(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 공개특허공보(A)

(51) Int. Cl.[6]
A61K 31/505

(11) 공개번호 특1996-0033454
(43) 공개일자 1996년10월22일

(21) 출원번호 특1996-0005381
(22) 출원일자 1996년02월29일

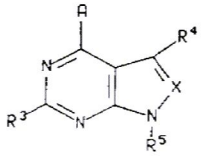
(30) 우선권주장 8/397,527 1995년03월02일 미국(US)
(71) 출원인 화이자 인코포레이티드 알렌 제이. 스피겔
미합중국 뉴욕 10017 뉴욕 이스트 42번 스트리트 235
(72) 발명자 유핑 엘. 첸
미합중국 코넥티컷 06385 워터포드 워터뷰 드라이브 8
(74) 대리인 김창세, 김영, 장성구

심사청구 : 있음

(54) 신경원성 질병 및 다른 질병의 치료를 위한 피라졸로 피리미딘 및 피롤로 피리미딘

요약

본 발명은 특정의 신경원성 질병성 및 다른 질병의 치료, 예방 또는 억제를 위한, 하기 일반식(I)의 피라졸로피리미딘 및 피롤로피리미딘, 및 상기 화합물의 약학적으로 허용가능한 염의 용도에 관한 것이다:



(I)

상기 식에서, A, X, R^3, R^4 및 R^5는 특허청구범위 제1항에 정의된 바와 같다.

명세서

[발명의 명칭]

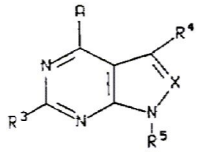
신경원성 질병 및 다른 질병의 치료를 위한 피라졸로피리미딘 및 피롤로피리미딘

본 내용은 요부공개 건이므로 전문 내용을 수록하지 않았음.

(57) 청구의 범위

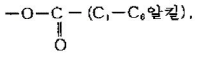
청구항 1

포유동물의 두부 외상, 척수 외상, 허혈성 신경원 손상, 독성자극성 신경원 손상, 간질, 발작, 스트레스성 면역 기능부진, 포비아, 근육 경련, 파킨슨 병, 헌팅톤 병, 요실금, 알츠하이머 형의 노인성 치매, 다중경색성 치매, 근육위축성 측상경화증, 약물 의존성 및 탐닉 및 저혈당증증에서 선택된 질병을 치료 또는 예방하기에 효과적인 양의 하기 일반식(I)의 화합물 또는 그의 약학적으로 허용가능한 염을 약학적으로 허용가능한 담체와 함께 포함되는, 상기 질환을 치료, 예방 또는 억제하기 위한 약학 조성물.

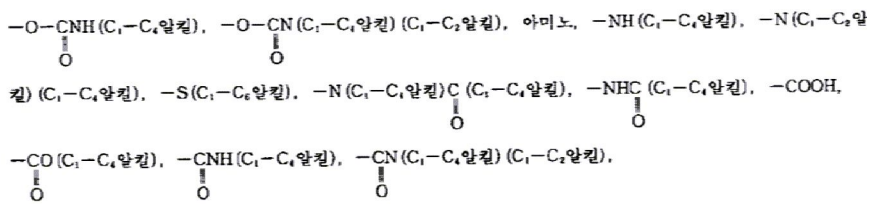


(I)

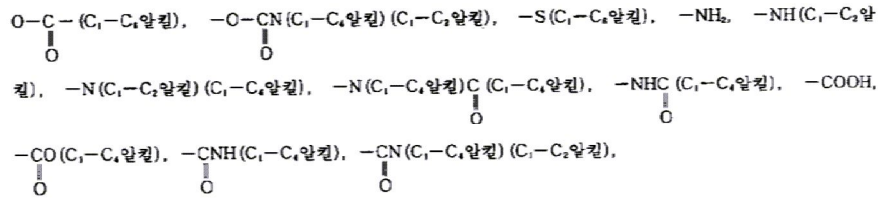
상기 식에서, X는 질소 또는 $-CR^6$이고, A는 $-NR^1R^2$, $-CR^1R^2R^{11}$, $-C(=CR^2R^{12})R^1$, $-NHCR^1R^2R^{11}$, $-OCR^1R^2R^{11}$, $-SCR^1R^2R^{11}$, $-NHNR^1R^2$, $-CR^2R^{11}NHR^1$, $-CR^2R^{11}OR^1$ 또는 $-C(O)R^2$이고, R^1은 수소, 또는 하이드록시, 플루오로, 클

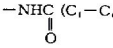
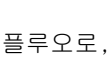


로로, 브로모, 요오드, C_1-C_8알콕시,



-SH, -CN, $-NO_2$, -SO(C_1-C_4알킬), $-SO_2$(C_1-C_4알킬), $-SO_2NH$(C_1-C_4알킬), $-SO_2N$(C_1-C_4알킬)(C_1-C_2알킬)로 이루어진 군에서 독립적으로 선택된 하나 또는 두개의 치환체로 선택적으로 치환될 수 있는 C_1-C_6알킬이고, 이때, 전술된 C_1-C_6알킬 잔기는 하나 또는 2개의 이중 또는 삼중 결합을 함유할 수 있고; R^2는 C_1-C_{12}알킬; 아릴 또는 -(C_1-C_{10}알킬렌)아릴(이때, 상기 아릴은 페닐, 나프틸, 티에닐, 벤조티에닐, 피리딜, 퀴놀릴, 피라지닐, 피리미딜, 아미다졸릴, 푸라닐, 벤조푸라닐, 벤조티아졸릴, 이소티아졸릴, 벤즈이소티아졸릴, 티아졸릴, 이속사졸릴, 벤즈이속사졸릴, 벤즈이미다졸릴, 트리아졸릴, 피라졸릴, 피롤릴, 인돌릴, 피롤로피리딜, 옥사졸릴 또는 벤족사졸릴임); 3 내지 8-원 사이클로알킬 또는 -(C_1-C_6알킬렌)사이클로알킬(이때, 상기 사이클로알킬 잔기의 임의의 하나 또는 두개의 탄소원자가 독립적으로 O, S 또는 N-Z(여기에서, Z는 수소, C_1-C_4알킬 또는 C_1-C_4알카노일임)에 의해 선택적으로 치환될 수 있음)이고, 상기 R^2는 클로로, 플루오로 및 C_1-C_4알킬 중에서 독립적으로 선택된 하나 내지 세개의 치환체에 의해, 또는 하이드록시, 브로모, 요오드, C_1-C_6알콕시,

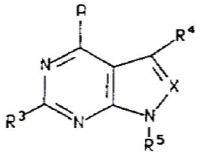


-SH, -CN, $-NO_2$, -SO(C_1-C_4알킬), $-SO_2$(C_1-C_4알킬), $-SO_2NH$(C_1-C_4알킬), $-SO_2N$(C_1-C_4알킬)(C_1-C_2알킬)중에서 선택된 하나의 치환체에 의해 선택적으로 치환될 수 있고, 이때 전술된 C_1-C_{12}알킬 및 C_1-C_{10}알킬렌 잔기는 선택적으로 하나 내지 세개의 이중 또는 삼중 결합을 함유할 수 있거나; 또는 R^1 및 R^2는 이들이 붙어 있는 원자와 함께 포화 3 내지 8-원 고리를 형성할 수 있고, 이때, 5 내지 8-원 고리의 경우 선택적으로 하나 또는 두개의 이중 결합을 함유할 수 있으며, 상기 5 내지 8-원 고리의 하나 또는 두 개의 탄소원자는 독립적으로 O, S 또는 N-Z(여기에서, Z는 수소, C_1-C_4알킬, C_1-C_4알카노일 또는 벤질임)에 의해 선택적으로 치환될 수 있고; R^3는 수소, C_1-C_6알킬, 플루오로, 클로로, 브로모, 요오드, 하이드록시, 아미노, -O(C_1-C_6알킬), -NH(C_1-C_6알킬), -N(C_1-C_4알킬)(C_1-C_2알킬), -SH, -S(C_1-C_4알킬), -SO(C_1-C_4알킬) 또는 $-SO_2$(C_1-C_4알킬)이고, 이때, 전술한 C_1-C_4알킬 및 C_1-C_b알킬 잔기 각각은 하나의 이중 또는 삼중 결합을 함유할 수 있고, 하이드록시, C_1-C_3알콕시, 플루오로, 클로로 및 C_1-C_3티오알킬로 이루어진 군에서 독립적으로 선택한 하나 내지 세개의 치환체로 선택적으로 치환될 수 있고; R^4는 수소, C_1-C_6알킬, 플루오로, 클로로, 브로모, 요오드, C_1-C_6알콕시, 포밀, -NH(C_1-C_6알킬), -N(C_1-C_6알킬)(C_1-C_2알킬), $-SO_n$(C_1-C_6알킬)(여기에서, n은 0,1, 또는 2임), 시아노, 하이드록시, 카복시 또는 아미도이고, 이때, 전술한 C_1-C_6알킬 잔기 각각 하이드록시, 트리플루오로메틸, 아미노, 카복시, 아미도,  -NH(C_1-C_4알킬), -N(C_1-C_4알킬)(C_1-C_2알킬),  C_1-C_3알콕시, C_1-C_3티오알킬, 플루오로, 브로모, 클로로, 요오도, 시아노 및 니트로에서 선택한 하나의 치환체로 선택적으로 치환될 수 있고; R^5는 페닐, 나프닐, 티에닐, 벤조티에닐, 피리딜, 퀴놀릴, 피라지닐, 피리미딜, 이미다졸릴, 푸라닐, 벤조푸라닐, 벤조티아졸릴, 이소티아졸릴, 벤조이소티아졸릴, 티아졸릴, 이속사졸릴, 벤즈이속사졸릴, 벤즈이미다졸릴, 트리아졸릴, 피라졸릴, 피롤릴, 인돌릴, 피롤로피리딜, 벤즈옥사졸릴, 옥사졸릴, 피롤리디닐, 티아졸릴디닐, 모르폴리닐, 피페리디닐, 피페라지닐, 테트라졸릴 또는 3 내지 8-원 사이클로알킬 또는 9내지 12-원 비사이클로알킬 고리이고, 이때, 상기 고리의 하나 또는 두개의 탄소원자가 독립적으로 O, S 또는 N-Z(여기에서, Z는 수소, C_1-C_4알킬 또는 C_1-C_4알카노일, 페닐 또는 벤질이다)에 의해 선택적으로 치환될 수 있고, 상기 R^5기 각각은 플루오로, 클로로, 브로모, 포밀, C_1-C_6알킬, C_1-C_6알콕시 및 트리플루오로메틸중에서 독립적으로 선택된 하나 이상의 치환체, 바람직하게는 두개 또는 세개의 치환체에 의해, 또는 하이드록시, 요오도, 시아노, 니트로, 아미노, -NH(C_1-C_4알킬), -N(C_1-C_4알킬)(C_1-C_2알킬), -COO(C_1-C_4알킬), -CO(C_1-C_4알킬), $-SO_2NH$(C_1-C_4알킬), $-SO_2N$(C_1-C_4알킬)(C_1-C_2알킬), $-SO_2NH_2$, $-NHSO_2$(C_1-C_4알킬), -S(C_1-C_6알킬), $-SO_2$(C_1-C_6알킬)중에서 선택된 하나의 치환체에 의해 선택적으로 치환될 수 있고, 전술한 상기 C_1-C_4알킬 및 C_1-C_6알킬 잔기는 각각 플루오로, 클로로, 하이드록시, C_1-C_4알콕시, 아미노, 메틸아미노, 디메틸아미

노 및 아세틸중에서 독립적으로 선택된 하나 또는 두개의 치환체로 선택적으로 치환될 수 있고, 전술한 상기 C_1-C_4알킬 및 C_1-C_6알킬 잔기는 각각 하나의 이중 또는 삼중 결합을 선택적으로 함유할 수 있고, 단 R^5는 치환되지 않은 페닐이 아니며; R^6는 수소, C_1-C_6알킬, 플루오로, 클로로, 브로모, 요오도, C_1-C_6알콕시, 포밀, 아미노, -NH(C_1-C_6알킬), -N(C_1-C_6알킬)(C_1-C_2알킬), -SO_n(C_1-C_6알킬)(여기에서, n은 0, 1, 또는 2이다), 시아노, 카복시 또는 아미도이고, 이때, 전술한 (C_1-C_6)알킬 잔기 각각 하이드록시, 트리플루오로메틸, 아미노, 카복시, 아미도, $-NHC(=O)(C_1-C_4\text{알킬})$, -NH($C_1$-$C_4$알킬), -N($C_1$-$C_4$알킬)($C_1$-$C_2$알킬), $-CO(=O)(C_1-C_4\text{알킬})$, C_1-C_3알콕시, C_1-C_3티오알킬, 플루오로, 브로모, 클로로, 요오도, 시아노 및 니트로 중에서 선택한 하나의 치환체로 선택적으로 치환될 수 있고; R^{11}은 수소, 하이드록시, 플루오로, 클로로, -COO(C_1-C_2알킬), 시아노 또는 -CO(C_1-C_2알킬)이고; R^{12}은 수소 또는 C_1-C_4알킬이고; 단, (1) X가 -CR^6이면 A는 직쇄 알킬이 아니고, (2) X가 -CR^6이고 R^5가 치환되지 않은 사이클로알킬이고 R^3 및 R^4가 둘다 수소이고, R^6이 수소 또는 메틸이면, A는 R^2가 벤질 또는 티에닐메틸인 -NHR^2가 아니고, (3) X가 -CR^6이고 R^5가 p-브로모페닐이고, R^3, R^4 및 R^6이 메틸이면, A는 메틸아미노 또는 하이드록시에틸아미노가 아니며; 또한 X가 질소이면: (a) A는 직쇄 C_1-C_{12}알킬이 아니고; (b) R^5는 당그룹이 아니고; (c) R^3 및 R^4가 수소이고 R^5가 클로로페닐일때, A는 -NH-$CH(CH_3)$-$(CH_2)_3$-$N(C_2H_5)_2$가 아니고; (d) R^3 및 R^4가 수소이고, A가 -NR^1R^2[이때, R^1은 C_3-C_7사이클로알킬이고, R^2은 C_2-C_6알케닐, 페닐-(C_1-C_6알킬렌)(이때, 상기 페닐은 플루오로, 클로로, 브로모 또는 요오드로 치환될 수 있다), 또는 헤테로 라디칼이 푸릴, 티에닐 또는 피리디닐인 헤테로-(C_1-C_6알킬렌)임]일때, R_5는 테트라하이드로푸라닐 또는 테트라하이드로피라닐이 아니고; (e) R^3가 메톡시, 메틸티오 또는 메틸설포닐이고 R^4가 수소이고, R^5가 테트라하이드로푸라닐 또는 테트라하이드로피라닐일 때, A는 -NH(C_1-C_2알킬), 모르폴리닐, 하이드라지노, 또는 페닐이 하나의 메틸 또는 두개의 메톡시기로 치환될 수 있는 $-NHC_2H_4C_6H_5$ 가 아니고; (f) R^3가 수소, C_1-C_6알킬, 클로로, 브로모, -SH 또는 -S(C_1-C_4알킬)이고, R^4가 수소이고 R^5가 C_3-C_8사이클로알킬일때, A는 하이드라지노, -NH(C_1-C_2알킬) 또는 -N(C_1-C_6알킬)(C_1-C_{12}알킬)이 아니고; (g) R^3 및 R^4가 수소이고 A가 -$NH(CH_2)_mCOOH$(이때, m은 1 내지 12임)일 때, R_5는 하나의 플루오로, 클로로, 브로모 도는 요오드기로 치환된 페닐이 아니고; (h) R^3가 수소, 하이드록시, 메틸티오, 클로로 또는 -NH벤질이고, R^4가 수소이고, R^5가 클로로페닐 또는 브로모페닐일때, A는 -NH(C_1-C_{12}알킬), -NH알릴 또는 -N(C_1-C_6알킬)(C_1-C_{12}알킬)(이 때, 상기 C_1-C_{12}알킬은, $-NC_2H_5$에 의해, 또는 하나 또는 두개의 브로모, 클로로, 플루오로, $-NC_2H_5$페닐 또는 모르폴리노프로필기에 의해 치환될 수 있는 -NH벤질에 의해 치환될 수 있음)이 아니고; (i) R^3 및 R^4가 수소이고 R^5가 니트로페닐일 때, A는 R^2가 하나 또는 두개의 하이드록시기에 의해 치환될 수 있는 페닐, 벤질 또는 $-C_1$-C_{12}알킬인 -NHR^2가 아니고; (j) R^3가 클로로 또는 -O(C_1-C_6알킬)이고 R^4가 수소이고 A가 R^1 및 R^2가 독립적으로 수소 또는 C_1-C_6알킬인 -NR^1R^2일 때, R^5는 클로로페닐이 아니고; (k) R^3가 수소이고, A가 벤질 또는 펜에틸이고 R^4가 플루오로, 클로로, 브로모 또는 요오드일때, R^5는 5'-데옥시-리보푸라노실 또는 5'-아미노-5'-데옥시-리보푸라노실이 아니다.

청구항 2

부신피질 호르몬 유리인자(CRF) 수용체를 길항하는 양의 하기 일반식(I)의 화합물 또는 그의 약학적으로 허용가능한 염을 약학적으로 허용가능한 담체와 함께 포함하는, 포유동물에서의 두부 외상, 척수 외상, 허혈성 신경원 손상, 독성자극성 신경원 손상, 간질, 발작, 스트레스성 면역 기능부진, 포비아, 근육 경련, 파킨슨 병, 헌팅톤 병, 요실금, 알츠하이머 형의 노인성 치매, 다중경색성 치매, 근육위축성 측상경화증, 약물 의존성 및 탐닉, 및 저혈당증중에서 선택된 질병을 치료예방 또는 억제하기 위한 약학 조성물:

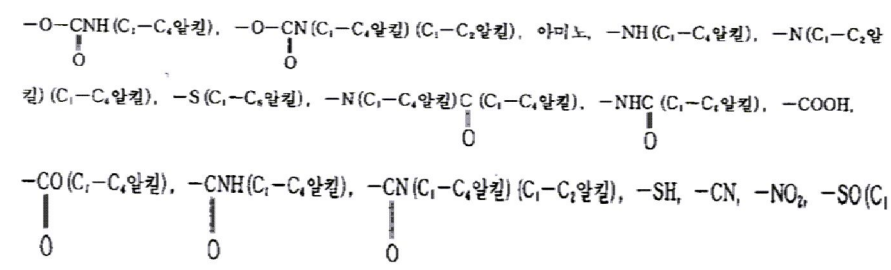


(I)

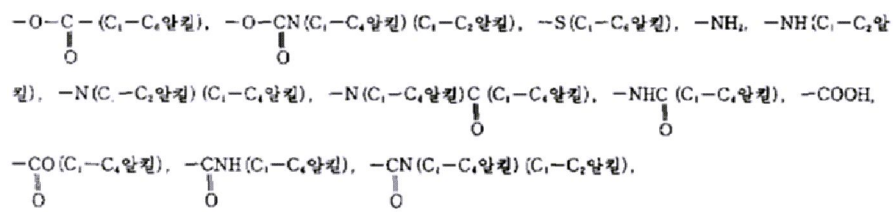
상기 식에서, X는 질소 또는 -CR^6이고, A는 -NR^1R^2, -$CR^1R^2R^{11}$, -$C(=CR^2R^{12})R^1$, -$NHCR^1R^2R^{11}$, -$OCR^1R^2R^{11}$, -$SCR^1R^2R^{11}$, -$NHNR^1R^2$, -$CR^2R^{11}NHR^1$, -$CR^2R^{11}OR^1$, -$CR^2R^{11}SR^1$ 또는 -C(O)R^2이고, R^1은 수소, 또는 하이드록시, 플



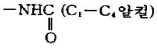
루오로, 클로로, 브로모, 요오드, C_1-C_8알콕시,



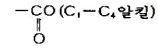
-SH, -CN, $-NO_2$, -SO(C_1-C_4알킬), $-SO_2$(C_1-C_4알킬), $-SO_2NH$(C_1-C_4알킬), $-SO_2N$(C_1-C_4알킬)(C_1-C_2알킬)로 이루어진 군에서 독립적으로 선택된 하나 또는 두개의 치환체로 선택적으로 치환될 수 있는 C_1-C_6알킬이고, 이때, 전술된, C_1-C_6알킬 잔기는 하나 또는 2개의 이중 또는 삼중 결합을 함유할 수 있고; R^2는 C_1-C_{12}알킬; 아릴 또는 -(C_1-C_{10}알킬렌)아릴(이때, 상기 아릴은 페닐, 나프틸, 티에닐, 벤조티에닐, 피리딜, 퀴놀릴, 피라지닐, 피리미딜, 이미다졸릴, 푸라닐, 벤조푸라닐, 벤조티아졸릴, 이소티아졸릴, 벤즈이소티아졸릴, 티아졸릴, 이속사졸릴, 벤즈이속사졸릴, 벤즈이미다졸릴, 트리아졸릴, 피라졸릴, 피롤릴, 인돌릴, 피롤리피리딜, 옥사졸릴 또는 벤족사졸릴임); 3 내지 8-원 사이클로알킬 또는 -(C_1-C_6알킬렌)사이클로알킬(이때, 상기 사이클로알킬 잔기의 임의의 하나 또는 두개의 탄소원자가 독립적으로 O, S 또는 N-Z(여기에서, Z는 수소, C_1-C_4알킬 또는 C_1-C_4알카노일임)에 의해 선택적으로 치환될 수 있음)이고, 상기 R^2는 클로로, 플루오로 및 C_1-C_4알킬 중에서 독립적으로 선택된 하나 내지 세개의 치환체에 의해, 또는 하이드록시, 브로모, 요오도, C_1-C_6알콕시,



-SH, -CN, $-NO_2$, -SO(C_1-C_4알킬), $-SO_2$(C_1-C_4알킬), $-SO_2NH$(C_1-C_4알킬)및, $-SO_2N$(C_1-C_4알킬)(C_1-C_2알킬)중에서 선택된 하나의 치환체에 의해 선택적으로 치환될 수 있고, 이때 전술한 C_1-C_{12}알킬 및 C_1-C_{10}알킬렌 잔기는 선택적으로 하나 내지 세개의 이중 또는 삼중 결합을 함유할 수 있거나; 또는 R^1 및 R^2는 이들이 붙어있는 원자와 함께 포화 3 내지 8-원 고리를 형성할 수 있고, 이때 5 내지 8-원 고리의 경우 선택적으로 하나 또는 두개의 이중 결합을 함유할 수 있으며, 상기 5 내지 8-원 고리의 하나 또는 두개의 탄소원자는 독립적으로 O, S 또는 N-Z(여기에서, Z는 수소, C_1-C_4알킬 또는 C_1-C_4알카노일 또는 벤질임)에 의해 선택적으로 치환될 수 있고; R^3는 수소, C_1-C_6알킬, 플루오로, 클로로, 브로모, 요오도, 하이드록시, 아미노, -O(C_1-C_6알킬), -NH(C_1-C_6알킬), -N(C_1-C_4알킬)(C_1-C_2알킬), -SH, -S(C_1-C_4알킬), -SO(C_1-C_4알킬) 또는 $-SO_2$(C_1-C_4알킬)이고, 이때, 전술한 C_1-C_4알킬 및 C_1-C_6알킬 잔기 각각은 하나의 이중 또는 삼중 결합을 함유할 수 있고, 하이드록시, C_1-C_3알콕시, 플루오로, 클로로 및 C_1-C_3티오알킬로 이루어진 군에서 독립적으로 선택한 하나 내지 세개의 치환체로 선택적으로 치환될 수 있고; R^4는 수소, C_1-C_6알킬, 플루오로, 클로로, 브로모, 요오도, C_1-C_6알콕시, 포밀, -NH(C_1-C_6알킬), -N(C_1-C_6알킬)(C_1-C_2알킬), $-SO_n$(C_1-C_6알킬)(여기에서, n은 0,1, 또는 2임), 시아노, 하이드록시, 카복시 또는 아미도이고, 이때, 전술한 C_1-C_6알킬 잔기 각각은 하이드록시, 트리플루오로메틸, 아미노, 카복시, 아미도,



-NH(C_1-C_4알킬), -N(C_1-C_4알킬)(C_1-C_2알킬),



C_1-C_3알콕시, C_1-C_3티오알킬, 플루오로, 브로모, 클로로, 요오도, 시아노 및 니트로에서 선택한 하나의 치환체로 선택적으로 치환될 수 있고; R^5는 페닐, 나프닐, 티에닐, 벤조티에닐, 피리딜, 퀴놀릴, 피라지닐, 피리미딜, 이미다졸릴, 푸라닐, 벤조푸라닐, 벤조티아졸릴, 이소티아졸릴, 벤조이소티아졸릴, 티아졸릴, 이속사졸릴, 벤즈이속사졸릴, 벤즈이미다졸릴, 트리아졸릴, 피라졸릴, 피롤릴, 인돌릴, 피롤리피리딜, 벤즈옥사졸릴, 옥사졸릴, 피롤리디닐, 티아졸릴디닐, 모르폴리닐, 피페리디닐, 피페라지닐, 테트라졸릴 또는 3 내지 8-원 사이클로알킬 또는 9 내지 12-원 비사이클로알킬 고리이고, 이때, 상기 고리의 하나 또는 두개의 탄소원자가 독립적으로 O, S 또는 N-Z(여기에서, Z는 수소, C_1-C_4알킬, C_1-C_4알카노일, 페닐 또는 벤질이다)에 의해 선택적으로 치환될 수 있고, 상기 R^5기 각각은 플루오로, 클로로, 브로모, 포밀, C_1-C_6알킬, C_1-C_6알콕시 및 트리플루오로메틸중에서 독립적으로 선택된 하나 이상의 치환체, 바람직하게는 두개 또는 세개의 치환체에 의해, 또는 하이드록시, 요오도, 시아노, 니트로, 아미노, -NH(C_1-C_4알킬), -N(C_1-C_4알킬)(C_1-C_2알킬), -COO(C_1-C_4알킬), -CO(C_1-C_4알킬), $-SO_2NH$(C_1-C_4알킬), $-SO_2N$(C_1-C_4알킬)(C_1-C_2알킬), $-SO_2NH_2$, $-NHSO_2$(C_1-C_4알킬), -S(C_1-C_6알킬), $-SO_2$(C_1-C_6알

킬)중에서 선택된 하나의 치환체에 의해 선택적으로 치환될 수 있고, 전술한 상기 C_1-C_4알킬 및 C_1-C_6알킬 잔기는 각각 플루오로, 클로로, 하이드록시, C_1-C_4알콕시, 아미노, 메틸아미노, 디메틸아미노 및 아세틸중에서 독립적으로 선택된 하나 또는 두개의 치환체로 선택적으로 치환될 수 있고, 전술한 상기 C_1-C_4알킬 및 C_1-C_6알킬 잔기는 각각 하나의 이중 또는 삼중 결합을 선택적으로 함유할 수 있고, 단 R^5는 치환되지 않은 페닐이 아니며; R^6는 수소, C_1-C_6알킬, 플루오로, 클로로, 브로모, 요오도, C_1-C_6알콕시, 포밀, 아미노, -NH(C_1-C_6알킬), -N(C_1-C_6알킬)(C_1-C_2알킬), -SO_n(C_1-C_6알킬)(여기에서, n은 0, 1 또는 2이다), 시아노, 카복시 또는 아미도이고, 이때, 전술한 (C_1-C_6)알킬 잔기 각각 하이드록시, 트리플루오로메틸, 아미노, 카복시, 아미도, $-\overset{\overset{O}{\|}}{NHC}(C_1-C_4\text{알킬})$, -NH($C_1$-$C_4$알킬), -N($C_1$-$C_4$알킬)($C_1$-$C_2$알킬), $-\overset{\overset{O}{\|}}{CO}(C_1-C_4\text{알킬})$, C_1-C_3알콕시, C_1-C_3티오알킬, 플루오로, 브로모, 클로로, 요오도, 시아노 및 니트로중에서 선택한 하나의 치환체로 선택적으로 치환될 수 있고; R^{11}은 수소, 하이드록시, 플루오로, 클로로, -COO(C_1-C_2알킬), 시아노 또는 -CO(C_1-C_2알킬)이고; R^{12}은 수소 또는 C_1-C_4알킬이고; 단, (1) X가 -CR^6이면 A는 직쇄 알킬이 아니고, (2) X가 -CR^6이고 R^5가 치환되지 않은 사이클로알킬이고 R^3 및 R^4가 둘다 수소이고, R^6이 수소 또는 메틸이면, A는 R^2가 벤질 또는 티에닐메틸인 -NHR^2가 아니고, (3) X가 -CR^6이고 R^5가 p-브로모페닐이고, R^3, R^4 및 R^6이 메틸이면, A는 메틸아미노 또는 하이드록시에틸아미노가 아니며; 또한 X가 질소이면; (a) A는 직쇄 C_1-C_{12}알킬이 아니고; (b) R^5는 당그룹이 아니고; (c) R^3 및 R^4가 수소이고 R^5가 클로로페닐일때, A는 -NH-CH(CH_3)-(CH_2)$_3$-N(C_2H_5)$_2$가 아니고; (d) R^3 및 R^4가 수소이고 A가 -NR^1R^2[이때, R^1은 C_3-C_7사이클로알킬이고, R^2은 C_2-C_6알킬렌, 페닐-(C_1-C_6알킬렌)(이때, 상기 페닐은 플루오로, 클로로, 브로모 또는 요오도로 치환될 수 있다), 또는 헤테로 라디칼이 푸릴, 티에닐 또는 피리디닐인 헤테로-(C_1-C_6알킬렌)임]일때, R^5는 테트라하이드로푸라닐 또는 테트라하이드로피라닐이 아니고; (e) R^3가 메톡시, 메틸티오 또는 메틸설포닐이고 R^4가 수소이고 R^5가 테트라하이드로푸라닐 또는 테트라하이드로피라닐일때, A는 -NH(C_1-C_2알킬), 모르폴리닐, 하이드라지노, 또는 페닐이 하나의 메틸 또는 두개의 메톡시기로 치환될 수 있는 -$NHC_2H_4C_6H_5$가 아니고; (f) R^3가 수소, C_1-C_6알킬, 클로로, 브로모, -SH 또는 -S(C_1-C_4알킬)이고, R^4가 수소이고 R^5가 C_3-C_8사이클로알킬일때, A는 하이드라지노, -NH(C_1-C_2알킬) 또는 -N(C_1-C_6알킬)(C_1-C_{12}알킬)이 아니고; (g) R^3 및 R^4가 수소이고 A가 -NH(CH_2)$_m$COOH(이때, m은 1 내지 12임)일때, R^5는 하나의 플루오로, 클로로, 브로모 또는 요오도기로 치환된 페닐이 아니고; (h) R^3가 수소, 하이드록시, 메틸티오, 클로로 또는 -NH벤질이고 R^4가 수소이고 R^5가 클로로페닐 또는 브로모페닐일때, A는 -NH(C_1-C_{12}알킬), -NH알릴 또는 -N(C_1-C_6알킬)(C_1-C_{12}알킬)(이때, 상기 C_1-C_{12}알킬은, -NC_2H_5에 의해, 또는 하나 또는 두개의 브로모, 클로로, 플루오로, -NC_2H_5페닐 또는 모르폴리노프로필기에 의해 치환될 수 있는 -NH벤질에 의해 치환될 수 있음)이 아니고; (i) R^3 및 R^4가 수소이고 R^5가 니트로페닐일때, A는 R^2가 하나 또는 두개의 하이드록시기에 의해 치환될 수 있는 페닐, 벤질 또는 -C_1-C_{12}알킬인 -NHR^2가 아니고; (j) R^3가 클로로 또는 -O(C_1-C_6알킬)이고 R^4가 수소이고 A가 R^1 및 R^2가 독립적으로 수소 또는 C_1-C_6알킬인 -NR^1R^2일 때, R^5는 클로로페닐이 아니고; (k) R^3가 수소이고, A가 벤질 또는 펜에틸이고 R^4가 플루오로, 클로로, 브로모 또는 요오도일때, R^5는 5'-데옥시-리보푸라노실 또는 5'-아미노-5'-데옥시-리보푸라노실이 아니다.

청구항 3

제1항에 있어서, 사용되는 일반식(I)의 화합물 또는 상기 화합물의 약학적으로 허용가능한 염이, X가 질소이고; (a) R^1이 C_1-C_4알킬, -(C_2-C_4알킬렌)O(C_1-C_4알킬) 또는 C_2-C_4하이드록시알킬이고, (b) R^2가 C_1-C_5알킬, 벤질, 피닐에틸, 또는 클로로, 플루오로, 메틸, 에틸, 메톡시, 에톡시 및 t-부틸중에서 독립적으로 선택된 하나 또는 두 개의 치환체에 의해, 또는 하나의 트리플루오로메틸기에 의해 치환된 벤질; (2-티에닐)메틸; (2-티에닐)에틸; (2-푸라닐)메틸; 2-(4-클로로티에닐)메틸; (2-벤조푸라닐)메틸; (2-벤조티에닐)메틸; (2-티아졸릴)메틸; 또는 (2-벤조티아졸릴)메틸이고; (c) R^3가 수소, 메틸, 에틸, 메톡시, 플루오로 또는 클로로이고; (d) R^4가 수소, 메틸, 에틸 또는 n-프로필이고; (e) R^5가 두개 또는 세개의 치환체로 치환된 페닐인 화합물인 약학 조성물.

청구항 4

제1항에 있어서, 사용되는 일반식(I)의 화합물 또는 상기 화합물의 약학적으로 허용가능한 염이, X가 -CR^6이고; (a) R^1이 C_1-C_4알킬, -(C_2-C_4알킬렌)O(C_1-C_4알킬) 또는 C_2-C_4하이드록시알킬이고, (b) R^2가 C_1-C_5알킬, 벤질, 페닐에틸, 또는 클로로, 플루오로, 메틸, 에틸, 메톡시, 에톡시 및 t-부틸중에서 독립적으로 선택된 하나 또는 두개의 치환체에 의해, 또는 하나의 트리플루오로메틸기에 의해 치환된 벤질; (2-티에닐)메틸; (2-티에닐)에틸; (2-푸라닐)메틸; 2-(4-클로로티에닐)메틸; (2-벤조푸라닐)메틸; (2-벤조티에닐)메틸; (2-티아졸릴)메틸; 또는 (2-벤조티아졸릴)메틸이고; (c) R^3가 수소, 메틸, 에틸, 메톡시, 플루

오로 또는 클로로이고; (d) R^4가 수소, 메틸, 에틸 또는 n-프로필이고; (e) R^5가 두개 또는 세개의 치환체로 치환된 페닐이고; (f) R^6이 수소, 메틸, 에틸 또는 클로로이고, 단 R^4 및 R^6이 둘다 수소는 아닌 화합물인 약학 조성물.

청구항 5

제1항에 있어서, 사용되는 일반식(I)의 화합물 또는 그의 약학적으로 허용가능한 염이, X가 질소이고; (a) A가 $-NR^1R^2$, $-NHCHR^1R^2$ 또는 $-OCHR^1R^2$이고, 이때 R^1이고, 하나의 하이드록시, 플루오로 또는 C_1-C_2알콕시기로 선택적으로 치환될 수 있고 선택적으로 하나의 이중 또는 삼중 결합을 함유할 수 있는 C_1-C_6알킬이고, R^2가 벤질, 또는 선택적으로 하나의 이중 또는 삼중 결합을 함유할 수 있는 C_1-C_6알킬이고, 이때 상기 C_1-C_6알킬 또는 상기 벤질의 페닐 잔기가 하나의 플루오로, C_1-C_6알킬 또는 C_1-C_6알콕시로 선택적으로 치환될 수 있거나; 또는 (b) A가 $-CR^1R^2R^{11}$이고, 이때 R^1이 하나의 C_1-C_6알콕시 또는 하이드록시기로 선택적으로 치환될 수 있는 C_1-C_6알킬이고; R^2가 벤질 또는 C_1-C_6알킬이고, 이때, 상기 C_1-C_6알킬 또는 벤질의 페닐 잔기가 하나의 C_1-C_6알킬, C_1-C_6알콕시, 플루오로, 클로로 또는 브로모기로 선택적으로 치환될 수 있고, R^{11}이 수소 또는 플루오로인 화합물인 약학 조성물.

청구항 6

제1항에 있어서, 사용되는 상기 일반식(I)의 화합물 또는 상기 화합물의 약학적으로 허용가능한 염이, X가 질소이고 R^2가 $-(C_1$-C_4알킬렌)아릴이고, 이때 상기 아릴이 페닐, 티에닐, 벤조푸라닐, 푸라닐, 벤조티에닐, 티아졸릴, 피리딜 또는 벤조티아졸릴인 화합물인 약학 조성물.

청구항 7

제1항에 있어서, 사용되는 일반식(I)의 화합물 또는 상기 화합물의 약학적으로 허용가능한 염이, X가 질소이고 R^2가 페닐잔기에서 하나의 에틸, t-부틸, 메톡시, 트리플루오로메틸, 니트로, 플루오로, 클로로 또는 메틸기인 선택적으로 치환되는 벤질인 화합물인 약학 조성물.

청구항 8

제1항에 있어서, 사용되는 일반식(I)의 화합물 또는 상기 화합물의 약학적으로 허용가능한 염이, X가 질소이고 R^2가 메틸렌 또는 에틸렌 브리지를 통해 퀴놀릴, 피롤릴, 피롤리다닐, 피리딜, 테트라하이드로피라닐, 사이클로프로필, 피페리디닐 또는 벤질-피페리디닐에 붙어있는 화합물인 약학 조성물.

청구항 9

제1항에 있어서, 사용되는 일반식(I)의 화합물 또는 상기 화합물의 약학적으로 허용가능한 염이, X가 질소 또는 $-CR^6$이고, R^1 및 R^2가 독립적으로 하나의 하이드록시, 메톡시, 에톡시, 클로로, 플루오로, $-OC(O)CH_3$, $-OC(O)NHCH_3$ 또는 $-C(O)NH_2$기로 선택적으로 치환될 수 있는 C_1-C_6알킬인 화합물인 약학 조성물.

청구항 10

제1항에 있어서, 사용되는 일반식(I)의 화합물 또는 상기 화합물의 약학적으로 허용가능한 염이, X가 질소 또는 $-CR^6$이고, R^2가 선택적으로 메톡시 및 에톡시중에서 선택된 하나의 치환체로 치환되는 C_1-C_6알킬인 화합물인 약학 조성물.

청구항 11

제1항에 있어서, 사용되는 일반식(I)의 화합물 또는 상기 화합물의 약학적으로 허용가능한 염이, X가 질소이고 A가 $-NR^1R^2$ 또는 $-CHR^1R^2$이고, 이때 R^1 및 R^2가 그들이 붙어있는 N 또는 CH와 함께 5 또는 6-원 고리를 형성하고, 이때 고리 탄소중의 하나가 산소 또는 황원자로 선택적으로 치환될 수 있는 화합물인 약학 조성물.

청구항 12

제1항에 있어서, 사용되는 일반식(I)의 화합물 또는 상기 화합물의 약학적으로 허용가능한 염이, X가 질소 또는 CR^6이고, A가 $-NHCHR^1R^2$ 또는 $-OCHR^1R^2$이고, 이때 CHR^1R^2가, 고리 탄소중의 하나가 산소 또는 황원자로 선택적으로 치환될 수 있는 5 또는 6원 고리인 화합물인 약학 조성물.

청구항 13

제1항에 있어서, 사용되는 일반식(I)의 화합물 또는 상기 화합물의 약학적으로 허용가능한 염이, X가 질소이고; (a) A가 $-NR^1R^2$, $-NHCHR^1R^2$ 또는 $-OCHR^1R^2$이고, 이때 R^1이, 하나의 하이드록시, 플루오로 또는 C_1-C_2알콕시로 선택적으로 치환될 수 있고 선택적으로 하나의 이중 또는 삼중 결합을 함유할 수 있는 C_1-C_6알킬이고; (b) R^2가 선택적으로 하나의 이중 또는 삼중 결합을 함유할 수 있는 벤질 또는 C_1-C_6알킬이고, 상기 C_1-C_6알킬 또는 상기 벤질의 페닐이 플루오로, C_1-C_6알킬 또는 C_1-C_6알콕시로 선택적으로 치환될 수

있고, (c) R^3가 메틸, 에틸, 플루오로, 클로로 또는 메톡시이고; (c) R^4 및 R^6가 독립적으로 수소, 메틸 또는 에틸중에서 선택되고; (d) R^5가 두개 또는 세개의 치환체로 치환된 페닐이고, 상기 치환체가 플루오로, 클로로, 브로모, 요오도, C_1-C_4알콕시, 트리플루오로메틸, C_1-C_6알킬(이는 하나의 하이드록시, C_1-C_4 알콕시 및 플루오로기로 선택적으로 치환될 수 있고 선택적으로 하나의 이중 또는 삼중 결합을 함유할 수 있음), -(C_1-C_4알킬렌)O(C_1-C_2알킬), C_1-C_3하이드록시알킬, 하이드록시, 포밀, -COO(C_1-C_2알킬) 및 -C(O)(C_1-C_4알킬)중에서 독립적으로 선택되는 화합물인 약학 조성물.

청구항 14

제1항에 있어서, 사용되는 일반식(I)의 화합물 또는 상기 화합물의 약학적으로 허용가능한 염이, X가 C^6이고; (a) A가 $-NR^1R^2$, $-NHCHR^1R^2$ 또는 $-OCHR^1R^2$이고, 이때 R^1이, 하나의 하이드록시, 플루오로 또는 C_1-C_2 알콕시로 선택적으로 치환될 수 있고 선택적으로 하나의 이중 또는 삼중 결합을 함유할 수 있는 C_1-C_6 알킬이고; (b) R^2가 벤질, 또는 선택적으로 하나의 이중 또는 삼중 결합을 함유할 수 있는 C_1-C_6알킬이고, 상기 C_1-C_6알킬 또는 상기 벤질의 페닐 진기는 플루오로, C_1-C_6알킬 또는 C_1-C_6알콕시로 선택적으로 치환될 수 있고; (c) R^3가 메틸, 에틸, 플루오로, 클로로 또는 메톡시이고; (c) R^4 및 R^6가 독립적으로 수소, 메틸 및 에틸중에서 선택되고; (d) R^5가 두개 또는 세개의 치환체로 치환된 페닐이고, 상기 치환체가 플루오로, 클로로, 브로모, 요오도, C_1-C_4알콕시, 트리플루오로메틸; 하나의 하이드록시, C_1-C_4알콕시 또는 플루오로기로 선택적으로 치환될 수 있고 선택적으로 하나의 이중 또는 삼중 결합을 함유할 수 있는 C_1-C_6알킬; -(C_1-C_4알킬렌)O(C_1-C_2알킬), C_1-C_3하이드록시알킬, 하이드록시, 포밀, -COO(C_1-C_2알킬) 및 -C(O)(C_1-C_4알킬)중에서 독립적으로 선택되는 화합물인 약학 조성물.

청구항 15

제1항에 있어서, 사용되는 일반식(I)의 화합물 또는 상기 화합물의 약학적으로 허용가능한 염이 하기화

합물에서 선택된 화합물인 약학 조성물;

3-{(4-메틸-벤질)-(3,6-디메틸-1-(2,4,6-트리메틸페닐)-1H-피라졸로(3,4-d)피리미딘-4-일]-아미노)-프로판-1-올; 디에틸-(6-메틸-3-메틸설파닐-1-(2,4,6-트리클로로페닐)-1H-피라졸로(3,4-d)피리미딘-4-일)-아민; 2-(부틸-(6-메틸-3-메틸설파닐-1-(2,4,6-트리클로로페닐)-1H-피라졸로(3,4-d)피리미딘-4-일)-아미노)-에탄올; 디부틸-(6-메틸-3-메틸설파닐-1-(2,4,6-트리클로로페닐)-1H-피라졸로(3,4-d)피리미딘-4-일)-아민; 부틸-에틸-(6-메틸-3-메틸설파닐-1-(2,4,6-트리클로로페닐)-1H-피라졸로(3,4-d)피리미딘-4-일)-아민; 부틸-에틸-(6-메틸-3-메틸설포닐-1-(2,4,6-트리클로로페닐)-1H-피라졸로(3,4-d)피리미딘-4-일)-아민; 부틸-사이클로프로필메틸-(6-메틸-3-메틸설파닐-1-(2,4,6-트리클로로페닐)-1H-피라졸로(3,4-d)피리미딘-4-일)-아민; 디-1-프로필-(6-메틸-3-메틸설파닐-1-(2,4,6-트리클로로페닐)-1H-피라졸로(3,4-d)피리미딘-4-일)-아민; 디알릴-(6-메틸-3-메틸설파닐-1-(2,4,6-트리클로로페닐)-1H-피라졸로(3,4-d)피리미딘-4-일)-아민; 부틸-에틸-(6-클로로-3-메틸설파닐-1-(2,4,6-트리클로로페닐)-1H-피라졸로(3,4-d)피리미딘-4-일)-아민; 부틸-에틸-(6-메톡시-3-메틸설파닐-1-(2,4,6-트리클로로페닐)-1H-피라졸로(3,4-d)피리미딘-4-일)-아민; 프로필-에틸-(3,6-디메틸-1-(2,4,6-트리메틸페닐)-1H-피라졸로(3,4-d)피리미딘-4-일)-아민; 4-(1-에틸-프로필)-6-메틸-3-메틸설파닐-1-(2,4,6-트리메틸페닐)-1H-피라졸로(3,4-d)피리미딘; 2-(3,6-디메틸-1-(2,4,6-트리메틸페닐)-1H-피라졸로(3,4-d)피리미딘-4-일아민)-부탄-1-올; (3,6-디메틸-1-(2,4,6-트리메틸페닐)-1H-피라졸로(3,4-d)피리미딘-4-일]-(1-메틸프로필)아민; 4-(1-메톡시메틸프로폭시)-3,6-디메틸-1-(2,4,6-트리메틸페닐)-1H-피라졸로(3,4-d)피리미딘; n-부틸-에틸-(2,5-디메틸-7-(2,4,6-트리메틸페닐)-7H-피롤로(2,3-d)피리미딘-4-일)아민; 디-n-프로필-(2,5-디메틸-7-(2,4,6-트리메틸페닐)-7H-피롤로(2,3-d)피리미딘-4-일)아민; 에틸-n-프로필-(2,5-디메틸-7-(2,4,6-트리메틸페닐)-7H-피롤로(2,3-d)피리미딘-4-일)아민; 디에틸-2,5-디메틸-7-(2,4,6-트리메틸페닐)-7H-피롤로(2,3-d)피리미딘-4-일)아민; n-부틸-에틸-(2,5,6-트리메틸-7-(2,4,6-트리메틸페닐)-7H-피롤로(2,3-d)피리미딘-4-일)아민; 2-(N-n-부틸-N-(2,5-디메틸-7-(2,4,6-트리메틸페닐)-7H-피롤로(2,3-d)피리미딘-4-일)아미노)-에탄올; 4-(1-에틸-프로필)-2,5,6-트리메틸-7-(2,4,6-트리메틸페닐)-7H-피롤로(2,3-d)피리미딘; n-부틸-에틸-(2,5-디메틸-7-(2,4-디메틸페닐)-7H-피롤로(2,3-d)피리미딘-4-일)아민; 2,5-디메틸-7-(2,4,6-트리메틸페닐)-7H-피롤로(2,3-d)피리미딘-4-일)-(1-에틸-프로필)아민; 2-(7-(4-브로모-2,6-디메틸페닐)-2,5-디메틸-7H-피롤로(2,3-d)피리미딘-4-일아미노)-부탄-1-올; 2-(S)-(7-(4-브로모-2,6-디메틸페닐)-2,5-디메틸-7H-피롤로(2,3-d)피리미딘-4-일아미노)-부탄-1-올; 4-(1-에틸-프로폭시)-2,5,6-트리메틸-7-(2,4,6-트리메틸페닐)-7H-피롤로(2,3-d)피리미딘; 4-(1-메톡시메틸-프로폭시)-2,5,6-트리메틸-7-(2,4,6-트리메틸페닐)-7H-피롤로(2,3-d)피리미딘; 4-(1-에틸-부틸)-2,5,6-트리메틸-7-(2,4,6-트리메틸페닐)-7H-피롤로(2,3-d)피리미딘; (7-(4-브로모-2,6-디메틸-페닐)-2,5-디메틸-7H-피롤로(2,3-d)피리미딘-4-일)-(1-메톡시메틸-프로필)-아민; 2-(7-(2-브로모-4,6-디메틸-페닐)-2,5-디메틸-7H-피롤로(2,3-d)피리미딘-4-일아미노)-부탄-1-올; 2-(7-(4-에틸-2,6-디메틸-페닐)-2,5-디메틸-7H-피롤로(2,3-d)피리미딘-4-일아미노)-부탄-1-올; 2-(7-(2-에틸-4,6-디메틸페닐)-2,5-디메틸-7H-피롤로(2,3-d)피리미딘-4-일아미노)-부탄-1-올; 및 2-(7-(2-플루오로메틸-4,6-디메틸페닐)-2,5-디메틸-7H-피롤로(2,3-d)피리미딘-4-일아미노)-부탄-1-올.

청구항 16

제2항에 있어서, 사용되는 일반식(I)의 화합물 또는 상기 화합물의 약학적으로 허용가능한 염이, X가 질소이고; (a) R^1이 C_1-C_4알킬, -(C_2-C_4알킬렌)(0)(C_1-C_4알킬) 또는 C_2-C_4하이드록시알킬이고; (b) R^2가 C_1-C_5알킬, 벤질, 페닐에틸, 또는 클로로, 플루오로, 메틸, 에틸, 메톡시, 에톡시 및 t-부틸중에서 독립적으로 선택된 하나 또는 두개의 치환체에 의해, 또는 하나의 트리플루오로메틸기에 의해 치환된 벤질; (2-티에닐)메틸; (2-티에닐)에틸; (2-푸라닐)메틸; 2-(4-클로로티에닐)메틸; (2-벤조푸라닐)메틸; (2-벤조티에닐)메틸; (2-티아졸릴)메틸; 또는 (2-벤조티아졸릴)메틸이고; (c) R^3가 수소, 메틸, 에틸, 메톡시, 플루오로 또는 클로로이고; (d) R^4가 수소, 메틸, 에틸 또는 n-프로필이고; (e) R^5가 두개 또는 세개의 치환체로 치환된 페닐인 화합물인 약학 조성물.

청구항 17

제2항에 있어서, 사용되는 일반식(I)의 화합물 또는 상기 화합물의 약학적으로 허용가능한 염이, X가 CR^6이고; (a) R^1이 C_1-C_4알킬, -(C_2-C_4알킬렌)(0)(C_1-C_4알킬) 또는 C_2-C_4하이드록시알킬이고; (b) R^2가 C_1-C_5알킬, 벤질, 페닐에틸, 또는 클로로, 플루오로, 메틸, 에틸, 메톡시, 에톡시 및 t-부틸중에서 독립적으로 선택된 하나 또는 두개의 치환체 또는 하나의 트리플루오로메틸기에 의해 치환된 벤질이고; (2-티에닐)메틸; (2-티에닐)에틸; (2-푸라닐)메틸; 2-(4-클로로티에닐)메틸; (2-벤조푸라닐)메틸; (2-벤조티에닐)

메틸; (2-티아졸릴)메틸; 또는 (2-벤조티아졸릴)메틸이고; (c) R^3가 수소, 메틸, 에틸, 메톡시, 플루오로 또는 클로로이고; (d) R^4가 수소, 메틸, 에틸 또는 n-프로필이고; (e) R^5가 두개 또는 세개의 치환체로 치환된 페닐이고; (f) R^6이 수소, 메틸, 에틸 또는 클로로이고, 단 R^4 및 R^6은 둘다 수소는 아닌 화합물인 약학 조성물.

청구항 18

제2항에 있어서, 사용되는 일반식(I)의 화합물 또는 그의 약학적으로 허용가능한 염이, X가 질소이고; (a) A가 $-NR^1R^2$, $-NHCHR^1R^2$ 또는 $-OCHR^1R^2$이고, 이때 R^1이, 하나의 하이드록시, 플루오로 또는 C_1-C_2알콕시기로 선택적으로 치환될 수 있고 선택적으로 하나의 이중 또는 삼중 결합을 함유할 수 있는 C_1-C_6알킬이고, R^2가 벤질, 또는 선택적으로 하나의 이중 또는 삼중 결합을 함유할 수 있는 C_1-C_6알킬이고, 이때, 상기 C_1-C_6알킬 또는 상기 벤질의 페닐 잔기가 하나의 플루오로, C_1-C_6알킬 또는 C_1-C_6알콕시로 선택적으로 치환될 수 있거나; 또는 (b) A가 $-CR^1R^2R^{11}$이고, 이때 R^1이 하나의 C_1-C_6알콕시 또는 하이드록시기로 선택적으로 치환될 수 있는 C_1-C_6알킬이고, R^2가 벤질 또는 C_1-C_6알킬이고, 이때, 상기 C_1-C_6알킬 또는 벤질의 페닐 잔기가 하나의 C_1-C_6알킬, C_1-C_6알콕시, 플루오로, 클로로 또는 브로모기가 선택적으로 치환될 수 있고, R^{11}이 수소 또는 플루오로인 화합물인 약학 조성물.

청구항 19

제2항에 있어서, 사용되는 상기 일반식(I)의 화합물 또는 상기 화합물의 약학적으로 허용가능한 염이, X가 질소이고 R^2가 -(C_1-C_4알킬렌)아릴이고, 이때 상기 아릴이 페닐, 티에닐, 벤조푸라닐, 푸라닐, 벤조티에닐, 티아졸릴, 피리딜 또는 벤조티아졸릴인 화합물인 약학 조성물.

청구항 20

제2항에 있어서, 사용되는 상기 일반식(I)의 화합물 또는 상기 화합물의 약학적으로 허용가능한 염이, X가 질소이고 R^2가 페닐잔기에서 하나의 에틸, t-부틸, 메톡시, 트리플루오로메틸, 니트로, 플루오로, 클로로 또는 메틸기로 선택적으로 치환되는 벤질인 화합물인 약학 조성물.

청구항 21

제2항에 있어서, 사용되는 일반식(I)의 화합물 또는 상기 화합물의 약학적으로 허용가능한 염이, X가 질소이고 R^2가 메틸렌 또는 에틸렌 브리지를 통해 퀴놀릴, 피롤릴, 피롤리디닐, 피리딜, 테트라하이드로피라닐, 사이클로프로필, 피페리디닐 또는 벤질-피페리디닐에 붙어있는 화합물인 약학 조성물.

청구항 22

제2항에 있어서, 사용되는 일반식(I)의 화합물 또는 상기 화합물의 약학적으로 허용가능한 염이, X가 질소 또는 $-CR^6$이고, R^1 및 R^2가 독립적으로 하나의 하이드록시, 메톡시, 에톡시, 클로로, 플루오로, $-OC(O)CH_3$, $-OC(O)NHCH_3$, 또는 $-C(O)NH_2$기로 선택적으로 치환될 수 있는 C_1-C_6알킬인 화합물인 약학 조성물.

청구항 23

제2항에 있어서, 사용되는 상기 일반식(I)의 화합물 또는 화합물의 약학적으로 허용가능한 염이, X가 질소 또는 $-CR^6$이고, R^2가 독립적으로 메톡시 및 에톡시 중에서 선택된 하나의 치환체로 치환되는 C_1-C_6알킬인 화합물인 약학 조성물.

청구항 24

제2항에 있어서, 사용되는 상기 일반식(I)의 화합물 또는 화합물의 약학적으로 허용가능한 염이, X가 질소이고 A가 $-NR^1R^2$ 또는 $-CHR^1R^2$이고, 이때 R^1 및 R^2가 그들이 붙어있는 N 또는 CH와 함께 5 또는 6-원 고리를 형성하고, 이때 고리 탄소중의 하나가 황 또는 산소 원자로 선택적으로 치환될 수 있는 화합물인 약학 조성물.

청구항 25

제2항에 있어서, 사용되는 일반식(I)의 화합물 또는 상기 화합물의 약학적으로 허용가능한 염이, X가 질소이고, A는 $-NHCHR^1R^2$ 또는 $-OCHR^1R^2$이고, 이때 CHR^1R^2가 고리 탄소 원자중의 하나가 산소 또는 황원자로 선택적으로 치환될 수 있는 화합물인 약학 조성물.

청구항 26

제2항에 있어서, 사용되는 일반식(I)의 화합물 또는 상기 화합물의 약학적으로 허용가능한 염이, X가 CR^6이고, (a) A가 $-NR^1R^2$, $-NHCHR^1R^2$ 또는 $-OCHR^1R^2$이고, 이때 R^1이, 하나의 하이드록시, 플루오로 또는 C_1-C_2알콕시기로 선택적으로 치환될 수 있고 선택적으로 하나의 이중 또는 삼중 결합을 함유할 수 있는 C_1-C_6

알킬이고; (b) R^2가 벤질, 또는 선택적으로 하나의 이중 또는 삼중 결합을 함유할 수 있는 C_1-C_6알킬이고, 상기 C_1-C_6알킬 또는 상기 벤질의 페닐 잔기는 플루오로, C_1-C_6알킬 또는 C_1-C_6알콕시로 선택적으로 치환될 수 있고; (c) R^3가 메틸, 에틸, 플루오로, 클로로 또는 메톡시이고; (c) R^4 및 R^6가 독립적으로 수소, 메틸 및 에틸중에서 선택되고; (d) R^5가 두개 또는 세개의 치환체로 치환된 페닐이고, 상기 치환체가 플루오로, 클로로, 브로모, 요오도, C_1-C_4알콕시, 트리플루오로메틸; 하나의 하이드록시, C_1-C_4알콕시 또는 플루오로기로 선택적으로 치환될 수 있고 선택적으로 하나의 이중 또는 삼중 결합을 함유할 수 있는 C_1-C_6알킬; -(C_1-C_4알킬렌)O(C_1-C_2알킬), C_1-C_3하이드록시알킬, 하이드록시, 포밀, -COO(C_1-C_2알킬) 및 -C(O)(C_1-C_4알킬)중에서 독립적으로 선택되는 화합물인 약학 조성물.

청구항 27

제2항에 있어서, 사용되는 일반식(I)의 화합물 또는 상기 화합물의 약학적으로 허용가능한 염이, X가 질소이고; (a) A가 $-NR^1R^2$, $-NHCHR^1R^2$ 또는 $-OCHR^1R^2$이고, 이때 R^1이, 하나의 하이드록시, 플루오로 또는 C_1-C_2알콕시로 선택적으로 치환될 수 있고 선택적으로 하나의 이중 또는 삼중 결합을 함유할 수 있는 C_1-C_6알킬이고; (b) R^2가 선택적으로 하나의 이중 또는 삼중 결합을 함유할 수 있는 벤질 또는 C_1-C_6알킬이고, 상기 C_1-C_6알킬 또는 상기 벤질의 페닐이 플루오로, C_1-C_6알킬 또는 C_1-C_6알콕시로 선택적으로 치환될 수 있고; (c) R^3가 메틸, 에틸, 플루오로, 클로로 또는 메톡시이고; (c) R^4 및 R^6가 독립적으로 수소, 메틸 또는 에틸중에서 선택되고; (d) R^5가 두개 또는 세개의 치환체로 치환된 페닐이고, 상기 치환체가 플루오로, 클로로, 브로모, 요오도, C_1-C_4알콕시, 트리플루오로메틸, C_1-C_6알킬(이는 하나의 하이드록시, C_1-C_4알콕시 및 플루오로기로 선택적으로 치환될 수 있고 선택적으로 하나의 이중 또는 삼중 결합을 함유할 수 있음), -(C_1-C_4알킬렌)O(C_1-C_2알킬), C_1-C_3하이드록시알킬, 하이드록시, 포밀, -COO(C_1-C_2알킬) 및 -C(O)(C_1-C_4알킬)중에서 독립적으로 선택되는 화합물인 약학 조성물.

청구항 28

제2항에 있어서, 사용되는 일반식(I)의 화합물 또는 그의 약학적으로 허용가능한 염이 하기 화합물에서

선택된 화합물인 약학 조성물

3-((4-메틸-벤질)-(3,6-디메틸-1-(2,4,6-트리메틸페닐)-1H-피라졸로[3,4-d]피리미딘-4-일)-아미노)-프로판-1-올; 디에틸-(6-메틸-3-메틸설파닐-1-(2,4,6-트리플로로페닐)-1H-피라졸로[3,4-d]피리미딘-4-일)-아민; 2-(부틸-(6-메틸-3-메틸설파닐-1-(2,4,6-트리플로로페닐)-1H-피라졸로[3,4-d]피리미딘-4-일)-아미노)-에탄올; 디부틸-(6-메틸-3-메틸설파닐-1-(2,4,6-트리플로로페닐)-1H-피라졸로[3,4-d-피리미딘-4-일)-아민; 부틸-에틸-(6-메틸-3-메틸설파닐-1-(2,4,6-트리플로로페닐)-1H-피라졸로[3,4-d]피리미딘-4-일)-아민; 부틸-에틸-(6-메틸-3-메틸설포닐-1-(2,4,6-트리플로로페닐)-1H-피라졸로[3,4-d]피리미딘-4-일)-아민; 부틸-사이클로프로필메틸-(6-메틸-3-메틸설파닐-1-(2,4,6-트리플로로페닐)-1H-피라졸로[3,4-d]피리미딘-4-일)-아민; 디-1-프로필-(6-메틸-3-메틸설파닐-1-(2,4,6-트리플로로페닐)-1H-피라졸로[3,4-d]피리미딘-4-일)-아민; 디알릴-(6-메틸-3-메틸설파닐-1-(2,4,6-트리클로로페닐)-1H-피라졸로[3,4-d]피리미딘-4-일)-아민; 부틸-에틸-(6-플로로-3-메틸설파닐-1-(2,4,6-트리플로로페닐)-1H-피라졸로[3,4-d]피리미딘-4-일)-아민; 부틸-에틸-(6-메톡시-3-메틸설파닐-1-(2,4,6-트리플로로페닐)-1H-피라졸로[3,4-d]피리미딘-4-일)-아민; 프로필-에틸-(3,6-디메틸-1-(2,4,6-트리메틸페닐)-1H-피라졸로[3,4-d]피리미딘-4-일)-아민; 4-(1-에틸-프로필)-5-메틸-3-메틸설파닐-1-(2,4,6-트리메틸페닐)-1H-피라졸로[3,4-d]피리미딘; 2-(3,6-디메틸-1(2,4,6-트리메틸페닐)-1H-피라졸로[3,4-d]피리미딘-4-일아민)-부탄-1-올; (3,6-디메틸-1-(2,4,6-트리메틸페닐)-1H-피라졸로[3,4-d]피리미딘-4-일)-(1-메틸프로필)아민; 4-(1-메톡시메틸프로폭시)-3,6-디메틸-1-(2,4,6-트리메틸페닐)-1H-피라졸로[3,4-d]피리미딘; n-부틸-에틸-(2,6-디메틸-7-(2,4,6-트리메틸페닐)-7H-피라졸로[2,3-d]피리미딘-4-일)아민; 디-n-프로필-(2,5-디메틸-7-(2,4,6-트리메틸페닐)-7H-피롤로[2,3-d]피리미딘-4-일)아민; 에틸-n-프로필-(2,5-디메틸-7-(2,4,6-트리메틸페닐)-7H-피롤로[2,3-d]피리미딘-4-일)아민; 디에틸-2,5-디메틸-7-(2,4,6-트리메틸페닐)-7H-피롤로[2,3-d]피리미딘-4-일)아민; n-부틸-에틸-(2,5,6-트리메틸-7-(2,4,6-트리메틸페닐)-7H-피롤로[2,3-d]피리미딘-4-일)아민; 2-(N-n-부틸-N-(2,5-디메틸-7-(2,4,6-트리메틸페닐)-7H-피롤로[2,3-d]피리미딘-4-일)아미노)-에탄올; 4-(1-에틸-프로필)-2,5,6-트리메틸-7-(2,4,6-트리메틸페닐)-7H-피롤로[2,3-d]피리미딘; n-부틸-에틸-(2,5-디메틸-7-(2,4-디메틸페닐)-7H-피롤로[2,3-d]피리미딘-4-일)아민; 2,5-디메틸-7-(2,4,6-트리메틸페닐)-7H-피롤로[2,3-d]피리미딘-4-일)-(1-에틸-프로필)아민; 2-(7-(4-브로모-2,6-디메틸페닐)-2,5-디메틸-7H-피롤로[2,3-d]피리미딘-4-일아미노)-부탄-1-올; 2-(S)-(7-(4-브로모-2,6-디메틸페닐)-2,5-디메틸-7H-피롤로[2,3-d]피리미딘-4-일아미노)-부탄-1-올; 4-(1-에틸-프로폭시)-2,5,6-트리메틸-7-(2,4,6-트리메틸페닐)-7H-피롤로[2,3-d]피리미딘; 4-(1-메톡시메틸-프로폭시)-2,5,6-트리메틸-7-(2,4,6-트리메틸페닐)-7H-피롤로[2,3-d]피리미딘; 4-(1-에틸-부틸)-2,5,6-트리메틸-7-(2,4,6-트리메틸페닐)-7H-피롤로[2,3-d]피리미딘; (7-(4-브로모-2,6-디메틸-에닐)-2,5-디메틸-7H-피롤로[2,3-d]피리미딘-4-일)-(1-메톡시메틸-프로필)-아민; 2-(7-(2-브로모-4,6-디메틸-페닐)-2,5-디메틸-7H-피롤로[2,3-d]피리미딘-4-일아미노)-부탄-1-올; 2-(7-(4-에틸-2,6-디메틸-페닐)-2,5-디메틸-7H-피롤로[2,3-d]피리미딘-4-일아미노)-부탄-1-올; 2-(7-(2-에틸-4,6-디메틸페닐)-2,5-디메틸-7H-피롤로[2,3-d]피리미딘-4-일아미노)-부탄-1-올; 및 2-(7-(2-플루오로메틸-4,6-디메틸페닐)-2,5-디메틸-7H-피롤로[2,3-d]피리미딘-4-일아미노]-부탄-1-올.

청구항 29

제1항에 있어서, 구속 스트레스에 기인한 가축에서의 스트레스성 면역 기능부진을 치료 또는 예방하기 위한 약학 조성물.

청구항 30

제2항에 있어서, 구속 스트레스에 기인한 가축에서의 스트레스성 면역 기능부진을 치료 또는 예방하기 위한 약학 조성물.

※ 참고사항 : 최초출원 내용에 의하여 공개하는 것임.