

【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25年4月18日(2013.4.18)

【公表番号】特表2012-521401(P2012-521401A)

【公表日】平成24年9月13日(2012.9.13)

【年通号数】公開・登録公報2012-037

【出願番号】特願2012-501401(P2012-501401)

【国際特許分類】

C 0 7 D 487/04	(2006.01)
A 6 1 K 31/519	(2006.01)
A 6 1 P 43/00	(2006.01)
A 6 1 P 29/00	(2006.01)
A 6 1 P 25/04	(2006.01)
A 6 1 P 25/02	(2006.01)
A 6 1 P 25/06	(2006.01)
A 6 1 P 19/02	(2006.01)
A 6 1 P 1/00	(2006.01)
A 6 1 P 25/28	(2006.01)
A 6 1 P 9/10	(2006.01)
A 6 1 P 25/00	(2006.01)
A 6 1 P 11/06	(2006.01)
A 6 1 P 11/14	(2006.01)
A 6 1 P 11/08	(2006.01)
A 6 1 P 1/06	(2006.01)
A 6 1 P 13/06	(2006.01)
A 6 1 P 7/12	(2006.01)
A 6 1 P 13/10	(2006.01)
A 6 1 P 21/00	(2006.01)
A 6 1 P 17/02	(2006.01)
A 6 1 P 17/06	(2006.01)
A 6 1 P 17/04	(2006.01)
A 6 1 P 1/04	(2006.01)
A 6 1 P 1/08	(2006.01)

【F I】

C 0 7 D 487/04	1 4 0
C 0 7 D 487/04	C S P
A 6 1 K 31/519	
C 0 7 D 487/04	1 4 3
A 6 1 P 43/00	1 1 1
A 6 1 P 29/00	
A 6 1 P 25/04	
A 6 1 P 25/02	1 0 1
A 6 1 P 25/06	
A 6 1 P 29/00	1 0 1
A 6 1 P 19/02	
A 6 1 P 1/00	
A 6 1 P 25/02	
A 6 1 P 25/28	
A 6 1 P 9/10	

A 6 1 P 25/00
A 6 1 P 11/06
A 6 1 P 11/14
A 6 1 P 11/08
A 6 1 P 1/06
A 6 1 P 13/06
A 6 1 P 7/12
A 6 1 P 13/10
A 6 1 P 21/00
A 6 1 P 17/02
A 6 1 P 17/06
A 6 1 P 17/04
A 6 1 P 1/04
A 6 1 P 1/08

【手続補正書】

【提出日】平成25年2月28日(2013.2.28)

【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

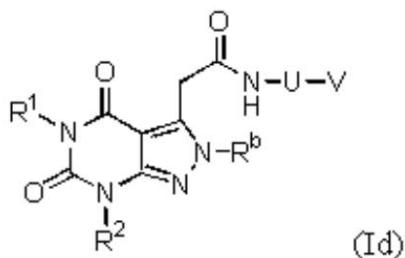
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I d) :

【化1】



で表される化合物

(式中、

R¹ 及び R² は、同一であっても異なっていてもよく、且つ独立して、水素、ヒドロキシル、置換又は非置換アルキル、ハロアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アリールアルキル、(CR^xR^y)_nOR^x、COR^x、COOR^x、CONR^xR^y、(CH₂)_nNR^xR^y、(CH₂)_nCHR^xR^y、(CH₂)_nNR^xR^y、及び(CH₂)_nNHCOR^xから選択され；

R^b は、水素、ヒドロキシル、シアノ、ハロゲン、置換又は非置換アルキル、ハロアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、-(CR^xR^y)_nOR^x、-COR^x、-COOR^x、-CONR^xR^y、-S(O)_mNR^xR^y、-NR^xR^y、-NR^x(CR^xR^y)_nOR^x、-(CH₂)_nNR^xR^y、-(CH₂)_nCHR^xR^y、-(CH₂)_nNR^xR^y、-NR^x(CR^xR^y)_nCONR^xR^y、-(CH₂)_nNHCOR^x、-(CH₂)_nNH(CH₂)_nSO₂R^x、及び(CH₂)_nNHSO₂R^xから選択され；

Uは、置換又は非置換アリール、チアゾール、イソチアゾール、オキサゾール、イソオキサゾール、チアジアゾール、オキサジアゾール、ピラゾール、イミダゾール、フラン、

チオフェン、ピロール、1,2,3-トリアゾール、1,2,4-トリアゾール、ピリミジン、ピリジン、ピリダジン、及びベンゾチアゾールからなる群より選択される置換又は非置換複素環から選択され；

Vは、水素、シアノ、ニトロ、-NR^xR^y、ハロゲン、ヒドロキシリ、置換又は非置換アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルケニル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、シクロアルキルアルコキシ、アリール、アリールアルキル、ビアリール、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、複素環、ヘテロシクリルアルキル、-C(=O)OR^x、-OR^x、-C(=O)NR^xR^y、-C(=O)R^x、及び-SO₂NR^xR^yから選択されるか；

或いは、U及びVは、O、S、及びNから選択される1以上のヘテロ原子を含んでいてもよく、置換されていてもよい3～7員飽和又は不飽和環を共に形成してもよく；

各出現時において、R^x及びR^yは、独立して、水素、ヒドロキシリ、ハロゲン、置換又は非置換アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルケニル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、複素環、及びヘテロシクリルアルキルからなる群より選択され；

各出現時において、「m」及び「n」は、独立して、0以上且つ2以下から選択される)。

【請求項2】

R¹、R²、及びR^bが、メチルである請求項1に記載の化合物。

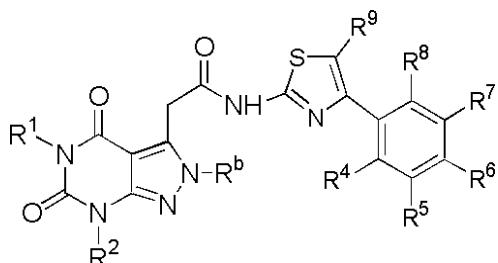
【請求項3】

Uがチアゾールであり、Vがフッ素、塩素、iso-ブチル、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、及びジフルオロメトキシから選択される1以上の置換基で置換されていてもよいフェニルである請求項1～2のいずれかに記載の化合物。

【請求項4】

次式：

【化2】



で表される化合物、又は薬学的に許容しうる塩

(式中、

R¹、R²、及びR^bは、同一であっても異なっていてもよく、且つ独立して水素又は(C₁-C₄)アルキルであり；

R⁴、R⁵、R⁶、R⁷、R⁸、及びR⁹は、同一であっても異なっていてもよく、且つ独立して水素、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシリ、ニトロ、アミノ、置換又は非置換アルキル、アルコキシ、ハロアルキル、及びハロアルコキシからなる群より選択される)。

【請求項5】

R¹、R²、及びR^bが、メチルである請求項4に記載の化合物。

【請求項6】

R⁴、R⁵、R⁶、R⁷、R⁸、及びR⁹が、同一であっても異なっていてもよく、且つ独立して、水素、フッ素、塩素、iso-ブチル、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、及びジフルオロメトキシから選択される請求項4～5のいずれかに記載の化合物。

【請求項7】

以下から選択される化合物：

N-[4-(2,4-ジフルオロフェニル)-1,3-チアゾール-2-イル]-2-

(1 , 3 - ジメチル - 2 , 4 - ジオキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - 5 H - ピロ口
[3 , 2 - d] ピリミジン - 5 - イル) アセトアミド ;

2 - (1 , 3 - ジメチル - 2 , 4 - ジオキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - 5 H -
ピロ口 [3 , 2 - d] ピリミジン - 5 - イル) - N - { 4 - [4 - フルオロ - 3 - (トリ
フルオロメチル) フェニル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } アセトアミド ;

2 - (1 , 3 - ジメチル - 2 , 4 - ジオキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - 5 H -
ピロ口 [3 , 2 - d] ピリミジン - 5 - イル) - N - { 4 - [3 - フルオロ - 4 - (トリ
フルオロメチル) フェニル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } アセトアミド ;

2 - (1 , 3 - ジメチル - 2 , 4 - ジオキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - 5 H -
ピロ口 [3 , 2 - d] ピリミジン - 5 - イル) - N - { 4 - [4 - クロ口 - 3 - (トリフ
ルオロメチル) フェニル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } アセトアミド ;

2 - (1 , 3 - ジメチル - 2 , 4 - ジオキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - 5 H -
ピロ口 [3 , 2 - d] ピリミジン - 5 - イル) - N - [4 - (2 , 3 , 4 - トリクロロフ
エニル) - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル] アセトアミド ;

2 - (1 , 3 - ジメチル - 2 , 4 - ジオキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - 5 H -
ピロ口 [3 , 2 - d] ピリミジン - 5 - イル) - N - { 4 - [4 - (2 , 2 - ジメチルブ
ロポキシ) - 3 , 5 - ジフルオロフェニル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } アセトア
ミド ;

N - { 4 - [3 , 5 - ジフルオロ - 4 - (3 - メチルブトキシ) フェニル] - 1 , 3 -
チアゾール - 2 - イル } - 2 - (1 , 3 - ジメチル - 2 , 4 - ジオキソ - 1 , 2 , 3 , 4
- テトラヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 2 - d] ピリミジン - 5 - イル) アセトアミド ;

N - { [4 - (2 , 2 - ジメチルブロポキシ) - 3 , 5 - ジフルオロフェニル] - 1 ,
3 - チアゾール - 2 - イル } - 2 - (1 , 3 - ジメチル - 2 , 4 - ジオキソ - 1 , 2 , 3
, 4 - テトラヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 2 - d] ピリミジン - 5 - イル) アセトアミド
 \vdots

2 - (1 , 3 - ジメチル - 2 , 4 - ジオキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - 5 H -
ピロ口 [3 , 2 - d] ピリミジン - 5 - イル) - N - { 4 - [2 , 4 - ジフルオロフェニ
ル - 3 - トリフルオロメチル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } アセトアミド ;

N - { 4 - [4 - (ジフルオロメトキシ) - 3 , 5 - ジフルオロフェニル] - 1 , 3 -
チアゾール - 2 - イル } - 2 - (1 , 3 - ジメチル - 2 , 4 - ジオキソ - 1 , 2 , 3 , 4
- テトラヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 2 - d] ピリミジン - 5 - イル) アセトアミド ;

N - { 4 - [3 , 5 - ジフルオロ - 4 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロエトキシ) フェニ
ル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } - 2 - (1 , 3 - ジメチル - 2 , 4 - ジオキソ -
1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 2 - d] ピリミジン - 5 - イル) ア
セトアミド ;

N - { 4 - [3 , 5 - ジフルオロ - 4 - (3 , 3 , 3 - トリフルオロプロポキシ) フェニ
ル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } - 2 - (1 , 3 - ジメチル - 2 , 4 - ジオキソ -
1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 2 - d] ピリミジン - 5 - イル) ア
セトアミド ;

N - { 4 - [3 , 5 - ジクロロ - 4 - (2 , 2 - ジメチルブロポキシ) フェニル] - 1
 $, 3 - \text{チアゾール - 2 - イル } } - 2 - (1 , 3 - \text{ジメチル - 2 , 4 - ジオキソ - }$
 $1 , 2 , 3 , 4 - \text{テトラヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 2 - d] ピリミジン - 5 - イル }) \text{ アセトアミド ;}$

N - { 4 - [3 , 5 - ジクロロ - 4 - (3 , 3 , 3 - トリフルオロブロポキシ) フェニ
ル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } - 2 - (1 , 3 - \text{ジメチル - 2 , 4 - ジオキソ - }
 $1 , 2 , 3 , 4 - \text{テトラヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 2 - d] ピリミジン - 5 - イル }) \text{ ア$
セトアミド ;

N - { 4 - [3 , 5 - ジクロロ - 4 - (3 , 3 , 4 , 4 , 4 - ペンタフルオロブトキシ
) フェニル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } - 2 - (1 , 3 - \text{ジメチル - 2 , 4 - ジ
オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - \text{テトラヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 2 - d] ピリミジン - 5 - }

イル) アセトアミド;

N - { 4 - [3 - クロロ - 5 - フルオロ - 4 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロエトキシ) フェニル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } - 2 - (1 , 3 - ジメチル - 2 , 4 - ジオキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - 5 H - ピロロ [3 , 2 - d] ピリミジン - 5 - イル) アセトアミド;

2 - (1 , 3 - ジメチル - 2 , 4 - ジオキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - 5 H - ピロロ [3 , 2 - d] ピリミジン - 5 - イル) - N - { 4 - [4 - (シクロプロピルメトキシ) - 3 , 5 - ジフルオロフェニル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } アセトアミド;

2 - (1 , 3 - ジメチル - 2 , 4 - ジオキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - 5 H - ピロロ [3 , 2 - d] ピリミジン - 5 - イル) - N - { 4 - [4 - (シクロブチルメトキシ) - 3 , 5 - ジフルオロフェニル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } アセトアミド;

2 - (1 , 3 - ジメチル - 2 , 4 - ジオキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - 5 H - ピロロ [3 , 2 - d] ピリミジン - 5 - イル) - N - { 4 - [4 - (シクロブチルメトキシ) - 3 , 5 - ジクロロフェニル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } アセトアミド;

2 - (1 , 3 - ジメチル - 2 , 4 - ジオキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - 5 H - ピロロ [3 , 2 - d] ピリミジン - 5 - イル) - N - { 4 - [3 , 5 - ジフルオロ - 4 - [2 - (トリフルオロメチル) ベンジルオキシ] フェニル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } アセトアミド;

2 - (1 , 3 - ジメチル - 2 , 4 - ジオキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - 5 H - ピロロ [3 , 2 - d] ピリミジン - 5 - イル) - N - { 4 - [3 , 5 - ジフルオロ - 4 - [4 - (トリフルオロメチル) ベンジルオキシ] フェニル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } アセトアミド;

N - [4 - (3 - フルオロ - 4 - トリフルオロメチルフェニル) - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル] - 2 - (1 , 3 , 6 - トリメチル - 2 , 4 - ジオキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - 5 H - ピロロ [3 , 2 - d] ピリミジン - 5 - イル) アセトアミド;

N - { 4 - [3 - プロモ - 4 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロエトキシ) フェニル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } - 2 - (1 , 3 - ジメチル - 2 , 4 - ジオキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - 5 H - ピロロ [3 , 2 - d] ピリミジン - 5 - イル) アセトアミド;

N 1 - { 4 - [3 , 5 - ジフルオロ - 4 - (2 , 2 - ジメチルプロポキシ) フェニル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } - 2 - (1 , 3 , 6 - トリメチル - 2 , 4 - ジオキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - 5 H - ピロロ [3 , 2 - d] ピリミジン - 5 - イル) アセトアミド;

N - { 4 - [2 , 4 - ジフルオロ - 3 - トリフルオロメチル) フェニル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } - 2 - (1 , 3 , 6 - トリメチル - 2 , 4 - ジオキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - 5 H - ピロロ [3 , 2 - d] ピリミジン - 5 - イル) アセトアミド;

N - [4 - (3 , 5 - ジフルオロ - 4 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロエトキシ) フェニル) - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル] - 2 - (1 , 3 , 6 - トリメチル - 2 , 4 - ジオキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - 5 H - ピロロ [3 , 2 - d] ピリミジン - 5 - イル) アセトアミド;

N - [4 - (4 - シクロブチルメトキシ - 3 , 5 - ジフルオロフェニル) - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル] - 2 - (1 , 3 , 6 - トリメチル - 2 , 4 - ジオキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - 5 H - ピロロ [3 , 2 - d] ピリミジン - 5 - イル) アセトアミド;

N - { 4 - [3 - クロロ - 4 - (2 , 2 - ジメチルプロポキシ) - 5 - フルオロフェニル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル] } - 2 - (1 , 3 , 6 - トリメチル - 2 , 4 - ジオキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - 5 H - ピロロ [3 , 2 - d] ピリミジン - 5 - イル) アセトアミド;

N - { 4 - [3 , 5 - ジクロロ - 4 - (2 , 2 - ジメチルプロポキシ) フェニル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } - 2 - (1 , 3 , 6 - トリメチル - 2 , 4 - ジオキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - 5 H - ピロロ [3 , 2 - d] ピリミジン - 5 - イル) アセトアミド ;

N - { 4 - [3 - クロロ - 5 - フルオロ - 4 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロエトキシ) フェニル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } - 2 - (1 , 3 , 6 - トリメチル - 2 , 4 - ジオキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - 5 H - ピロロ [3 , 2 - d] ピリミジン - 5 - イル) アセトアミド ;

N - { 4 - [4 - (2 , 2 - ジメチルプロポキシ) - 3 - フルオロフェニル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } - 2 - (1 , 3 , 6 - トリメチル - 2 , 4 - ジオキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - 5 H - ピロロ [3 , 2 - d] ピリミジン - 5 - イル) アセトアミド ;

N - { 4 - [3 - クロロ - 4 - (2 , 2 - ジメチルプロポキシ) フェニル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } - 2 - (1 , 3 , 6 - トリメチル - 2 , 4 - ジオキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - 5 H - ピロロ [3 , 2 - d] ピリミジン - 5 - イル) アセトアミド ;

N - [5 - (4 - ブロモフェニル) イソオキサゾール - 3 - イル] - 2 - (1 , 3 , 6 - トリメチル - 2 , 4 - ジオキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - 5 H - ピロロ [3 , 2 - d] ピリミジン - 5 - イル) アセトアミド ;

N - { 4 - [3 , 5 - ジフルオロ - 4 - (2 , 2 - ジメチルプロポキシ) フェニル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } - 2 - (1 , 3 , 7 - トリメチル - 2 , 4 - ジオキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - 5 H - ピロロ [3 , 2 - d] ピリミジン - 5 - イル) アセトアミド ;

2 - (7 - ブロモ - 1 , 3 - ジメチル - 2 , 4 - ジオキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - 5 H - ピロロ [3 , 2 - d] ピリミジン - 5 - イル) - N - { 4 - [3 , 5 - ジフルオロ - 4 - (2 , 2 - ジメチルプロポキシ) フェニル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } アセトアミド ;

2 - (7 - ブロモ - 1 , 3 - ジメチル - 2 , 4 - ジオキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - 5 H - ピロロ [3 , 2 - d] ピリミジン - 5 - イル) - N - { 4 - [3 - フルオロ - 4 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } アセトアミド ;

N - { 4 - [3 - フルオロ - 4 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } - 2 - { 7 - [(ジメチルアミノ) メチル] - 1 , 3 - ジメチル - 2 , 4 - ジオキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - 5 H - ピロロ [3 , 2 - d] ピリミジン - 5 - イル } アセトアミド ;

N - { 4 - [3 , 5 - ジフルオロ - 4 - (2 , 2 - ジメチルプロポキシ) フェニル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } - 2 - { 7 - [(ジメチルアミノ) メチル] - 1 , 3 - ジメチル - 2 , 4 - ジオキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - 5 H - ピロロ [3 , 2 - d] ピリミジン - 5 - イル } アセトアミド ;

N - { 4 - [3 - フルオロ - 4 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } - 2 - { 7 - [(ジエチルアミノ) メチル] - 1 , 3 - ジメチル - 2 , 4 - ジオキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - 5 H - ピロロ [3 , 2 - d] ピリミジン - 5 - イル } アセトアミド ;

N - { 4 - [3 - フルオロ - 4 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } - 2 - (1 , 3 , 7 - トリメチル - 2 , 4 - ジオキソ - 2 , 3 , 4 , 7 - テトラヒドロ - 1 H - ピロロ [2 , 3 - d] ピリミジン - 5 - イル) アセトアミド ;

N - [4 - (3 , 5 - ジフルオロ - 4 - (2 , 2 - ジメチルプロポキシ) フェニル) -

1 , 3 - チアゾール - 2 - イル] - 2 - (1 , 3 , 7 - トリメチル - 2 , 4 - ジオキソ -
2 , 3 , 4 , 7 - テトラヒドロ - 1 H - ピロロ [2 , 3 - d] ピリミジン - 5 - イル) ア
セトアミド ;

N - { 4 - [2 , 4 - ジフルオロ - 3 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } - 2 - (1 , 3 , 7 - トリメチル - 2 , 4 - ジオキソ - 2 , 3 , 4 , 7 - テトラヒドロ - 1 H - ピロロ [2 , 3 - d] ピリミジン - 5 - イル) アセトアミド :

N - { 4 - [3 , 5 - ジフルオロ - 4 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロエトキシ) フェニル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } - 2 - (1 , 3 , 7 - トリメチル - 2 , 4 - ジオキソ - 2 , 3 , 4 , 7 - テトラヒドロ - 1 H - ピロロ [2 , 3 - d] ピリミジン - 5 - イル) アセトアミド ;

N - [4 - (4 - クロロフェニル) - 1 , 3 - チアゾール - 2 -イル] - 2 - (4 , 6 -ジメチル - 5 , 7 - ジオキソ - 4 , 5 , 6 , 7 - テトラヒドロ - 1H - ピラゾロ [4 , 3 - d] ピリミジン - 1 -イル) アセトアミド ;

2 - (4 , 6 - ジメチル - 5 , 7 - ジオキソ - 4 , 5 , 6 , 7 - テトラヒドロ - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - d] ピリミジン - 1 -イル) - N - { 4 - [3 - フルオロ - 4 - (ト リフルオロメチル) フェニル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 -イル } アセトアミド ;

N - { 4 - [4 - (2 , 2 - ジメチルプロポキシ) - 3 - フルオロフェニル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } - 2 - (4 , 6 - ジメチル - 5 , 7 - ジオキソ - 4 , 5 , 6 , 7 - テトラヒドロ - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - d] ピリミジン - 1 - イル) アセトアミド
:

N - { 4 - [3 - クロロ - 4 - (2 , 2 - ジメチルプロポキシ) フェニル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } - 2 - (4 , 6 - ジメチル - 5 , 7 - ジオキソ - 4 , 5 , 6 , 7 - テトラヒドロ - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - d] ピリミジン - 1 - イル) アセトアミド :

N - { 4 - [2 , 4 - ジフルオロ - 3 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } - 2 - (4 , 6 - ジメチル - 5 , 7 - ジオキソ - 4 , 5 , 6 , 7 - テトラヒドロ - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - d] ピリミジン - 1 - イル) アセトアミド ;

N - { 4 - [4 - (ジフルオロメトキシ) - 3 , 5 - ジフルオロフェニル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } - 2 - (4 , 6 - ジメチル - 5 , 7 - ジオキソ - 4 , 5 , 6 , 7 - テトラヒドロ - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - d] ピリミジン - 1 - イル) アセトアミド ;

N - { 4 - [3 , 5 - ジフルオロ - 4 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロエトキシ) フェニル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } - 2 - (4 , 6 - ジメチル - 5 , 7 - ジオキソ - 4 , 5 , 6 , 7 - テトラヒドロ - 1H - ピラゾロ [4 , 3 - d] ピリミジン - 1 - イル) アセトアニド :

N - [4 - (3 , 5 - ジフルオロ - 4 - イソブトキシフェニル) - 1 , 3 - チアゾール
- 2 - イル] - 2 - (4 , 6 - ジメチル - 5 , 7 - ジオキソ - 4 , 5 , 6 , 7 - テトラヒ

ドロ - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - d] ピリミジン - 1 -イル) アセトアミド ;
 N - [4 - (3 , 5 - ジクロロ - 4 - イソブトキシフェニル) - 1 , 3 - チアゾール -
 2 - イル] - 2 - (4 , 6 - ジメチル - 5 , 7 - ジオキソ - 4 , 5 , 6 , 7 - テトラヒド
 ロ - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - d] ピリミジン - 1 -イル) アセトアミド ;

N - { 4 - [3 , 5 - ジフルオロ - 4 - (3 - メチルブトキシ) フェニル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } - 2 - (4 , 6 - ジメチル - 5 , 7 - ジオキソ - 4 , 5 , 6 , 7 - テトラヒドロ - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - d] ピリミジン - 1 - イル) アセトアミド ;

N - { 4 - [3 , 5 - ジクロロ - 4 - イソブトキシフェニル] - 1 , 3 - チアゾール -
 2 - イル } - 2 - (4 , 6 - ジメチル - 5 , 7 - ジオキソ - 4 , 5 , 6 , 7 - テトラヒド
 ロ - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - d] ピリミジン - 1 - イル) アセトアミド ;

1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } - 2 - (4 , 6 - ジメチル - 5 , 7 - ジオキソ - 4 , 5 , 6 , 7 - テトラヒドロ - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - d] ピリミジン - 1 - イル) アセトアミド ;

N - { 4 - [3 , 5 - ジクロロ - 4 - (2 , 2 - ジメチルプロポキシ) フェニル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } - 2 - (4 , 6 - ジメチル - 5 , 7 - ジオキソ - 4 , 5 , 6 , 7 - テトラヒドロ - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - d] ピリミジン - 1 - イル) アセトアミド ;

N - { 4 - [3 - クロロ - 4 - (2 , 2 - ジメチルプロポキシ) - 5 - フルオロフェニル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } - 2 - (4 , 6 - ジメチル - 5 , 7 - ジオキソ - 4 , 5 , 6 , 7 - テトラヒドロ - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - d] ピリミジン - 1 - イル) アセトアミド ;

N - { 4 - [4 - (シクロブチルメトキシ) - 3 , 5 - ジフルオロフェニル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } - 2 - (4 , 6 - ジメチル - 5 , 7 - ジオキソ - 4 , 5 , 6 , 7 - テトラヒドロ - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - d] ピリミジン - 1 - イル) アセトアミド ;

N - [4 - (3 , 5 - ジフルオロ - 4 - (2 , 2 - ジメチルプロポキシ) フェニル) - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル] - 2 - (3 , 4 , 6 - トリメチル - 5 , 7 - ジオキソ - 3 a , 4 , 5 , 6 , 7 , 7 a - ヘキサヒドロ - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - d] ピリミジン - 1 - イル) アセトアミド ;

N - [4 - (3 , 5 - ジクロロ - 4 - (2 , 2 - ジメチルプロポキシ) フェニル) - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル] - 2 - (3 , 4 , 6 - トリメチル - 5 , 7 - ジオキソ - 3 a , 4 , 5 , 6 , 7 , 7 a - ヘキサヒドロ - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - d] ピリミジン - 1 - イル) アセトアミド ; 及び

N - [5 - (4 - プロモフェニル) イソオキサゾール - 3 - イル] - 2 - (4 , 6 - ジメチル - 5 , 7 - ジオキソ - 3 a , 4 , 5 , 6 , 7 , 7 a - ヘキサヒドロ - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - d] ピリミジン - 1 - イル) アセトアミド ;

又はその薬学的に許容しうる塩。

【請求項 8】

以下から選択される化合物 :

N - [4 - (4 - イソブチルフェニル) - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル] - 2 - (2 , 5 , 7 - トリメチル - 4 , 6 - ジオキソ - 4 , 5 , 6 , 7 - テトラヒドロ - 2 H - ピラゾロ [3 , 4 - d] ピリミジン - 3 - イル) アセトアミド ;

N - [4 - (4 - クロロフェニル) - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル] - 2 - (2 , 5 , 7 - トリメチル - 4 , 6 - ジオキソ - 4 , 5 , 6 , 7 - テトラヒドロ - 2 H - ピラゾロ [3 , 4 - d] ピリミジン - 3 - イル) アセトアミド ;

N - { 4 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } - 2 - (2 , 5 , 7 - トリメチル - 4 , 6 - ジオキソ - 4 , 5 , 6 , 7 - テトラヒドロ - 2 H - ピラゾロ [3 , 4 - d] ピリミジン - 3 - イル) アセトアミド ;

N - { 4 - [3 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } - 2 - (2 , 5 , 7 - トリメチル - 4 , 6 - ジオキソ - 4 , 5 , 6 , 7 - テトラヒドロ - 2 H - ピラゾロ [3 , 4 - d] ピリミジン - 3 - イル) アセトアミド ;

N - { 4 - [3 - (トリフルオロメトキシ) フェニル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } - 2 - (2 , 5 , 7 - トリメチル - 4 , 6 - ジオキソ - 4 , 5 , 6 , 7 - テトラヒドロ - 2 H - ピラゾロ [3 , 4 - d] ピリミジン - 3 - イル) アセトアミド ;

N - [4 - (2 , 4 - ジフルオロフェニル) - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル] - 2 - (2 , 5 , 7 - トリメチル - 4 , 6 - ジオキソ - 4 , 5 , 6 , 7 - テトラヒドロ - 2 H - ピラゾロ [3 , 4 - d] ピリミジン - 3 - イル) アセトアミド ;

N - [4 - (3 , 4 - ジフルオロフェニル) - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル] - 2 - (2 , 5 , 7 - トリメチル - 4 , 6 - ジオキソ - 4 , 5 , 6 , 7 - テトラヒドロ - 2 H - ピラゾロ [3 , 4 - d] ピリミジン - 3 - イル) アセトアミド ;

N - [4 - (3 , 5 - ジフルオロフェニル) - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル] - 2 - (2 , 5 , 7 - トリメチル - 4 , 6 - ジオキソ - 4 , 5 , 6 , 7 - テトラヒドロ - 2 H - ピラゾロ [3 , 4 - d] ピリミジン - 3 - イル) アセトアミド ;

又はその薬学的に許容しうる塩。

【請求項 9】

次式：

【化 3】



で表される化合物、又はその薬学的に許容しうる塩。

【請求項 10】

請求項 1～9 のいずれかに記載の化合物から選択される 1 以上の化合物と、1 以上の薬学的に許容しうる賦形剤、担体、希釈剤、又はこれらの混合物とを含む医薬組成物。

【請求項 11】

対象における T R P A 1 機能に関連する疾患又は症状の予防又は治療に使用するための組成物であって、請求項 1～9 のいずれかに記載の化合物を含む組成物。

【請求項 12】

疼痛、慢性疼痛、複合性局所疼痛症候群、神経因性疼痛、術後痛、関節リウマチ痛、変形性関節症痛、背痛、内臓痛、癌痛、痛覚過敏、神経痛、偏頭痛、ニューロパシー、糖尿病性ニューロパシー、坐骨神経痛、H I V 関連ニューロパシー、ヘルペス後神経痛、線維筋痛症、神経損傷、虚血、神経変性、脳卒中、脳卒中後痛、多発性硬化症、呼吸器疾患、喘息、咳、C O P D、炎症性障害、食道炎、胃食道逆流性疾患 (G E R D)、過敏性腸症候群、炎症性腸疾患、骨盤過敏症、尿失禁、膀胱炎、火傷、乾癬、湿疹、嘔吐、胃十二指腸潰瘍、及び搔痒から選択される T R P A 1 機能に関連する疾患又は症状の症候の予防又は治療に使用するための請求項 11 に記載の組成物。

【請求項 13】

慢性疼痛、神経因性疼痛、関節リウマチ痛、変形性関節症痛、C O P D、咳、又は喘息に関連する疾患又は症状の症候の予防又は治療に使用するための請求項 11 に記載の組成物。