

【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22年6月3日(2010.6.3)

【公表番号】特表2004-527508(P2004-527508A)

【公表日】平成16年9月9日(2004.9.9)

【年通号数】公開・登録公報2004-035

【出願番号】特願2002-571501(P2002-571501)

【国際特許分類】

C 07 D 471/14	(2006.01)
A 61 K 31/4745	(2006.01)
A 61 K 31/4985	(2006.01)
A 61 K 31/519	(2006.01)
A 61 P 9/00	(2006.01)
A 61 P 9/06	(2006.01)
A 61 P 11/00	(2006.01)
A 61 P 13/02	(2006.01)
A 61 P 13/12	(2006.01)
A 61 P 17/06	(2006.01)
A 61 P 25/04	(2006.01)
A 61 P 25/08	(2006.01)
A 61 P 25/14	(2006.01)
A 61 P 25/16	(2006.01)
A 61 P 25/20	(2006.01)
A 61 P 25/28	(2006.01)
A 61 P 27/06	(2006.01)
A 61 P 29/00	(2006.01)
A 61 P 35/00	(2006.01)
A 61 P 37/00	(2006.01)
C 07 D 487/04	(2006.01)
C 07 D 495/04	(2006.01)
C 07 D 513/04	(2006.01)

【F I】

C 07 D 471/14	1 0 1
A 61 K 31/4745	
A 61 K 31/4985	
A 61 K 31/519	
A 61 P 9/00	
A 61 P 9/06	
A 61 P 11/00	
A 61 P 13/02	
A 61 P 13/12	
A 61 P 17/06	
A 61 P 25/04	
A 61 P 25/08	
A 61 P 25/14	
A 61 P 25/16	
A 61 P 25/20	
A 61 P 25/28	
A 61 P 27/06	

A 6 1 P 29/00
A 6 1 P 35/00
A 6 1 P 37/00
C 0 7 D 487/04 1 4 0
C 0 7 D 487/04 1 4 2
C 0 7 D 495/04 1 0 5 Z
C 0 7 D 513/04 3 5 5
C 0 7 M 7:00

【誤訳訂正書】

【提出日】平成22年3月31日(2010.3.31)

【誤訳訂正1】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】特許請求の範囲

【訂正方法】変更

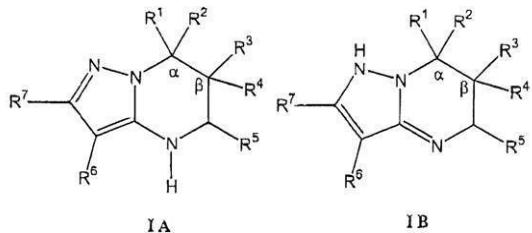
【訂正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

一般式(IA)又は(IB)

【化1】



{式中、

基R¹及びR²が相互に無関係にH、O-R⁹、S-R¹⁰、メチル、エチル、n-プロピル、2-プロピル、n-ブチル、t-ブチル又はn-ヘキシル、アリール¹、アリール²又はアリール³を示し、アリール¹の置換基R²⁹、R³⁰及びR³¹が相互に無関係にH、メチル、エチル、n-プロピル、2-プロピル、n-ブチル、t-ブチル又はn-ヘキシル、F、Cl、Br、I、OH、O-メチル、O-エチルを示し、

この場合R¹及びR²のうちの一方はHであり、R¹及びR²のうちの他方はHを示さないか、又はR¹及びR²のうちの一方がアリール¹、アリール²又はアリール³を意味する場合、R¹及びR²のうちの他方がH又はメチル、エチル、n-プロピル、2-プロピル、n-ブチル、t-ブチル又はn-ヘキシルを意味する；

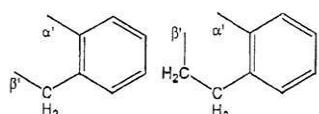
R³及びR⁴がH、メチル又はアリール¹を示し、アリール¹の置換基R²⁹、R³⁰及びR³¹が相互に無関係にH、メチル、又はO-メチルであり、

この場合基R³及びR⁴のうちの少なくとも1つはHであるか、

あるいは

基R¹及びR²のうちの一方は基R³及びR⁴の一方と一緒にになってWを形成し、Wは' - C H = C H - C H₂ - '、' - C H = C H - C H₂ - C H₂ - '、'- O - (C H₂)_m - ' (m = 2, 3, 4又は5)、

【化2】



を示し、'で表わされるWの末端は一般式(IA)又は(IB)の化合物の'で表わさ

れる原子と結合し、'で表わされるWの末端は一般式(IA)又は(IB)の化合物の
で表わされる原子と結合し、

基R¹及びR²のうちの他方、及び基R³及びR⁴のうちの他方は、それぞれHを示し、
R⁵がメチル、エチル、n-プロピル、2-プロピル、n-ブチル、イソ-ブチル、s-
ブチル、t-ブチル、-(CH₂)₄-OH、シクロプロピル(この際シクロプロピルは
置換されていないか又はC(=O)OH、C(=O)O-メチル又はC(=O)O-エチル
によってモノ置換されていてよい。)、シクロペンチル、シクロヘキシリル、アリール¹
又は-(CH₂)_k-アリール¹(この際アリール¹-置換基R²⁹、R³⁰及びR³¹が相互
に無関係にH、-OH、-O-メチル、O-C₆H₅、CH₃、CF₃又はC(=O)O
Hであり、k=1又は2)、ヘテロシクリル又はC(=O)R¹¹を示し、

R⁶はH、-CN、臭素、C(=O)R¹⁷又は-N=N-フェニルを示し、

R⁷はH、又はR²⁹、R³⁰及びR³¹がH、OH又はSR¹⁹であるアリール¹、又はメチ
ル、エチル、n-プロピル、2-プロピル、n-ブチル、イソ-ブチル、s-ブチル又は
t-ブチルを示し、

R⁹はメチル、エチル、n-プロピル、2-プロピル、n-ブチル、イソ-ブチル、s-
ブチル、t-ブチル、n-アミル、イソ-アミル、s-アミル、n-ヘキシリル、イソ-ヘ
キシリル、s-ヘキシリル、シクロプロピル、シクロペンチル又はシクロヘキシリルを示すか、
又は-[(CH₂)_r-O]_s-H(r=1,2又は3、そしてs=1又は2)を示し、

R¹⁰はアリール¹(R²⁹、R³⁰及びR³¹がHである。)を示し、

R¹¹はアリール¹(R²⁹、R³⁰及びR³¹がHである。)を示し、

R¹⁷はOR²⁶を示し、

R¹⁹はメチルであり、

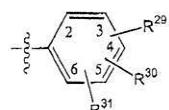
R²⁶がH、メチル又はエチルを示し、

この際、

ヘテロシクリルはフラン-2-イル、フラン-3-イル、チエン-2-イル、チエン-3-
イル、ピリジン-2-イル、ピリジン-3-イル又はピリジン-4-イルを示し、この
場合フラニル、チエニル及びピリジニルはそれぞれ置換されていないか、又は-N₂O、
-CH₃又はC(=O)OHによってモノ-置換又は同一又は異なってジ-、トリ-、又
はテトラ-置換されている、

アリール¹は

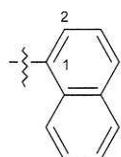
【化3】



を示し、

アリール²が

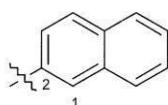
【化4】



を示し、

アリール³が

【化5】



を示す。}

で表わされる化合物、又はその生理学的に許容し得る塩、又はその立体異性体、又は任意の混合物割合でのその立体異性体の混合物、又はそのラセミ化合物

(但し、一般式 I A 又は I B で表わされる次の化合物は除く：

4, 5, 6, 7 - テトラヒドロ - 2 - メチル - 5, 7 - ジフェニル - ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン、

4, 5, 6, 7 - テトラヒドロ - 2, 5 - ジメチル - 7 - フェニル - ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン、

4, 5, 6, 7 - テトラヒドロ - 2, 5, 7 - トリメチル - ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン、

4, 5, 6, 7 - テトラヒドロ - 5, 7 - ジメチル - 2 - フェニル - ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン、

4, 5, 6, 7 - テトラヒドロ - 2 - メチル - 5, 7 - ジ - n - プロピル - ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボニトリル、

7 - [4 - (クロロ) - フェニル] - 4, 5, 6, 7 - テトラヒドロ - 5 - メチル - ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボニトリル、

7 - [3 - (クロロ) - フェニル] - 4, 5, 6, 7 - テトラヒドロ - 5 - メチル - ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボニトリル)。

【請求項 2】

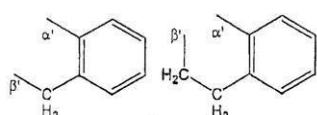
基 R¹ 及び R² が相互に無関係に H、O - C H₂ - C H₂ - O H、O - シクロヘキシル、S - フェニル、メチル、フェニル、3 - フルオロ - フェニル、3 - ブロモ - フェニル、4 - ブロモ - フェニル、4 - クロロ - フェニル、4 - フルオロ - フェニル、3 - メチル - フェニル、4 - ヒドロキシ - フェニル、4 - メトキシ - フェニル、2, 4 - ジメチル - フェニル、3, 4 - ジメトキシ - フェニル、2, 3, 4 - トリメトキシフェニル、2 - ナフチル又は - C H₂ - フェニルを示し、

R³ 及び R⁴ が H、メチル又は 4 - メトキシ - フェニルを示し、この場合基 R³ 及び R⁴ のうちの少なくとも 1 つが H であるか、

あるいは

基 R¹ 及び R² のうちの一方は基 R³ 及び R⁴ の一方と一緒にになって W を形成し、この場合 W は ' - C H = C H - C H₂ - '、' - C H = C H - C H₂ - C H₂ - '、' - O - (C H₂)_m - ' (m = 2, 3, 4 又は 5)、

【化 6】



を示し、' で表わされる W の末端は一般式 (I A) 又は (I B) の化合物の ' で表わされる原子と結合し、' で表わされる W の末端は一般式 (I A) 又は (I B) の化合物の ' で表わされる原子と結合し、

R¹ 及び R² のうちの他方は及び基 R³ 及び R⁴ のうちの他方はそれぞれ H を示し、R⁵ が n - ブロピル、n - ブチル、t - ブチル、- (C H₂)₄ - O H、シクロプロピル、シクロプロブ - 2 - イル - 1 - カルボン酸エチルエステル、シクロヘキシル、4 - トリフルオロフェニル、4 - フェノキシ - フェニル、2 - ヒドロキシ - 3 - メトキシ - フェニル、4 - ヒドロキシ - 3 - メトキシ - フェニル、3 - カルボキシ - 2 - ヒドロキシ - フェニル、- (C H₂)₂ - フェニル、5 - カルボキシ - フラン - 2 - イル、5 - メチル - フラン - 2 - イル、5 - ニトロ - フラン - 2 - イル、5 - ニトロ - チエン - 2 - イル、ピリジン - 2 - イル、ピリジン - 3 - イル、C (= O) フェニル、C (= O) O H 又は C (= O) O エチルを示し、

この際同時に R¹ がアリール、R² がアルキルを示す場合、R⁵ は C (= O) O H を示さない、

R⁶ が H、 - C N , 臭素、 - C (= O) OH , - C (= O) O エチル又は - N = N - フェニルを示し、

R⁷ が H、 フェニル、 OH、 - S - メチル、 又は t - ブチルを示す、
請求項 1 記載の化合物。

【請求項 3】

前記化合物が次の群 :

- ・ 3 - ブロモ - 5 - (5 - ニトロ - フラン - 2 - イル) - 7 - m - トリル - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン、
- ・ 3 - ブロモ - 7 - (4 - フルオロ - フェニル) - 7 - メチル - 5 - (5 - ニトロ - フラン - 2 - イル) - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン、
- ・ 3 - ブロモ - 7 - ナフタリン - 2 - イル - 5 - (5 - ニトロ - フラン - 2 - イル) - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン、
- ・ 2 - (3 - ブロモ - 7 - m - トリル - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 5 - イル) - シクロプロパンカルボン酸エチルエステル、
- ・ 2 - [3 - ブロモ - 7 - (4 - ブロモ - フェニル) - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 5 - イル] - シクロプロパンカルボン酸エチルエステル、
- ・ 2 - (3 - ブロモ - 7 - ナフタリン - 2 - イル - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 5 - イル) - シクロプロパンカルボン酸エチルエステル、
- ・ 3 - ブロモ - 7 - (4 - フルオロ - フェニル) - 7 - メチル - 5 - (5 - メチル - フラン - 2 - イル) - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン、
- ・ 3 - ブロモ - 7 - (3 , 4 - ジメトキシ - フェニル) - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 5 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ 3 - ブロモ - 7 - (4 - メトキシ - フェニル) - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 5 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ 3 - ブロモ - 7 - (4 - メトキシ - フェニル) - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 5 - カルボン酸、
- ・ 3 - ブロモ - 7 - (2 , 4 - ジメチル - フェニル) - 5 - (5 - ニトロ - フラン - 2 - イル) - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン、
- ・ 3 - ブロモ - 7 - (4 - メトキシ - フェニル) - 5 - (5 - ニトロ - フラン - 2 - イル) - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン、
- ・ 5 , 5 a , 6 , 8 a - テトラヒドロ - 3 H - 1 , 4 , 8 b - トリアザ - a s - インダセン - 3 , 5 - ジカルボン酸ジエチルエステル ; 5 , 5 a , 6 , 8 a - テトラヒドロ - 4 H - 1 , 4 , 8 b - トリアザ - a s - インダセン - 3 , 5 - ジカルボン酸ジエチルエステル
- ・ 2 - ヒドロキシ - 3 - フェニルアゾ - 5 , 5 a , 6 , 8 a - テトラヒドロ - 3 H - 1 , 4 , 8 b - トリアザ - a s - インダセン - 5 - カルボン酸エチルエステル ; 2 - ヒドロキシ - 3 - フェニルアゾ - 5 , 5 a , 6 , 8 a - テトラヒドロ - 4 H - 1 , 4 , 8 b - トリアザ - a s - インダセン - 5 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ 2 - t - ブチル - 5 , 5 a , 6 , 8 a - テトラヒドロ - 3 H - 1 , 4 , 8 b - トリアザ - a s - インダセン - 5 - カルボン酸エチルエステル ; 2 - t - ブチル - 5 , 5 a , 6 , 8 a - テトラヒドロ - 3 H - 1 , 4 , 8 b - トリアザ - a s - インダセン - 5 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ 3 - ブロモ - 2 - フェニル - 5 , 5 a , 6 , 8 a - テトラヒドロ - 3 H - 1 , 4 , 8 b - トリアザ - a s - インダセン - 5 - カルボン酸エチルエステル ; 3 - ブロモ - 2 - フェニル - 5 , 5 a , 6 , 8 a - テトラヒドロ - 4 H - 1 , 4 , 8 b - トリアザ - a s - インダセン - 5 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ 7 - (2 , 3 , 4 - トリメトキシ - フェニル) - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 , 5 - ジカルボン酸ジエチルエステル、
- ・ 3 - ジアノ - 2 - メチルスルファニル - 7 - (2 , 3 , 4 - トリメトキシ - フェニル) - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 5 - カルボン酸エチルエステル、

- ・ 2 - ヒドロキシ - 7 - (4 - ヒドロキシ - フェニル) - 6 - メチル - 3 - フェニルアゾ - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 5 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ 3 - プロモ - 7 - (4 - ヒドロキシ - フェニル) - 6 - メチル - 2 - フェニル - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 5 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ 5 , 5 a , 6 , 10 b - テトラヒドロ - 3 H - 1 , 4 , 10 c - トリアザ - シクロ펜タ [c] フルオレン - 3 , 5 - ジカルボン酸ジエチルエステル ; 5 , 5 a , 6 , 10 b - テトラヒドロ - 4 H - 1 , 4 , 10 c - トリアザ - シクロ펜タ [c] フルオレン - 3 , 5 - ジカルボン酸ジエチルエステル、
- ・ 2 - ヒドロキシ - 3 - フェニルアゾ - 5 , 5 a , 6 , 10 b - テトラヒドロ - 3 H - 1 , 4 , 10 c - トリアザ - シクロ펜타 [c] フルオレン - 5 - カルボン酸エチルエステル ; 2 - ヒドロキシ - 3 - フェニルアゾ - 5 , 5 a , 6 , 10 b - テトラヒドロ - 4 H - 1 , 4 , 10 c - トリアザ - シクロ펜타 [c] フルオレン - 5 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ 7 - フェニルスルファニル - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 , 5 - ジカルボン酸ジエチルエステル、
- ・ 3 - シアノ - 2 - メチルスルファニル - 7 - フェニルスルファニル - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 5 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ 3 - シアノ - 2 - メチルスルファニル - 7 - (2 , 3 , 4 - トリメトキシ - フェニル) - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 5 - カルボン酸、
- ・ 7 - フェニルスルファニル - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 , 5 - ジカルボン酸 - 3 - エチルエステル、
- ・ 3 - シアノ - 7 - (2 , 4 - ジメチル - フェニル) - 2 - メチルスルファニル - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 5 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ 3 - シアノ - 7 - (3 , 4 - ジメチル - フェニル) - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 5 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ 7 - (2 , 4 - ジメチル - フェニル) - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 , 5 - ジカルボン酸 - 3 - エチルエステル、
- ・ 3 - ブロモ - 7 - (2 , 4 - ジメチル - フェニル) - 2 - フェニル - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 5 - カルボン酸、
- ・ 3 - シアノ - 7 - (2 , 4 - ジメチル - フェニル) - 2 - メチルスルファニル - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 5 - カルボン酸、
- ・ 3 - シアノ - 7 - (2 , 4 - ジメチル - フェニル) - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 5 - カルボン酸、
- ・ 3 - シアノ - 7 - (2 , 4 - ジメトキシ - フェニル) - 2 - メチルスルファニル - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 5 - カルボン酸、
- ・ 7 - (2 , 4 - ジメチル - フェニル) - 5 - (5 - ニトロ - フラン - 2 - イル) - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ 7 - (2 , 4 - ジメチル - フェニル) - 5 - (5 - ニトロ - フラン - 2 - イル) - 3 - フェニルアゾ - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 2 - オール、
- ・ 3 - ブロモ - 7 - (2 , 4 - ジメチル - フェニル) - 5 - (5 - ニトロ - フラン - 2 - イル) - 2 - フェニル - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン
- ・ 7 - (2 , 4 - ジメチル - フェニル) - 2 - メチルスルファニル - 5 - (5 - ニトロ - フラン - 2 - イル) - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボニトリル、
- ・ 7 - (2 , 4 - ジメチル - フェニル) - 5 - (5 - ニトロ - フラン - 2 - イル) - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボニトリル、
- ・ 3 - ブロモ - 7 - (3 , 4 - ジメトキシ - フェニル) - 5 - (5 - ニトロ - フラン - 2 - イル) - 2 - フェニル - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン、
- ・ 7 - (4 - メトキシ - フェニル) - 2 - メチルスルファニル - 5 - (5 - ニトロ - フラン - 2 - イル) - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボニトリ

ル、

- ・ 7 - (2 , 4 - ジメチル - フェニル) - 5 - (5 - エトキシカルボニル - シクロプロピル) - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ 2 - [7 - (2 , 4 - ジメチル - フェニル) - 2 - ヒドロキシ - 3 - フェニルアゾ - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 5 - イル] - シクロプロパンカルボン酸エチルエステル、
- ・ 2 - [2 - t - ブチル - 7 - (2 , 4 - ジメチル - フェニル) - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 5 - イル] - シクロプロパンカルボン酸エチルエステル、
- ・ 2 - [3 - プロモ - 7 - (2 , 4 - ジメチル - フェニル) - 2 - フェニル - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 5 - イル] - シクロプロパンカルボン酸エチルエステル、
- ・ 2 - [3 - シアノ - 7 - (2 , 4 - ジメチル - フェニル) - 2 - メチルスルファニル - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 5 - イル] - シクロプロパンカルボン酸エチルエステル、
- ・ 5 - (2 - エトキシカルボニル - シクロプロピル) - 7 - (3 - フルオロ - フェニル) - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ 2 - [3 - プロモ - 7 - (3 - プロモ - フェニル) - 2 - フェニル - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 5 - イル] - シクロプロパンカルボン酸エチルエステル、
- ・ 2 - [7 - (3 - プロモ - フェニル) - 3 - シアノ - 2 - メチルスルファニル - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 5 - イル] - シクロプロパンカルボン酸エチルエステル、
- ・ 7 - (2 , 4 - ジメチル - フェニル) - 5 - (5 - ニトロ - チオフェン - 2 - イル) - 3 - フェニルアゾ - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 2 - オール、
- ・ 7 - (2 , 4 - ジメチル - フェニル) - 2 - メチルスルファニル - 5 - (5 - ニトロ - チオフェン - 2 - イル) - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボニトリル、
- ・ 7 - (2 , 4 - ジメチル - フェニル) - 5 - (5 - ニトロ - チオフェン - 2 - イル) - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボニトリル、
- ・ 7 - (3 , 4 - ジメトキシ - フェニル) - 5 - (5 - ニトロ - チオフェン - 2 - イル) - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ 7 - (3 , 4 - ジメトキシ - フェニル) - 5 - (5 - ニトロ - チオフェン - 2 - イル) - 3 - フェニルアゾ - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 2 - オール、
- ・ 3 - プロモ - 7 - (3 , 4 - ジメトキシ - フェニル) - 5 - (5 - ニトロ - チオフェン - 2 - イル) - 2 - フェニル - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン、
- ・ 7 - (3 , 4 - ジメトキシ - フェニル) - 2 - メチルスルファニル - 5 - (5 - ニトロ - チオフェン - 2 - イル) - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボニトリル、
- ・ 7 - (3 , 4 - ジメトキシ - フェニル) - 5 - (5 - ニトロ - チオフェン - 2 - イル) - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボニトリル、
- ・ 7 - (4 - メトキシ - フェニル) - 5 - (5 - ニトロ - チオフェン - 2 - イル) - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ 5 - [3 - プロモ - 7 - (4 - メトキシ - フェニル) - 2 - フェニル - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 5 - イル] - フラン - 2 - カルボン酸、
- ・ 5 - ベンゾイル - 7 - (2 , 4 - ジメチル - フェニル) - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ 5 - ベンゾイル - 7 - (2 , 4 - ジメトキシ - フェニル) - 2 - メチルスルファニル - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボニトリル、
- ・ 5 - ベンゾイル - 7 - (2 , 4 - ジメチル - フェニル) - テトラヒドロ - ピラゾロ [1

- , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボニトリル、
 • 5 - ベンゾイル - 7 - (3 , 4 - ジメトキシ - フェニル) - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボン酸エチルエステル、
 • [3 - ブロモ - 7 - (3 , 4 - ジメトキシ - フェニル) - 2 - フェニル - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 5 - イル] - フェニル - メタノン、
 • 5 - ベンゾイル - 7 - (3 , 4 - ジメトキシ - フェニル) - 2 - メチルスルファニル - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボニトリル、
 • 5 - ベンゾイル - 7 - (3 , 4 - ジメトキシ - フェニル) - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボニトリル、
 • 5 - ベンゾイル - 7 - (4 - メトキシ - フェニル) - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボン酸エチルエステル、
 • 5 - ベンゾイル - 7 - (4 - メトキシ - フェニル) - 2 - メチルスルファニル - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボニトリル、
 • 5 - ベンゾイル - 7 - (4 - メトキシ - フェニル) - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボニトリル、
 • 5 - ベンゾイル - 7 - (3 - フルオロ - フェニル) - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボン酸エチルエステル、
 • [3 - ブロモ - 7 - (3 - フルオロ - フェニル) - 2 - フェニル - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 5 - イル] - フェニル - メタノン、
 • [3 - ブロモ - 7 - (3 - ブロモ - フェニル) - 2 - フェニル - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 5 - イル] - フェニル - メタノン、
 • 7 - (2 , 4 - ジメチル - フェニル) - 5 - (4 - フェノキシ - フェニル) - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボン酸エチルエステル、
 • 3 - ブロモ - 7 - (2 , 4 - ジメチル - フェニル) - 5 - (4 - フェノキシ - フェニル) - 2 - フェニル - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン、
 • 7 - (2 , 4 - ジメチル - フェニル) - 2 - メチルスルファニル - 5 - (4 - フェノキシ - フェニル) - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボニトリル、
 • 7 - (2 , 4 - ジメチル - フェニル) - 5 - (4 - フェノキシ - フェニル) - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボニトリル、
 • 7 - (3 , 4 - ジメトキシ - フェニル) - 2 - フェニル - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボニトリル、
 • 7 - (3 , 4 - ジメトキシ - フェニル) - 2 - メチルスルファニル - 5 - (4 - フェノキシ - フェニル) - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボニトリル、
 • 3 - [3 - シアノ - 7 - (4 - ヒドロキシ - フェニル) - 6 - メチル - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 5 - イル] - 2 - ヒドロキシ - 安息香酸、
 • 3 - (3 - シアノ - 5 , 5 a , 6 , 1 0 b - テトラヒドロ - 3 H - 1 , 4 , 1 0 c - トリアザ - シクロペンタ [c] フルオレン - 5 - イル) - 2 - ヒドロキシ - 安息香酸 ; 3 - (3 - シアノ - 5 , 5 a , 6 , 1 0 b - テトラヒドロ - 4 H - 1 , 4 , 1 0 c - トリアザ - シクロペンタ [c] フルオレン - 5 - イル) - 2 - ヒドロキシ - 安息香酸
 • 3 - (3 - シアノ - 7 - フェニスルファニル - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 5 - イル] - 2 - ヒドロキシ - 安息香酸、
 • 3 - [2 - t - ブチル - 7 - (4 - クロロ - フェニル) - 7 - メチル - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 5 - イル] - 2 - ヒドロキシ - 安息香酸、
 • 5 - (4 - ヒドロキシ - 3 - メトキシ - フェニル) - 7 - (4 - ヒドロキシ - フェニル) - 6 - メチル - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボン酸エチルエステル、
 • 5 - (4 - ヒドロキシ - 3 - メトキシ - フェニル) - 7 - (4 - ヒドロキシ - フェニル) - 6 - メチル - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボニトリル

ル、

- ・ 5 - (4 - ヒドロキシ - 3 - メトキシ - フェニル) - 5 , 5 a , 6 , 1 0 b - テトラヒドロ - 3 H - 1 , 4 , 1 0 c - トリアザ - シクロペンタ [c] フルオレン - 3 - カルボン酸エチルエステル ; 5 - (4 - ヒドロキシ - 3 - メトキシ - フェニル) - 5 , 5 a , 6 , 1 0 b - テトラヒドロ - 4 H - 1 , 4 , 1 0 c - トリアザ - シクロペンタ [c] フルオレン - 3 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ 4 - (2 - t - ブチル - 5 , 5 a , 6 , 1 0 b - テトラヒドロ - 3 H - 1 , 4 , 1 0 c - トリアザ - シクロペンタ [c] フルオレン - 5 - イル) - 2 - メトキシ - フエノール ; 4 - (2 - t - ブチル - 5 , 5 a , 6 , 1 0 b - テトラヒドロ - 4 H - 1 , 4 , 1 0 c - トリアザ - シクロペンタ [c] フルオレン - 5 - イル) - 2 - メトキシ - フエノール
- ・ 5 - (4 - ヒドロキシ - 3 - メトキシ - フェニル) - 2 - メチルスルファニル - 5 , 5 a , 6 , 1 0 b - テトラヒドロ - 3 H - 1 , 4 , 1 0 c - トリアザ - シクロペンタ [c] フルオレン - 3 - カルボニトリル ; 5 - (4 - ヒドロキシ - 3 - メトキシ - フェニル) - 2 - メチルスルファニル - 5 , 5 a , 6 , 1 0 b - テトラヒドロ - 3 H - 1 , 4 , 1 0 c - トリアザ - シクロペンタ [c] フルオレン - 3 - カルボニトリル、
- ・ 5 - (4 - ヒドロキシ - 3 - メトキシ - フェニル) - 7 - フエニルスルファニル - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ 4 - (2 - t - ブチル - 7 - フエニルスルファニル - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 5 - イル) - 2 - メトキシ - フエノール、
- ・ 4 - (3 - ブロモ - 2 - フエニル - 7 - フエニルスルファニル - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 5 - イル) - 2 - メトキシ - フエノール、
- ・ 5 - (2 - ヒドロキシ - 3 - メトキシ - フェニル) - 7 - フエニルスルファニル - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ 7 - (4 - クロロ - フエニル) - 5 - (2 - ヒドロキシ - 3 - メトキシ - フェニル) - 7 - メチル - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ 5 - (4 - ヒドロキシ - ブチル) - 5 , 5 a , 6 , 1 0 b - テトラヒドロ - 3 H - 1 , 4 , 1 0 c - トリアザ - シクロペンタ [c] フルオレン - 3 - カルボニトリル ; 5 - (4 - ヒドロキシ - ブチル) - 5 , 5 a , 6 , 1 0 b - テトラヒドロ - 4 H - 1 , 4 , 1 0 c - トリアザ - シクロペンタ [c] フルオレン - 3 - カルボニトリル
- ・ 5 - (4 - ヒドロキシ - ブチル) - 2 - メチルスルファニル - 7 - フエニルスルファニル - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボニトリル、
- ・ 5 - (4 - ヒドロキシ - ブチル) - 7 - フエニルスルファニル - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボニトリル、
- ・ 7 - (4 - クロロ - フエニル) - 5 - (2 - ヒドロキシ - ブチル) - 7 - メチル - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボニトリル、
- ・ 5 - ブチル - 2 - メチルスルファニル - 5 , 5 a , 6 , 1 0 b - テトラヒドロ - 3 H - 1 , 4 , 1 0 c - トリアザ - シクロペンタ [c] フルオレン - 3 - カルボニトリル ; 5 - ブチル - 2 - メチルスルファニル - 5 , 5 a , 6 , 1 0 b - テトラヒドロ - 4 H - 1 , 4 , 1 0 c - トリアザ - シクロペンタ [c] フルオレン - 3 - カルボニトリル、
- ・ 5 - ブチル - 2 - メチルスルファニル - 7 - フエニルスルファニル - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボニトリル、
- ・ 5 - ブチル - 7 - フエニルスルファニル - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボニトリル、
- ・ 5 - ブチル - 7 - (4 - クロロ - フエニル) - 7 - メチル - 2 - メチルスルファニル - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボニトリル、
- ・ 5 - シクロプロピル - 7 - (2 , 4 - ジメチル - フエニル) - 3 - フエニルアゾ - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 2 - オール、
- ・ 2 - t - ブチル - 5 - シクロプロピル - 7 - (2 , 4 - ジメチル - フエニル) - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン、

- ・ 5 - シクロプロピル - 7 - (2 , 4 - ジメチル - フェニル) - 2 - メチルスルファニル - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボニトリル、
- ・ 2 - t - ブチル - 5 - シクロプロピル - 7 - (3 , 4 - ジメトキシ - フェニル) - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン、
- ・ 3 - プロモ - 5 - シクロプロピル - 7 - (3 , 4 - ジメトキシ - フェニル) - 2 - フェニル - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン、
- ・ 5 - シクロプロピル - 7 - (4 - メトキシ - フェニル) - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ 5 - シクロプロピル - 3 , 5 , 5 a , 6 , 7 , 11 b - ヘキサヒドロ - 1 , 4 , 11 c - トリアザ - シクロペンタ [c] フェナントレン - 3 - カルボニトリル、
- ・ 7 - (2 , 4 - ジメチル - フェニル) - 5 - ピリジン - 2 - イル - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ 7 - (2 , 4 - ジメチル - フェニル) - 3 - フェニルアゾ - 5 - ピリジン - 2 - イル - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 2 - オール、
- ・ 3 - プロモ - 7 - (2 , 4 - ジメチル - フェニル) - 2 - フェニル - 5 - ピリジン - 2 - イル - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン、
- ・ 7 - (2 , 4 - ジメチル - フェニル) - 2 - メチルスルファニル - 5 - ピリジン - 2 - イル - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボニトリル、
- ・ 7 - (3 , 4 - ジメトキシ - フェニル) - 2 - メチルスルファニル - 5 - フェネチル - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボニトリル、
- ・ 7 - (3 , 4 - ジメトキシ - フェニル) - 5 - フェネチル - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボニトリル、
- ・ 5 - シクロプロピル - 7 - (2 - ヒドロキシ - エトキシ) - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ 2 - (2 - t - ブチル - 5 - シクロプロピル - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 7 - イルオキシ) - エタノール、
- ・ 5 - シクロプロピル - 3 , 5 , 5 a , 6 , 7 , 8 a - ヘキサヒドロ - 8 - オキサ - 1 , 4 , 8 b - トリアザ - a s - インダセン - 3 - カルボン酸エチルエステル； 5 - シクロプロピル - 4 , 5 , 5 a , 6 , 7 , 8 a - ヘキサヒドロ - 8 - オキサ - 1 , 4 , 8 b - トリアザ - a s - インダセン - 3 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ 5 - シクロプロピル - 3 - フェニルアゾ - 3 , 5 , 5 a , 6 , 7 , 8 a - ヘキサヒドロ - 8 - オキサ - 1 , 4 , 8 b - トリアザ - a s - インダセン - 2 - オール； 5 - シクロプロピル - 3 - フェニルアゾ - 4 , 5 , 5 a , 6 , 7 , 8 a - ヘキサヒドロ - 8 - オキサ - 1 , 4 , 8 b - トリアザ - a s - インダセン - 2 - オール、
- ・ 7 - シクロヘキシルオキシ - 5 - シクロプロピル - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ 7 - シクロヘキシルオキシ - 5 - シクロプロピル - 2 - メチルスルファニル - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボニトリル、
- ・ 7 - (4 - クロロ - フェニル) - 5 - シクロヘキシル - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボニトリル、
- ・ 5 - シクロヘキシル - 7 - (2 - ヒドロキシ - エトキシ) - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ 5 - シクロヘキシル - 3 , 5 , 5 a , 6 , 7 , 8 a - ヘキサヒドロ - 8 - オキサ - 1 , 4 , 8 b - トリアザ - a s - インダセン - 3 - カルボン酸エチルエステル； 5 - シクロヘキシル - 4 , 5 , 5 a , 6 , 7 , 8 a - ヘキサヒドロ - 8 - オキサ - 1 , 4 , 8 b - トリアザ - a s - インダセン - 3 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ 5 - シクロヘキシル - 7 - シクロヘキシルオキシ - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ 7 - (2 , 4 - ジメチル - フェニル) - 3 - フェニルアゾ - 5 - プロピル - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 2 - オール、

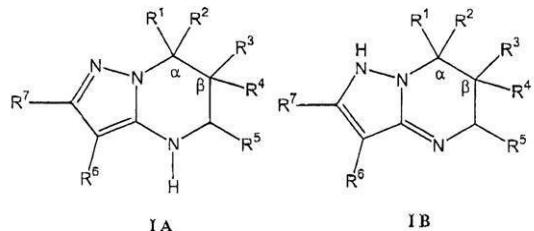
- ・ 7 - (2 , 4 - ジメチル - フェニル) - 2 - メチルスルファニル - 5 - プロピル - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボニトリル、
- ・ 5 - t - ブチル - 7 - (2 , 4 - ジメチル - フェニル) - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ 2 , 5 - ジ - t - ブチル - 7 - (3 , 4 - ジメトキシ - フェニル) - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン、
- ・ 3 - ブロモ - 5 - t - ブチル - 7 - (3 , 4 - ジメトキシ - フェニル) - 2 - フェニル - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン、
- ・ 2 - [3 - シアノ - 6 , 7 - ビス - (4 - メトキシ - フェニル) - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 5 - イル] - シクロプロパンカルボン酸エチルエステル、
- ・ 3 - シアノ - 6 , 7 - ビス - (4 - メトキシ - フェニル) - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 5 - カルボン酸、
- ・ 4 - [3 - ブロモ - 6 - メチル - 2 - フェニル - 5 - (4 - トリフルオロメチル - フェニル) - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 7 - イル] - フェノール、
- ・ 7 - (4 - ヒドロキシフェニル) - 6 - メチル - 2 - メチルスルファニル - 5 - (4 - トリフルオロメチル - フェニル) - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボニトリル、
- ・ 7 - (4 - ヒドロキシフェニル) - 6 - メチル - 5 - (4 - トリフルオロメチル - フェニル) - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボニトリル、
- ・ 7 - フェニル - 3 - フェニルアゾ - 5 - ピリジン - 2 - イル - 3 , 5 , 6 , 7 - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 2 - オール、
- ・ 7 - フェニルスルファニル - 5 - ピリジン - 2 - イル - 3 , 5 , 6 , 7 - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ 3 - フェニルスアゾ - 7 - フェニルスルファニル - 5 - ピリジン - 2 - イル - 3 , 5 , 6 , 7 - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 2 - オール、
- ・ 3 - ブロモ - 7 - フェニルスルファニル - 5 - ピリジン - 2 - イル - 3 , 5 , 6 , 7 - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン、
- ・ 7 - フェニルスルファニル - 5 - ピリジン - 2 - イル - 3 , 5 , 6 , 7 - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボニトリル、
- ・ 7 - (3 , 4 - ジメトキシフェニル) - 2 - メチルスルファニル - 5 - ピリジン - 2 - イル - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボニトリル、
- ・ 3 - ブロモ - 7 - (3 , 4 - ジメトキシフェニル) - 2 - フェニル - 5 - ピリジン - 2 - イル - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン、
- ・ 3 - ブロモ - 7 - (3 , 4 - ジメトキシフェニル) - 2 - フェニル - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 5 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ 3 - ブロモ - 7 - (3 , 4 - ジメトキシフェニル) - 5 - (5 - ニトロ - フラン - 2 - イル) - 2 - フェニル - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン、
- ・ 3 - シアノ - 7 - (3 , 4 - ジメトキシフェニル) - 2 - メチルスルファニル - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 5 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ 3 - シアノ - 7 - (3 , 4 - ジメトキシフェニル) - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 5 - カルボン酸エチルエステル、
- ・ 3 - ブロモ - 7 - (3 , 4 - ジメトキシフェニル) - 2 - フェニル - 5 - ピリジン - 2 - イル - 4 , 5 , 6 , 7 - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボニトリル、
- ・ 7 - (3 , 4 - ジメトキシフェニル) - 2 - メチルスルファニル - 5 - (5 - ニトロ - フラン - 2 - イル) - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボニトリル、
- ・ 7 - (3 , 4 - ジメトキシフェニル) - 5 - ピリジン - 2 - イル - 4 , 5 , 6 , 7 - テ

トラヒドロ - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボン酸エチルエステルから選ばれる、請求項 1 記載の一般式 (I A) 又は (I B) で表わされる化合物。

【請求項 4】

一般式 (I A) 又は (I B)

【化 7】



{ 式中、

基 R¹ 及び R² が相互に無関係に H、O - R⁹、S - R¹⁰、メチル、エチル、n - プロピル、2 - プロピル、n - ブチル、t - ブチル又は n - ヘキシル、アリール¹、アリール² 又はアリール³ を示し、アリール¹ の置換基 R²⁹、R³⁰ 及び R³¹ が相互に無関係に H、メチル、エチル、n - プロピル、2 - プロピル、n - ブチル、t - ブチル又は n - ヘキシル、F、Cl、Br、I、OH、O - メチル、O - エチルを示し、

この場合 R¹ 及び R² のうちの一方は H であり、R¹ 及び R² のうちの他方は H を示さないか、又は R¹ 及び R² のうちの一方がアリール¹、アリール² 又はアリール³ を意味する場合、R¹ 及び R² のうちの他方が H 又はメチル、エチル、n - プロピル、2 - プロピル、n - ブチル、t - ブチル又は n - ヘキシルを意味する；

R³ 及び R⁴ が H、メチル又はアリール¹ を示し、アリール¹ の置換基 R²⁹、R³⁰ 及び R³¹ が相互に無関係に H、メチル、又は O - メチルであり、

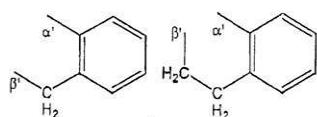
この場合基 R³ 及び R⁴ のうちの少なくとも 1 つは H であるか、

あるいは

基 R¹ 及び R² のうちの一方は基 R³ 及び R⁴ の一方と一緒にになって W を形成し、

W は ' - C H = C H - C H₂ - ' 、 ' - C H = C H - C H₂ - C H₂ - ' 、
- O - (C H₂)_m - ' (m = 2 , 3 , 4 又は 5) 、

【化 8】



を示し、' で表わされる W の末端は一般式 (I A) 又は (I B) の化合物の ' で表わされる原子と結合し、' で表わされる W の末端は一般式 (I A) 又は (I B) の化合物の ' で表わされる原子と結合し、

基 R¹ 及び R² のうちの他方、及び基 R³ 及び R⁴ のうちの他方は、それぞれ H を示し、R⁵ がメチル、エチル、n - プロピル、2 - プロピル、n - ブチル、イソ - ブチル、s - ブチル、t - ブチル、- (C H₂)₄ - OH、シクロプロピル（この際シクロプロピルは置換されていないか又は C (= O) OH、C (= O) O - メチル又は C (= O) O - エチルによってモノ置換されていてよい。）、シクロペンチル、シクロヘキシル、アリール¹ 又は - (C H₂)_k - アリール¹（この際アリール¹ - 置換基 R²⁹、R³⁰ 及び R³¹ が相互に無関係に H、- OH、- O - メチル、O - C₆H₅、C H₃、C F₃ 又は C (= O) OH であり、k = 1 又は 2）、ヘテロシクリル又は C (= O) R¹¹ を示し、

R⁶ は H、- CN、臭素、C (= O) R¹⁷ 又は - N = N - フェニルを示し、

R⁷ は又は R²⁹、R³⁰ 及び R³¹ が H、OH 又は SR¹⁹ であるアリール¹、又はメチル、エチル、n - プロピル、2 - プロピル、n - ブチル、イソ - ブチル、s - ブチル又は t - ブチルを示し、

R⁹ はメチル、エチル、n - プロピル、2 - プロピル、n - ブチル、イソ - ブチル、s -

ブチル、t - ブチル、n - アミル、イソ - アミル、s - アミル、n - ヘキシル、イソ - ヘキシル、s - ヘキシル、シクロプロピル、シクロペンチル又はシクロヘキシルを示すか、又は - [(C H₂)_r - O]_s - H (r = 1, 2 又は 3, そして s = 1 又は 2) を示し、

R¹⁰ はアリール¹ (R²⁹、R³⁰ 及び R³¹ が H である。) を示し、

R¹¹ はアリール¹ (R²⁹、R³⁰ 及び R³¹ が H である。) を示し、

R¹⁷ は O R²⁶ を示し、

R¹⁹ はメチルであり、

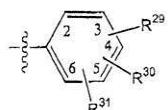
R²⁶ が H、メチル又はエチルを示し、

この際、

ヘテロシクリルはフラン - 2 - イル、フラン - 3 - イル、チエン - 2 - イル、チエン - 3 - イル、ピリジン - 2 - イル、ピリジン - 3 - イル又はピリジン - 4 - イルを示し、この場合フラニル、チエニル及びピリジニルはそれぞれ置換されていないか又はモノ置換された又は - N O₂、- C H₃ 又は C (= O) O H によって、同一又は異なってジ - 、トリ - 、又はテトラ - 置換されている。

アリール¹ は

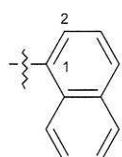
【化 9】



を示し、

アリール² が

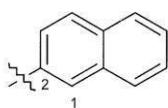
【化 10】



を示し、

アリール³ が

【化 11】

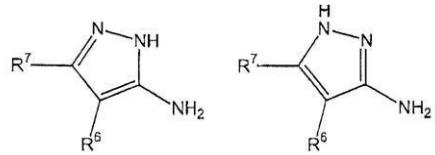


を示す。 }

で表わされる化合物又はその薬学的に許容し得る塩を製造するにあたり、

一般式 (IIIA) 又は (IIIB)

【化 12】



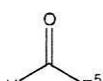
III A

III B

(式中、R⁶ 及び R⁷ は上記に定義された通りである。)

で表わされるピラゾールアミンを一般式 (IV)

【化 13】

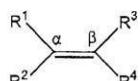


IV

(式中、R⁵は請求項1に定義した通りである。)

で表わされるアルデヒド及び一般式(V)

【化14】



V

(式中、R¹、R²、R³及びR⁴は上記に定義した通りであるが、基R¹及びR²のうちの一方は基R³及びR⁴の一方と一緒にになってWを形成する場合、

'で表わされるWの末端は一般式(V)のオレフィンの'で表わされる炭素原子と結合し、「で表わされるWの末端は一般式(V)のオレフィンの'で表わされる炭素原子と結合する。)

で表わされるオレフィンと酸の存在下で反応させることを特徴とする、上記一般式(IA)又は(IB)で表わされる化合物又はその薬学的に許容し得る塩の製造方法。

【請求項5】

一般式(IIIA)又は(IIIB)で表わされるヘテロシクリルアミンと一般式(IV)で表わされるアルデヒド及び一般式(V)で表わされるオレフィンの反応を回分法で実施する、請求項4記載の方法。

【請求項6】

酸がトリフルオロ酢酸である、請求項4又は5記載の方法。

【請求項7】

反応が有機溶剤中で0~100の温度で0.25~12時間の反応時間で実施される、請求項4~6のいずれか1つに記載の方法。

【請求項8】

反応が15~40の温度で実施される、請求項4~7のいずれか1つに記載の方法。

【請求項9】

請求項1記載の一般式(IA)又は(IB)で表わされる化合物、又はその生理学的に許容し得る塩、又はその立体異性体、又は任意の混合物割合でのその立体異性体の混合物、又はそのラセミ化合物の少なくとも1種を含有する、痛み、癲癇、統合失調症；アルツハイマー病、ハンチングトン病又はパーキンソン病から選ばれる神経変性疾患、脳虚血、脳梗塞、高められたアミノ酸レベルに起因する精神病、脳浮腫；低酸素症及び無酸素症での中枢神経系供給不足状態(Unterversorgungszustaenden des zentralen Nervensystem)、 AIDS-痴呆症、脳脊髄炎、ツレット症候群、周産期仮死、耳鳴り、神経障害性痛、気道疾患、癌、心臓不整脈、虚血、ハンチングトン病、免疫障害及び免疫疾患、炎症状態及び炎症疾患、新生児低酸素症、神経変性疾患、腎不全、不眠症、卒中発作、血栓症、尿失禁、糖尿病、乾癬、敗血症性ショック、脳外傷、縁内障及び/又はうつ血性機能不全の予防及び/又は治療用医薬。

【請求項10】

請求項1記載の一般式(IA)又は(IB)で表わされる化合物、又はその生理学的に許容し得る塩、又はその立体異性体、又は任意の混合物割合でのその立体異性体の混合物、又はそのラセミ化合物の痛みの治療用医薬の製造への使用。

【請求項11】

請求項1記載の一般式(IA)又は(IB)で表わされる化合物、又はその生理学的に許容し得る塩、又はその立体異性体、又は任意の混合物割合でのその立体異性体の混合物、

又はそのラセミ化合物の、癲癇、統合失調症；アルツハイマー病、ハンチングトン病又はパーキンソン病から選ばれる神経変性疾患、脳虚血、脳梗塞、高められたアミノ酸レベルに起因する精神病、脳浮腫；低酸素症及び無酸素症での中枢神経系供給不足状態、AID S - 痴呆症、脳脊髄炎、ツレット症候群、周産期仮死及び耳鳴りの治療及び／又は予防用医薬の製造への使用。

【請求項 1 2】

請求項 1 記載の一般式 (IA) 又は (IB) で表わされる化合物、又はその生理学的に許容し得る塩、又はその立体異性体、又は任意の混合物割合でのその立体異性体の混合物、又はそのラセミ化合物の、痛み、神経障害性痛、気道疾患、癌、心臓不整脈、虚血、癲癇、ハンチングトン病、免疫障害及び免疫疾患、炎症状態及び炎症疾患、新生児低酸素症、神経変性疾患、パーキンソン病、腎不全、統合失調症、不眠症、卒中発作、血栓症、尿失禁、糖尿病、乾癬、敗血症性ショック、脳外傷、縁内障及び／又はうつ血性機能不全の予防及び／又は治療用医薬の製造への使用。

【請求項 1 3】

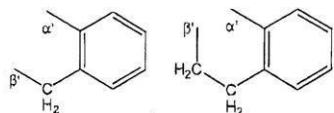
基 R¹ 及び R² が相互に無関係に H、O - C H₂ - C H₂ - O H、O - シクロヘキシル、S - フェニル、メチル、フェニル、3 - フルオロ - フェニル、3 - ブロモ - フェニル、4 - ブロモ - フェニル、4 - クロロ - フェニル、4 - フルオロ - フェニル、3 - メチル - フェニル、4 - ヒドロキシ - フェニル、4 - メトキシ - フェニル、2, 4 - ジメチル - フェニル、3, 4 - ジメトキシ - フェニル、2, 3, 4 - トリメトキシフェニル、2 - ナフチル又は - C H₂ - フェニルを示し、

R³ 及び R⁴ が H、メチル又は 4 - メトキシ - フェニルを示し、この場合基 R³ 及び R⁴ のうちの少なくとも 1 つが H であるか、

あるいは

基 R¹ 及び R² のうちの一方は基 R³ 及び R⁴ の一方と一緒にになって W を形成し、この場合 W は ' - C H = C H - C H₂ - '、' - C H = C H - C H₂ - C H₂ - '、' - O - (C H₂)_m - ' (m = 2, 3, 4 又は 5)、

【化 1 9】



を示し、' で表わされる W の末端は一般式 (IA) 又は (IB) の化合物の ' で表わされる原子と結合し、' で表わされる W の末端は一般式 (IA) 又は (IB) の化合物の ' で表わされる原子と結合し、

R¹ 及び R² のうちの他方は及び基 R³ 及び R⁴ のうちの他方はそれぞれ H を示し、R⁵ が n - プロピル、n - ブチル、t - ブチル、- (C H₂)₄ - O H、シクロプロピル、シクロプロブ - 2 - イル - 1 - カルボン酸エチルエステル、シクロヘキシル、4 - トリフルオロメチルフェニル、4 - フェノキシ - フェニル、2 - ヒドロキシ - 3 - メトキシ - フェニル、4 - ヒドロキシ - 3 - メトキシ - フェニル、3 - カルボキシ - 2 - ヒドロキシ - フェニル、- (C H₂)₂ - フェニル、5 - カルボキシ - フラン - 2 - イル、5 - メチル - フラン - 2 - イル、5 - ニトロ - フラン - 2 - イル、5 - ニトロ - チエン - 2 - イル、ピリジン - 2 - イル、ピリジン - 3 - イル、C (= O) フェニル、C (= O) O H 又は C (= O) O エチルを示し、

この際同時に R¹ がアリール、R² がアルキルを示す場合、R⁵ は C (= O) O H を示さない、

R⁶ が H、- C N, 臭素、- C (= O) O H, - C (= O) O エチル又は - N = N - フェニルを示し、

R⁷ が H、フェニル、O H、- S - メチル又は t - ブチルを示す、

請求項 1 2 記載の使用。

【請求項 1 4】

請求項 1 記載の一般式 (I A) 又は (I B) で表わされる化合物、又はその生理学的に許容し得る塩、又はその立体異性体、又は任意の混合物割合でのその立体異性体の混合物、又はそのラセミ化合物の少なくとも 1 種及び医薬用助剤の少なくとも 1 種を含有する、痛み、癲癇、統合失調症；アルツハイマー病、ハンチングトン病又はパーキンソン病から選ばれる神経変性疾患、脳虚血、脳梗塞、高められたアミノ酸レベルに起因する精神病、脳浮腫；低酸素症及び無酸素症での中枢神経系供給不足状態、AIDS - 痴呆症、脳脊髄炎、ツレット症候群、周産期仮死、耳鳴り、神経障害性痛、気道疾患、癌、心臓不整脈、虚血、ハンチングトン病、免疫障害及び免疫疾患、炎症状態及び炎症疾患、新生児低酸素症、神経変性疾患、腎不全、不眠症、卒中発作、血栓症、尿失禁、糖尿病、乾癬、敗血症性ショック、脳外傷、縁内障及び / 又はうっ血性機能不全の予防及び / 又は治療用薬学的調合物。