(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
2002 年10 月17 日 (17.10.2002)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 02/081448 A1

(51) 国際特許分類[7]: C07D 211/46, 211/72, 401/04, 401/06, 413/04, 417/04, 451/06, 471/04, A61K 31/435, 31/445, 31/454, 31/4545, 31/46, A61P 7/02, 9/00, 43/00, 9/10

(21) 国際出願番号: PCT/JP02/03355

(22) 国際出願日: 2002 年4 月3 日 (03.04.2002)

(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2001-107615 2001 年4 月5 日 (05.04.2001) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 三共株式会社 (SANKYO COMPANY, LIMITED) [JP/JP]; 〒103-8426 東京都 中央区 日本橋本町3丁目5番1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): 藤本 光一 (FUJIMOTO,Koichi) [JP/JP]; 〒140-8710 東京都 品川区 広町１丁目２番５８号 三共株式会社内 Tokyo (JP). 田中 直樹 (TANAKA,Naoki) [JP/JP]; 〒140-8710 東京都 品川区 広町１丁目２番５８号 三共株式会社内 Tokyo (JP). 島田 郁子 (SHIMADA,Ikuko) [JP/JP]; 〒140-8710 東京都 品川区 広町１丁目２番５８号 三共株式会社内 Tokyo (JP). 浅井 史敏 (ASAI,Fumitoshi) [JP/JP]; 〒140-8710 東京都 品川区 広町１丁目２番５８号 三共株式会社内 Tokyo (JP).

(74) 代理人: 大野 彰夫, 外(OHNO,Akio et al.); 〒140-8710 東京都 品川区 広町1丁目2番58号 三共株式会社内 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, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

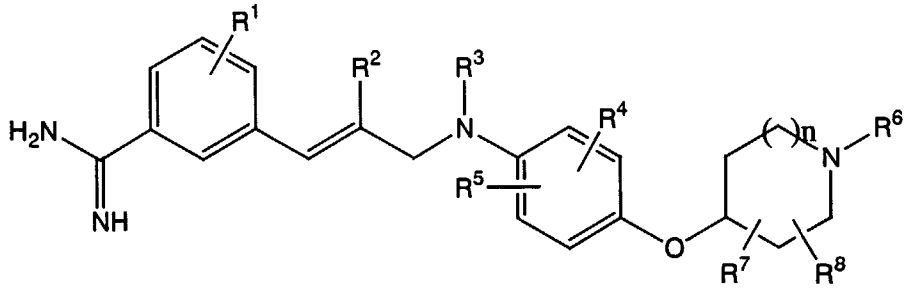
(84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許 (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, TR), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

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。

(54) Title: BENZAMIDINE DERIVATIVE

(54) 発明の名称: ベンズアミジン誘導体



(1)

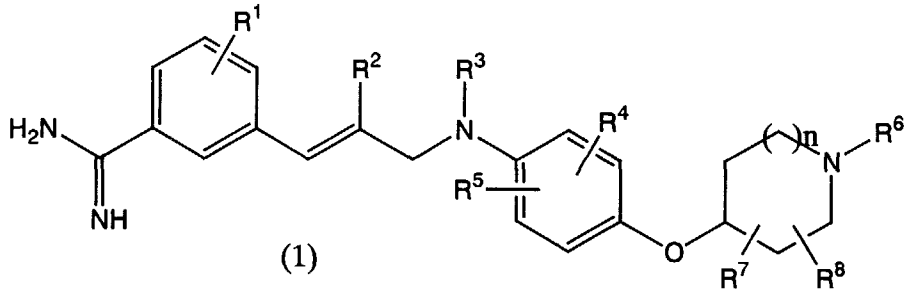
(57) Abstract: A benzamidine derivative having the general formula: (1) wherein R^1 represents a hydrogen atom, a halogen atom, an alkyl group or a hydroxyl group, R^2 represents a hydrogen atom or a halogen atom, R^3 represents a hydrogen atom, an alkyl group optionally substituted, an aralkyl group, an alkylcarbonyl group optionally substituted, an alkylsulfonyl group optionally substituted, or the like, R^4 and R^5 each represent a hydrogen atom, a halogen atom, an alkyl or carbamoyl group optionally substituted, or the like, R^6 represents a heteroring or the like, R^7 and R^8 each represent a hydrogen atom, an alkyl group, or the like, and n represents 0,1 or 2; or a salt thereof being pharmacologically acceptable. The benzamidine derivative and the salt have excellent inhibition action for activated blood coagulation factor X, and are useful as a medicine for therapy or prevention of a disease of blood coagulation.

[続葉有]

WO 02/081448 A1

(57) 要約:

一般式



(1)

［式中、R^1は、水素原子、ハロゲン原子、アルキル基又は水酸基を示し、R^2は、水素原子又はハロゲン原子を示し、R^3は、水素原子、置換可アルキル基、アラルキル基、置換可アルキルカルボニル基又は置換可アルキルスルホニル基等を示し、R^4及びR^5は、水素原子、ハロゲン原子、置換可アルキル基又はカルバモイル基等を示し、R^6は、ヘテロ環等を示し、R^7及びR^8は、水素原子、アルキル基等を示し、ｎは、０、１又は２を示す。］を有するベンズアミジン誘導体又はその薬理上許容される塩は、優れた活性化血液凝固第Ｘ因子阻害作用を有し、血液凝固性疾患の治療薬又は予防薬として有用である。