

【公報種別】特許法第17条の2の規定による補正の掲載

【部門区分】第3部門第2区分

【発行日】平成25年11月7日(2013.11.7)

【公表番号】特表2013-505949(P2013-505949A)

【公表日】平成25年2月21日(2013.2.21)

【年通号数】公開・登録公報2013-009

【出願番号】特願2012-531061(P2012-531061)

【国際特許分類】

C 07 D 239/36 (2006.01)
A 61 K 31/513 (2006.01)
A 61 P 43/00 (2006.01)
A 61 P 11/00 (2006.01)
A 61 P 9/12 (2006.01)
A 61 P 11/06 (2006.01)
A 61 P 9/00 (2006.01)
A 61 P 9/10 (2006.01)
A 61 P 9/04 (2006.01)
A 61 P 27/06 (2006.01)
A 61 P 7/02 (2006.01)
A 61 P 29/00 (2006.01)
A 61 P 31/18 (2006.01)
A 61 P 1/04 (2006.01)
A 61 P 17/06 (2006.01)
A 61 P 19/02 (2006.01)
A 61 P 1/16 (2006.01)
A 61 P 15/10 (2006.01)
A 61 P 11/16 (2006.01)
A 61 P 17/02 (2006.01)
A 61 P 3/04 (2006.01)
A 61 P 25/24 (2006.01)
A 61 P 25/22 (2006.01)
A 61 P 25/18 (2006.01)
A 61 P 31/06 (2006.01)
A 61 P 31/04 (2006.01)
A 61 P 33/02 (2006.01)
A 61 P 31/10 (2006.01)
A 61 P 31/08 (2006.01)
A 61 P 33/00 (2006.01)
A 61 P 35/00 (2006.01)
A 61 P 35/02 (2006.01)
C 07 D 405/04 (2006.01)
C 07 D 239/40 (2006.01)
A 61 K 31/505 (2006.01)
C 07 D 417/04 (2006.01)
C 07 D 409/04 (2006.01)
A 61 K 31/5377 (2006.01)
C 07 D 403/04 (2006.01)
C 07 D 413/04 (2006.01)
C 07 D 239/42 (2006.01)

C 0 7 D 409/14 (2006.01)
C 0 7 D 401/04 (2006.01)
C 0 7 D 401/14 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 239/36
A 6 1 K 31/513
A 6 1 P 43/00 1 1 1
A 6 1 P 11/00
A 6 1 P 9/12
A 6 1 P 11/06
A 6 1 P 9/00
A 6 1 P 9/10
A 6 1 P 9/04
A 6 1 P 27/06
A 6 1 P 9/10 1 0 3
A 6 1 P 7/02
A 6 1 P 29/00
A 6 1 P 31/18
A 6 1 P 1/04
A 6 1 P 17/06
A 6 1 P 19/02
A 6 1 P 1/16
A 6 1 P 15/10
A 6 1 P 11/16
A 6 1 P 17/02
A 6 1 P 3/04
A 6 1 P 25/24
A 6 1 P 25/22
A 6 1 P 25/18
A 6 1 P 31/06
A 6 1 P 31/04
A 6 1 P 33/02
A 6 1 P 31/10
A 6 1 P 31/08
A 6 1 P 33/00
A 6 1 P 35/00
A 6 1 P 35/02
C 0 7 D 405/04
C 0 7 D 239/40
A 6 1 K 31/505
C 0 7 D 417/04
C 0 7 D 409/04
A 6 1 K 31/5377
C 0 7 D 403/04
C 0 7 D 413/04
C 0 7 D 239/42 Z
C 0 7 D 409/14
C 0 7 D 401/04
C 0 7 D 401/14

【手続補正書】

【提出日】平成25年9月19日(2013.9.19)

【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

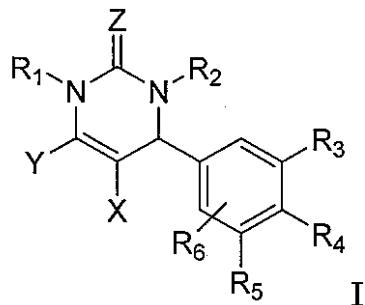
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式Iの化合物またはその医薬的に許容できる塩：

【化1】



[式中：

Xは、アリール、置換アリール、ヘテロアリール、置換ヘテロアリール、シクロアルキル、置換シクロアルキル、ヘテロサイクリルおよび置換ヘテロサイクリルからなる群より選択され、それぞれ環中に6個以下の員子を有し；

Yは、アリール、置換アリール、ヘテロアリール、置換ヘテロアリール、C₄ - C₆シクロアルキル、置換C₄ - C₆シクロアルキル、ヘテロサイクリルおよび置換ヘテロサイクリルからなる群より選択され；

Zは、O、SおよびNR₇からなる群より選択され；

R₁、R₂およびR₇は、独立して、水素およびC₁ - C₆アルキルからなる群より選択され；

R₃は、水素、ニトロ、シアノ、カルボキシ、カルバモイル、メチルスルホンアミド、フルオロ、クロロ、ブロモ、ヒドロキシ、メチルスルホニル、およびメチルスルフィニル、イソオキサゾール-4-イル、C₁ - C₆アルコキシ、-C(NH)NHOH、スルホン酸、およびアセチルからなる群より選択され；

R₄は、ヒドロキシ、カルボキシ、およびテトラゾール-5-イルからなる群より選択され；

R₅は、水素、ヒドロキシ、カルボキシ、クロロ、フルオロ、シアノ、-O(CH₂)₁₋₆NMe₂、C₁ - C₆アルキル、-O(CH₂)₁₋₆OCH₃、-O(CH₂)₁₋₆OH、アセチル、CF₃、およびC₁ - C₆アルコキシからなる群より選択され；

R₆は、水素およびヒドロキシからなる群より選択される]。

【請求項2】

R₁、R₂およびR₇は、独立して水素およびメチルからなる群より選択され；

R₃は、水素、ニトロ、シアノ、カルボキシ、カルバモイル、メチルスルホンアミド、フルオロ、クロロ、ブロモ、メチルスルホニル、およびメチルスルフィニル、イソオキサゾール-4-イル、C₁ - C₆アルコキシ、-C(NH)NHOH、スルホン酸、およびアセチルからなる群より選択され；

R₄は、ヒドロキシ、カルボキシ、およびテトラゾール-5-イルからなる群より選択され；

R_5 は、水素、ヒドロキシ、カルボキシ、クロロ、フルオロ、シアノ、-O(CH₂)₂NMe₂、C₁-C₆アルキル、-O(CH₂)₂OCH₃、-O(CH₂)₂OH、アセチル、CF₃、メトキシ、エトキシ、イソプロポキシ、およびn-プロポキシからなる群より選択される；

R_6 は、水素である；

請求項1に記載の化合物または塩。

【請求項3】

Xは、フェニル、置換フェニル、チオフェン-イル、置換チオフェン-イル、チアゾール-イル、置換チアゾール-イル、ピラジン-イル、置換ピラジン-イル、ピリジン-イル、および置換ピリジン-イル、シクロヘキシル、および置換シクロヘキシルからなる群より選択される、請求項1に記載の化合物または塩。

【請求項4】

Xは、フェニル、チオフェン-2-イル、チオフェン-3-イル、チアゾール-2-イル、2-フルオロフェニル、p-トリル、m-トリル、ビフェニル-4-イル、4-メトキシフェニル、3-クロロフェニル、3,4-ジクロロフェニル、3-メトキシフェニル、3,4-ジメトキシフェニル、4-プロモフェニル、o-トリル、4-クロロフェニル、2-クロロフェニル、3-シアノフェニル、3,4-ジフルオロフェニル、4-シアノフェニル、3-カルバモイルフェニル、ピラジン-2-イル、ビフェニル-3-イル、2-シアノフェニル、ピリジン-4-イル、およびピリジン-3-イル、4-(ジメチルアミノ)フェニル、3-フルオロフェニル、3-エチルフェニル、およびシクロヘキシルからなる群より選択される、請求項1に記載の化合物または塩。

【請求項5】

Yは、フェニル、置換フェニル、チオフェン-イル、置換チオフェン-イル、チアゾール-イル、置換チアゾール-イル、ピラジン-イル、置換ピラジン-イル、ピリジン-イル、置換ピリジン-イル、フラン-イル、置換フラン-イル、ベンゾ[d][1,3]ジオキソール-イル、置換ベンゾ[d][1,3]ジオキソール-イル、イミダゾール-イル、置換イミダゾール-イル、ナフタレン-イル、置換ナフタレン-イル、ピロール-イル、置換ピロール-イル、ピラゾール-イル、置換ピラゾール-イル、テトラヒドロフラン-イル、置換テトラヒドロフラン-イル、シクロペンチル、置換シクロペンチル、シクロヘキシル、および置換シクロヘキシルからなる群より選択される、請求項1に記載の化合物または塩。

【請求項6】

Yは、フェニル、3-メトキシフェニル、p-トリル、4-メトキシフェニル、3,5-ジクロロフェニル、3-フルオロフェニル、4-プロモフェニル、ビフェニル-4-イル、4-フルオロフェニル、4-クロロフェニル、3-クロロフェニル、3,4-ジメトキシフェニル、3-フルオロ-4-メトキシフェニル、4-クロロ-3-フルオロフェニル、3-クロロ-4-フルオロフェニル、3,4-ジフルオロフェニル、4-ヒドロキシフェニル、2,4-ジフルオロフェニル、3,4-ジクロロフェニル、4-ヒドロキシフェニル、2-フルオロフェニル、4-モルホリノフェニル、4-アミノフェニル、ナフタル-2-イル、ベンゾ[d][1,3]ジオキソール-5-イル、4-シアノフェニル、ナフタル-3-イル、ナフタル-4-イル、4-アセトアミドフェニル、チオフェン-2-イル、チオフェン-3-イル、1-メチル-1H-イミダゾール-4-イル、ナフタレン-1-イル、メチルフェニルカルバメート、およびナフタレン-2-イル、4-(メタンスルホンアミド)フェニル、1H-ピロール-3-イル、1-(フェニルスルホニル)-1H-ピロール-3-イル、フラン-2-イル、4-(トリフルオロメチル)フェニル、o-トリル、1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル、1-メチル-1H-ピラゾール-3-イル、3-クロロ-5-フルオロフェニル、3-ヒドロキシフェニル、ピラジン-2-イル、キノリン-6-イル、イソキノリン-6-イル、1-メチル-1H-ピラゾール-5-イル、テトラヒドロフラン-2-イル、シクロペンチル、テト

ラヒドロフラン - 3 - イル、およびシクロヘキシルからなる群より選択される、請求項 1 に記載の化合物または塩。

【請求項 7】

下記のものからなる群より選択される、請求項 1 に記載の化合物：

4 - (3 - エトキシ - 4 - ヒドロキシ - 5 - ニトロフェニル) - 5 , 6 - ジフェニル - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - オン ;
 (S) - 4 - (3 - エトキシ - 4 - ヒドロキシ - 5 - ニトロフェニル) - 5 , 6 - ジフェニル - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - オン ;
 4 - (3 - エトキシ - 4 - ヒドロキシ - 5 - ニトロフェニル) - 6 - フェニル - 5 - (チオフェン - 2 - イル) - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - オン ;
 4 - (3 - エトキシ - 4 - ヒドロキシ - 5 - ニトロフェニル) - 6 - フェニル - 5 - (チオフェン - 3 - イル) - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - オン ;
 (S) - 4 - (3 - エトキシ - 4 - ヒドロキシ - 5 - ニトロフェニル) - 6 - フェニル - 5 - (チオフェン - 3 - イル) - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - オン ;
 4 - (3 - エトキシ - 4 - ヒドロキシ - 5 - ニトロフェニル) - 5 , 6 - ジフェニル - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - チオン ;
 4 - (4 - ヒドロキシ - 3 - メトキシ - 5 - ニトロフェニル) - 5 , 6 - ジフェニル - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - オン ;
 4 - (3 , 4 - ジヒドロキシ - 5 - ニトロフェニル) - 5 , 6 - ジフェニル - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - オン ;
 4 - (3 - エトキシ - 4 - ヒドロキシ - 5 - ニトロフェニル) - 1 - メチル - 5 , 6 - ジフェニル - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - オン ;
 4 - (3 - エトキシ - 4 - ヒドロキシ - 5 - ニトロフェニル) - 6 - フェニル - 5 - (チアゾール - 2 - イル) - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - オン ;
 4 - (3 - エトキシ - 4 - ヒドロキシ - 5 - ニトロフェニル) - 5 - (2 - フルオロフェニル) - 6 - フェニル - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - オン ;
 4 - (3 - エトキシ - 4 - ヒドロキシ - 5 - ニトロフェニル) - 6 - フェニル - 5 - p - トリル - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - オン ;
 4 - (3 - エトキシ - 4 - ヒドロキシ - 5 - ニトロフェニル) - 6 - (3 - メトキシフェニル) - 5 - フェニル - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - オン ;
 4 - (3 - エトキシ - 4 - ヒドロキシ - 5 - ニトロフェニル) - 5 - フェニル - 6 - p - トリル - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - オン ;
 4 - (3 - エトキシ - 4 - ヒドロキシ - 5 - ニトロフェニル) - 6 - フェニル - 5 - m - トリル - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - オン ;
 5 - (ピフェニル - 4 - イル) - 4 - (3 - エトキシ - 4 - ヒドロキシ - 5 - ニトロフェニル) - 6 - フェニル - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - オン ;
 4 - (3 - エトキシ - 4 - ヒドロキシ - 5 - ニトロフェニル) - 5 - (4 - メトキシフェニル) - 6 - フェニル - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - オン ;
 4 - (3 - エトキシ - 4 - ヒドロキシ - 5 - ニトロフェニル) - 6 - (4 - メトキシフェニル) - 5 - フェニル - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - オン ;
 5 - (3 - クロロフェニル) - 4 - (3 - エトキシ - 4 - ヒドロキシ - 5 - ニトロフェニル) - 6 - フェニル - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - オン ;
 5 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) - 4 - (3 - エトキシ - 4 - ヒドロキシ - 5 - ニトロフェニル) - 6 - フェニル - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - オン ;
 4 - (3 - エトキシ - 4 - ヒドロキシ - 5 - ニトロフェニル) - 5 - (3 - メトキシフェニル) - 6 - フェニル - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - オン ;
 5 - (3 , 4 - ジメトキシフェニル) - 4 - (3 - エトキシ - 4 - ヒドロキシ - 5 - ニトロフェニル) - 6 - フェニル - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - オン ;
 5 - (4 - ブロモフェニル) - 4 - (3 - エトキシ - 4 - ヒドロキシ - 5 - ニトロフェニル) - 6 - フェニル - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - オン ;

ル) - 5 - フェニル - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - オン ;
 6 - (2 - クロロフェニル) - 4 - (3 - エトキシ - 4 - ヒドロキシ - 5 - ニトロフェニル) - 5 - フェニル - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - オン ;
 3 - (4 - (3 - エトキシ - 4 - ヒドロキシ - 5 - ニトロフェニル) - 2 - オキソ - 6 - フェニル - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロピリミジン - 5 - イル) ベンズアミド ;
 3 - (6 - (3 - エトキシ - 4 - ヒドロキシ - 5 - ニトロフェニル) - 2 - オキソ - 5 - フェニル - 1 , 2 , 3 , 6 - テトラヒドロピリミジン - 4 - イル) ベンゾニトリル ;
 6 - (4 - (ジメチルアミノ) フェニル) - 4 - (3 - エトキシ - 4 - ヒドロキシ - 5 - ニトロフェニル) - 5 - フェニル - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - オン ;
 4 - (3 - エトキシ - 4 - ヒドロキシ - 5 - ニトロフェニル) - 6 - (2 - フルオロフェニル) - 5 - フェニル - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - オン ;
 4 - (3 - エトキシ - 4 - ヒドロキシ - 5 - ニトロフェニル) - 6 - (4 - モルホリノフェニル) - 5 - フェニル - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - オン ;
 6 - (4 - アミノフェニル) - 4 - (3 - エトキシ - 4 - ヒドロキシ - 5 - ニトロフェニル) - 5 - フェニル - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - オン ;
 4 - (3 - エトキシ - 4 - ヒドロキシ - 5 - ニトロフェニル) - 6 - フェニル - 5 - (ピラジン - 2 - イル) - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - オン ;
 4 - (3 - エトキシ - 4 - ヒドロキシ - 5 - ニトロフェニル) - 5 - フェニル - 6 - (ピリジン - 2 - イル) - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - オン ;
 5 - (ピフェニル - 3 - イル) - 4 - (3 - エトキシ - 4 - ヒドロキシ - 5 - ニトロフェニル) - 6 - フェニル - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - オン ;
 6 - (ベンゾ [d] [1 , 3] ジオキソール - 5 - イル) - 4 - (3 - エトキシ - 4 - ヒドロキシ - 5 - ニトロフェニル) - 5 - フェニル - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - オン ;
 4 - (3 - エトキシ - 4 - ヒドロキシ - 5 - ニトロフェニル) - 3 - メチル - 5 , 6 - ジフェニル - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - オン ;
 4 - (6 - (3 - エトキシ - 4 - ヒドロキシ - 5 - ニトロフェニル) - 2 - オキソ - 5 - フェニル - 1 , 2 , 3 , 6 - テトラヒドロピリミジン - 4 - イル) ベンゾニトリル ;
 4 - (3 - エトキシ - 5 - フルオロ - 4 - ヒドロキシフェニル) - 5 , 6 - ジフェニル - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - オン ;
 4 - (3 - エトキシ - 4 - ヒドロキシ - 5 - ニトロフェニル) - 5 - フェニル - 6 - (ピリジン - 3 - イル) - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - オン ;
 (R) - 4 - (3 - エトキシ - 4 - ヒドロキシ - 5 - ニトロフェニル) - 5 - フェニル - 6 - (ピリジン - 3 - イル) - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - オン ;
 (S) - 4 - (3 - エトキシ - 4 - ヒドロキシ - 5 - ニトロフェニル) - 5 - フェニル - 6 - (ピリジン - 3 - イル) - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - オン ;
 4 - (3 - フルオロ - 4 - ヒドロキシ - 5 - メトキシフェニル) - 5 , 6 - ジフェニル - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - オン ;
 3 - エトキシ - 2 - ヒドロキシ - 5 - (2 - オキソ - 5 , 6 - ジフェニル - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロピリミジン - 4 - イル) ベンゾニトリル ;
 2 - (4 - (3 - エトキシ - 4 - ヒドロキシ - 5 - ニトロフェニル) - 2 - オキソ - 6 - フェニル - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロピリミジン - 5 - イル) ベンゾニトリル ;
 4 - (3 - エトキシ - 4 - ヒドロキシ - 5 - ニトロフェニル) - 5 - フェニル - 6 - (ピリジン - 4 - イル) - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - オン ;
 N - (4 - (6 - (3 - エトキシ - 4 - ヒドロキシ - 5 - ニトロフェニル) - 2 - オキソ - 5 - フェニル - 1 , 2 , 3 , 6 - テトラヒドロピリミジン - 4 - イル) フェニル) アセトアミド ;
 4 - (3 - エトキシ - 4 - ヒドロキシ - 5 - ニトロフェニル) - 6 - フェニル - 5 - (ピリジン - 4 - イル) - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - オン ;
 N - (3 - エトキシ - 2 - ヒドロキシ - 5 - (2 - オキソ - 5 , 6 - ジフェニル - 1 ,

2 , 3 , 4 - テトラヒドロピリミジン - 4 - イル) フェニル) メタンスルホンアミド ;
 N - (2 - ヒドロキシ - 3 - メトキシ - 5 - (2 - オキソ - 5 , 6 - ジフェニル - 1 ,
 2 , 3 , 4 - テトラヒドロピリミジン - 4 - イル) フェニル) メタンスルホンアミド ;
 3 - エトキシ - 2 - ヒドロキシ - 5 - (2 - オキソ - 5 , 6 - ジフェニル - 1 , 2 , 3
 , 4 - テトラヒドロピリミジン - 4 - イル) 安息香酸 ;
 4 - (3 - エトキシ - 4 - ヒドロキシ - 5 - ニトロフェニル) - 5 - フェニル - 6 - (
 チオフェン - 2 - イル) - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - オン ;
 4 - (3 - エトキシ - 4 - ヒドロキシ - 5 - ニトロフェニル) - 5 - フェニル - 6 - (
 チオフェン - 3 - イル) - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - オン ;
 4 - (3 - エトキシ - 4 - ヒドロキシ - 5 - ニトロフェニル) - 6 - (1 - メチル - 1
 H - イミダゾール - 4 - イル) - 5 - フェニル - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H
) - オン ;
 4 - (3 - エトキシ - 4 - ヒドロキシ - 5 - ニトロフェニル) - 6 - (ナフタレン - 1
 - イル) - 5 - フェニル - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - オン ;
 3 - エトキシ - 2 - ヒドロキシ - 5 - (2 - オキソ - 5 , 6 - ジフェニル - 1 , 2 , 3
 , 4 - テトラヒドロピリミジン - 4 - イル) ベンズアミド ;
 4 - (6 - (3 - エトキシ - 4 - ヒドロキシ - 5 - ニトロフェニル) - 2 - オキソ - 5
 - フェニル - 1 , 2 , 3 , 6 - テトラヒドロピリミジン - 4 - イル) フェニルカルバミン
 酸メチル ;
 4 - (3 - エトキシ - 4 - ヒドロキシ - 5 - ニトロフェニル) - 6 - フェニル - 5 - (
 ピリジン - 3 - イル) - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - オン ;
 4 - (3 - エトキシ - 4 - ヒドロキシ - 5 - ニトロフェニル) - 6 - (ナフタレン - 2
 - イル) - 5 - フェニル - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - オン ;
 2 - ヒドロキシ - 5 - (2 - オキソ - 5 , 6 - ジフェニル - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒ
 ドロピリミジン - 4 - イル) 安息香酸 ;
 4 - (4 - ヒドロキシ - 3 - メトキシフェニル) - 5 , 6 - ジフェニル - 3 , 4 - ジヒ
 ドロピリミジン - 2 (1 H) - オン ;
 5 - (4 - (ジメチルアミノ) フェニル) - 4 - (3 - エトキシ - 4 - ヒドロキシ - 5
 - ニトロフェニル) - 6 - フェニル - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - オン ;
 4 - (2 - オキソ - 5 , 6 - ジフェニル - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロピリミジン -
 4 - イル) 安息香酸 ;
 1 , 1 ' - (2 - ヒドロキシ - 5 - (2 - オキソ - 5 , 6 - ジフェニル - 1 , 2 , 3 ,
 4 - テトラヒドロピリミジン - 4 - イル) - 1 , 3 - フェニレン) ジエタノン ;
 4 - (4 - ヒドロキシ - 3 - ニトロフェニル) - 5 , 6 - ジフェニル - 3 , 4 - ジヒド
 ロピリミジン - 2 (1 H) - オン ;
 2 - ヒドロキシ - 5 - (2 - オキソ - 5 , 6 - ジフェニル - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒ
 ドロピリミジン - 4 - イル) ベンゾニトリル ;
 2 - エトキシ - 4 - (2 - オキソ - 5 , 6 - ジフェニル - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒド
 ロピリミジン - 4 - イル) 安息香酸 ;
 4 - (3 - ブロモ - 5 - エトキシ - 4 - ヒドロキシフェニル) - 5 , 6 - ジフェニル -
 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - オン ;
 N - (4 - (6 - (3 - エトキシ - 4 - ヒドロキシ - 5 - ニトロフェニル) - 2 - オキ
 ソ - 5 - フェニル - 1 , 2 , 3 , 6 - テトラヒドロピリミジン - 4 - イル) フェニル) メ
 タンスルホンアミド ;
 4 - (4 - ヒドロキシ - 3 - イソプロポキシ - 5 - ニトロフェニル) - 5 , 6 - ジフェ
 ニル - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - オン ;
 4 - (3 - エトキシ - 4 - ヒドロキシ - 5 - (メチルスルホニル) フェニル) - 5 , 6
 - ジフェニル - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - オン ;
 4 - (3 - エトキシ - 4 - ヒドロキシ - 5 - (メチルスルフィニル) フェニル) - 5 ,
 6 - ジフェニル - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - オン ;

3 - エトキシ - 2 - ヒドロキシ - 5 - (2 - オキソ - 6 - フェニル - 5 - (チオフェン - 3 - イル) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロピリミジン - 4 - イル) ベンゾニトリル ;
 4 - (3 - エトキシ - 4 - ヒドロキシ - 5 - ニトロフェニル) - 5 - フェニル - 6 - (1 H - ピロール - 3 - イル) - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - オン ;
 4 - (3 - エトキシ - 4 - ヒドロキシ - 5 - ニトロフェニル) - 5 - フェニル - 6 - (1 - (フェニルスルホニル) - 1 H - ピロール - 3 - イル) - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - オン ;
 4 - (3 - エトキシ - 4 - ヒドロキシ - 5 - ニトロフェニル) - 6 - (4 - フルオロフェニル) - 5 - (3 - メトキシフェニル) - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - オン ;
 4 - (3 - エトキシ - 4 - ヒドロキシ - 5 - ニトロフェニル) - 6 - (4 - フルオロフェニル) - 5 - (チオフェン - 3 - イル) - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - オン ;
 2 - ヒドロキシ - 3 - ニトロ - 5 - (2 - オキソ - 5 , 6 - ジフェニル - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロピリミジン - 4 - イル) 安息香酸 ;
 4 - (3 - エトキシ - 4 - ヒドロキシ - 5 - ニトロフェニル) - 6 - (フラン - 2 - イル) - 5 - フェニル - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - オン ;
 2 - エトキシ - 4 - (2 - イミノ - 5 , 6 - ジフェニル - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロピリミジン - 4 - イル) - 6 - ニトロフェノール ;
 4 - (3 - エトキシ - 4 - ヒドロキシ - 5 - ニトロフェニル) - 5 - フェニル - 6 - (4 - (トリフルオロメチル) フェニル) - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - オン ;
 4 - (3 - エトキシ - 4 - ヒドロキシ - 5 - ニトロフェニル) - 5 - フェニル - 6 - 0 - トリル - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - オン ;
 4 - (3 - エトキシ - 4 - ヒドロキシ - 5 - ニトロフェニル) - 5 - (3 - フルオロフェニル) - 6 - フェニル - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - オン ;
 4 - (3 - エトキシ - 4 - ヒドロキシ - 5 - ニトロフェニル) - 6 - (ピリジン - 3 - イル) - 5 - (チオフェン - 3 - イル) - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - オン ;
 (Z) - 2 - エトキシ - 4 - (2 - (メチルイミノ) - 5 , 6 - ジフェニル - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロピリミジン - 4 - イル) - 6 - ニトロフェノール ;
 4 - (3 - エトキシ - 4 - ヒドロキシ - 5 - ニトロフェニル) - 6 - (1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) - 5 - (チオフェン - 3 - イル) - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - オン ;
 4 - (3 - エトキシ - 4 - ヒドロキシ - 5 - ニトロフェニル) - 6 - (1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イル) - 5 - (チオフェン - 3 - イル) - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - オン ;
 4 - (3 - クロロ - 4 - ヒドロキシ - 5 - ニトロフェニル) - 5 , 6 - ジフェニル - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - オン ;
 6 - (3 - クロロ - 5 - フルオロフェニル) - 4 - (3 - エトキシ - 4 - ヒドロキシ - 5 - ニトロフェニル) - 5 - フェニル - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - オン ;
 2 - ヒドロキシ - 3 - ニトロ - 5 - (2 - オキソ - 5 , 6 - ジフェニル - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロピリミジン - 4 - イル) ベンゾニトリル ;
 2 - ヒドロキシ - 5 - (2 - オキソ - 5 , 6 - ジフェニル - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロピリミジン - 4 - イル) ベンゼンスルホン酸 ;
 (S) - 3 - エトキシ - 2 - ヒドロキシ - 5 - (2 - オキソ - 6 - (ピリジン - 3 - イル) - 5 - (チオフェン - 3 - イル) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロピリミジン - 4 - イル) 安息香酸 ;
 3 - エトキシ - 2 - ヒドロキシ - 5 - (2 - オキソ - 6 - (ピリジン - 3 - イル) - 5

- (チオフェン-3-イル)-1,2,3,4-テトラヒドロピリミジン-4-イル)安息香酸；

4-(3-フルオロ-4-ヒドロキシ-5-ニトロフェニル)-5,6-ジフェニル-3,4-ジヒドロピリミジン-2(1H)-オン；

3-エトキシ-2-ヒドロキシ-5-(2-オキソ-6-(ピリジン-3-イル)-5- (チオフェン-3-イル)-1,2,3,4-テトラヒドロピリミジン-4-イル)ベンゾニトリル；

4-(3-エトキシ-4-ヒドロキシ-5-ニトロフェニル)-6-(3-ヒドロキシフェニル)-5-フェニル-3,4-ジヒドロピリミジン-2(1H)-オン；

4-(4-ヒドロキシ-3-ニトロ-5-プロポキシフェニル)-5,6-ジフェニル-3,4-ジヒドロピリミジン-2(1H)-オン；

4-(3-エトキシ-4-ヒドロキシ-5-ニトロフェニル)-6-(ピラジン-2-イル)-5-(チオフェン-3-イル)-3,4-ジヒドロピリミジン-2(1H)-オン；

4-(3-エトキシ-4-ヒドロキシ-5-ニトロフェニル)-5-フェニル-6-(キノリン-6-イル)-3,4-ジヒドロピリミジン-2(1H)-オン；

4-(3-エトキシ-4-ヒドロキシ-5-ニトロフェニル)-6-(イソキノリン-6-イル)-5-フェニル-3,4-ジヒドロピリミジン-2(1H)-オン；

4-(3-エトキシ-4-ヒドロキシ-5-ニトロフェニル)-5-(3-メトキシフェニル)-6-(ピリジン-3-イル)-3,4-ジヒドロピリミジン-2(1H)-オン；

3-エトキシ-2-ヒドロキシ-5-(5-(3-メトキシフェニル)-2-オキソ-6-(ピリジン-3-イル)-1,2,3,4-テトラヒドロピリミジン-4-イル)安息香酸；

4-(3-エトキシ-4-ヒドロキシ-5-ニトロフェニル)-6-(ピリジン-4-イル)-5-(チオフェン-3-イル)-3,4-ジヒドロピリミジン-2(1H)-オン；

4-(4-ヒドロキシ-3-(2-ヒドロキシエトキシ)-5-ニトロフェニル)-5,6-ジフェニル-3,4-ジヒドロピリミジン-2(1H)-オン；

2-ヒドロキシ-4-(2-オキソ-5,6-ジフェニル-1,2,3,4-テトラヒドロピリミジン-4-イル)安息香酸；

4-(3-エトキシ-4-ヒドロキシ-5-ニトロフェニル)-6-(1-メチル-1H-ピラゾール-5-イル)-5-(チオフェン-3-イル)-3,4-ジヒドロピリミジン-2(1H)-オン；

2-ニトロ-4-(2-オキソ-5,6-ジフェニル-1,2,3,4-テトラヒドロピリミジン-4-イル)安息香酸；

4-(3-エトキシ-4-ヒドロキシ-5-ニトロフェニル)-5-(3-エチルフェニル)-6-フェニル-3,4-ジヒドロピリミジン-2(1H)-オン；

3-エトキシ-2-ヒドロキシ-5-(6-(1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル)-2-オキソ-5-(チオフェン-3-イル)-1,2,3,4-テトラヒドロピリミジン-4-イル)安息香酸；

(S)-4-(3-エトキシ-4-ヒドロキシ-5-ニトロフェニル)-6-(ピリジン-3-イル)-5-(チオフェン-3-イル)-3,4-ジヒドロピリミジン-2(1H)-オン；

2-クロロ-4-(2-オキソ-5,6-ジフェニル-1,2,3,4-テトラヒドロピリミジン-4-イル)安息香酸；

(S)-3-エトキシ-2-ヒドロキシ-5-(6-(1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル)-2-オキソ-5-(チオフェン-3-イル)-1,2,3,4-テトラヒドロピリミジン-4-イル)安息香酸；

(S)-4-(3-エトキシ-4-ヒドロキシ-5-ニトロフェニル)-6-(1-メ

チル - 1 H - ピラゾール - 3 - イル) - 5 - (チオフェン - 3 - イル) - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - オン ;
 3 - フルオロ - 2 - ヒドロキシ - 5 - (2 - オキソ - 5 , 6 - ジフェニル - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロピリミジン - 4 - イル) 安息香酸 ;
 2 - フルオロ - 4 - (2 - オキソ - 5 , 6 - ジフェニル - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロピリミジン - 4 - イル) 安息香酸 ;
 2 - エトキシ - 6 - ニトロ - 4 - (2 - オキソ - 5 , 6 - ジフェニル - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロピリミジン - 4 - イル) 安息香酸 ;
 4 - (4 - ヒドロキシ - 3 - ニトロ - 5 - (トリフルオロメチル) フェニル) - 5 , 6 - ジフェニル - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - オン ;
 4 - (4 - ヒドロキシ - 3 - (2 - メトキシエトキシ) - 5 - ニトロフェニル) - 5 , 6 - ジフェニル - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - オン ;
 4 - (4 - ヒドロキシ - 3 - ニトロ - 5 - プロピルフェニル) - 5 , 6 - ジフェニル - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - オン ;
 4 - (2 - オキソ - 5 , 6 - ジフェニル - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロピリミジン - 4 - イル) - 2 - (トリフルオロメチル) 安息香酸 ;
 2 - フルオロ - 6 - ヒドロキシ - 4 - (2 - オキソ - 5 , 6 - ジフェニル - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロピリミジン - 4 - イル) 安息香酸 ;
 2 - ヒドロキシ - 4 - (6 - (1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) - 2 - オキソ - 5 - (チオフェン - 3 - イル) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロピリミジン - 4 - イル) 安息香酸 ;
 2 - ヒドロキシ - 4 - (2 - オキソ - 5 - フェニル - 6 - (ピリジン - 3 - イル) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロピリミジン - 4 - イル) 安息香酸 ;
 2 - エトキシ - 6 - ヒドロキシ - 4 - (2 - オキソ - 5 , 6 - ジフェニル - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロピリミジン - 4 - イル) 安息香酸 ;
 4 - (4 - (2 H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル) - 5 - フェニル - 6 - (ピリジン - 3 - イル) - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - オン ;
 2 - クロロ - 6 - ヒドロキシ - 4 - (2 - オキソ - 5 , 6 - ジフェニル - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロピリミジン - 4 - イル) 安息香酸 ;
 4 - (4 - (2 H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル) - 5 , 6 - ジフェニル - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - オン ;
 2 - ヒドロキシ - 6 - メトキシ - 4 - (2 - オキソ - 5 , 6 - ジフェニル - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロピリミジン - 4 - イル) 安息香酸 ;
 4 - (4 - (2 H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル) - 6 - (ピリジン - 3 - イル) - 5 - (チオフェン - 3 - イル) - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - オン ;
 2 - ヒドロキシ - 4 - (6 - (1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) - 2 - オキソ - 5 - フェニル - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロピリミジン - 4 - イル) 安息香酸 ;
 (S) - 2 - ヒドロキシ - 4 - (6 - (1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) - 2 - オキソ - 5 - (チオフェン - 3 - イル) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロピリミジン - 4 - イル) 安息香酸 ;
 4 - (3 - (2 - (ジメチルアミノ) エトキシ) - 4 - ヒドロキシ - 5 - ニトロフェニル) - 5 , 6 - ジフェニル - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - オン ;
 4 - (3 - エトキシ - 4 - ヒドロキシ - 5 - ニトロフェニル) - 5 - フェニル - 6 - (テトラヒドロフラン - 2 - イル) - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - オン ;
 6 - シクロペンチル - 4 - (3 - エトキシ - 4 - ヒドロキシ - 5 - ニトロフェニル) - 5 - フェニル - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - オン ;
 4 - (3 - エトキシ - 4 - ヒドロキシ - 5 - ニトロフェニル) - 5 - フェニル - 6 - (テトラヒドロフラン - 3 - イル) - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - オン ;
 6 - シクロヘキシル - 4 - (3 - エトキシ - 4 - ヒドロキシ - 5 - ニトロフェニル) - 5 - (チオフェン - 3 - イル) - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - オン ;

4 - (3 - エトキシ - 4 - ヒドロキシ - 5 - ニトロフェニル) - 5 - フェニル - 6 - (S) - テトラヒドロフラン - 2 - イル) - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - オン ;

4 - (3 - エトキシ - 4 - ヒドロキシ - 5 - ニトロフェニル) - 5 - フェニル - 6 - (R) - テトラヒドロフラン - 2 - イル) - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - オン ; および

5 - シクロヘキシル - 4 - (3 - エトキシ - 4 - ヒドロキシ - 5 - ニトロフェニル) - 6 - フェニル - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - オン ;

これらの医薬的に許容できる塩。

【請求項 8】

療法有効量の請求項 1 ~ 7 のいずれかに記載の化合物またはその塩を医薬的に許容できるキャリヤーまたは賦形剤と共に含む、医薬組成物。

【請求項 9】

疾患または状態を処置する方法に使用される、請求項 8 に記載の医薬組成物。

【請求項 10】

疾患または状態が、N O ドナー療法により改善される障害である、請求項 8 または 9 に記載の医薬組成物。

【請求項 11】

前記の式 I の化合物またはその塩が、S 鏡像異性体である、請求項 8 ~ 1 0 のいずれかに記載の医薬組成物。

【請求項 12】

疾患または状態が、低酸素症および / または肺の平滑筋収縮および / または肺の感染症および / または肺の傷害に関連する肺障害、心血管疾患、心疾患、血管新生を特徴とする疾患、血栓症が起きるリスクのある障害、再狭窄が起きるリスクのある障害、炎症性疾患、機能性腸障害、アポトーシスが起きるリスクのある疾患、インポテンス、睡眠無呼吸、糖尿病性創傷の治癒、皮膚感染症、乾癬、異常な食欲に応答した摂食により起きる肥満症、発作、再灌流傷害、心臓または脳を後続の虚血事象に対して N O 保護のために前調整することが有益である障害、中枢神経系障害、細菌により起きる感染症からなる群より選択される、請求項 8 ~ 1 1 のいずれかに記載の医薬組成物。

【請求項 13】

疾患または状態が、肺高血圧症、A R D S 、喘息、肺炎、肺線維症 / 間質性肺疾患、囊胞性線維症、C O P D 、高血圧症、虚血性冠動脈症候群、アテローム性硬化症、心不全、緑内障、冠動脈疾患、エイズ関連認知症、炎症性腸疾患、クローン病、過敏性腸症候群、心不全、アテローム性硬化症、変性性神経障害、関節炎、肝傷害、心臓もしくは肺の外傷性筋傷害、または圧挫損傷、不安、うつ病、精神病、統合失調症、結核、および、クロストリジウム - ディフィシレ (c. difficile) 感染症からなる群より選択される、請求項 8 ~ 1 1 のいずれかに記載の医薬組成物。

【請求項 14】

請求項 1 ~ 7 のいずれかに記載の式 I の化合物またはその塩と医薬的に許容できるキャリヤーまたは賦形剤とを共にすることを含む、請求項 8 ~ 1 3 のいずれかに記載の医薬組成物を製造する方法。