(12)特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局

(43) 国際公開日
2003 年2 月27 日 (27.02.2003)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 03/016302 A1

(51) 国際特許分類[7]: C07D 401/12, 401/14, 417/12, 487/04, 495/04, 498/04, 513/04, 513/14, 519/00, A61K 31/428, 31/429, 31/437, 31/444, 31/454, 31/4545, 31/4709, 31/4725, 31/501, 31/502, 31/5025, 31/506, 31/517, 31/519, A61P 7/02, 9/00

(21) 国際出願番号: PCT/JP02/08119

(22) 国際出願日: 2002 年8 月8 日 (08.08.2002)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:

特願2001-243046	2001 年8 月9 日 (09.08.2001)	JP
特願2001-311808	2001 年10 月9 日 (09.10.2001)	JP
特願2001-398708	2001 年12 月28 日 (28.12.2001)	JP
PCT/JP02/02683	2002 年3 月20 日 (20.03.2002)	JP
PCT/JP02/06141	2002 年6 月20 日 (20.06.2002)	JP

(63) 先の出願に対する継続または一部継続による関係:
US PCT/JP02/06141 (一部継続)
出願日 2002 年6 月20 日 (20.06.2002)

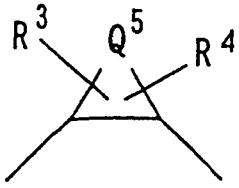
(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 第一製薬株式会社 (DAIICHI PHARMACEUTICAL CO., LTD.) [JP/JP]; 〒103-8234 東京都 中央区日本橋 3丁目１４番１０号 Tokyo (JP).

(72) 発明者; および
(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 太田 敏晴 (OHTA,Toshiharu) [JP/JP]; 〒134-8630 東京都 江戸川区北葛西 １丁目１６−１３ 第一製薬株式会社東京研究開発センター内 Tokyo (JP). 小森谷 聡 (KOMORIYA,Satoshi) [JP/JP]; 〒134-8630 東京都 江戸川区北葛西 １丁目１６−１３ 第一製薬株式会社東京研究開発センター内 Tokyo (JP). 吉野 利治 (YOSHINO,Toshiharu) [JP/JP]; 〒134-8630 東京都 江戸川区北葛西 １丁目１６−１３ 第一製薬株式会社東京研究開発センター内 Tokyo (JP). 魚戸 浩一 (UOTO,Kouichi) [JP/JP]; 〒134-8630 東京都 江戸川区北葛西 １丁目１６−１３ 第一製薬株式会社東京研究開発センター内 Tokyo (JP). 中本 有美 (NAKAMOTO,Yumi) [JP/JP]; 〒134-8630 東京都 江戸川区北葛西 １丁目１６−１３ 第一製薬株式会社東京研究開発センター内 Tokyo (JP). 内藤 博之 (NAITO,Hiroyuki) [JP/JP]; 〒134-8630 東京都 江戸川区北葛西 １丁目１６−１３ 第一製薬株式会社東京研究開発センター内 Tokyo (JP). 望月 明慶 (MOCHIZUKI,Akiyoshi) [JP/JP]; 〒134-8630 東京都 江戸川区北葛西 １丁目１６−１３ 第一製薬株式会社東京研究開発センター内 Tokyo (JP). 永田 勉 (NAGATA,Tsutomu) [JP/JP]; 〒134-8630 東京都 江戸川区北葛西 １丁目１６−１３ 第一製薬株式会社東京研究開発センター内 Tokyo (JP). 菅野 英幸 (KANNO,Hideyuki) [JP/JP]; 〒134-8630 東京都 江戸川区北葛西 １丁目１６−１３ 第一製薬株式会社東京研究開発センター内 Tokyo (JP). 萩野谷 憲康 (HAGINOYA,Noriyasu) [JP/JP]; 〒134-8630 東京都 江戸川区北葛西 １丁目１６−１３ 第一製薬株式会社東京研究開発センター内 Tokyo (JP). 吉川 謙次 (YOSHIKAWA,Kenji) [JP/JP]; 〒134-8630 東京都 江戸川区北葛西 １丁目１６−１３ 第一製薬株式会

[続葉有]

(54) Title: DIAMINE DERIVATIVES

(54) 発明の名称: ジアミン誘導体



(1)

(57) Abstract: Compounds represented by the following general formula (1), salts thereof, solvates of the same or N-oxides of the same: Q^1-Q^2-T^0-N(R^1)-Q^3-N(R^2)-T^1-Q^4 (1) wherein R^1 and R^2 represent each hydrogen, etc.; Q^1 represents optionally substituted, saturated or unsaturated 5- or 6-membered hydrocarbyl, etc.; Q^2 represents a single bond, etc.; Q^3 represents the following group; (wherein Q^5 represents C_{1-8} alkylene, etc.); and T^0 and T^1 represent each carbonyl, etc. These compounds are useful as preventives and/or remedies for brain infarction, cerebral embolism, myocardial infarction, angina, pulmonary infarction, pulmonary embolism, Buerger's disease, bottom venous thrombosis, disseminated intravascular coagulation, thrombosis following artificial valve/joint replacement, thrombosis and reocclusion following circulation reconstruction, systemic inflammatory responsive syndrome (SIRS), multiple organ dysfunction (MODS), thrombosis in extracorporeal circulation or blood coagulation in collecting blood.

[続葉有]

WO 03/016302 A1

社東京研究開発センター内 Tokyo (JP). 永持 雅敏 (NAGAMOCHI,Masatoshi) [JP/JP]; 〒134-8630 東京都 江戸川区北葛西 １丁目１６−１３ 第一製薬株式会社東京研究開発センター内 Tokyo (JP). 小林 祥三 (KOBAYASHI,Syozo) [JP/JP]; 〒134-8630 東京都 江戸川区北葛西 １丁目１６−１３ 第一製薬株式会社東京研究開発センター内 Tokyo (JP). 小野 誠 (ONO,Makoto) [JP/JP]; 〒134-8630 東京都 江戸川区北葛西 １丁目１６−１３ 第一製薬株式会社東京研究開発センター内 Tokyo (JP).

(74) 代理人: 特許業務法人アルガ特許事務所 (THE PATENT CORPORATE BODY ARUGA PATENT OFFICE); 〒103-0013 東京都 中央区日本橋人形町 1丁目3番6号共同ビル Tokyo (JP).

(81) 指定国 (国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許 (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, SK, TR), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:
— 国際調査報告書

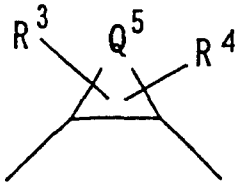
２文字コード及び他の略語については、定期発行される各*PCT*ガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

(57) 要約:

一般式（１）

$$Q^1—Q^2—T^0—N(R^1)—Q^3—N(R^2)—T^1—Q^4 \qquad (1)$$

［式中、R^1およびR^2は水素原子などを、Q^1は置換基を有することもある飽和もしくは不飽和の５～６員の環状炭化水素基などを、Q^2は単結合などを、Q^3は下記の基



（基中、Q^5は炭素数１～８のアルキレン基などを示す。）を、T^0及びT^1はカルボニル基などを示す。］で表される化合物、その塩、それらの溶媒和物またはそれらのＮ－オキシド。

脳梗塞、脳塞栓、心筋梗塞、狭心症、肺梗塞、肺塞栓、バージャー病、深部静脈血栓症、汎発性血管内凝固症候群、人工弁／関節置換後の血栓形成、血行再建後の血栓形成および再閉塞、全身性炎症性反応症候群（ＳＩＲＳ）、多臓器不全（ＭＯＤＳ）、体外循環時の血栓形成または採血時の血液凝固の予防剤および／または治療剤として有用である。