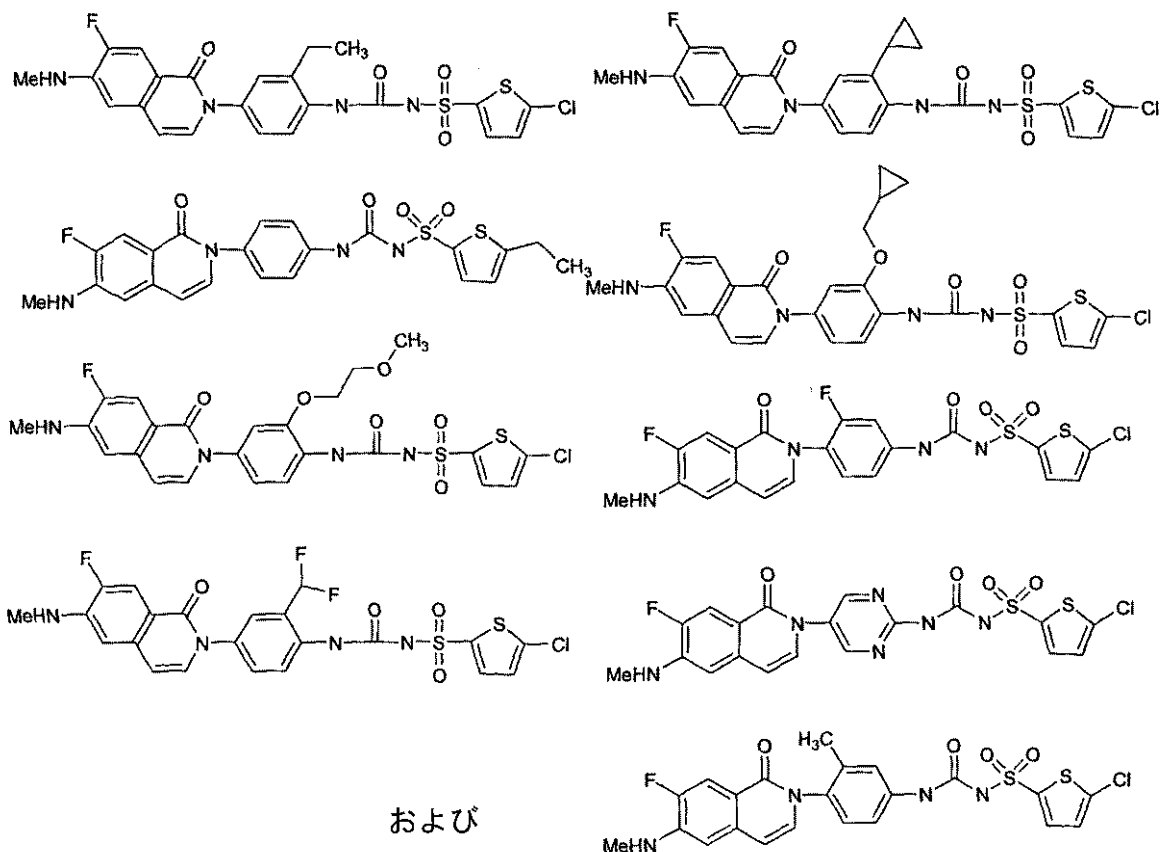
【請求項21】

前記化合物が、

【化9】



## 【化 10】

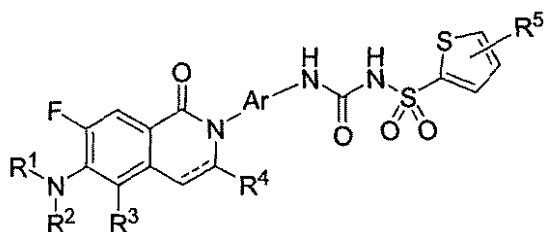


からなる群より選択される、請求項 18 に記載の薬学的組成物。

## 【請求項 22】

被験体における血栓症を処置するための組成物であって、該組成物は、次式

## 【化 11】



を有する化合物またはそれらの薬学的に受容可能な塩を含み、

ここで、該点線は、任意の二重結合を示す；

$R^1$  は、 $C_1 \sim 6$  アルキル、 $C_1 \sim 6$  ハロアルキル、 $C_3 \sim 5$  シクロアルキル、 $C_3 \sim 5$  シクロアルキル-アルキルおよびベンジルからなる群より選択されるメンバーである；

$R^2$  は、H、 $C_1 \sim 6$  アルキルおよび  $C_1 \sim 6$  ハロアルキルからなる群より選択されるメンバーである；

$R^3$  は、H、 $C_1 \sim 6$  アルキル、 $C_2 \sim 6$  アルケニル、 $C_2 \sim 6$  アルキニル、 $C_3 \sim 5$  シクロアルキル、 $C_3 \sim 5$  シクロアルキル-アルキル、 $C_1 \sim 6$  ハロアルキル、 $C_1 \sim 6$  ヒドロキシアルキル、シアノおよび  $-C(O)R^{3a}$  からなる群より選択されるメンバーであり、ここで、 $R^{3a}$  は、H、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 6$  アルキル、 $C_1 \sim 6$  アルコキシ、アミノ、 $C_1 \sim 6$  アルキルアミノおよびジ- $C_1 \sim 6$  アルキルアミノからなる群より選択されるメンバーである；

$R^4$  は、H および  $C_1 \sim 6$  アルキルからなる群より選択されるメンバーである；

$R^5$  は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim 6$  アルキル、 $C_2 \sim 6$  アルケニル、 $C_2 \sim 6$  アルキニル、 $C_1 \sim 6$  ハロアルキル、 $C_1 \sim 6$  アルコキシ、シアノおよび  $-C(O)R^{5a}$  からなる群より選択されるメンバーであり、ここで、 $R^{5a}$  は、 $C_1 \sim 6$  アルコキシ、アミノ、 $C_1 \sim 6$  アルキルアミノおよびジ- $C_1 \sim 6$  アルキルアミノからなる群より選択されるメンバーである；そして

$Ar$  は、芳香環であり、該芳香環は、ベンゼン、ピリジンおよびピリミジンからなる群より選択され、各々は、必要に応じて、1個～2個の  $R^6$  置換基で置換されており、

ここで、各  $R^6$  は、別個に、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 6$  アルキル、 $C_2 \sim 6$  アルケニル、 $C_2 \sim 6$  アルキニル、 $C_1 \sim 6$  アルコキシ、 $C_1 \sim 6$  ハロアルキル、 $C_1 \sim 6$  ハロアルコキシ、 $C_3 \sim 5$  シクロアルキル、 $C_3 \sim 5$  シクロアルキル-アルキル、 $C_3 \sim 5$  シクロアルキル-アルコキシ、アミノ、 $C_1 \sim 6$  アルキルアミノ、ジ- $C_1 \sim 6$  アルキルアミノ、 $-C(O)R^{6a}$ 、 $-O(CH_2)_mOR^{6b}$ 、 $-(CH_2)_mOR^{6b}$ 、 $-O(CH_2)_mN(R^{6b})_2$  および  $-(CH_2)_mN(R^{6b})_2$  からなる群より選択され、

ここで、該下付き文字  $m$  は、1～3の整数であり、各  $R^{6a}$  は、別個に、H、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 6$  アルキル、 $C_1 \sim 6$  アルコキシ、アミノ、 $C_1 \sim 6$  アルキルアミノおよびジ- $C_1 \sim 6$  アルキルアミノからなる群より選択されるメンバーであり、そして各  $R^{6b}$  は、別個に、H、 $C_1 \sim 4$  アルキルおよび  $C_1 \sim 4$  アルカノイルからなる群より選択されるメンバーであり、必要に応じて、窒素に結合した2個の  $R^{6b}$  基は、該窒素原子と結合して、アゼチジン環、ピロリジン環またはピペリジン環を形成する、

組成物。

#### 【請求項23】

前記組成物は、第二治療剤と併用して投与するためのものであり、該第二治療剤が、抗血小板化合物、抗凝固剤、フィブリン溶解剤、抗炎症性化合物、コレステロール降下剤、血圧降下剤およびセロトニンブロッカーからなる群より選択される、請求項22に記載の組成物。

#### 【請求項24】

前記第二治療剤が、抗血小板化合物であり、該抗血小板化合物が、 $GP_{IIb/IIIa}$  アンタゴニスト、アスピリン、ホスホジエステラーゼIIIインヒビターおよびトロンボキサンA2レセプターアンタゴニストからなる群より選択される、請求項23に記載の組成物。

#### 【請求項25】

前記第二治療剤が、抗凝固剤であり、該抗凝固剤が、トロンビンインヒビター、クマジン、ヘパリンおよび  $Lox$  (登録商標) からなる群より選択される、請求項23に記載の組成物。

#### 【請求項26】

前記第二治療剤が、抗炎症性化合物であり、該抗炎症性化合物が、非ステロイド性抗炎症剤、シクロオキシゲナーゼ-2インヒビターおよび慢性関節リウマチ剤からなる群より選択される、請求項23に記載の組成物。

#### 【請求項27】

前記組成物は、経口投与するためのものである、請求項23に記載の組成物。

#### 【請求項28】

二次虚血事象の発生を予防するための組成物であって、該組成物は、

薬学的に受容可能なキャリアと共に、請求項1に記載の化合物を含み、該組成物は、一次虚血事象に罹った患者に投与するためのものである、組成物。

#### 【請求項29】

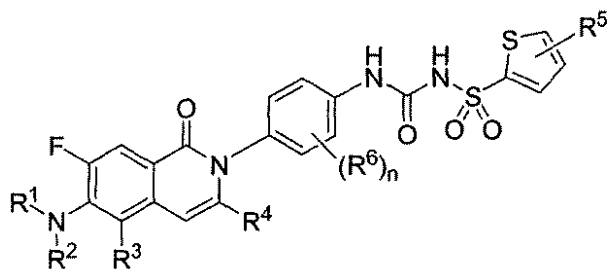
前記一次虚血事象および/または二次虚血事象が、心筋梗塞、安定狭心症または不安定狭心症、経皮的経管的冠状動脈形成術後の急性再閉塞、再狭窄、血栓性脳卒中、一過性脳虚血発作、可逆的虚血性神経学的欠損および間欠性跛行からなる群より選択される、請求項

28に記載の組成物。

【請求項30】

前記化合物が、次式

【化12】



を有する、請求項22に記載の組成物であって、

ここで、 $n$ は、0または1である； $R^1$ は、 $C_1 \sim 4$ アルキル、 $C_3 \sim 5$ シクロアルキルまたは $C_3 \sim 5$ シクロアルキル-アルキルである； $R^2$ は、Hである； $R^3$ は、H、 $C_1 \sim 4$ アルキル、 $C_2 \sim 4$ アルケニル、 $C_2 \sim 4$ アルキニル、 $C_3 \sim 5$ シクロアルキル、 $C_3 \sim 5$ シクロアルキル-アルキル、 $C_1 \sim 4$ ハロアルキル、シアノまたは $-C(O)R^{3a}$ である； $R^4$ は、Hまたは $C_1 \sim 4$ アルキルである； $R^5$ は、ハロゲン、 $C_1 \sim 4$ アルキル、 $C_1 \sim 4$ アルコキシ、 $C_1 \sim 4$ ハロアルキル、 $-CN$ 、 $-CCH$ または $-CONH_2$ である；そして $R^6$ は、存在する場合には、 $C_1 \sim 4$ アルキル、 $C_1 \sim 4$ アルコキシ、 $C_3 \sim 5$ シクロアルキル-アルコキシ、 $-O(CH_2)_mOR^{6b}$ および $-O(CH_2)_mN(R^{6b})_2$ からなる群より選択され、ここで、該下付き文字 $m$ は、1または2であり、そして各 $R^{6b}$ は、別個に、H、 $C_1 \sim 4$ アルキルおよび $C_1 \sim 4$ アルカノイルからなる群より選択される、  
組成物。

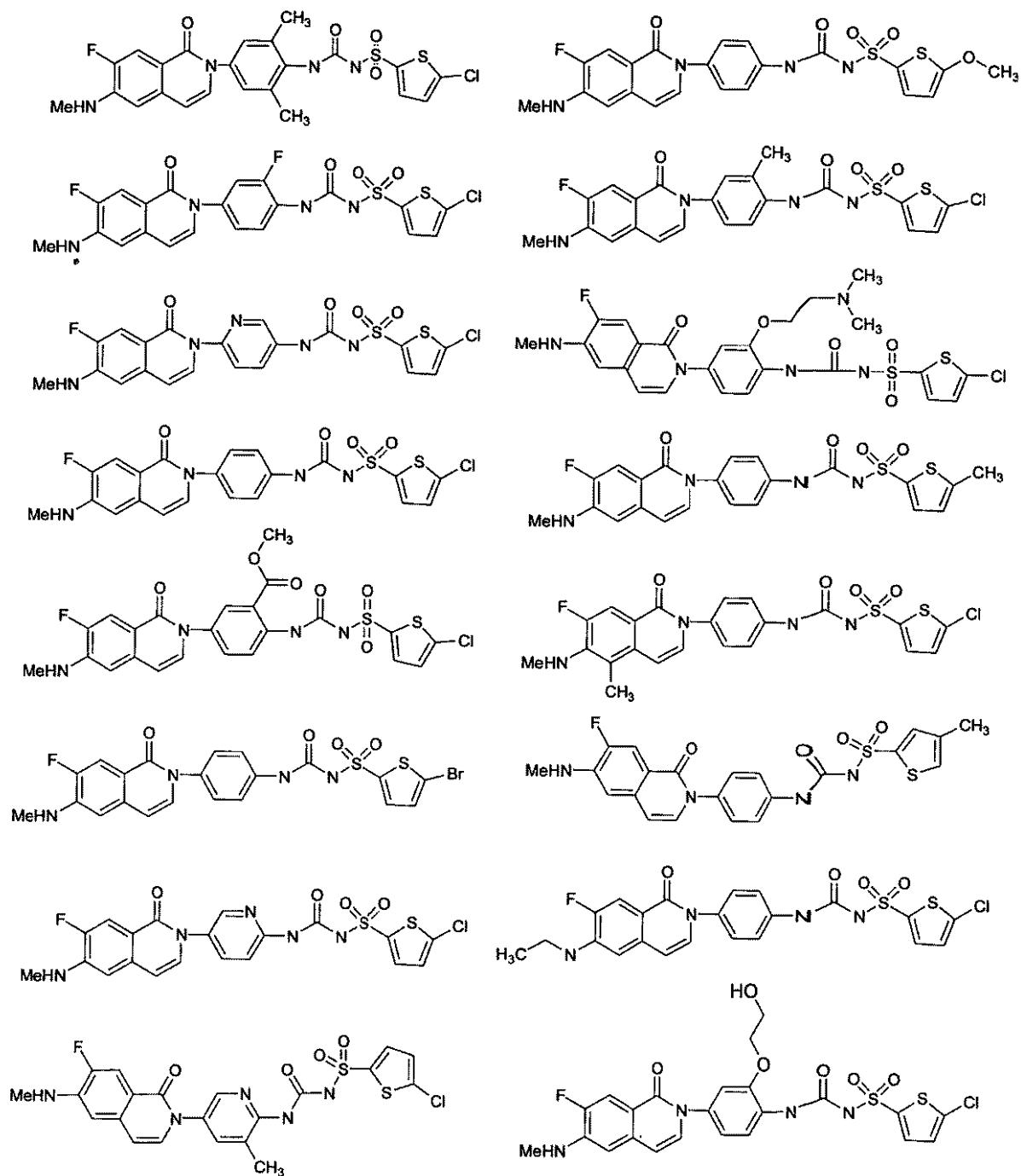
【請求項31】

$R^1$ が、メチルである； $R^3$ が、H、 $C_1 \sim 4$ アルキル、 $C_2 \sim 4$ アルケニル、 $C_2 \sim 4$ アルキニル、 $C_3 \sim 5$ シクロアルキルまたは $C_3 \sim 5$ シクロアルキル-アルキルである； $R^4$ が、Hまたは $CH_3$ である； $R^5$ が、クロロであり、そして前記チエニル環の5位に結合されている；そして $R^6$ は、存在する場合には、 $C_1 \sim 4$ アルキル、 $-O(CH_2)_mOR^{6b}$ および $-O(CH_2)_mN(R^{6b})_2$ からなる群より選択され、ここで、該下付き文字 $m$ が、1または2であり、そして各 $R^{6b}$ が、別個に、H、 $C_1 \sim 4$ アルキルおよび $C_1 \sim 4$ アルカノイルからなる群より選択される、請求項30に記載の組成物。

【請求項32】

前記化合物が、

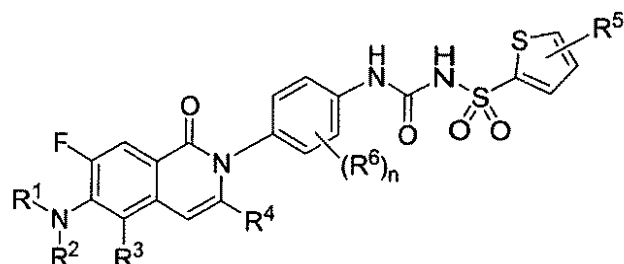
## 【化 1 3】



および

【請求項 33】

【化 1 5】



ここで、nは、0または1である； $R^1$ は、 $C_1 \sim 4$ アルキル、 $C_3 \sim 5$ シクロアルキルまたは $C_3 \sim 5$ シクロアルキル-アルキルである； $R^2$ は、Hである； $R^3$ は、H、 $C_1 \sim 4$ アルキル、 $C_2 \sim 4$ アルケニル、 $C_2 \sim 4$ アルキニル、 $C_3 \sim 5$ シクロアルキル、 $C_3 \sim 5$ シクロアルキル-アルキル、 $C_1 \sim 4$ ハロアルキル、シアノまたは $-C(O)R^{3a}$ である； $R^4$ は、Hまたは $C_1 \sim 4$ アルキルである； $R^5$ は、ハロゲン、 $C_1 \sim 4$ アルキル、 $C_1 \sim 4$ アルコキシ、 $C_1 \sim 4$ ハロアルキル、 $-CN$ 、 $-CCH$ または $-CONH_2$ である；そして $R^6$ は、存在する場合には、 $C_1 \sim 4$ アルキル、 $C_1 \sim 4$ アルコキシ、 $C_3 \sim 5$ シクロアルキル-アルコキシ、 $-O(CH_2)_mOR^{6b}$ および $-O(CH_2)_mN(R^{6b})_2$ からなる群より選択され、ここで、該下付き文字mは、1または2であり、そして各 $R^{6b}$ は、別個に、H、 $C_1 \sim 4$ アルキルおよび $C_1 \sim 4$ アルカノイルからなる群より選択される、

組成物。

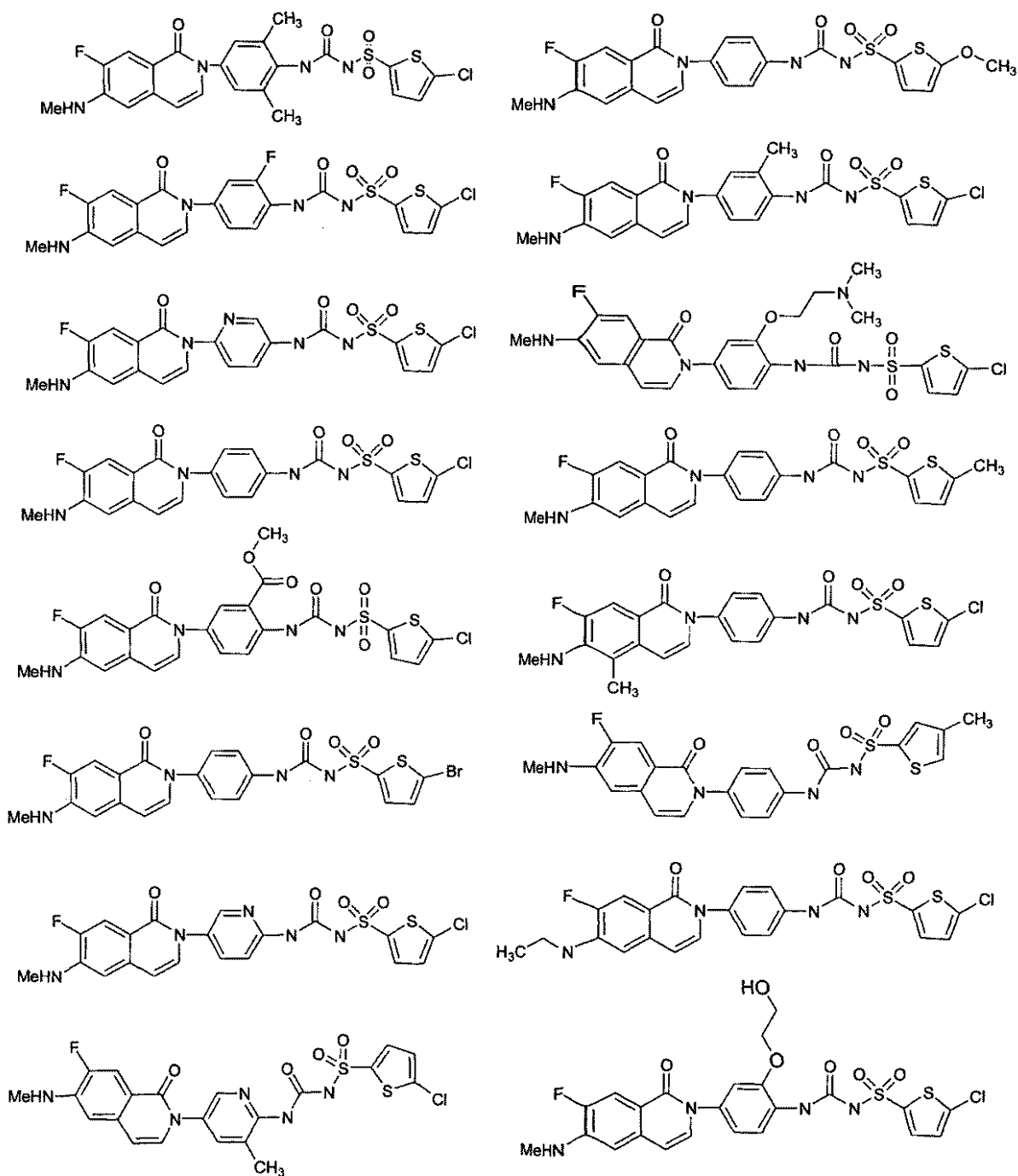
【請求項 3 4】

$R^1$  が、メチルである； $R^3$  が、H、 $C_1 \sim 4$  アルキル、 $C_2 \sim 4$  アルケニル、 $C_2 \sim 4$  アルキニル、 $C_3 \sim 5$  シクロアルキルまたは  $C_3 \sim 5$  シクロアルキル - アルキルである； $R^4$  が、H または  $CH_3$  である； $R^5$  が、クロロであり、そして前記チエニル環の 5 位に結合されている；そして  $R^6$  は、存在する場合には、 $C_1 \sim 4$  アルキル、 $-O(CH_2)_mOR^{6b}$  および  $-O(CH_2)_mN(R^{6b})_2$  からなる群より選択され、ここで、該下付き文字  $m$  が、1 または 2 であり、そして各  $R^{6b}$  が、別個に、H、 $C_1 \sim 4$  アルキルおよび  $C_1 \sim 4$  アルカノイルからなる群より選択される、請求項 3 3 に記載の組成物。

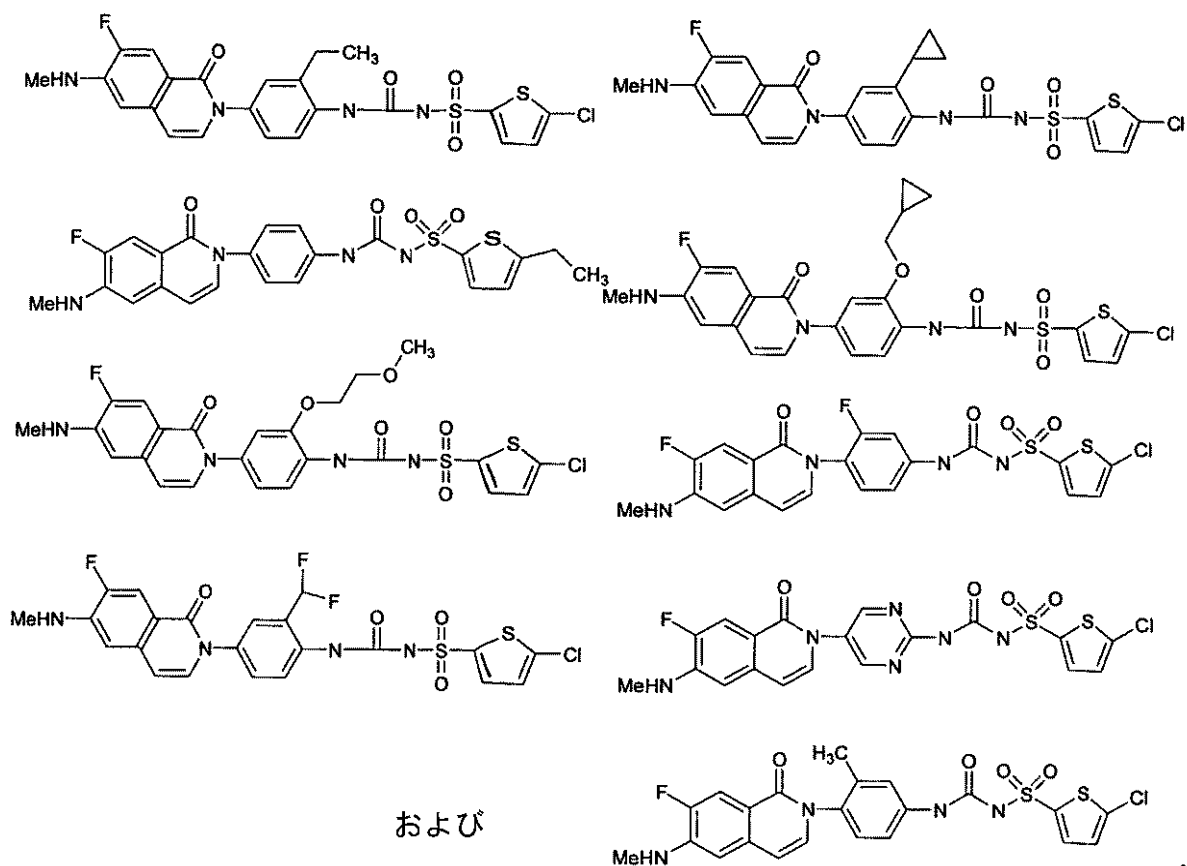
【請求項 3 5】

前記化合物が、

【化 1 6】



## 【化 17】



からなる群より選択される、請求項 28 に記載の組成物。