

【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23年5月12日 (2011.5.12)

【公表番号】特表2010-523497(P2010-523497A)

【公表日】平成22年7月15日 (2010.7.15)

【年通号数】公開・登録公報2010-028

【出願番号】特願2010-501235(P2010-501235)

【国際特許分類】

C 0 7 D 487/14 (2006.01)

A 6 1 K 31/519 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/24 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 25/16 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/14 (2006.01)

A 6 1 P 25/20 (2006.01)

A 6 1 P 1/16 (2006.01)

A 6 1 P 17/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/30 (2006.01)

A 6 1 K 31/551 (2006.01)

C 0 7 D 519/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 487/14 C S P

A 6 1 K 31/519

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 25/24

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 25/16

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 25/14

A 6 1 P 25/20

A 6 1 P 1/16

A 6 1 P 17/00

A 6 1 P 25/30

A 6 1 K 31/551

C 0 7 D 519/00 3 0 1

【手続補正書】

【提出日】平成23年3月25日 (2011.3.25)

【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

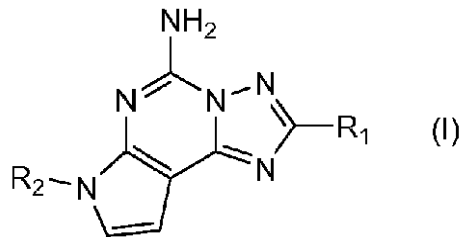
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式：

【化 0 4 4】



〔式中の、 R_1 は、置換されていてもよい $C_3 - C_7$ シクロアルキル、置換されていてもよい $C_6 - C_{10}$ アリール、置換されていてもよいヘテロアリール又は置換されていてもよいヘテロシクリルであり；

R_2 は、 $-(CR_3R_4)_m - Y - (CR_5R_6)_n - Z - Q$

（式中の、 R_3 、 R_4 、 R_5 及び R_6 は、互いに独立して、水素、 $C_1 - C_6$ アルキル又は $C_3 - C_{12}$ シクロアルキルであり；

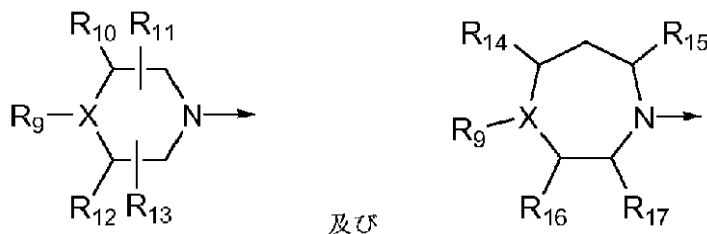
m 及び n は、互いに独立して、1～6の整数であり；

Y は、単結合、 $CH=CH$ 、 $C-C$ 、 O 、 S 、 NR_7 （ここにおいて、 R_7 は水素又は $C_1 - C_4$ アルキル）であり；

Z は、単結合、 O 、 S 、又は NR_8 （ここにおいて、 R_8 は水素又は $C_1 - C_4$ アルキル）であり；

Q は、置換されていてもよい $C_6 - C_{10}$ アリール又は置換されていてもよいヘテロアリールであるか、又は

【化 0 4 5】



（式中の、 R_9 は、置換されていてもよい $C_1 - C_6$ アルキル、置換されていてもよい $C_3 - C_{12}$ シクロアルキル、置換されていてもよい $C_6 - C_{10}$ アリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキル、置換されていてもよいヘテロアラルキル、ヘテロシクリル又はアシルであり；

R_{10} 及び R_{11} は、互いに独立して、水素、置換されていてもよい $C_1 - C_3$ アルキルであるか、又は

R_{10} 及び R_{11} が結合したアルキレンは、それらが同じ炭素原子に結合する場合に、それらが結合している炭素原子と共に3～7員のスピロ環状環を形成し；

R_{12} 、 R_{13} 、 R_{14} 、 R_{15} 、 R_{16} 及び R_{17} は、互いに独立して、水素又は置換されていてもよい $C_1 - C_3$ アルキルであり；そして

X は、 N 又は CH （ Z が単結合である場合）

よりなる群から選ばれる1価の基である）

である〕：

の化合物又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 2】

R_1 が5員又は6員のヘテロアリールである、請求項1に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

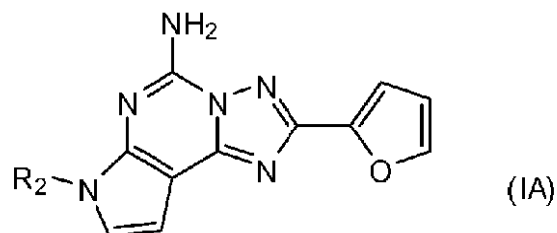
【請求項 3】

R_1 が2-フリルである、請求項2に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 4】

式：

【化 0 4 6】



[式中の、 R_2 は、 $-(CR_3R_4)_m-Y-(CR_5R_6)_n-Z-Q$

(式中の、 R_3 、 R_4 、 R_5 及び R_6 は、互いに独立して、水素又は C_1-C_6 アルキルであり；

m は、1 又は 2 の整数であり；

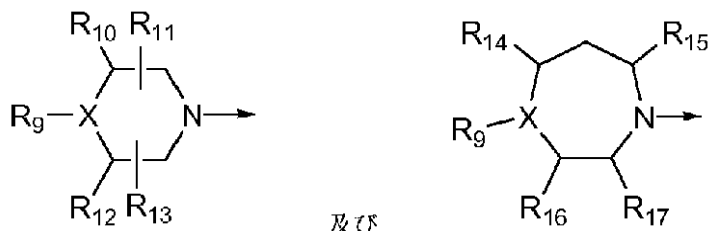
n は、1 ~ 4 の整数であり；

Y は、単結合又は NR_7 (ここにおいて、 R_7 は水素又は C_1-C_4 アルキル) であり；

Z は、単結合、 O 、 S 、又は NR_8 (ここにおいて、 R_8 は水素又は C_1-C_4 アルキル) であり；

Q は、置換されていてもよい単環式アリールであるか、又は

【化 0 4 7】



(式中の、 R_9 は、置換されていてもよい C_1-C_6 アルキル、置換されていてもよい単環式アリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアラルキル、置換されていてもよいヘテロアラルキル又はアシルであり；

R_{10} 、 R_{11} 、 R_{12} 、 R_{13} 、 R_{14} 、 R_{15} 、 R_{16} 及び R_{17} は、互いに独立して、水素又は置換されていてもよい C_1-C_3 アルキルであり；

X は、 N 又は CH (そのとき Z は単結合である) よりなる群から選ばれる 1 価の基である) である) ；

の、請求項 3 に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 5】

R_2 が、 $-(CR_3R_4)_m-Y-(CR_5R_6)_n-Z-Q$

[式中の、 R_3 、 R_4 、 R_5 及び R_6 は、互いに独立して、水素又は C_1-C_6 アルキルであり；

m は、1 又は 2 の整数であり；

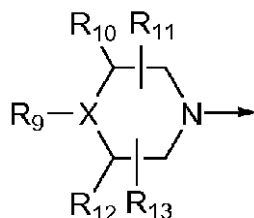
n は、1 ~ 4 の整数であり；

Y は、単結合であり；

Z は、単結合であり；

Q は、式：

【化 0 4 8】



(式中の、 R_9 は、置換されていてもよい $C_1 - C_6$ アルキル、置換されていてもよい単環式アリール、置換されていてもよいヘテロアリール又はアシルであり；

R_{10} 、 R_{11} 、 R_{12} 、 R_{13} は、水素であり；

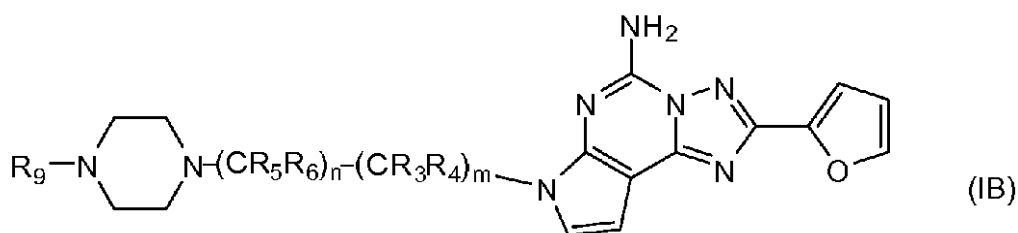
X は N である)

の 1 価の基である]、請求項 4 に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 6】

式：

【化 0 4 9】



(式中の、 R_3 、 R_4 、 R_5 及び R_6 は、水素であり；

m 及び n は、1 であり；

R_9 は、置換されていてもよい $C_1 - C_6$ アルキル、置換されていてもよい単環式アリール、置換されていてもよいヘテロアリール又はアシルである)：

の請求項 5 に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 7】

R_9 が、1 ~ 3 個のハロゲンで置換されていてもよい単環式アリールである、請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 8】

R_9 が、1 ~ 3 個のハロゲンで置換されていてもよい単環式アロイルである、請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 9】

R_9 が、アシルで置換されている $C_1 - C_6$ アルキルである、請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 10】

アシルが、置換されていてもよい単環式アロイル又は置換されていてもよい単環式ヘテロアロイルである、請求項 9 に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

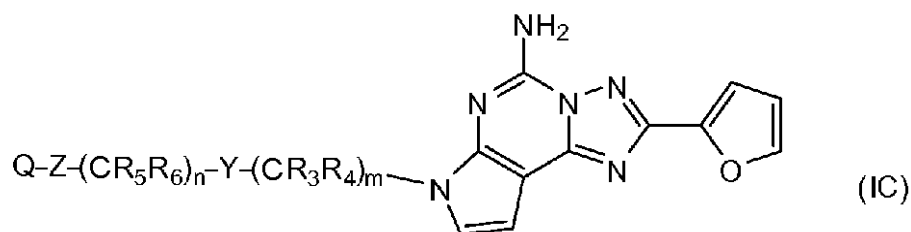
【請求項 11】

アシルが、1 ~ 3 個のハロゲンで置換されていてもよい単環式アロイルである、請求項 10 に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 12】

式：

【化 0 5 0】



(式中の、 R_3 、 R_4 、 R_5 及び R_6 は、水素であり；

m は、2 であり；

n は、2 ～ 4 の整数であり；

Y は、 NR_7 (ここで R_7 は水素又は $C_1 - C_4$ アルキル) であり；

Z は、 NR_8 (ここで R_8 は水素又は $C_1 - C_4$ アルキル) であり；

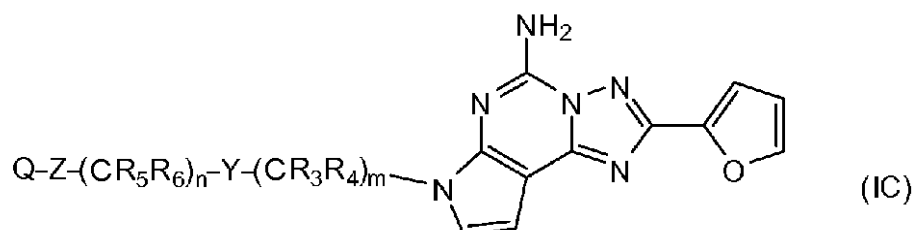
Q は、置換されていてもよい単環式アリールである)；

の請求項 4 に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 1 3】

式：

【化 0 5 1】



(式中の、 R_3 、 R_4 、 R_5 及び R_6 は、水素であり；

m は、1 であり；

n は、1 ～ 4 の整数であり；

Y は、単結合であり；

Z は、 O 、 S 又は NR_8 (ここで R_8 は水素又は $C_1 - C_4$ アルキル) であり；

Q は、置換されていてもよい単環式アリールである)；

の請求項 4 に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 1 4】

Q が、1 ～ 3 個のハロゲンで置換されていてもよい単環式アリールである、請求項 1 2 又は 1 3 に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 1 5】

7 - (2 - (4 - (2, 5 - ジフルオロフェニル) ピペラジン - 1 - イル) エチル) - 2 - (フラン - 2 - イル) - 7 H - ピロロ[3, 2 - e][1, 2, 4] トリアゾロ[1, 5 - c] ピリミジン - 5 - アミン；

7 - (2 - (4 - (2, 4 - ジフルオロベンジル) ピペラジン - 1 - イル) エチル) - 2 - (フラン - 2 - イル) - 7 H - ピロロ[3, 2 - e][1, 2, 4] トリアゾロ[1, 5 - c] ピリミジン - 5 - アミン；

2 - (フラン - 2 - イル) - 7 - (2 - (4 - ((3 - メチルベンゾ[b]チオフェン - 2 - イル) メチル) ピペラジン - 1 - イル) エチル) - 7 H - ピロロ[3, 2 - e][1, 2, 4] トリアゾロ[1, 5 - c] ピリミジン - 5 - アミン

7 - (2 - (4 - (2, 4 - ジフルオロフェネチル) ピペラジン - 1 - イル) エチル) - 2 - (フラン - 2 - イル) - 7 H - ピロロ[3, 2 - e][1, 2, 4] トリアゾロ[1, 5 - c] ピリミジン - 5 - アミン；

7 - (2 - (4 - (3 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) プロピル) ピペラジン - 1 - イル) エチル) - 2 - (フラン - 2 - イル) - 7 H - ピロロ[3, 2 - e][1, 2, 4]

] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 5 - アミン ;
 (4 - (2 - (5 - アミノ - 2 - (フラン - 2 - イル) - 7 H - ピロロ [3 , 2 - e]
 [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) エチル) ピペラジン -
 1 - イル) (2 , 4 - ジフルオロフェニル) メタノン ;
 1 - (4 - (2 - (5 - アミノ - 2 - (フラン - 2 - イル) - 7 H - ピロロ [3 , 2 -
 e] [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) エチル) ピペラジ
 ン - 1 - イル) - 2 - (2 , 4 - ジフルオロフェニル) エタノン ;
 1 - (4 - (2 - (5 - アミノ - 2 - (フラン - 2 - イル) - 7 H - ピロロ [3 , 2 -
 e] [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) エチル) ピペラジ
 ン - 1 - イル) - 3 - (2 , 4 - ジフルオロフェニル) プロパン - 1 - オン ;
 7 - (2 - (4 - (2 , 4 - ジフルオロフェニル) - 1 , 4 - ジアゼパン - 1 - イル)
 エチル) - 2 - (フラン - 2 - イル) - 7 H - ピロロ [3 , 2 - e] [1 , 2 , 4] トリ
 アゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 5 - アミン ;
 7 - (2 - (4 - (2 , 4 - ジフルオロフェニル) ピペリジン - 1 - イル) エチル) -
 2 - (フラン - 2 - イル) - 7 H - ピロロ [3 , 2 - e] [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1
 , 5 - c] ピリミジン - 5 - アミン ;
 7 - (2 - (2 , 4 - ジフルオロフェノキシ) エチル) - 2 - (フラン - 2 - イル) -
 7 H - ピロロ [3 , 2 - e] [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 5 -
 アミン ;
 7 - (2 - (2 , 4 - ジフルオロフェニルチオ) エチル) - 2 - (フラン - 2 - イル)
 - 7 H - ピロロ [3 , 2 - e] [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 5
 - アミン ;
 7 - (2 - (2 , 4 - ジフルオロフェニルアミノ) エチル) - 2 - (フラン - 2 - イル
) - 7 H - ピロロ [3 , 2 - e] [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン -
 5 - アミン ;
 7 - (2 - (4 - (2 , 4 - ジフルオロフェニル) ピペラジン - 1 - イル) プロピル)
 - 2 - (フラン - 2 - イル) - 7 H - ピロロ [3 , 2 - e] [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1
 , 5 - c] ピリミジン - 5 - アミン ;
 7 - (3 - (4 - (2 , 4 - ジフルオロフェニル) ピペラジン - 1 - イル) ブチル) -
 2 - (フラン - 2 - イル) - 7 H - ピロロ [3 , 2 - e] [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1
 , 5 - c] ピリミジン - 5 - アミン ;
 2 - (フラン - 2 - イル) - 7 - (2 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) エチル)
 - 7 H - ピロロ [3 , 2 - e] [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 5
 - アミン ;
 2 - (フラン - 2 - イル) - 7 - (2 - (4 - イソプロピルピペラジン - 1 - イル) エ
 チル) - 7 H - ピロロ [3 , 2 - e] [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジ
 ン - 5 - アミン ;
 7 - (2 - (4 - シクロペンチルピペラジン - 1 - イル) エチル) - 2 - (フラン - 2
 - イル) - 7 H - ピロロ [3 , 2 - e] [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミ
 ジン - 5 - アミン ;
 7 - (2 - (4 - シクロヘキシルピペラジン - 1 - イル) エチル) - 2 - (フラン - 2
 - イル) - 7 H - ピロロ [3 , 2 - e] [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミ
 ジン - 5 - アミン ;
 7 - (2 - (4 - シクロヘブチルピペラジン - 1 - イル) エチル) - 2 - (フラン - 2
 - イル) - 7 H - ピロロ [3 , 2 - e] [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミ
 ジン - 5 - アミン ;
 7 - (2 - (4 - シクロオクチルピペラジン - 1 - イル) エチル) - 2 - (フラン - 2
 - イル) - 7 H - ピロロ [3 , 2 - e] [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミ
 ジン - 5 - アミン ;
 2 - (フラン - 2 - イル) - 7 - (2 - (4 - フェニルピペラジン - 1 - イル) エチル

7 - (2 - (4 - (2 , 4 - ジメチルフェニル) ピペラジン - 1 - イル) エチル) - 2 - (フラン - 2 - イル) - 7 H - ピロロ [3 , 2 - e] [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 5 - アミン ;

2 - (フラン - 2 - イル) - 7 - (2 - (4 - (3 - メトキシ - 5 - (トリフルオロメチル)フェニル)ピペラジン - 1 - イル)エチル) - 7 H - ピロロ [3 , 2 - e] [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 5 - アミン ;

7 - (2 - (4 - (3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル)フェニル)ピペラジン - 1 - イル)エチル) - 2 - (フラン - 2 - イル) - 7 H - ピロロ [3 , 2 - e] [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 5 - アミン ;

2 - (フラン - 2 - イル) - 7 - (2 - (4 - (4 - ニトロフェニル)ピペラジン - 1 - イル)エチル) - 7 H - ピロロ [3 , 2 - e] [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 5 - アミン ;

2 - (フラン - 2 - イル) - 7 - (2 - (4 - (4 - (トリフルオロメチル)フェニル)ピペラジン - 1 - イル)エチル) - 7 H - ピロロ [3 , 2 - e] [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 5 - アミン ;

2 - (フラン - 2 - イル) - 7 - (2 - (4 - (2 - (トリフルオロメチル)フェニル)ピペラジン - 1 - イル)エチル) - 7 H - ピロロ [3 , 2 - e] [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 5 - アミン ;

2 - (フラン - 2 - イル) - 7 - (2 - (4 - (4 - イソプロピオフェニル)ピペラジン - 1 - イル)エチル) - 7 H - ピロロ [3 , 2 - e] [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 5 - アミン ;

7 - (2 - (4 - (4 - ブチルフェニル)ピペラジン - 1 - イル)エチル) - 2 - (フラン - 2 - イル) - 7 H - ピロロ [3 , 2 - e] [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 5 - アミン ;

7 - (2 - (4 - (4 - t - ブチルフェニル)ピペラジン - 1 - イル)エチル) - 2 - (フラン - 2 - イル) - 7 H - ピロロ [3 , 2 - e] [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 5 - アミン ;

7 - (2 - (4 - (3 , 4 - ジメトキシフェニル)ピペラジン - 1 - イル)エチル) - 2 - (フラン - 2 - イル) - 7 H - ピロロ [3 , 2 - e] [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 5 - アミン ;

2 - (フラン - 2 - イル) - 7 - (2 - (4 - (2 - (メチルチオ)フェニル)ピペラジン - 1 - イル)エチル) - 7 H - ピロロ [3 , 2 - e] [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 5 - アミン ;

2 - (フラン - 2 - イル) - 7 - (2 - (4 - (3 - (メチルチオ)フェニル)ピペラジン - 1 - イル)エチル) - 7 H - ピロロ [3 , 2 - e] [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 5 - アミン ;

2 - (フラン - 2 - イル) - 7 - (2 - (4 - (4 - (トリフルオロメトキシ)フェニル)ピペラジン - 1 - イル)エチル) - 7 H - ピロロ [3 , 2 - e] [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 5 - アミン ;

2 - (フラン - 2 - イル) - 7 - (2 - (4 - (ピリジン - 2 - イル)ピペラジン - 1 - イル)エチル) - 7 H - ピロロ [3 , 2 - e] [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 5 - アミン ;

2 - (フラン - 2 - イル) - 7 - (2 - (4 - (ピリジン - 3 - イル)ピペラジン - 1 - イル)エチル) - 7 H - ピロロ [3 , 2 - e] [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 5 - アミン ;

2 - (フラン - 2 - イル) - 7 - (2 - (4 - (ピリジン - 4 - イル)ピペラジン - 1 - イル)エチル) - 7 H - ピロロ [3 , 2 - e] [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 5 - アミン ;

7 - (2 - (4 - (ベンゾ [d] イソチアゾル - 3 - イル)ピペラジン - 1 - イル)エチル) - 2 - (フラン - 2 - イル) - 7 H - ピロロ [3 , 2 - e] [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 5 - アミン ;

7 - (2 - (4 - (3 - クロロ - 5 - (トリフルオロメチル)ピリジン - 2 - イル)ピペラジン - 1 - イル)エチル) - 2 - (フラン - 2 - イル) - 7 H - ピロロ [3 , 2 - e]

[1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 5 - アミン ;

メチル 5 - (4 - (2 - (5 - アミノ - 2 - (フラン - 2 - イル) - 7 H - ピロロ [3 , 2 - e] [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) エチル) ピペラジン - 1 - イル) - 7 - (トリフルオロメチル) チエノ [3 , 2 - b] ピリジン - 3 - カルボキシレート ;

7 - (2 - (4 - (1 H - インドル - 4 - イル) ピペラジン - 1 - イル) エチル) - 2 - (フラン - 2 - イル) - 7 H - ピロロ [3 , 2 - e] [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 5 - アミン ;

5 - (4 - (2 - (5 - アミノ - 2 - (フラン - 2 - イル) - 7 H - ピロロ [3 , 2 - e] [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) エチル) ピペラジン - 1 - イル) - 4 - ニトロチオフエン - 2 - スルホンアミド ;

7 - (2 - (4 - (ベンゾ [d] [1 , 3] ジオキシオル - 5 - イルメチル) ピペラジン - 1 - イル) エチル) - 2 - (フラン - 2 - イル) - 7 H - ピロロ [3 , 2 - e] [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 5 - アミン ;

7 - (2 - (4 - ((3 , 5 - ジメチル - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾル - 4 - イル) メチル) ピペラジン - 1 - イル) エチル) - 2 - (フラン - 2 - イル) - 7 H - ピロロ [3 , 2 - e] [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 5 - アミン ;

5 - (4 - (2 - (5 - アミノ - 2 - (フラン - 2 - イル) - 7 H - ピロロ [3 , 2 - e] [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) エチル) ピペラジン - 1 - イル) メチル) 1 , 3 - ジメチルピリミジン - 2 , 4 - (1 H , 3 H) - ジオン ;

2 - (フラン - 2 - イル) - 7 - (2 - (4 - (2 - メトキシフェニル) ピペラジン - 1 - イル) エチル) - 7 H - ピロロ [3 , 2 - e] [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 5 - アミン ;

7 - (2 - (4 - フルオロフェノキシ) エチル) - 2 - (フラン - 2 - イル) - 7 H - ピロロ [3 , 2 - e] [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 5 - アミン ;

7 - (3 - (4 - (2 , 4 - ジフルオロフェニル) ピペラジン - 1 - イル) プロピル) - 2 - (フラン - 2 - イル) - 7 H - ピロロ [3 , 2 - e] [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 5 - アミン ;

7 - (1 - (4 - (2 , 4 - ジフルオロフェニル) ピペラジン - 1 - イル) プロパン - 2 - イル) - 2 - (フラン - 2 - イル) - 7 H - ピロロ [3 , 2 - e] [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 5 - アミン ;

7 - (4 - (4 - (2 , 4 - ジフルオロフェニル) ピペラジン - 1 - イル) - 2 - ブチニル) - 2 - (フラン - 2 - イル) - 7 H - ピロロ [3 , 2 - e] [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 5 - アミン ;

7 - (4 - (4 - (2 , 4 - ジフルオロフェニル) ピペラジン - 1 - イル) ブタン - 2 - イル) - 2 - (フラン - 2 - イル) - 7 H - ピロロ [3 , 2 - e] [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 5 - アミン ;

7 - (3 - (4 - (2 , 4 - ジフルオロフェニル) ピペラジン - 1 - イル) - 2 - メチルプロピル) - 2 - (フラン - 2 - イル) - 7 H - ピロロ [3 , 2 - e] [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 5 - アミン ;

N¹ - (2 - (5 - アミノ - 2 - (フラン - 2 - イル) - 7 H - ピロロ [3 , 2 - e] [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) エチル) - N⁴ - (2 , 4 - ジフルオロフェニル) ブタン - 1 , 4 - ジアミン ;

N¹ - (2 - (5 - アミノ - 2 - (フラン - 2 - イル) - 7 H - ピロロ [3 , 2 - e] [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) エチル) - N² - (2 , 4 - ジフルオロフェニル) - N² - エチルエタン - 1 , 2 - ジアミン ;

N¹ - (2 - (5 - アミノ - 2 - (フラン - 2 - イル) - 7 H - ピロロ [3 , 2 - e] [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) エチル) - N² - (2 , 4 - ジフルオロフェニル) - N¹ - エチルエタン - 1 , 2 - ジアミン ;

N¹ - (2 - (5 - アミノ - 2 - (フラン - 2 - イル) - 7 H - ピロロ [3 , 2 - e]

[1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) エチル) - N³ - (2 , 4 - ジフルオロフェニル) - N¹ - メチルプロパン - 1 , 3 - ジアミン ;
 N¹ - (2 - (5 - アミノ - 2 - (フラン - 2 - イル) - 7 H - ピロロ [3 , 2 - e] [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) エチル) - N⁴ - (2 , 4 - ジフルオロフェニル) - N¹ - メチルブタン - 1 , 4 - ジアミン ;
 N¹ - (2 - (5 - アミノ - 2 - (フラン - 2 - イル) - 7 H - ピロロ [3 , 2 - e] [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) エチル) - N² - (2 , 4 - ジフルオロフェニル) - N¹ , N² - ジメチルエタン - 1 , 2 - ジアミン ;
 7 - (2 - (4 - (2 , 4 - ジフルオロフェニル) ピペラジン - 1 - イル) エチル - 2 - (フラン - 2 - イル) - 7 H - ピロロ [3 , 2 - e] [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 5 - アミン ;
 7 - (2 - (4 - (2 , 4 - ジフルオロフェニル) ピペラジン - 1 - イル) エチル - 2 - フェニル - 7 H - ピロロ [3 , 2 - e] [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 5 - アミン ;
 7 - (4 - (4 - (2 , 4 - ジフルオロフェニル) ピペラジン - 1 - イル) ブチル - 2 - (フラン - 2 - イル) - 7 H - ピロロ [3 , 2 - e] [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 5 - アミン ;
 7 - (5 - (4 - (2 , 4 - ジフルオロフェニル) ピペラジン - 1 - イル) ペンチル - 2 - (フラン - 2 - イル) - 7 H - ピロロ [3 , 2 - e] [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 5 - アミン ;
 7 - (2 - (2 - (4 - (2 , 4 - ジフルオロフェニル) ピペラジン - 1 - イル) エトキシ) エチル) - 2 - (フラン - 2 - イル) - 7 H - ピロロ [3 , 2 - e] [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 5 - アミン ;
 (E) - 7 - (4 - (4 - (2 , 4 - ジフルオロフェニル) ピペラジン - 1 - イル) - 2 - ブテニル) - 2 - (フラン - 2 - イル) - 7 H - ピロロ [3 , 2 - e] [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 5 - アミン ;
 (Z) - 7 - (4 - (4 - (2 , 4 - ジフルオロフェニル) ピペラジン - 1 - イル) - 2 - ブテニル) - 2 - (フラン - 2 - イル) - 7 H - ピロロ [3 , 2 - e] [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 5 - アミン ;
 7 - (2 - (4 - (2 , 4 - ジフルオロフェニル) ピペラジン - 1 - イル) エチル) - 2 - (チオフェン - 2 - イル) - 7 H - ピロロ [3 , 2 - e] [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 5 - アミン ;
 7 - (2 - (4 - (2 , 4 - ジフルオロフェニル) ピペラジン - 1 - イル) エチル) - 2 - (テトラヒドロフラン - 2 - イル) - 7 H - ピロロ [3 , 2 - e] [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 5 - アミン ;
 2 - (ベンゾフラン - 2 - イル) - 7 - (2 - (4 - (2 , 4 - ジフルオロフェニル) ピペラジン - 1 - イル) エチル) - 7 H - ピロロ [3 , 2 - e] [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 5 - アミン ;
 7 - (2 - (4 - (2 , 4 - ジフルオロフェニル) ピペラジン - 1 - イル) エチル) - 2 - (ピリジン - 2 - イル) - 7 H - ピロロ [3 , 2 - e] [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 5 - アミン ;
 7 - (2 - (4 - (2 , 4 - ジフルオロフェニル) ピペラジン - 1 - イル) エチル) - 2 - (ピリジン - 3 - イル) - 7 H - ピロロ [3 , 2 - e] [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 5 - アミン ;
 2 - (5 - アミノ - 7 - (2 - (4 - (2 , 4 - ジフルオロフェニル) ピペラジン - 1 - イル) エチル) - 7 H - ピロロ [3 , 2 - e] [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 2 - イル) フェノール ; 及び
 7 - (2 - (4 - (2 , 4 - ジフルオロフェニル) ピペラジン - 1 - イル) エチル) - 2 - (フラン - 3 - イル) - 7 H - ピロロ [3 , 2 - e] [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 5 - アミン ;

よりなる群から選ばれる、請求項 1 に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 16】

請求項 1 ～ 15 の何れか一項に記載の少なくとも 1 つの化合物を含有する、医薬組成物。

【請求項 17】

A_{2A} 受容体活性が介在する疾患の治療のための、請求項 16 に記載の医薬組成物。

【請求項 18】

A_{2A} 受容体活性が介在する疾患が、うつ病、認知疾患、及び神経変性疾患よりなる群から選ばれる、請求項 17 に記載の医薬組成物。

【請求項 19】

A_{2A} 受容体活性が介在する疾患が、パーキンソン病、老人性認知症、器質因性精神障害、注意欠陥障害、錐体外路症候群、緊張異常、下肢静止不能症候群、睡眠時周期的脚運動、肝硬変、線維症及び脂肪肝、皮膚線維症、及び常習行為よりなる群から選ばれる、請求項 17 に記載の医薬組成物。

【請求項 20】

A_{2A} 受容体活性が介在する疾患がパーキンソン病である、請求項 19 に記載の医薬組成物。

【請求項 21】

A_{2A} 受容体活性が介在する疾患が肝硬変である、請求項 19 に記載の医薬組成物。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

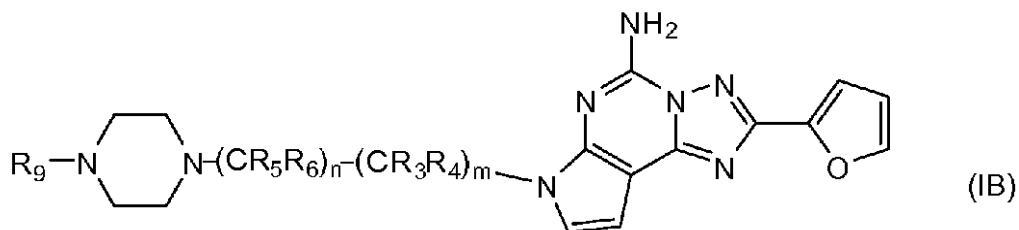
【補正対象項目名】0103

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0103】

【化008】



【手続補正 3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0111

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0111】

【化009】

