

【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24年11月22日(2012.11.22)

【公表番号】特表2012-509332(P2012-509332A)

【公表日】平成24年4月19日(2012.4.19)

【年通号数】公開・登録公報2012-016

【出願番号】特願2011-537547(P2011-537547)

【国際特許分類】

| | |
|---------------|-----------|
| C 07 D 487/04 | (2006.01) |
| A 61 P 43/00 | (2006.01) |
| A 61 P 29/00 | (2006.01) |
| A 61 P 25/06 | (2006.01) |
| A 61 P 25/16 | (2006.01) |
| A 61 P 25/28 | (2006.01) |
| A 61 P 25/00 | (2006.01) |
| A 61 P 1/04 | (2006.01) |
| A 61 P 25/24 | (2006.01) |
| A 61 P 25/18 | (2006.01) |
| A 61 P 25/22 | (2006.01) |
| A 61 P 25/08 | (2006.01) |
| A 61 P 27/06 | (2006.01) |
| A 61 P 11/00 | (2006.01) |
| A 61 P 1/14 | (2006.01) |
| A 61 P 11/02 | (2006.01) |
| A 61 P 11/06 | (2006.01) |
| A 61 P 9/10 | (2006.01) |
| A 61 P 37/06 | (2006.01) |
| A 61 P 17/04 | (2006.01) |
| A 61 P 17/06 | (2006.01) |
| A 61 P 3/04 | (2006.01) |
| A 61 P 3/06 | (2006.01) |
| A 61 P 1/12 | (2006.01) |
| A 61 P 9/12 | (2006.01) |
| A 61 P 35/00 | (2006.01) |
| A 61 P 13/12 | (2006.01) |
| A 61 P 13/00 | (2006.01) |
| A 61 P 13/10 | (2006.01) |
| A 61 P 1/00 | (2006.01) |
| A 61 K 31/519 | (2006.01) |
| A 61 K 31/55 | (2006.01) |

【F I】

| | |
|---------------|-------|
| C 07 D 487/04 | 1 4 0 |
| C 07 D 487/04 | C S P |
| A 61 P 43/00 | |
| A 61 P 29/00 | |
| A 61 P 25/06 | |
| A 61 P 25/16 | |
| A 61 P 25/28 | |
| A 61 P 25/00 | |

A 6 1 P 29/00 1 0 1
 A 6 1 P 1/04
 A 6 1 P 25/24
 A 6 1 P 25/18
 A 6 1 P 25/22
 A 6 1 P 25/08
 A 6 1 P 27/06
 A 6 1 P 11/00
 A 6 1 P 1/14
 A 6 1 P 11/02
 A 6 1 P 11/06
 A 6 1 P 9/10 1 0 3
 A 6 1 P 37/06
 A 6 1 P 17/04
 A 6 1 P 17/06
 A 6 1 P 3/04
 A 6 1 P 3/06
 A 6 1 P 1/12
 A 6 1 P 9/12
 A 6 1 P 35/00
 A 6 1 P 13/12
 A 6 1 P 13/00
 A 6 1 P 13/10
 A 6 1 P 1/00
 A 6 1 K 31/519
 A 6 1 K 31/55

【手続補正書】

【提出日】平成24年10月4日(2012.10.4)

【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

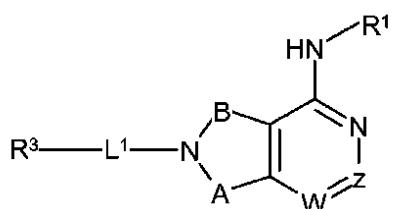
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式:

【化83】



I

(式中、

各AおよびBは、独立して、C₂^aR₂^bであり、WおよびZは、独立して、NまたはC₂⁴であり、L¹は、単結合、置換または非置換のC₁~C₅アルキレン、-CO-、-NHCO-

) - 、 - O C (O) - 、 - S O - 、 または S (O)₂ - であり、

R¹ は、置換または非置換のアリールまたはヘテロアリールから選択され、

各 R^{2a} および R^{2b} は、水素、および置換または非置換の C₁ ~ C₆ アルキルから独立して選択され、

R³ は、置換または非置換の C₁ ~ C₆ アルキル、置換または非置換の C₃ ~ C₈ シクロアルキル、置換または非置換のヘテロシクロアルキル、置換または非置換のアリール、および置換または非置換のヘテロアリールから選択され、

R⁴ は、H、C₁ ~ C₆ アルキル、置換 C₁ ~ C₆ アルキル、アシル、置換アシル、置換または非置換のアシルアミノ、置換または非置換のアミノ、置換または非置換のアルコキシ、アルコキシカルボニル、置換アルコキシカルボニルアリールアルキルオキシ、置換アリールアルキルオキシ、アミノ、アリール、置換アリール、アリールアルキル、置換アリールアルキル、置換スルファニル、置換スルフィニル、置換スルホニル、置換または非置換のアミノスルホニル、スルホ、スルホン酸エステル、アジド、カルボキシ、置換または非置換のカルバモイル、シアノ、置換または非置換の C₃ ~ C₈ シクロアルキル、置換または非置換のヘテロシクロアルキル、ハロ、ヘテロアリールオキシ、置換または非置換のヘテロアリール、ヒドロキシ、ニトロ、およびチオールから独立して選択される) を有する化合物であって、

該化合物は、

N - [5 - (1 , 1 - ジメチルエチル) - 2 - メチルフェニル] - 6 , 7 - ジヒドロ - 2 - [4 - (4 - メトキシフェニル) - 1 - ピペラジニル] - 6 - (メチルスルホニル) - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - アミン ;

4 - [[5 - (1 , 1 - ジメチルエチル) - 2 - メチルフェニル] アミノ] - 5 , 7 - ジヒドロ - 2 - [4 - (4 - メトキシフェニル) - 1 - ピペラジニル] - 6 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 6 - カルボン酸 1 , 1 - ジメチルエチルエステル ;

2 - クロ口 - 4 - [[3 - (ジメチルアミノ) - 5 - メトキシフェニル] アミノ] - 5 , 7 - ジヒドロ - 6 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 6 - カルボン酸 9 H - フルオレン - 9 - イルメチルエステル ;

2 - クロ口 - 5 , 7 - ジヒドロ - 4 - [(5 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イル) アミノ] - 6 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 6 - カルボン酸 9 H - フルオレン - 9 - イルメチルエステル、および

N - (2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 2 - イル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 2 - (メチルチオ) - 6 - (フェニルメチル) - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - アミン以外であることを条件とする、化合物、またはその薬学的に許容可能な塩、溶媒和物、もしくはプロドラッグ；ならびにその立体異性体、同位体変異体、および互変異性体。

【請求項 2】

L¹ は、 - C O - 、 - N H C (O) - 、 - O C (O) - 、 - S O - または - S (O)₂ - である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

L¹ は単結合、あるいは置換または非置換の C₁ ~ C₅ アルキレンである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 4】

A は C H R^{2b} または C H₂ であり、B は C H R^{2b} または C H₂ である、あるいは、A および B はそれぞれ C H₂ である、請求項 1 から 3 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 5】

R¹ は置換または非置換のフェニル、あるいは置換または非置換のヘテロアリールである、請求項 1 から 4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 6】

R¹ は、置換または非置換のピリジル、キノリニル、イソキノリニル、置換または非置換のベンゾジオキソール、置換または非置換のベンゾジオキサン、置換または非置換のベンゾフラン、置換または非置換のベンゾチオフェン、および置換または非置換のベンゾジオ

キセピンである、請求項 1 から 5 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 7】

R¹ は置換または非置換のキノリン - 3 - イルである、請求項 1 から 6 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 8】

L¹ は、 - C H₂ - 、 - C (M e) H - 、 - C H₂ C H₂ - 、 - C (M e) H C H₂ - 、または - C H₂ C (M e) H - である、請求項 1 および 3 から 7 のいずれか 1 項に記載の化合物。

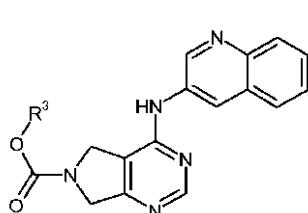
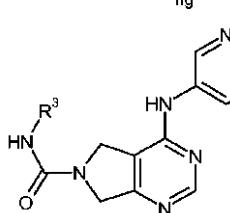
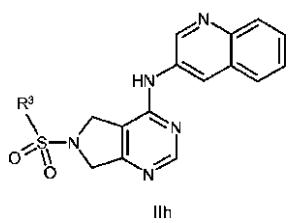
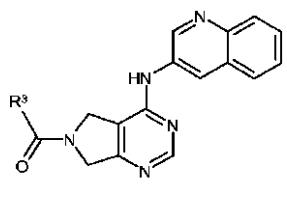
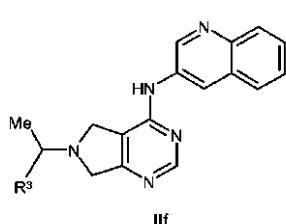
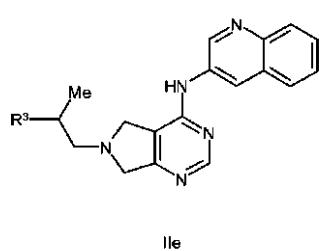
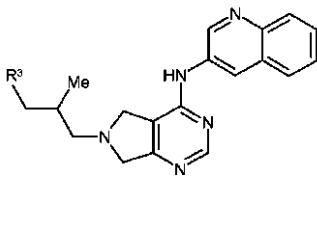
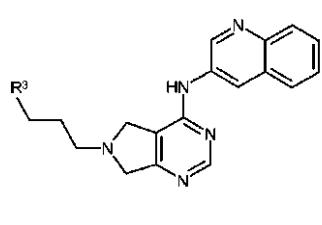
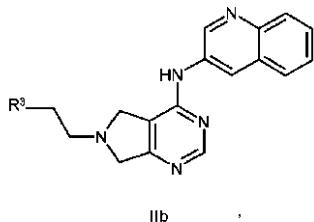
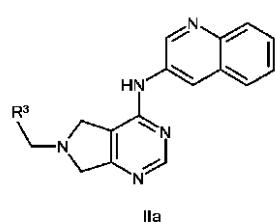
【請求項 9】

W は N であり、Z は C R⁴ であり、R⁴ は、H、M e、C F₃、C l、または F である、請求項 1 から 8 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 10】

前記化合物が、式 I I a、I I b、I I c、I I d、I I e、I I f、I I g、I I h、I I i、または I I j :

【化 8 6】



または

(式中、R³は請求項1の通りである)の化合物である、請求項1に記載の化合物。

【請求項11】

R³は、C1、F、またはOHで置換されたC₁~C₆アルキルである、請求項1から10のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項12】

R³は、Me、Et、n-Pr、i-Pr、n-Bu、t-Bu、2,2-ジメチルプロピル、2-メチルプロピル、またはCF₃である、請求項1から10のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項13】

R³は、非置換であるか、ハロ、ヒドロキシル、C₁~C₆アルキル、アルコキシ、およびハロアルキルから独立して選択される1つまたは複数の置換基で置換されたC₃~C₈シクロアルキルである、請求項1から10のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項14】

R³は、非置換であるか、ハロ、ヒドロキシル、C₁~C₆アルキル、アルコキシ、およびハロC₁~C₆アルキルから独立して選択される1つまたは複数の置換基で置換されたピロリジニル、ピペリジニル、モルホリニル、テトラヒドロピラニル、またはピペラジニルである、請求項1から10のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項15】

R³は、非置換であるか、ハロ、ヒドロキシル、アミノ、シアノ、スルホ、置換スルファンil、置換スルフィニル、置換スルホニル、置換または非置換のアミド、置換または非置換のアミノ、カルボキシ、C₁~C₆アルコキシカルボニル、C₁~C₆アルキル、置換C₁~C₆アルキル、アルケニル、置換アルケニル、アルキニル、置換アルキニル、およびスルホンアミドから独立して選択される1つまたは複数の置換基で置換されたフェニルまたはピリジルである、請求項1から10のいずれか1項に記載の化合物。

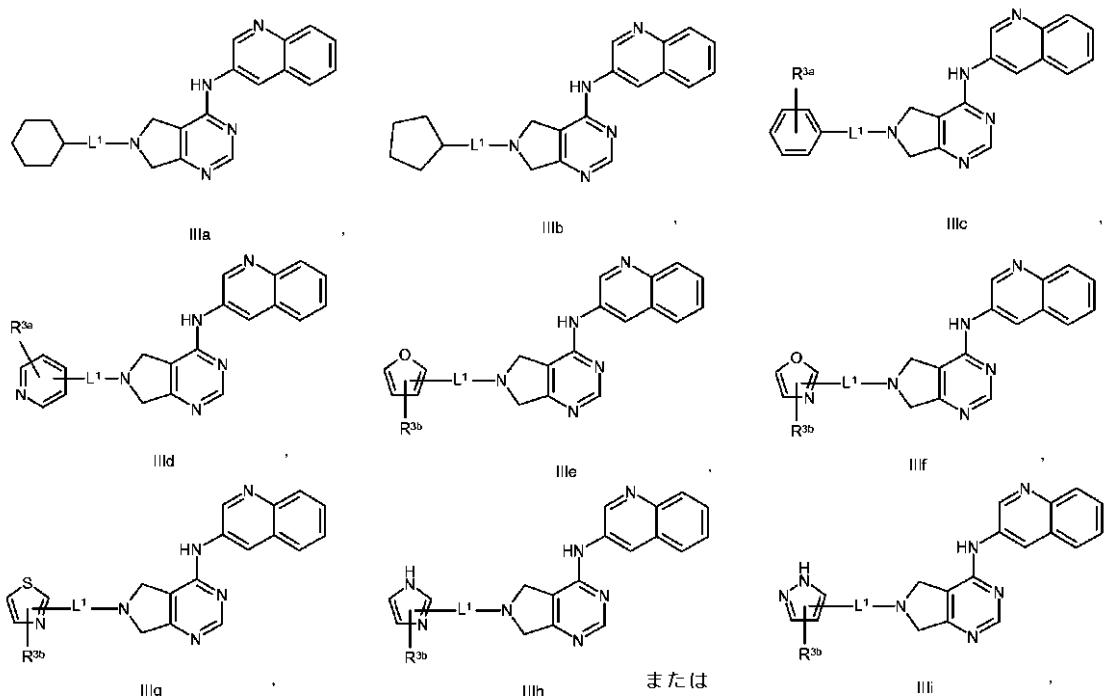
【請求項16】

R³は、非置換であるか、ハロ、ヒドロキシル、アミノ、シアノ、スルホ、置換スルホニル、置換スルファンil、アミド、カルボキシ、C₁~C₆アルコキシカルボニル、C₁~C₆アルキル、置換C₁~C₆アルキル、アルケニル、置換アルケニル、アルキニル、置換アルキニル、およびスルホンアミドから独立して選択される1つまたは複数の置換基で置換されたビリミジニル、キノリニル、イソキノリニル、インドリル、インダゾリル、ベンゾフラニル、ベンゾチオフェニル、ベンゾオキサジニル、ベンズジオキソラニル、ピロリル、フラニル、ピラゾリル、イミダゾリル、トリアゾリル、オキサゾリル、チエニル、チアゾリル、オキサジアゾリル、またはチアジアゾリルである、請求項1から10のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項17】

前記化合物が、式IIIa、IIIb、IIIC、IIID、IIIE、IIIF、IIIG、IIIH、またはIIII :

【化 8 7】

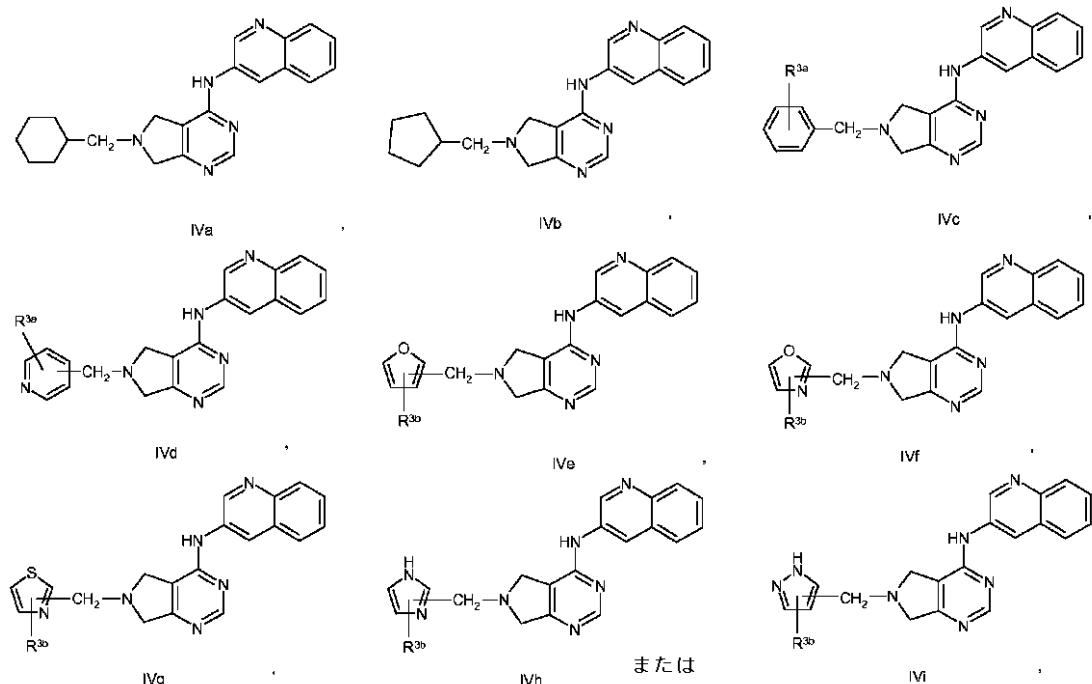


(式中、 L^1 は、単結合、 $-CH_2-$ 、 $-CO-$ 、 $-NHCO(O)-$ 、 $-OCC(O)-$ 、
または $S(O)_2$ であり、 R^{3a} は、H、アルキル、アルコキシ、ハロ、ハロアルキル、
チオアルキル、またはハロアルキルオキシであり、 R^{3b} はHまたはアルキルである)の
化合物である、請求項1に記載の化合物。

【請求項18】

前記化合物が、式IVa、IVb、IVc、IVd、IVe、IVf、IVg、IVh、
またはIVi：

【化 8 8】

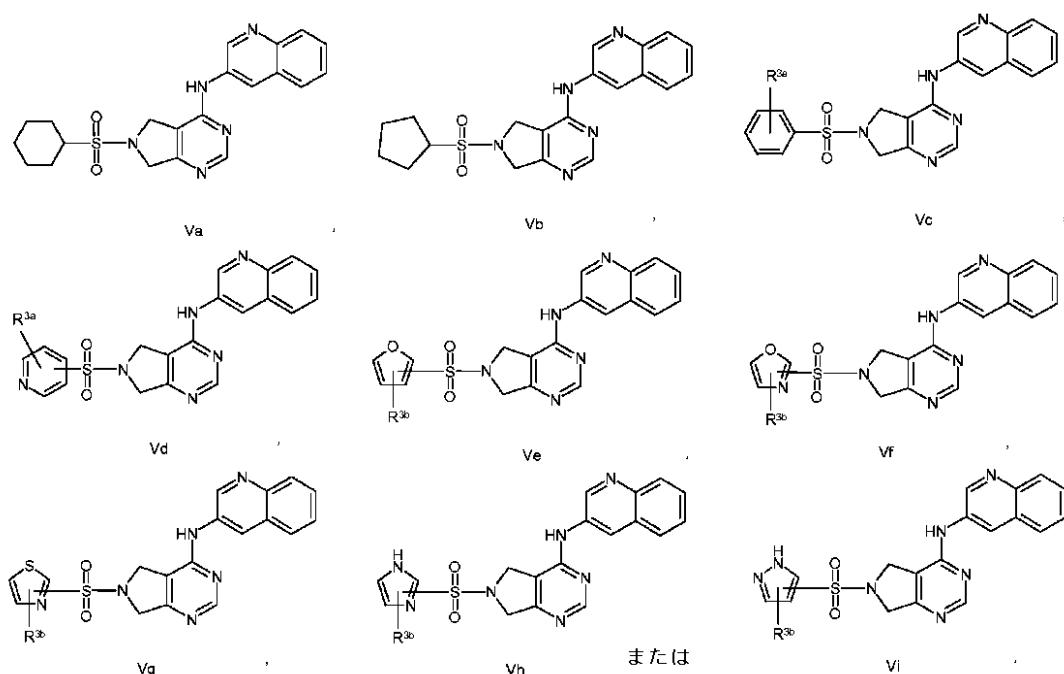


(式中、 R^{3a} は、H、アルキル、アルコキシ、ハロ、ハロアルキル、チオアルキル、
またはハロアルキルオキシであり、 R^{3b} はHまたはアルキルである)の化合物である、
請求項1に記載の化合物。

【請求項19】

前記化合物が、式 V a、V b、V c、V d、V e、V f、V g、V h、またはV i：

【化 8 9】



(式中、R^{3a}は、H、アルキル、アルコキシ、ハロ、ハロアルキル、チオアルキル、またはハロアルキオキシであり、R^{3b}はHまたはアルキルである)の化合物である、請求項1に記載の化合物。

【請求項20】

前記化合物が、以下：

- (6 - ベンジル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル) - キノリン - 3 - イル - アミン ;
- (6 - シクロヘキシルメチル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル) - キノリン - 3 - イル - アミン ;
- (6 - シクロペンチルメチル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル) - キノリン - 3 - イル - アミン ;
- [6 - (2 - エチル - プチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
- [6 - (2 - メチル - ピリジン - 3 - イルメチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
- キノリン - 3 - イル - [6 - (テトラヒドロ - チオピラン - 4 - イルメチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - アミン ;
- [6 - (2 - フェニル - プロピル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
- (6 - フェネチル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル) - キノリン - 3 - イル - アミン ;
- [6 - (2 , 4 - ジメチル - チアゾール - 5 - イルメチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
- キノリン - 3 - イル - [6 - (テトラヒドロ - ピラン - 4 - イルメチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - アミン ;
- [6 - (1 - シクロヘキシル - エチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
- キノリン - 3 - イル - [6 - (トルエン - 2 - スルホニル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - アミン ;
- [6 - (4 - メチル - チアゾール - 5 - イルメチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口

[3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
5 - [4 - (キノリン - 3 - イルアミノ) - 5 , 7 - ジヒドロ - ピロ口 [3 , 4 - d] ピ
リミジン - 6 - スルホニル] - フラン - 2 - カルボン酸メチルエステル ;
[6 - (3 - メチル - ピリジン - 4 - イルメチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
[6 - (2 - フルオロ - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピ
リミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
[6 - (2 - メトキシ - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピ
リミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
[6 - (2 - クロロ - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリ
ミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
[6 - (3 - メチル - フラン - 2 - イルメチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
[6 - (2 , 3 - ジメチル - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
[6 - (2 , 5 - ジメチル - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
[6 - (2 - エチル - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリ
ミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
[6 - (2 - メチル - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリ
ミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
(6 - ピリジン - 4 - イルメチル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリ
ミジン - 4 - イル) - キノリン - 3 - イル - アミン ;
キノリン - 3 - イル - [6 - (2 - トリフルオロメチル - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ
- 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - アミン ;
[6 - (2 - エチル - 4 - メチル - チアゾール - 5 - イルメチル) - 6 , 7 - ジヒドロ
- 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
キノリン - 3 - イル - [6 - (2 - トリフルオロメトキシ - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒド
ロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - アミン ;
キノリン - 3 - イル - [6 - (3 - トリフルオロメチル - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ
- 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - アミン ;
[6 - (2 - エトキシ - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピ
リミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
[6 - (2 , 3 - ジヒドロ - ベンゾフラン - 7 - イルメチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H
- ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
[6 - (2 - メチルスルファニル - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 ,
4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
(6 - ベンゾ [1 , 3] ジオキソール - 4 - イルメチル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ
口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル) - キノリン - 3 - イル - アミン ;
キノリン - 3 - イル - [6 - (3 - トリフルオロメトキシ - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒド
ロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - アミン ;
[6 - (2 - ジフルオロメトキシ - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 ,
4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
(6 - ベンジル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル
) - キノリン - 3 - イル - アミン ;
(6 - シクロヘキシリメチル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジ
ン - 4 - イル) - キノリン - 3 - イル - アミン ;
(6 - エチル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル)
- キノリン - 3 - イル - アミン ;
(6 - プロピル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル

) - キノリン - 3 - イル - アミン ;
(6 - シクロプロピルメチル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル) - キノリン - 3 - イル - アミン ;
(6 - プチル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル) - キノリン - 3 - イル - アミン ;
(6 - イソブチル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル) - キノリン - 3 - イル - アミン ;
[6 - (2 - メチル - ブチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
[6 - (3 - メチル - ブチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
(6 - ペンチル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル) - キノリン - 3 - イル - アミン ;
[6 - (2 , 2 - ジメチル - プロピル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
(6 - シクロペンチルメチル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル) - キノリン - 3 - イル - アミン ;
キノリン - 3 - イル - [6 - (テトラヒドロ - フラン - 3 - イルメチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - アミン ;
[6 - (2 - エチル - ブチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
[6 - (3 , 3 - ジメチル - ブチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
キノリン - 3 - イル - [6 - (テトラヒドロ - ピラン - 3 - イルメチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - アミン ;
[6 - (2 - メチル - ピリジン - 3 - イルメチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
キノリン - 3 - イル - [6 - (テトラヒドロ - チオピラン - 4 - イルメチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - アミン ;
[6 - (2 - フェニル - プロピル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
4 - [4 - (キノリン - 3 - イルアミノ) - 5 , 7 - ジヒドロ - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 6 - イル] - ブタン - 1 - オール ;
(6 - シクロブチルメチル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル) - キノリン - 3 - イル - アミン ;
(6 - フェネチル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル) - キノリン - 3 - イル - アミン ;
(6 - シクロヘキシル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル) - キノリン - 3 - イル - アミン ;
[6 - (2 - メチル - 2 H - ピラゾール - 3 - イルメチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
[6 - (2 - メチル - チアゾール - 4 - イルメチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
[6 - (1 , 5 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イルメチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
[6 - (1 - メチル - ピペリジン - 4 - イルメチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
[6 - (2 , 4 - ジメチル - チアゾール - 5 - イルメチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
[6 - (3 - メチル - オキセタン - 3 - イルメチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口

[3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
キノリン - 3 - イル - [6 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロ - エチル) - 6 , 7 - ジヒドロ
- 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - アミン ;
キノリン - 3 - イル - [6 - (3 , 3 , 3 - トリフルオロ - プロピル) - 6 , 7 - ジヒドロ
- 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - アミン ;
[6 - (1 , 2 - ジメチル - プロピル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d
] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
キノリン - 3 - イル - [6 - (テトラヒドロ - ピラン - 4 - イルメチル) - 6 , 7 - ジヒ
ドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - アミン ;
(6 - イソプロピル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 -
イル) - キノリン - 3 - イル - アミン ;
(6 - sec - ブチル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4
- イル) - キノリン - 3 - イル - アミン ;
[6 - (1 - シクロブチル - エチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d]
ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
[6 - (1 - シクロペンチル - エチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d
] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
[6 - (1 - シクロヘキシル - エチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d
] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
キノリン - 3 - イル - [6 - (1 , 3 , 3 - トリメチル - ブチル) - 6 , 7 - ジヒドロ -
5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - アミン ;
(6 - シクロヘプチル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4
- イル) - キノリン - 3 - イル - アミン ;
(6 - シクロペンチル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4
- イル) - キノリン - 3 - イル - アミン ;
[6 - (1 - メチル - ブチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミ
ジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
(6 - シクロブチル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 -
イル) - キノリン - 3 - イル - アミン ;
(6 - オキセタン - 3 - イル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミ
ジン - 4 - イル) - キノリン - 3 - イル - アミン ;
4 - (キノリン - 3 - イルアミノ) - 5 , 7 - ジヒドロ - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジ
ン - 6 - カルボン酸 t e r t - ブチルエステル ;
4 - (キノリン - 3 - イルアミノ) - 5 , 7 - ジヒドロ - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジ
ン - 6 - カルボン酸シクロヘキシルメチル - アミド ;
4 - (キノリン - 3 - イルアミノ) - 5 , 7 - ジヒドロ - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジ
ン - 6 - カルボン酸シクロヘキシルアミド ;
4 - (キノリン - 3 - イルアミノ) - 5 , 7 - ジヒドロ - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジ
ン - 6 - カルボン酸 (2 , 4 - ジメチル - チアゾール - 5 - イルメチル) - アミド ;
(2 , 4 - ジメチル - チアゾール - 5 - イル) - [4 - (キノリン - 3 - イルアミノ) -
5 , 7 - ジヒドロ - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 6 - イル] - メタノン ;
2 - (2 , 4 - ジメチル - チアゾール - 5 - イル) - 1 - [4 - (キノリン - 3 - イルア
ミノ) - 5 , 7 - ジヒドロ - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 6 - イル] - エタノン ;
4 - (キノリン - 3 - イルアミノ) - 5 , 7 - ジヒドロ - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジ
ン - 6 - カルボン酸 (2 , 4 - ジメチル - チアゾール - 5 - イル) - アミド ;
2 - アゼパン - 1 - イル - 1 - [4 - (キノリン - 3 - イルアミノ) - 5 , 7 - ジヒドロ
- ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 6 - イル] - エタノン ;
2 - ピペリジン - 1 - イル - 1 - [4 - (キノリン - 3 - イルアミノ) - 5 , 7 - ジヒド
ロ - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 6 - イル] - エタノン ;
2 - ピロリジン - 1 - イル - 1 - [4 - (キノリン - 3 - イルアミノ) - 5 , 7 - ジヒド

口 - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 6 - イル] - エタノン ;
[6 - (5 - オキサゾール - 5 - イル - チオフェン - 2 - スルホニル) - 6 , 7 - ジヒド
口 - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン
;
[6 - (3 - メチル - チオフェン - 2 - スルホニル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口
[3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
(6 - シクロペンタンスルホニル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリ
ミジン - 4 - イル) - キノリン - 3 - イル - アミン ;
[6 - (2 , 4 - ジフルオロ - ベンゼンスルホニル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口
[3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
キノリン - 3 - イル - [6 - (トルエン - 2 - スルホニル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H -
ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - アミン ;
[6 - (2 - メチル - 2 H - ピラゾール - 3 - スルホニル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H -
ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
[6 - (2 , 4 - ジメチル - チアゾール - 5 - スルホニル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H -
ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
2 - メチル - 5 - [4 - (キノリン - 3 - イルアミノ) - 5 , 7 - ジヒドロ - ピロ口 [3
, 4 - d] ピリミジン - 6 - スルホニル] - フラン - 3 - カルボン酸メチルエステル ;
(6 - フェニルメタンスルホニル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリ
ミジン - 4 - イル) - キノリン - 3 - イル - アミン ;
(6 - シクロヘキサンスルホニル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリ
ミジン - 4 - イル) - キノリン - 3 - イル - アミン ;
(6 - ベンゼンスルホニル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン
- 4 - イル) - キノリン - 3 - イル - アミン ;
[6 - (4 - メチル - チアゾール - 5 - イルメチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口
[3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
[6 - (3 , 5 - ジメチル - イソオキサゾール - 4 - イルメチル) - 6 , 7 - ジヒドロ -
5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
5 - [4 - (キノリン - 3 - イルアミノ) - 5 , 7 - ジヒドロ - ピロ口 [3 , 4 - d] ピ
リミジン - 6 - スルホニル] - フラン - 2 - カルボン酸メチルエステル ;
[6 - (2 - メチル - チアゾール - 5 - イルメチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口
[3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
キノリン - 3 - イル - [6 - (2 - トリフルオロメトキシ - ベンゼンスルホニル) - 6 ,
7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - アミン ;
[6 - (2 - フルオロ - ベンゼンスルホニル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3
, 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
[6 - (2 - クロロ - ベンゼンスルホニル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4
- d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
[6 - (2 - メトキシ - ベンゼンスルホニル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4
- d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
[6 - (2 - メチル - 6 - トリフルオロメチル - ピリジン - 3 - イルメチル) - 6 , 7 -
ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル -
アミン ;
キノリン - 3 - イル - (6 - チアゾール - 4 - イルメチル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H -
ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル) - アミン ;
キノリン - 3 - イル - (6 - チアゾール - 2 - イルメチル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H -
ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル) - アミン ;
[6 - (4 - メチル - チアゾール - 2 - イルメチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口
[3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
[6 - (3 - メチル - ピリジン - 4 - イルメチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [

口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル) - キノリン - 3 - イル - アミン ;
キノリン - 3 - イル - [6 - (3 - トリフルオロメトキシ - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - アミン ;
[6 - (2 - ジフルオロメトキシ - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
[6 - (3 - メトキシ - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
[6 - (2 , 3 - ジフルオロ - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
[6 - (2 - プロポキシ - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
[6 - (1 H - インドール - 7 - イルメチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
[6 - (3 - メチル - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ; および
[6 - (2 - シクロプロピル - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
(6 - ベンジル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル) - キノリン - 3 - イル - アミン ;
(6 - シクロヘキシルメチル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル) - キノリン - 3 - イル - アミン ;
(6 - シクロペンチルメチル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル) - キノリン - 3 - イル - アミン ;
[6 - (2 - エチル - ブチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
[6 - (2 - メチル - ピリジン - 3 - イルメチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
キノリン - 3 - イル - [6 - (テトラヒドロ - チオビラン - 4 - イルメチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - アミン ;
[6 - (2 - フェニル - プロピル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
(6 - フェネチル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル) - キノリン - 3 - イル - アミン ;
[6 - (2 , 4 - ジメチル - チアゾール - 5 - イルメチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
キノリン - 3 - イル - [6 - (テトラヒドロ - ピラン - 4 - イルメチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - アミン ;
[6 - (1 - シクロヘキシル - エチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
キノリン - 3 - イル - [6 - (トルエン - 2 - スルホニル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - アミン ;
[6 - (4 - メチル - チアゾール - 5 - イルメチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
5 - [4 - (キノリン - 3 - イルアミノ) - 5 , 7 - ジヒドロ - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 6 - スルホニル] - フラン - 2 - カルボン酸メチルエステル ;
[6 - (3 - メチル - ピリジン - 4 - イルメチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
[6 - (2 - フルオロ - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピ

リミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
[6 - (2 - メトキシ - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
[6 - (2 - クロロ - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
[6 - (3 - メチル - フラン - 2 - イルメチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
[6 - (2 , 3 - ジメチル - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
[6 - (2 , 5 - ジメチル - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
[6 - (2 - エチル - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
[6 - (2 - メチル - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
(6 - ピリジン - 4 - イルメチル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル) - キノリン - 3 - イル - アミン ;
キノリン - 3 - イル - [6 - (2 - トリフルオロメチル - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - アミン ;
[6 - (2 - エチル - 4 - メチル - チアゾール - 5 - イルメチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
キノリン - 3 - イル - [6 - (2 - トリフルオロメトキシ - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - アミン ;
キノリン - 3 - イル - [6 - (3 - トリフルオロメチル - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - アミン ;
[6 - (2 - エトキシ - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
[6 - (2 , 3 - ジヒドロ - ベンゾフラン - 7 - イルメチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
[6 - (2 - メチルスルファニル - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
(6 - ベンゾ [1 , 3] ジオキソール - 4 - イルメチル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル) - キノリン - 3 - イル - アミン ;
キノリン - 3 - イル - [6 - (3 - トリフルオロメトキシ - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - アミン ;
[6 - (2 - ジフルオロメトキシ - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
[6 - (3 - メトキシ - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
[6 - (2 , 3 - ジフルオロ - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
[6 - (1 H - インドール - 7 - イルメチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
[6 - (3 - メチル - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
[6 - (2 - シクロプロピル - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ; および
[6 - (3 - メチル - ブチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;

から選択される、請求項 1 に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩、溶媒和物

、もしくはプロドラッグ；ならびにその立体異性体、同位体変異体、および互変異性体。

【請求項 2 1】

薬学的に許容可能なキャリアおよび薬学的有効量の請求項 1 から 2 0 のいずれか 1 項に記載の化合物を含む薬学的組成物。

【請求項 2 2】

疼痛（急性、炎症性、および神経因性の疼痛、慢性疼痛、歯痛、および頭痛（片頭痛、群発頭痛、および緊張性頭痛が含まれる）が含まれる）；パーキンソン病、アルツハイマー病、および多発性硬化症；炎症、関節炎、関節リウマチ、および骨関節炎によって媒介されるか、これらを生じる疾患および障害；神経炎症によって媒介されるか、これを生じる疾患および障害、脳炎；中枢神経を介した神経精神疾患および神経精神障害、躁鬱病、双極性疾患、不安、統合失調症、体重および摂食障害、睡眠障害、および認識障害；神経学的および神経変性の疾患および障害；骨障害；皮膚炎；癲癇および発作性障害；前立腺、膀胱および腸管の機能障害、尿失禁、遅延性排尿、直腸過敏症、大便失禁、良性前立腺肥大症および炎症性腸疾患；嗜癖、痙攣、緑内障、呼吸器および気道の疾患および障害、アレルギー性鼻炎、喘息および反応性気道疾患、ならびに慢性閉塞性肺疾患；心筋梗塞；高血圧症；自己免疫疾患および自己免疫障害、疥癬／搔痒、乾癬；肥満；脂質障害；嘔気；嘔吐；癌；および腎障害から選択される疾患または容態の処置または予防において使用するための請求項 2 1 に記載の薬学的組成物。

【請求項 2 3】

請求項 1 から 2 0 のいずれ 1 項に定義の化合物と別の薬学的活性薬剤との組み合わせ物。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 0 3 0

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 0 3 0】

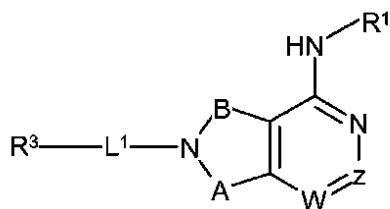
他の目的および利点は、以下の詳細な説明を考慮すると、当業者に明らかとなるであろう。

例えば、本発明は以下の項目を提供する。

(項目 1)

式：

【化 8 3】



I

(式中、

各 A および B は、独立して、C R^{2 a} R^{2 b} であり、

W および Z は、独立して、N または C R⁴ であり、

L¹ は、単結合、置換または非置換の C₁ ~ C₅ アルキレン、-CO-、-NHCO(O)-、-OC(O)-、-SO-、または S(O)₂- であり、

R¹ は、置換または非置換のアリールまたはヘテロアリールから選択され、

各 R^{2 a} および R^{2 b} は、水素、および置換または非置換の C₁ ~ C₆ アルキルから独立して選択され、

R³ は、置換または非置換の C₁ ~ C₆ アルキル、置換または非置換の C₃ ~ C₈ シク

ロアルキル、置換または非置換のヘテロシクロアルキル、置換または非置換のアリール、および置換または非置換のヘテロアリールから選択され、

R^4 は、H、C₁～C₆アルキル、置換C₁～C₆アルキル、アシル、置換アシル、置換または非置換のアシルアミノ、置換または非置換のアミノ、置換または非置換のアルコキシ、アルコキシカルボニル、置換アルコキシカルボニルアリールアルキルオキシ、置換アリールアルキルオキシ、アミノ、アリール、置換アリール、アリールアルキル、置換アリールアルキル、置換スルファニル、置換スルフィニル、置換スルホニル、置換または非置換のアミノスルホニル、スルホ、スルホン酸エステル、アジド、カルボキシ、置換または非置換のカルバモイル、シアノ、置換または非置換のC₃～C₈シクロアルキル、置換または非置換のヘテロシクロアルキル、ハロ、ヘテロアリールオキシ、置換または非置換のヘテロアリール、ヒドロキシ、ニトロ、およびチオールから独立して選択される)を有する化合物であって、

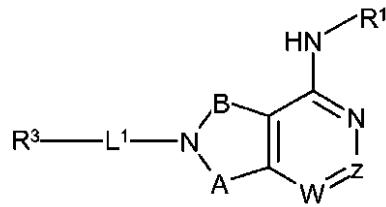
該化合物は、

N - [5 - (1 , 1 - ジメチルエチル) - 2 - メチルフェニル] - 6 , 7 - ジヒドロ - 2 - [4 - (4 - メトキシフェニル) - 1 - ピペラジニル] - 6 - (メチルスルホニル) - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - アミン ;
 4 - [[5 - (1 , 1 - ジメチルエチル) - 2 - メチルフェニル] アミノ] - 5 , 7 - ジヒドロ - 2 - [4 - (4 - メトキシフェニル) - 1 - ピペラジニル] - 6 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 6 - カルボン酸 , 1 , 1 - ジメチルエチルエステル ;
 2 - クロ口 - 4 - [[3 - (ジメチルアミノ) - 5 - メトキシフェニル] アミノ] - 5 , 7 - ジヒドロ - 6 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 6 - カルボン酸 , 9 H - フルオレン - 9 - イルメチルエステル ;
 2 - クロ口 - 5 , 7 - ジヒドロ - 4 - [(5 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イル) アミノ] - 6 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 6 - カルボン酸 , 9 H - フルオレン - 9 - イルメチルエステル、および
 N - (2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 2 - イル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 2 - (メチルチオ) - 6 - (フェニルメチル) - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - アミン以外であることを条件とする、化合物、またはその薬学的に許容可能な塩、溶媒和物、もしくはプロドラッグ；ならびにその立体異性体、同位体変異体、および互変異性体。

(項目2)

式：

【化84】



I

(式中、

各AおよびBは、独立して、CR^{2a}R^{2b}であり、

WおよびZは、独立して、NまたはCR⁴であり、

L¹は、-CO-、-NHC(O)-、-OC(O)-、-SO-、またはS(O)₂-であり、

R¹は、置換または非置換のアリールまたはヘテロアリールから選択され、

各R^{2a}およびR^{2b}は、水素、および置換または非置換のC₁～C₆アルキルから独立して選択され、

R³は、置換または非置換のC₁～C₆アルキル、置換または非置換のC₃～C₈シク

ロアルキル、置換または非置換のヘテロシクロアルキル、置換または非置換のアリール、および置換または非置換のヘテロアリールから選択され、

R^4 は、H、C₁～C₆アルキル、置換C₁～C₆アルキル、アシル、置換アシル、置換または非置換のアシルアミノ、置換または非置換のアミノ、置換または非置換のアルコキシ、アルコキシカルボニル、置換アルコキシカルボニルアリールアルキルオキシ、置換アリールアルキルオキシ、アミノ、アリール、置換アリール、アリールアルキル、置換アリールアルキル、置換スルファニル、置換スルフィニル、置換スルホニル、置換または非置換のアミノスルホニル、スルホ、スルホン酸エステル、アジド、カルボキシ、置換または非置換のカルバモイル、シアノ、置換または非置換のC₃～C₈シクロアルキル、置換または非置換のヘテロシクロアルキル、ハロ、ヘテロアリールオキシ、置換または非置換のヘテロアリール、ヒドロキシ、ニトロ、およびチオールから独立して選択される)を有する化合物であって、

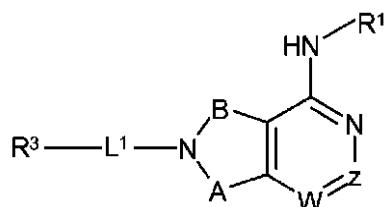
該化合物は、

N - [5 - (1 , 1 - ジメチルエチル) - 2 - メチルフェニル] - 6 , 7 - ジヒドロ - 2 - [4 - (4 - メトキシフェニル) - 1 - ピペラジニル] - 6 - (メチルスルホニル) - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - アミン ;
 4 - [[5 - (1 , 1 - ジメチルエチル) - 2 - メチルフェニル] アミノ] - 5 , 7 - ジヒドロ - 2 - [4 - (4 - メトキシフェニル) - 1 - ピペラジニル] - 6 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 6 - カルボン酸 , 1 , 1 - ジメチルエチルエステル ;
 2 - クロ口 - 4 - [[3 - (ジメチルアミノ) - 5 - メトキシフェニル] アミノ] - 5 , 7 - ジヒドロ - 6 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 6 - カルボン酸 , 9 H - フルオレン - 9 - イルメチルエステル、および
 2 - クロ口 - 5 , 7 - ジヒドロ - 4 - [(5 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イル) アミノ] - 6 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 6 - カルボン酸 , 9 H - フルオレン - 9 - イルメチルエステル以外であることを条件とする、化合物、またはその薬学的に許容可能な塩、溶媒和物、もしくはプロドラッグ；ならびにその立体異性体、同位体変異体、および互変異性体。

(項目3)

式：

【化85】



|

(式中、

各AおよびBは、独立して、CR^{2a}R^{2b}であり、

WおよびZは、独立して、NまたはCR⁴であり、

L¹は、単結合、または置換または非置換のC₁～C₅アルキレンであり、

R¹は、置換または非置換のアリールまたはヘテロアリールから選択され、

各R^{2a}およびR^{2b}は、水素、および置換または非置換のC₁～C₆アルキルから独立して選択され、

R³は、置換または非置換のC₁～C₆アルキル、置換または非置換のC₃～C₈シクロアルキル、置換または非置換のヘテロシクロアルキル、置換または非置換のアリール、および置換または非置換のヘテロアリールから選択され、

R⁴ は、 H、 C₁ ~ C₆ アルキル、 置換 C₁ ~ C₆ アルキル、 アシル、 置換アシル、 置換または非置換のアシルアミノ、 置換または非置換のアミノ、 置換または非置換のアルコキシ、 アルコキシカルボニル、 置換アルコキシカルボニルアリールアルキルオキシ、 置換アリールアルキルオキシ、 アミノ、 アリール、 置換アリール、 アリールアルキル、 置換アリールアルキル、 置換スルファニル、 置換スルフィニル、 置換スルホニル、 置換または非置換のアミノスルホニル、 スルホ、 スルホン酸エステル、 アジド、 カルボキシ、 置換または非置換のカルバモイル、 シアノ、 置換または非置換の C₃ ~ C₈ シクロアルキル、 置換または非置換のヘテロシクロアルキル、 ハロ、 ヘテロアリールオキシ、 置換または非置換のヘテロアリール、 ヒドロキシ、 ニトロ、 およびチオールから独立して選択される) を有する化合物であって、 該化合物は、 N - (2, 3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 2 - イル) - 6, 7 - ジヒドロ - 2 - (メチルチオ) - 6 - (フェニルメチル) - 5H - ピロロ [3, 4 - d] ピリミジン - 4 - アミン以外であることを条件とする、 化合物、 またはその薬学的に許容可能な塩、 溶媒和物、 もしくはプロドラッグ、 ならびにその立体異性体、 同位体変異体、 および互変異性体。

(項目 4)

A は C H R² b または C H₂ である、 項目 1 から 3 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 5)

B は C H R² b または C H₂ である、 項目 1 から 4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 6)

A および B はそれぞれ C H₂ である、 項目 1 から 3 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 7)

R¹ は置換または非置換のフェニルである、 項目 1 から 6 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 8)

R¹ は置換または非置換のヘテロアリールである、 項目 1 から 6 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 9)

R¹ は、 置換または非置換のピリジル、 キノリニル、 イソキノリニル、 置換または非置換のベンゾジオキソール、 置換または非置換のベンゾジオキサン、 置換または非置換のベンゾフラン、 置換または非置換のベンゾチオフェン、 および置換または非置換のベンゾジオキセピンである、 項目 1 から 6 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 10)

R¹ は置換または非置換のキノリン - 3 - イルである、 項目 1 から 6 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 11)

R¹ は、 ハロ、 C₁ ~ C₆ アルキル、 ハロ C₁ ~ C₆ アルキル、 C₃ ~ C₈ シクロアルキル、 アミノ、 アリール、 ヘテロアリール、 シアノ、 ヒドロキシ、 アルコキシ、 および置換スルホニルから独立して選択される 1 つまたは複数の置換基で置換されたフェニル、 ピリジル、 またはキノリン - 3 - イルである、 項目 1 から 6 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 12)

R¹ は、 M e、 E t、 P h、 C l、 F、 B r、 C N、 O H、 O M e、 O E t、 O P h、 C O P h、 C F₃、 C H F₂、 O C F₃、 i - P r、 i - B u、 t - B u、 S M e、 C H = C H - C O₂ H、 S O M e、 S O₂ M e、 S O₃ H、 S O₃ M e、 およびピリジルから独立して選択される 1 つまたは複数の置換基で置換されたフェニル、 ピリジル、 またはキノリン - 3 - イルである、 項目 1 から 6 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 13)

R¹ は非置換キノリン - 3 - イルである、 項目 1 から 6 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 14)

L¹ は単結合である、 項目 1 および 3 から 1 3 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 15)

L¹はC₁～C₅アルキレン基である、項目1および3から13のいずれか1項に記載の化合物。

(項目16)

L¹は、-CH₂-、-C(Me)H-、-CH₂CH₂-、-C(Me)HCH₂-、または-CH₂C(Me)H-である、項目1および3から13のいずれか1項に記載の化合物。

(項目17)

L¹は、-CO-、-NHC(O)-、または-OOC(O)-である、項目1から2および4から13のいずれか1項に記載の化合物。

(項目18)

L¹は-SO-である、項目1から2および4から13のいずれか1項に記載の化合物。

(項目19)

L¹は-S(O)₂-である、項目1から2および4から13のいずれか1項に記載の化合物。

(項目20)

各WおよびZは、独立して、CR⁴であり、R⁴は、H、置換または非置換のC₁～C₆アルキル、またはハロである、項目1から19のいずれか1項に記載の化合物。

(項目21)

WはNであり、ZはCR⁴であり、R⁴は、H、Me、CF₃、Cl、またはFである、項目1から19のいずれか1項に記載の化合物。

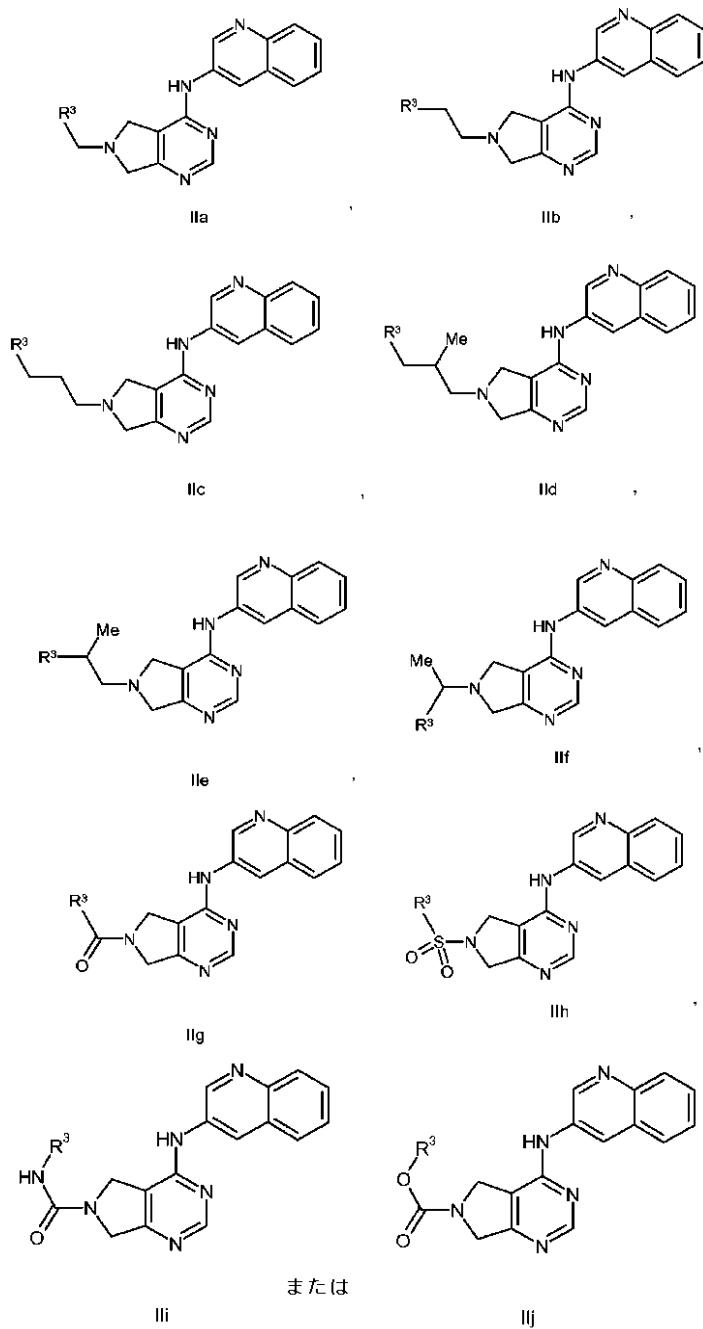
(項目22)

WはNであり、ZはCHである、項目1から19のいずれか1項に記載の化合物。

(項目23)

前記化合物が、式IIa、IIb、IIc、IId、IIe、IIf、IIf、IIg、IIh、IIi、またはIIj：

【化 8 6】



(式中、R³は項目1の通りである)の化合物である、項目1に記載の化合物。

(項目24)

R³は置換または非置換のC₁～C₆アルキルである、項目1から24のいずれか1項に記載の化合物。

(項目25)

R³は、C1、F、またはOHで置換されたC₁～C₆アルキルである、項目1から24のいずれか1項に記載の化合物。

(項目26)

R³は、Me、Et、n-Pr、i-Pr、n-Bu、t-Bu、2,2-ジメチルプロピル、2-メチルプロピル、またはCF₃である、項目1から24のいずれか1項に記載の化合物。

(項目27)

R³は、非置換であるか、ハロ、ヒドロキシル、C₁～C₆アルキル、アルコキシ、およ

びハロアルキルから独立して選択される1つまたは複数の置換基で置換されたC₃～C₈シクロアルキルである、項目1から24のいずれか1項に記載の化合物。

(項目28)

R³は、非置換であるか、ハロ、ヒドロキシリ、C₁～C₆アルキル、アルコキシ、およびハロアルキルから独立して選択される1つまたは複数の置換基で置換されたシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、またはシクロヘキシリである、項目1から24のいずれか1項に記載の化合物。

(項目29)

R³は、Me、Et、Cl、F、CN、OH、OMe、OEt、CF₃、CHF₂、OCF₃、i-Pr、i-Bu、およびt-Buから独立して選択される1つまたは複数の置換基で置換されたシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、またはシクロヘキシリである、項目1から24のいずれか1項に記載の化合物。

(項目30)

R³は置換または非置換のヘテロシクロアルキルである、項目1から18のいずれか1項に記載の化合物。

(項目31)

R³は、非置換であるか、ハロ、ヒドロキシリ、C₁～C₆アルキル、アルコキシ、およびハロC₁～C₆アルキルから独立して選択される1つまたは複数の置換基で置換されたピロリジニル、ピペリジニル、モルホリニル、テトラヒドロピラニル、またはピペラジニルである、項目1から24のいずれか1項に記載の化合物。

(項目32)

R³は、Me、Et、Cl、F、CN、OH、OMe、OEt、CF₃、CHF₂、OCF₃、i-Pr、i-Bu、およびt-Buから独立して選択される1つまたは複数の置換基で置換されたピロリジニル、ピペリジニル、モルホリニル、テトラヒドロピラニル、またはピペラジニルである、項目1から24のいずれか1項に記載の化合物。

(項目33)

R³は置換または非置換のアリールまたはヘテロアリールである、項目1から24のいずれか1項に記載の化合物。

(項目34)

R³は、非置換であるか、ハロ、ヒドロキシリ、アミノ、シアノ、スルホ、置換スルファン、置換スルフィニル、置換スルホニル、置換または非置換のアミド、置換または非置換のアミノ、カルボキシ、C₁～C₆アルコキシカルボニル、C₁～C₆アルキル、置換C₁～C₆アルキル、アルケニル、置換アルケニル、アルキニル、置換アルキニル、およびスルホンアミドから独立して選択される1つまたは複数の置換基で置換されたフェニルまたはピリジルである、項目1から24のいずれか1項に記載の化合物。

(項目35)

R³は、Me、Et、Ph、Cl、F、Br、CN、OH、OMe、OEt、OPh、COPh、CF₃、CHF₂、OCF₃、i-Pr、i-Bu、t-Bu、SMe、CH=CH-CO₂H、SOMe、SO₂Me、SO₃H、SO₃Me、およびピリジルから独立して選択される1つまたは複数の置換基で置換されたフェニルまたはピリジルである、項目1から24のいずれか1項に記載の化合物。

(項目36)

R³は、非置換であるか、ハロ、ヒドロキシリ、アミノ、シアノ、スルホ、置換スルホニル、置換スルファン、アミド、カルボキシ、C₁～C₆アルコキシカルボニル、C₁～C₆アルキル、置換C₁～C₆アルキル、アルケニル、置換アルケニル、アルキニル、置換アルキニル、およびスルホンアミドから独立して選択される1つまたは複数の置換基で置換されたピリミジニル、キノリニル、イソキノリニル、インドリル、インダゾリル、ベンゾフラニル、ベンゾチオフェニル、ベンゾオキサジニル、ベンズジオキソラニル、ピロリル、フラニル、ピラゾリル、イミダゾリル、トリアゾリル、オキサゾリル、チエニル、チアゾリル、オキサジアゾリル、またはチアジアゾリルである、項目1から24のいずれ

か 1 項に記載の化合物。

(項目 37)

R^3 は、非置換であるか、Me、Et、Ph、Cl、F、CN、OH、OMe、OEt、OPh、COPh、CF₃、CHF₂、OCF₃、i-Pr、i-Bu、t-Bu、Se、CO₂Me、CO₂Et、CH=CH-CO₂H、SOMe、SO₂Me、SO₃H、SO₃Me、およびピリジルから独立して選択される1つまたは複数の置換基で置換されたピリミジニル、キノリニル、イソキノリニル、インドリル、インダゾリル、ベンゾフランニル、ベンゾチオフェニル、ベンゾオキサジニル、ベンズジオキソラニル、ピロリル、フラニル、ピラゾリル、イミダゾリル、トリアゾリル、オキサゾリル、チエニル、チアゾリル、オキサジアゾリル、またはチアジアゾリルである、項目1から24のいずれか1項に記載の化合物。

(項 目 3 8)

R³は、非置換であるか、Me、Et、Cl、CF₃、CO₂Me、CO₂Et、およびNHCから独立して選択される1つまたは複数の置換基で置換されたチエニル、フラン、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、チアゾリル、チアジアゾリル、またはオキシアゾリルである、項目1から24のいずれか1項に記載の化合物。

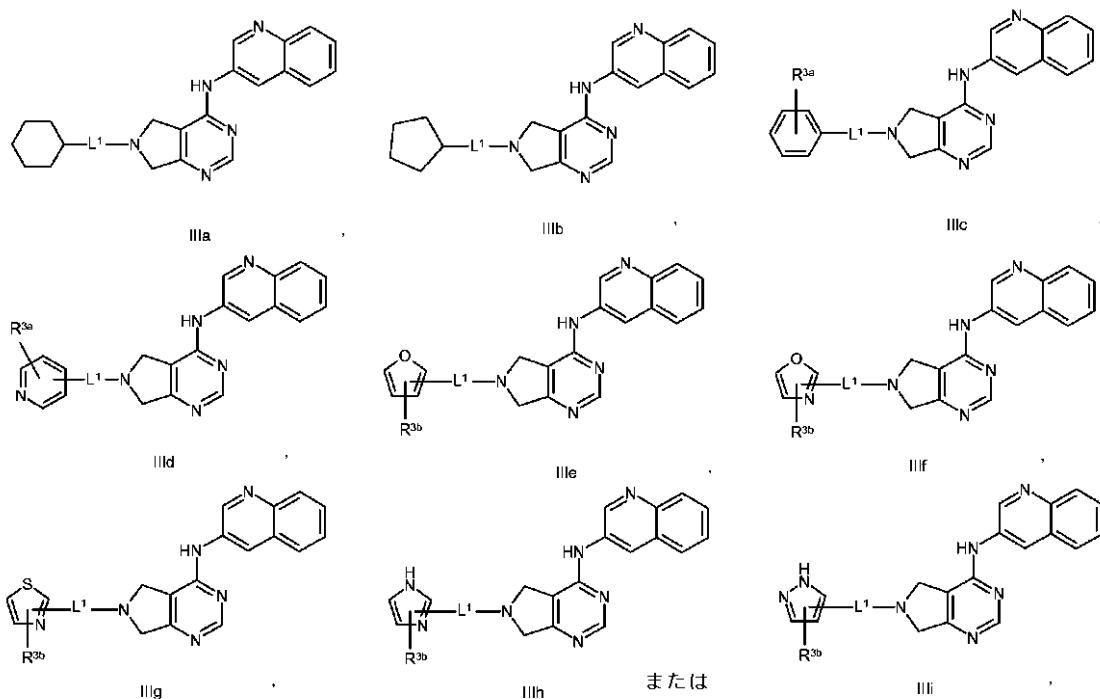
(項目 39)

R³は、非置換であるか、1つまたは2つのMeに置換されたチアゾリル、ピリジル、シクロヘキシリル、フェニル、シクロペンチル、テトラヒドロチオピラニル、ピラゾリル、テトラヒドロピラニルである、項目1から24のいずれか1項に記載の化合物。

(項目 40)

前記化合物が、式 I I I a、I I I b、I I I c、I I I d、I I I e、I I I f、I I I g、I I I h、またはI I I i：

【化 8 7】



(式中、 L^1 は、単結合、-CH₂-、-CO-、-NHCO(O)-、-OC(O)-、またはS(O)₂であり、R^{3a}は、H、アルキル、アルコキシ、ハロ、ハロアルキル、チオアルキル、またはハロアルキルオキシであり、R^{3b}はHまたはアルキルである)の化合物である、項目1に記載の化合物。

(項目41)

L^{-1} は $-\text{CH}_2-$ である、項目 40 に記載の化合物。

(項目42)

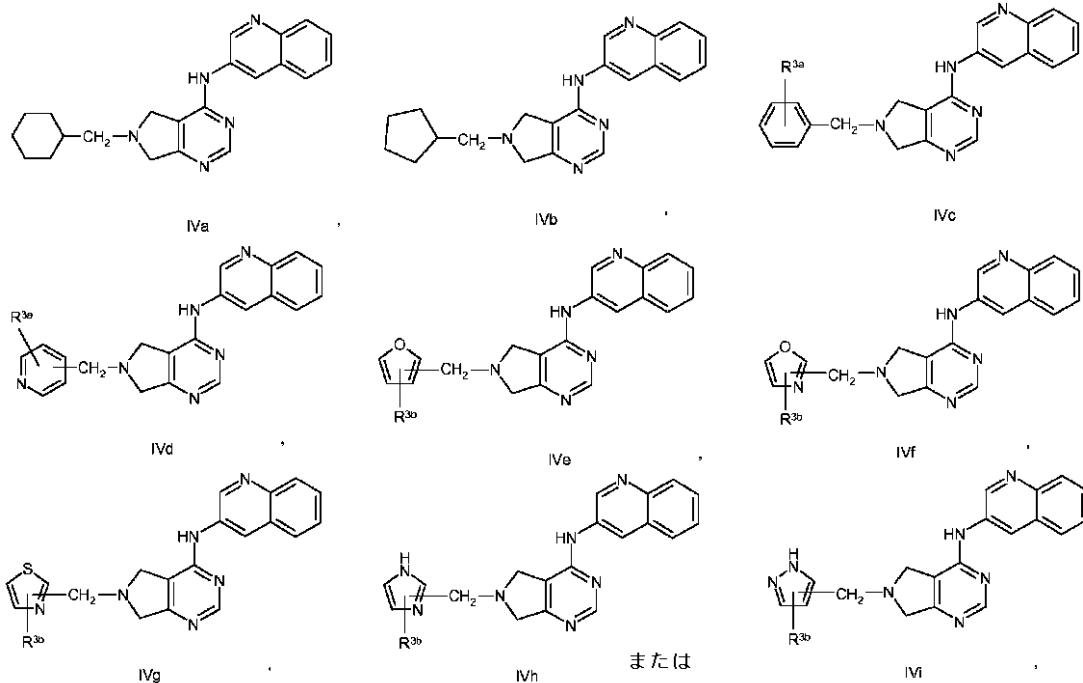
L¹は-CO-、-NHC(O)-、または-OOC(O)-である、項目40に記載の化合物。

(項目43)

L¹は-S(O)₂-である、項目40に記載の化合物。

(項目44)

前記化合物が、式IVa、IVb、IVc、IVd、IVe、IVf、IVg、IVh、またはIVi：

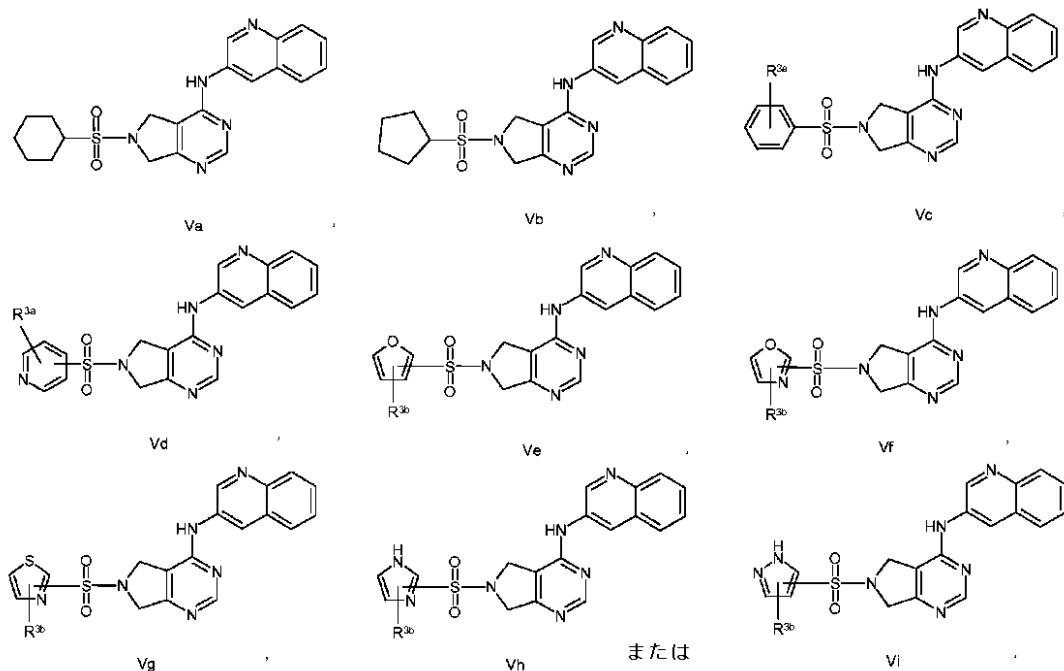
【化88】

(式中、R^{3a}は、H、アルキル、アルコキシ、ハロ、ハロアルキル、チオアルキル、またはハロアルキオキシであり、R^{3b}はHまたはアルキルである)の化合物である、項目1に記載の化合物。

(項目45)

前記化合物が、式Va、Vb、Vc、Vd、Ve、Vf、Vg、Vh、またはVi：

【化 8 9】



(式中、R^{3 a}は、H、アルキル、アルコキシ、ハロ、ハロアルキル、チオアルキル、またはハロアルキルオキシであり、R^{3 b}はHまたはアルキルである)の化合物である、請求項1に記載の化合物。

(項目46)

R^{3 a}は、H、Me、Et、OMe、CF₃、OCF₃、OCF₂、SMe、Cl、またはFである、項目40から45のいずれか1項に記載の化合物。

(項目47)

R^{3 b}は、H、Me、Et、またはi-Prである、項目40から46のいずれか1項に記載の化合物。

(項目48)

R^{3 a}はHである、項目40から45のいずれか1項に記載の化合物。

(項目49)

R^{3 b}はHである、項目40から46のいずれか1項に記載の化合物。

(項目50)

前記化合物が、以下：

(6-ベンジル-6,7-ジヒドロ-5H-ピロ口[3,4-d]ピリミジン-4-イル)-キノリン-3-イル-アミン；
 (6-シクロヘキシルメチル-6,7-ジヒドロ-5H-ピロ口[3,4-d]ピリミジン-4-イル)-キノリン-3-イル-アミン；
 (6-シクロペンチルメチル-6,7-ジヒドロ-5H-ピロ口[3,4-d]ピリミジン-4-イル)-キノリン-3-イル-アミン；
 [6-(2-エチル-ブチル)-6,7-ジヒドロ-5H-ピロ口[3,4-d]ピリミジン-4-イル]-キノリン-3-イル-アミン；
 [6-(2-メチル-ピリジン-3-イルメチル)-6,7-ジヒドロ-5H-ピロ口[3,4-d]ピリミジン-4-イル]-キノリン-3-イル-アミン；
 キノリン-3-イル-[6-(テトラヒドロ-チオピラン-4-イルメチル)-6,7-ジヒドロ-5H-ピロ口[3,4-d]ピリミジン-4-イル]-アミン；
 [6-(2-フェニル-プロピル)-6,7-ジヒドロ-5H-ピロ口[3,4-d]ピリミジン-4-イル]-キノリン-3-イル-アミン；
 (6-フェネチル-6,7-ジヒドロ-5H-ピロ口[3,4-d]ピリミジン-4-イ

ル) - キノリン - 3 - イル - アミン;

[6 - (2 , 4 - ジメチル - チアゾール - 5 - イルメチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H -
ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン;
キノリン - 3 - イル - [6 - (テトラヒドロ - ピラン - 4 - イルメチル) - 6 , 7 - ジヒ
ドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - アミン;
[6 - (1 - シクロヘキシル - エチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d
] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン;
キノリン - 3 - イル - [6 - (トルエン - 2 - スルホニル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H -
ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - アミン;
[6 - (4 - メチル - チアゾール - 5 - イルメチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口
[3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン;
5 - [4 - (キノリン - 3 - イルアミノ) - 5 , 7 - ジヒドロ - ピロ口 [3 , 4 - d] ピ
リミジン - 6 - スルホニル] - フラン - 2 - カルボン酸メチルエステル;
[6 - (3 - メチル - ピリジン - 4 - イルメチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [
3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン;
[6 - (2 - フルオロ - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピ
リミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン;
[6 - (2 - クロロ - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリ
ミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン;
[6 - (3 - メチル - フラン - 2 - イルメチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3
, 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン;
[6 - (2 , 3 - ジメチル - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d
] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン;
[6 - (2 , 5 - ジメチル - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d
] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン;
[6 - (2 - エチル - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリ
ミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン;
[6 - (2 - メチル - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリ
ミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン;
(6 - ピリジン - 4 - イルメチル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリ
ミジン - 4 - イル) - キノリン - 3 - イル - アミン;
キノリン - 3 - イル - [6 - (2 - トリフルオロメチル - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ
- 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - アミン;
[6 - (2 - エチル - 4 - メチル - チアゾール - 5 - イルメチル) - 6 , 7 - ジヒドロ -
5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン;
キノリン - 3 - イル - [6 - (2 - トリフルオロメトキシ - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒド
ロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - アミン;
キノリン - 3 - イル - [6 - (3 - トリフルオロメチル - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ
- 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - アミン;
[6 - (2 - エトキシ - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピ
リミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン;
[6 - (2 , 3 - ジヒドロ - ベンゾフラン - 7 - イルメチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H
- ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン;
[6 - (2 - メチルスルファニル - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 ,
4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン;
(6 - ベンゾ [1 , 3] ジオキソール - 4 - イルメチル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ
口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル) - キノリン - 3 - イル - アミン;
キノリン - 3 - イル - [6 - (3 - トリフルオロメトキシ - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒド

口 - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - アミン ;
[6 - (2 - ジフルオロメトキシ - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 ,
4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
(6 - ベンジル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル
) - キノリン - 3 - イル - アミン ;
(6 - シクロヘキシルメチル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジ
ン - 4 - イル) - キノリン - 3 - イル - アミン ;
(6 - エチル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル
) - キノリン - 3 - イル - アミン ;
(6 - プロピル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル
) - キノリン - 3 - イル - アミン ;
(6 - シクロプロピルメチル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジ
ン - 4 - イル) - キノリン - 3 - イル - アミン ;
(6 - ブチル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル
) - キノリン - 3 - イル - アミン ;
(6 - イソブチル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イ
ル) - キノリン - 3 - イル - アミン ;
[6 - (2 - メチル - ブチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミ
ジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
[6 - (3 - メチル - ブチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミ
ジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
(6 - ベンチル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル
) - キノリン - 3 - イル - アミン ;
[6 - (2 , 2 - ジメチル - プロピル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d
] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
(6 - シクロペンチルメチル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジ
ン - 4 - イル) - キノリン - 3 - イル - アミン ;
キノリン - 3 - イル - [6 - (テトラヒドロ - フラン - 3 - イルメチル) - 6 , 7 - ジヒ
ドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - アミン ;
[6 - (2 - エチル - ブチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミ
ジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
[6 - (3 , 3 - ジメチル - ブチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d]
ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
キノリン - 3 - イル - [6 - (テトラヒドロ - ピラン - 3 - イルメチル) - 6 , 7 - ジヒ
ドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - アミン ;
[6 - (2 - メチル - ピリジン - 3 - イルメチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [
3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
キノリン - 3 - イル - [6 - (テトラヒドロ - チオピラン - 4 - イルメチル) - 6 , 7 -
ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - アミン ;
[6 - (2 - フェニル - プロピル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピ
リミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
4 - [4 - (キノリン - 3 - イルアミノ) - 5 , 7 - ジヒドロ - ピロ口 [3 , 4 - d] ピ
リミジン - 6 - イル] - ブタン - 1 - オール ;
(6 - シクロブチルメチル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジ
ン - 4 - イル) - キノリン - 3 - イル - アミン ;
(6 - フェネチル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イ
ル) - キノリン - 3 - イル - アミン ;
(6 - シクロヘキシル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4
- イル) - キノリン - 3 - イル - アミン ;
[6 - (2 - メチル - 2 H - ピラゾール - 3 - イルメチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H -

ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
 [6 - (2 - メチル - チアゾール - 4 - イルメチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口
 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
 [6 - (1 , 5 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イルメチル) - 6 , 7 - ジヒドロ -
 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
 [6 - (1 - メチル - ピペリジン - 4 - イルメチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口
 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
 [6 - (2 , 4 - ジメチル - チアゾール - 5 - イルメチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H -
 ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
 [6 - (3 - メチル - オキセタン - 3 - イルメチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口
 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
 キノリン - 3 - イル - [6 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロ - エチル) - 6 , 7 - ジヒドロ
 - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - アミン ;
 キノリン - 3 - イル - [6 - (3 , 3 , 3 - トリフルオロ - プロピル) - 6 , 7 - ジヒド
 ロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - アミン ;
 [6 - (1 , 2 - ジメチル - プロピル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d
] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
 キノリン - 3 - イル - [6 - (テトラヒドロ - ピラン - 4 - イルメチル) - 6 , 7 - ジヒ
 ドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - アミン ;
 (6 - イソプロピル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 -
 イル) - キノリン - 3 - イル - アミン ;
 (6 - sec - ブチル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4
 - イル) - キノリン - 3 - イル - アミン ;
 [6 - (1 - シクロブチル - エチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d]
 ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
 [6 - (1 - シクロペンチル - エチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d
] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
 [6 - (1 - シクロヘキシル - エチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d
] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
 キノリン - 3 - イル - [6 - (1 , 3 , 3 - トリメチル - ブチル) - 6 , 7 - ジヒドロ -
 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - アミン ;
 (6 - シクロヘプチル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4
 - イル) - キノリン - 3 - イル - アミン ;
 (6 - シクロペンチル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4
 - イル) - キノリン - 3 - イル - アミン ;
 [6 - (1 - メチル - ブチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミ
 ジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
 (6 - シクロブチル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 -
 イル) - キノリン - 3 - イル - アミン ;
 (6 - オキセタン - 3 - イル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジ
 ン - 4 - イル) - キノリン - 3 - イル - アミン ;
 4 - (キノリン - 3 - イルアミノ) - 5 , 7 - ジヒドロ - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジ
 ン - 6 - カルボン酸 t e r t - ブチルエステル ;
 4 - (キノリン - 3 - イルアミノ) - 5 , 7 - ジヒドロ - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジ
 ン - 6 - カルボン酸シクロヘキシルメチル - アミド ;
 4 - (キノリン - 3 - イルアミノ) - 5 , 7 - ジヒドロ - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジ
 ン - 6 - カルボン酸シクロヘキシルアミド ;
 4 - (キノリン - 3 - イルアミノ) - 5 , 7 - ジヒドロ - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジ
 ン - 6 - カルボン酸 (2 , 4 - ジメチル - チアゾール - 5 - イルメチル) - アミド ;
 (2 , 4 - ジメチル - チアゾール - 5 - イル) - [4 - (キノリン - 3 - イルアミノ) -
]

5 , 7 - ジヒドロ - ピロロ [3 , 4 - d] ピリミジン - 6 - イル] - メタノン ;
 2 - (2 , 4 - ジメチル - チアゾール - 5 - イル) - 1 - [4 - (キノリン - 3 - イルア
ミノ) - 5 , 7 - ジヒドロ - ピロロ [3 , 4 - d] ピリミジン - 6 - イル] - エタノン ;
 4 - (キノリン - 3 - イルアミノ) - 5 , 7 - ジヒドロ - ピロロ [3 , 4 - d] ピリミジ
ン - 6 - カルボン酸 (2 , 4 - ジメチル - チアゾール - 5 - イル) - アミド ;
 2 - アゼパン - 1 - イル - 1 - [4 - (キノリン - 3 - イルアミノ) - 5 , 7 - ジヒドロ
- ピロロ [3 , 4 - d] ピリミジン - 6 - イル] - エタノン ;
 2 - ピペリジン - 1 - イル - 1 - [4 - (キノリン - 3 - イルアミノ) - 5 , 7 - ジヒド
ロ - ピロロ [3 , 4 - d] ピリミジン - 6 - イル] - エタノン ;
 2 - ピロリジン - 1 - イル - 1 - [4 - (キノリン - 3 - イルアミノ) - 5 , 7 - ジヒド
ロ - ピロロ [3 , 4 - d] ピリミジン - 6 - イル] - エタノン ;
 [6 - (5 - オキサゾール - 5 - イル - チオフェン - 2 - スルホニル) - 6 , 7 - ジヒド
ロ - 5 H - ピロロ [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン
;
 [6 - (3 - メチル - チオフェン - 2 - スルホニル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロロ
[3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
 (6 - シクロペンタ NSLホニル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロロ [3 , 4 - d] ピリ
ミジン - 4 - イル) - キノリン - 3 - イル - アミン ;
 [6 - (2 , 4 - ジフルオロ - ベンゼンスルホニル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロロ
[3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
 キノリン - 3 - イル - [6 - (トルエン - 2 - スルホニル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H -
ピロロ [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - アミン ;
 [6 - (2 - メチル - 2 H - ピラゾール - 3 - スルホニル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H -
ピロロ [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
 [6 - (2 , 4 - ジメチル - チアゾール - 5 - スルホニル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H -
ピロロ [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
 2 - メチル - 5 - [4 - (キノリン - 3 - イルアミノ) - 5 , 7 - ジヒドロ - ピロロ [3
, 4 - d] ピリミジン - 6 - スルホニル] - フラン - 3 - カルボン酸メチルエステル ;
 (6 - フェニルメタンスルホニル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロロ [3 , 4 - d] ピリ
ミジン - 4 - イル) - キノリン - 3 - イル - アミン ;
 (6 - シクロヘキサンスルホニル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロロ [3 , 4 - d] ピリ
ミジン - 4 - イル) - キノリン - 3 - イル - アミン ;
 (6 - ベンゼンスルホニル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロロ [3 , 4 - d] ピリミジン
- 4 - イル) - キノリン - 3 - イル - アミン ;
 [6 - (4 - メチル - チアゾール - 5 - イルメチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロロ
[3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
 [6 - (3 , 5 - ジメチル - イソオキサゾール - 4 - イルメチル) - 6 , 7 - ジヒドロ -
5 H - ピロロ [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
 5 - [4 - (キノリン - 3 - イルアミノ) - 5 , 7 - ジヒドロ - ピロロ [3 , 4 - d] ピ
リミジン - 6 - スルホニル] - フラン - 2 - カルボン酸メチルエステル ;
 [6 - (2 - メチル - チアゾール - 5 - イルメチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロロ
[3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
 キノリン - 3 - イル - [6 - (2 - トリフルオロメトキシ - ベンゼンスルホニル) - 6 ,
7 - ジヒドロ - 5 H - ピロロ [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - アミン ;
 [6 - (2 - フルオロ - ベンゼンスルホニル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロロ [3 ,
4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
 [6 - (2 - クロロ - ベンゼンスルホニル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロロ [3 , 4
- d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
 [6 - (2 - メトキシ - ベンゼンスルホニル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロロ [3 ,
4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;

[6 - (2 - メチル - 6 - トリフルオロメチル - ピリジン - 3 - イルメチル) - 6 , 7 -
ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル -
アミン ;
キノリン - 3 - イル - (6 - チアゾール - 4 - イルメチル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピ
ロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル) - アミン ;
キノリン - 3 - イル - (6 - チアゾール - 2 - イルメチル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピ
ロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル) - アミン ;
[6 - (4 - メチル - チアゾール - 2 - イルメチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口
[3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
[6 - (3 - メチル - ピリジン - 4 - イルメチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [
3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
[6 - (2 - フルオロ - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピ
リミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
キノリン - 3 - イル - (6 - チアゾール - 5 - イルメチル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピ
ロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル) - アミン ;
[6 - (2 - フェニル - エタンスルホニル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4
- d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
[6 - (2 - メトキシ - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピ
リミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
[6 - (2 - クロロ - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリ
ミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
キノリン - 3 - イル - (6 - キノリン - 4 - イルメチル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ
口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル) - アミン ;
[6 - (3 - メチル - フラン - 2 - イルメチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3
, 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
[6 - (2 , 3 - ジメチル - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d
] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
[6 - (2 , 6 - ジメチル - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d
] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
[6 - (2 , 5 - ジメチル - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d
] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
[6 - (2 - エチル - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリ
ミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
[6 - (2 - クロロ - チアゾール - 5 - イルメチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口
[3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
[6 - (2 - メチル - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリ
ミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
[6 - (2 , 4 - ジメチル - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d
] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
(6 - ピリジン - 4 - イルメチル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリ
ミジン - 4 - イル) - キノリン - 3 - イル - アミン ;
キノリン - 3 - イル - [6 - (2 - トリフルオロメチル - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ
- 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - アミン ;
[6 - (2 - メチル - フラン - 3 - イルメチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3
, 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
[6 - (2 - エチル - 4 - メチル - チアゾール - 5 - イルメチル) - 6 , 7 - ジヒドロ -
5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
キノリン - 3 - イル - [6 - (2 - トリフルオロメトキシ - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒド

ハ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - アミン ;
 キノリン - 3 - イル - [6 - (3 - トリフルオロメチル - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ
 - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - アミン ;
 [6 - (2 - エトキシ - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピ
 リミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
 [6 - (2 , 3 - ジヒドロ - ベンゾフラン - 7 - イルメチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H
 - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
 [6 - (2 - メチルスルファニル - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 ,
 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
 (6 - ベンゾ [1 , 3] ジオキソール - 4 - イルメチル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ
 口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル) - キノリン - 3 - イル - アミン ;
 キノリン - 3 - イル - [6 - (3 - トリフルオロメトキシ - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒド
 ロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - アミン ;
 [6 - (2 - ジフルオロメトキシ - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 ,
 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
 [6 - (3 - メトキシ - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピ
 リミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
 [6 - (2 , 3 - ジフルオロ - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 -
 d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
 [6 - (2 - プロポキシ - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d]
 ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
 [6 - (2 - イソプロポキシ - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 -
 d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
 [6 - (1 H - インドール - 7 - イルメチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 ,
 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
 [6 - (3 - メチル - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリ
 ミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ; および
 [6 - (2 - シクロプロピル - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 -
 d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
 またはその薬学的に許容可能な塩、溶媒和物、もしくはプロドラッグ；
 ならびにその立体異性体、同位体変異体、および互変異性体から選択される、項目1に記
 載の化合物。

(項目51)

前記化合物が、以下：

(6 - ベンジル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル
) - キノリン - 3 - イル - アミン ;
 (6 - シクロヘキシルメチル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジ
 ン - 4 - イル) - キノリン - 3 - イル - アミン ;
 (6 - シクロペンチルメチル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジ
 ン - 4 - イル) - キノリン - 3 - イル - アミン ;
 [6 - (2 - エチル - ブチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミ
 ジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
 [6 - (2 - メチル - ピリジン - 3 - イルメチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [
 3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
 キノリン - 3 - イル - [6 - (テトラヒドロ - チオピラン - 4 - イルメチル) - 6 , 7 -
 ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - アミン ;
 [6 - (2 - フェニル - プロピル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピ
 リミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
 (6 - フェネチル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イ
 ル) - キノリン - 3 - イル - アミン ;

[6 - (2 , 4 - ジメチル - チアゾール - 5 - イルメチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
 キノリン - 3 - イル - [6 - (テトラヒドロ - ピラン - 4 - イルメチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - アミン ;
 [6 - (1 - シクロヘキシル - エチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
 キノリン - 3 - イル - [6 - (トルエン - 2 - スルホニル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - アミン ;
 [6 - (4 - メチル - チアゾール - 5 - イルメチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
 5 - [4 - (キノリン - 3 - イルアミノ) - 5 , 7 - ジヒドロ - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 6 - スルホニル] - フラン - 2 - カルボン酸メチルエステル ;
 [6 - (3 - メチル - ピリジン - 4 - イルメチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
 [6 - (2 - フルオロ - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
 [6 - (2 - メトキシ - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
 [6 - (2 - クロロ - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
 [6 - (3 - メチル - フラン - 2 - イルメチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
 [6 - (2 , 3 - ジメチル - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
 [6 - (2 , 5 - ジメチル - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
 [6 - (2 - エチル - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
 [6 - (2 - メチル - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
 (6 - ピリジン - 4 - イルメチル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル) - キノリン - 3 - イル - アミン ;
 キノリン - 3 - イル - [6 - (2 - トリフルオロメチル - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - アミン ;
 [6 - (2 - エチル - 4 - メチル - チアゾール - 5 - イルメチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
 キノリン - 3 - イル - [6 - (2 - トリフルオロメトキシ - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - アミン ;
 キノリン - 3 - イル - [6 - (3 - トリフルオロメチル - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - アミン ;
 [6 - (2 - エトキシ - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
 [6 - (2 , 3 - ジヒドロ - ベンゾフラン - 7 - イルメチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
 [6 - (2 - メチルスルファニル - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - キノリン - 3 - イル - アミン ;
 (6 - ベンゾ [1 , 3] ジオキソール - 4 - イルメチル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル) - キノリン - 3 - イル - アミン ;
 キノリン - 3 - イル - [6 - (3 - トリフルオロメトキシ - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - アミン ;

[6 - (2 - ジフルオロメトキシ - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 -イル] - キノリン - 3 -イル - アミン ;

[6 - (3 - メトキシ - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 -イル] - キノリン - 3 -イル - アミン ;

[6 - (2 , 3 - ジフルオロ - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 -イル] - キノリン - 3 -イル - アミン ;

[6 - (1 H - インドール - 7 - イルメチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 -イル] - キノリン - 3 -イル - アミン ;

[6 - (3 - メチル - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 -イル] - キノリン - 3 -イル - アミン ;

[6 - (2 - シクロプロピル - ベンジル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 -イル] - キノリン - 3 -イル - アミン ; および

[6 - (3 - メチル - プチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロ口 [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 -イル] - キノリン - 3 -イル - アミン ;

またはその薬学的に許容可能な塩、溶媒和物、もしくはプロドラッグ；

ならびにその立体異性体、同位体変異体、および互変異性体から選択される、項目 1 に記載の化合物。

(項目 5 2)

薬学的に許容可能なキャリアおよび薬学的有効量の項目 1 から 5 1 のいずれか 1 項に記載の化合物を含む薬学的組成物。

(項目 5 3)

前記キャリアが非経口キャリアである、項目 5 2 に記載の薬学的組成物。

(項目 5 4)

前記キャリアが経口キャリアである、項目 5 2 に記載の薬学的組成物。

(項目 5 5)

前記キャリアが局所キャリアである、項目 5 2 に記載の薬学的組成物。

(項目 5 6)

有効な疾患処置量または容態処置量の項目 1 から 5 1 のいずれか 1 項に記載の化合物または項目 5 2 から 5 5 のいずれか 1 項に記載の薬学的組成物を哺乳動物に投与する工程を含む、 in vivo での F A A H の異常な挙動に関連するか、 F A A H 活性の調整によって緩和することができる疾患または容態を哺乳動物において予防、処置、または改善する方法。

(項目 5 7)

前記疾患または容態が、以下：疼痛（急性、炎症性、および神経因性の疼痛、慢性疼痛、歯痛、および頭痛（片頭痛、群発頭痛、および緊張性頭痛が含まれる）が含まれる）、パーキンソン病、アルツハイマー病、および多発性硬化症；炎症、関節炎、関節リウマチおよび骨関節炎、ならびに炎症性腸疾患によって媒介されるか、これらを生じる疾患および障害；神経炎症によって媒介されるか、これを生じる疾患および障害、脳炎；中枢神経を介した神経精神疾患および神経精神障害、躁鬱病、双極性疾患、不安、統合失調症、体重および摂食障害、睡眠障害、および認識障害；神経学的および神経変性の疾患および障害；癲癇および発作性障害；嗜癖、痙攣、緑内障、呼吸器および気道の疾患および障害、アレルギー性鼻炎、喘息および反応性気道疾患、ならびに慢性閉塞性肺疾患；心筋梗塞、自己免疫疾患および自己免疫障害、疥癬 / 搓痒、乾癬；肥満；脂質障害；高血圧症；嘔吐；嘔氣；癌；および腎障害から選択される、項目 5 6 に記載の方法。

(項目 5 8)

前記疾患または容態がパーキンソン病である、項目 5 7 に記載の方法。

(項目 5 9)

前記疾患または容態がアルツハイマー病である、項目 5 7 に記載の方法。

(項目 6 0)

前記疾患または容態が疼痛である、項目 5 7 に記載の方法。

(項目61)

前記疾患または容態が神経因性疼痛である、項目57に記載の方法。

(項目62)

前記疾患または容態が自己免疫疾患である、項目57に記載の方法。

(項目63)

前記疾患または容態が炎症性の疾患または容態である、項目57に記載の方法。

(項目64)

前記疾患または容態が神経学的または神経変性の疾患または容態である、項目57に記載の方法。

(項目65)

医薬品として使用するための項目1から51のいずれか1項に記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩もしくは溶媒和物。

(項目66)

疼痛（急性、炎症性、および神経因性の疼痛、慢性疼痛、歯痛、および頭痛（片頭痛、群発頭痛、および緊張性頭痛が含まれる）が含まれる）；パーキンソン病、アルツハイマー病、および多発性硬化症；炎症、関節炎、関節リウマチ、および骨関節炎によって媒介されるか、これらを生じる疾患および障害；神経炎症によって媒介されるか、これを生じる疾患および障害、脳炎；中枢神経を介した神経精神疾患および神経精神障害、躁鬱病、双極性疾患、不安、統合失調症、体重および摂食障害、睡眠障害、および認識障害；神経学的および神経変性の疾患および障害；骨障害；皮膚炎；癲癇および発作性障害；前立腺、膀胱および腸管の機能障害、尿失禁、遅延性排尿、直腸過敏症、大便失禁、良性前立腺肥大症および炎症性腸疾患；嗜癖、痙攣、緑内障、呼吸器および気道の疾患および障害、アレルギー性鼻炎、喘息および反応性気道疾患、ならびに慢性閉塞性肺疾患；心筋梗塞；高血圧症；自己免疫疾患および自己免疫障害、疥癬／搔痒、乾癬；肥満；脂質障害；嘔気；嘔吐；癌；および腎障害から選択される疾患または容態の処置または予防における医薬品として使用するための項目1から51のいずれか1項に記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩もしくは溶媒和物。

(項目67)

疼痛（急性、炎症性、および神経因性の疼痛、慢性疼痛、歯痛、および頭痛（片頭痛、群発頭痛、および緊張性頭痛が含まれる）が含まれる）；パーキンソン病、アルツハイマー病、および多発性硬化症；炎症、関節炎、関節リウマチ、および骨関節炎によって媒介されるか、これらを生じる疾患および障害；神経炎症によって媒介されるか、これを生じる疾患および障害、脳炎；中枢神経を介した神経精神疾患および神経精神障害、躁鬱病、双極性疾患、不安、統合失調症、体重および摂食障害、睡眠障害、および認識障害；神経学的および神経変性の疾患および障害；癲癇および発作性障害；骨障害；皮膚炎；前立腺、膀胱および腸管の機能障害、尿失禁、遅延性排尿、直腸過敏症、大便失禁、良性前立腺肥大症および炎症性腸疾患；嗜癖、痙攣、緑内障、呼吸器および気道の疾患および障害、アレルギー性鼻炎、喘息および反応性気道疾患、ならびに慢性閉塞性肺疾患；心筋梗塞；高血圧症；自己免疫疾患および自己免疫障害、疥癬／搔痒、乾癬；肥満；脂質障害；嘔気；嘔吐；癌；および腎障害から選択される疾患または容態の処置または予防のための薬物の製造における項目1から51のいずれか1項に記載の化合物の使用。

(項目68)

項目1から51のいずれ1項に定義の化合物と別の薬学的活性薬剤との組み合わせ。

(項目69)

前記組み合わせがパーキンソン病処置に有用である、項目68に記載の組み合わせ。

(項目70)

前記別の薬学的活性薬剤がドーパミンD₂受容体アゴニストを含む、項目68または69に記載の組み合わせ。

(項目71)

前記別の薬学的活性薬剤がドーパミンを含む、項目68または69に記載の組み合わせ。