

【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4月11日(2013.4.11)

【公表番号】特表2011-525898(P2011-525898A)

【公表日】平成23年9月29日(2011.9.29)

【年通号数】公開・登録公報2011-039

【出願番号】特願2011-515594(P2011-515594)

【国際特許分類】

C 07 D 487/04	(2006.01)
A 61 K 31/519	(2006.01)
A 61 P 43/00	(2006.01)
A 61 P 25/16	(2006.01)
A 61 P 25/14	(2006.01)
A 61 P 25/24	(2006.01)
A 61 P 25/28	(2006.01)
A 61 P 25/04	(2006.01)

【F I】

C 07 D 487/04	1 4 6
C 07 D 487/04	C S P
A 61 K 31/519	
A 61 P 43/00	1 1 1
A 61 P 25/16	
A 61 P 25/14	
A 61 P 25/24	
A 61 P 25/28	
A 61 P 25/04	

【手続補正書】

【提出日】平成24年3月14日(2012.3.14)

【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

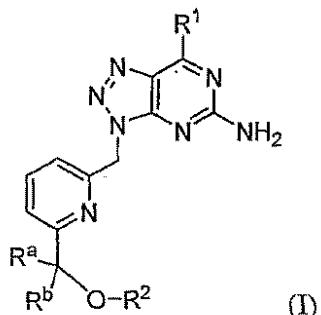
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)の化合物、ならびに、それらの互変異性体、立体異性体、薬学的に許容される塩および溶媒和物：

【化8】



式中、

R¹はフェニルまたはヘテロアリールであり、該フェニル基または該ヘテロアリール基は、アルキル、アルコキシ、ハロ、または-C≡Nで必要に応じて置換され得る；

R^aは、Hまたはアルキルである；

R^bは、Hまたはアルキルである；

あるいは、R^aとR^bは、それらに結合した原子と一緒に、3員～8員の飽和もしくは部分的に飽和した炭化水素環を形成するか、または、O、N(R³)、およびSから選択される環構成要素を含む4員～8員の飽和もしくは部分的に飽和した複素環を形成する；

R²は、H、アルキル、またはヘテロシクロアルキルであり、ここでは、該アルキルは、ハロ、アルコキシ、またはヘテロシクロアルキルで必要に応じて置換され得る；

ただし、R¹が、フラン-2-イルまたは5-メチル-フラン-2-イルであり、R^aとR^bがいずれもHである場合は、R²は、ヘテロシクロアルキル、およびアルキル(ハロ、アルコキシ、もしくはヘテロシクロアルキルによって置換されている)から選択される；

R³は、Hまたはアルキルである；

ここで、

ヘテロアリールは、N、N(R⁴)、S、およびOから選択される1つもしくは2つの環構成要素を含む5員もしくは6員の芳香環である；

アルキル(またはアルコキシ基のアルキル基)は、10個までの炭素原子を含む直鎖または分枝した飽和炭化水素である；

ヘテロシクロアルキルは、C結合したかまたはN結合した3員～10員の非芳香族の単環であり、ここでは、該ヘテロシクロアルキル環には、N、N(R⁴)、S(O)_q、およびOから別々に選択される1個、2個、もしくは3個の環構成要素が含まれる；

R⁴は、Hまたはアルキルである；

qは、0、1、または2である。

【請求項2】

R¹が、フェニル、2-フラニル、2-ピロリル、2-イミダゾリル、2-オキサゾリル、および2-チアゾリルから選択され、ここでは、それぞれが必要に応じて、アルキルまたはアルコキシで置換され得る、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

R¹が、5-メチル-フラン-2-イルである、請求項1に記載の化合物。

【請求項4】

R^aとR^bが、それらに結合した原子と一緒に、テトラヒドロピリル環、シクロブチル環、シクロペンチル環、またはシクロヘキシリル環を形成する、請求項1～3のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項5】

R^aとR^bが、Hおよび(C₁～C₆)アルキルから別々に選択される、請求項1～3のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項6】

R²が、H、(C₁～C₄)アルキル、およびテトラヒドロフラニルから選択され、ここでは、該(C₁～C₄)アルキルは、フルオロ、(C₁～C₃)アルコキシ、およびテトラヒドロフラニルで必要に応じて置換され得る、請求項1～5のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項7】

R²が、Hおよびテトラヒドロフリルから選択される、請求項1～5のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項8】

以下から選択される、請求項1に記載の化合物、ならびに、それらの薬学的に許容される塩および溶媒和物：

7-(5-メチルフラン-2-イル)-3-(6-[2-イソプロピルオキシエトキシ]

ジン - 5 - アミン ;
7 - (3 - シアノフェニル) - 3 - (6 - [1 - ヒドロキシシクロブチル] ピリド - 2 - イルメチル) - 3 H - [1 , 2 , 3] トリアゾロ [4 , 5 - d] ピリミジン - 5 - アミン ;
7 - (3 - メトキシフェニル) - 3 - (6 - [1 - ヒドロキシ - 1 - メチルエチル] ピリド - 2 - イルメチル) - 3 H - [1 , 2 , 3] トリアゾロ [4 , 5 - d] ピリミジン - 5 - アミン ;
7 - (3 - シアノフェニル) - 3 - (6 - [メトキシメチル] ピリド - 2 - イルメチル) - 3 H - [1 , 2 , 3] トリアゾロ [4 , 5 - d] ピリミジン - 5 - アミン ;
S - 7 - (4 - メチルチアゾール - 2 - イル) - 3 - (6 - [テトラヒドロフラン - 3 - イル] オキシメチルピリド - 2 - イルメチル) - 3 H - [1 , 2 , 3] トリアゾロ [4 , 5 - d] ピリミジン - 5 - アミン ;
7 - (4 - メチルチアゾール - 2 - イル) - 3 - (6 - [1 - ヒドロキシ - 1 - シクロペンチル] ピリド - 2 - イルメチル) - 3 H - [1 , 2 , 3] トリアゾロ [4 , 5 - d] ピリミジン - 5 - アミン ;
7 - (4 - メチルチアゾール - 2 - イル) - 3 - (6 - [4 - ヒドロキシテトラヒドロピラン - 4 - イル] ピリド - 2 - イルメチル) - 3 H - [1 , 2 , 3] トリアゾロ [4 , 5 - d] ピリミジン - 5 - アミン ;
7 - (5 - メチルフラン - 2 - イル) - 3 - (6 - [1 - ヒドロキシシクロブチル] ピリド - 2 - イルメチル) - 3 H - [1 , 2 , 3] トリアゾロ [4 , 5 - d] ピリミジン - 5 - アミン ;
7 - (4 - メチルチアゾール - 2 - イル) - 3 - (6 - [メトキシメチル] ピリド - 2 - イルメチル) - 3 H - [1 , 2 , 3] トリアゾロ [4 , 5 - d] ピリミジン - 5 - アミン ;
7 - (5 - メチルフラン - 2 - イル) - 3 - (6 - [ジフルオロメチルオキシメチル] - ピリド - 2 - イルメチル) - 3 H - [1 , 2 , 3] トリアゾロ [4 , 5 - d] ピリミジン - 5 - アミン ;
7 - フェニル - 3 - (6 - [4 - ヒドロキシテトラヒドロピラン - 4 - イル] ピリド - 2 - イルメチル) - 3 H - [1 , 2 , 3] トリアゾロ [4 , 5 - d] ピリミジン - 5 - アミン ;
7 - (5 - メチルフラン - 2 - イル) - 3 - (6 - [2 - エトキシエトキシメチル] ピリド - 2 - イルメチル) - 3 H - [1 , 2 , 3] トリアゾロ [4 , 5 - d] ピリミジン - 5 - アミン ;
7 - (5 - メチルフラン - 2 - イル) - 3 - (6 - [テトラヒドロフラン - 2 - イルメチル] オキシメチルピリド - 2 - イルメチル) - 3 H - [1 , 2 , 3] トリアゾロ [4 , 5 - d] ピリミジン - 5 - アミン ;
7 - (5 - メチルフラン - 2 - イル) - 3 - (6 - [テトラヒドロフラン - 3 - イルメチル] オキシメチルピリド - 2 - イルメチル) - 3 H - [1 , 2 , 3] トリアゾロ [4 , 5 - d] ピリミジン - 5 - アミン ;
7 - (5 - メチルフラン - 2 - イル) - 3 - (6 - [1 - メトキシ - 1 - メチルエチル] オキシメチルピリド - 2 - イルメチル) - 3 H - [1 , 2 , 3] トリアゾロ [4 , 5 - d] ピリミジン - 5 - アミン ;
7 - (3 - シアノフェニル) - 3 - (6 - [1 - ヒドロキシ - 1 - シクロペンチル] ピリド - 2 - イルメチル) - 3 H - [1 , 2 , 3] トリアゾロ [4 , 5 - d] ピリミジン - 5 - アミン ;
7 - (5 - メチルフラン - 2 - イル) - 3 - (6 - [2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル] オキシメチルピリド - 2 - イルメチル) - 3 H - [1 , 2 , 3] トリアゾロ [4 , 5 - d]

] ピリミジン - 5 - アミン；

S - 7 - (チアゾール - 2 - イル) - 3 - (6 - [テトラヒドロフラン - 3 - イル] オキシメチルピリド - 2 - イルメチル) - 3H - [1, 2, 3] トリアゾロ [4, 5 - d] ピリミジン - 5 - アミン；

7 - (4 - メチルチアゾール - 2 - イル) - 3 - (6 - [1 - ヒドロキシ - 1 - メチルエチル] ピリド - 2 - イルメチル) - 3H - [1, 2, 3] トリアゾロ [4, 5 - d] ピリミジン - 5 - アミン。

【請求項 9】

薬学的に許容される担体と、請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはそれらの薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物を含む薬学的組成物。

【請求項 10】

プリン受容体の遮断によって処置することができる障害の処置が必要な被験体を処置するための組成物であって、有効用量の請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはそれらの薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物を含む、組成物。

【請求項 11】

請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはそれらの薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物の、プリン受容体の遮断によって処置することができる障害の処置のための医薬品の製造における使用。

【請求項 12】

前記プリン受容体がアデノシン A_{2A} 受容体である、請求項 11 に記載の使用。

【請求項 13】

前記障害が、パーキンソン病、不穏下肢症候群、夜間ミオクロヌス、薬剤誘発性のパーキンソニズム、脳炎後のパーキンソニズム、中毒によって誘導されたパーキンソニズム、または外傷後のパーキンソン病、進行性核上性麻痺、ハンチントン病、多系統萎縮症、大脳皮質基底核変性症、ウィルソン病、ハレルフォルデン・スペツ病、進行性淡蒼球萎縮、ドーパ反応性ジストニー - パーキンソニズム、およびジスキネジーを生じる脳幹神経節の痙性または他の障害から選択される運動障害である、請求項 11 に記載の使用。

【請求項 14】

前記運動障害がパーキンソン病である、請求項 11 に記載の使用。

【請求項 15】

前記処置に、前記運動障害の処置に有用な追加薬がさらに含まれる、請求項 11 に記載の使用。

【請求項 16】

前記運動障害の処置に有用な前記追加薬が、パーキンソン病の処置に有用な薬物である、請求項 15 に記載の使用。

【請求項 17】

前記追加薬が、L - DOPA またはドーパミンアゴニストである、請求項 16 に記載の使用。

【請求項 18】

前記障害が、鬱病、認知障害もしくは記憶障害、急性もしくは慢性の疼痛、ADHD、またはナルコレプシーである、請求項 11 に記載の使用。

【請求項 19】

前記認知障害もしくは記憶障害がアルツハイマー病である、請求項 18 に記載の使用。

【請求項 20】

前記プリン受容体がアデノシン A_{2A} 受容体である、請求項 10 に記載の組成物。

【請求項 21】

前記障害が、パーキンソン病、不穏下肢症候群、夜間ミオクロヌス、薬剤誘発性のパーキンソニズム、脳炎後のパーキンソニズム、中毒によって誘導されたパーキンソニズム、または外傷後のパーキンソン病、進行性核上性麻痺、ハンチントン病、多系統萎縮症、大脳皮質基底核変性症、ウィルソン病、ハレルフォルデン・スペツ病、進行性淡蒼球萎縮、

ドーパ反応性ジストニー - パーキンソニズム、およびジスキネジーを生じる脳幹神経節の痙性または他の障害から選択される運動障害である、請求項 10 に記載の組成物。

【請求項 22】

前記運動障害がパーキンソン病である、請求項 10 に記載の組成物。

【請求項 23】

前記運動障害の処置に有用な追加薬をさらに含む、請求項 10 に記載の組成物。

【請求項 24】

前記運動障害の処置に有用な前記追加薬が、パーキンソン病の処置に有用な薬物である、請求項 23 に記載の組成物。

【請求項 25】

前記追加薬が、L-DOPA またはドーパミンアゴニストである、請求項 24 に記載の組成物。

【請求項 26】

前記障害が、鬱病、認知障害もしくは記憶障害、急性もしくは慢性の疼痛、ADHD、またはナルコレプシーである、請求項 10 に記載の組成物。

【請求項 27】

前記認知障害もしくは記憶障害がアルツハイマー病である、請求項 26 に記載の組成物。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0022

【補正方法】変更

【補正の内容】

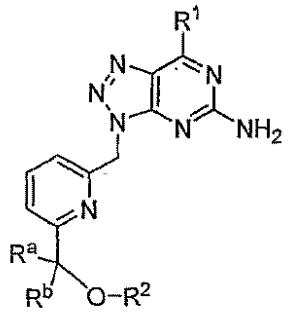
【0022】

本発明は、例えば、以下を提供する：

(項目 1)

式(I)の化合物、ならびに、それらの互変異性体、立体異性体、薬学的に許容される塩および溶媒和物：

【化 8】



式中、

R¹ はフェニルまたはヘテロアリールであり、該フェニル基または該ヘテロアリール基は、アルキル、アルコキシ、ハロ、または -CN で必要に応じて置換され得る；

R^a は、H またはアルキルである；

R^b は、H またはアルキルである；

あるいは、R^a と R^b は、それらに結合した原子と一緒に、3員～8員の飽和もしくは部分的に飽和した炭化水素環を形成するか、または、O、N(R³)、およびSから選択される環構成要素を含む4員～8員の飽和もしくは部分的に飽和した複素環を形成する；

R² は、H、アルキル、またはヘテロシクロアルキルであり、ここでは、該アルキルは、ハロ、アルコキシ、またはヘテロシクロアルキルで必要に応じて置換され得る；

ただし、R¹ が、フラン-2-イルまたは5-メチル-フラン-2-イルであり、R^a と R^b がいずれも H である場合は、R² は、ヘテロシクロアルキル、およびアルキル(ハロ

、アルコキシ、もしくはヘテロシクロアルキルによって置換されている)から選択される;
;

R³は、Hまたはアルキルである;
ここで、

ヘテロアリールは、N、N(R⁴)、S、およびOから選択される1つもしくは2つの環構成要素を含む5員もしくは6員の芳香環である;

アルキル(またはアルコキシ基のアルキル基)は、10個までの炭素原子を含む直鎖または分枝した炭化水素である;

ヘテロシクロアルキルは、C結合したかまたはN結合した3員~10員の非芳香族の単環であり、ここでは、該ヘテロシクロアルキル環には、N、N(R⁴)、S(O)_q、およびOから別々に選択される1個、2個、もしくは3個の環構成要素が含まれる;

R⁴は、Hまたはアルキルである;
qは、0、1、または2である。

(項目2)

R¹が、フェニル、2-フラニル、2-ピロリル、2-イミダゾリル、2-オキサゾリル、および2-チアゾリルから選択され、ここでは、それぞれが必要に応じて、アルキルまたはアルコキシで置換され得る、項目1に記載の化合物。

(項目3)

R¹が、5-メチル-フラン-2-イルである、項目1に記載の化合物。

(項目4)

R^aとR^bが、それらに結合した原子と一緒に、テトラヒドロピリル環、シクロプロチル環、シクロペンチル環、またはシクロヘキシリル環を形成する、項目1~3のいずれか1項に記載の化合物。

(項目5)

R^aとR^bが、Hおよび(C₁~C₆)アルキルから別々に選択される、項目1~3のいずれか1項に記載の化合物。

(項目6)

R²が、H、(C₁~C₄)アルキル、およびテトラヒドロフラニルから選択され、ここでは、該(C₁~C₄)アルキルは、フルオロ、(C₁~C₃)アルコキシ、およびテトラヒドロフラニルで必要に応じて置換され得る、項目1~5のいずれか1項に記載の化合物。

(項目7)

R²が、Hおよびテトラヒドロフリルから選択される、項目1~5のいずれか1項に記載の化合物。

(項目8)

以下から選択される、項目1に記載の化合物、ならびに、それらの薬学的に許容される塩および溶媒和物:

7-(5-メチルフラン-2-イル)-3-(6-[2-イソプロピルオキシエトキシ]オキシメチルピリド-2-イルメチル)-3H-[1,2,3]トリアゾロ[4,5-d]ピリミジン-5-アミン;

7-(5-メチルフラン-2-イル)-3-(6-[1-ヒドロキシ-1-メチルエチル]ピリド-2-イルメチル)-3H-[1,2,3]トリアゾロ[4,5-d]ピリミジン-5-アミン;

7-(5-メチルフラン-2-イル)-3-(6-[1-ヒドロキシ-1-シクロペンチル]ピリド-2-イルメチル)-3H-[1,2,3]トリアゾロ[4,5-d]ピリミジン-5-アミン;

7-(5-メチルフラン-2-イル)-3-(6-[4-ヒドロキシテトラヒドロピラン-4-イル]ピリド-2-イルメチル)-3H-[1,2,3]トリアゾロ[4,5-d]ピリミジン-5-アミン;

S-7-フェニル-3-(6-[テトラヒドロフラン-3-イル]オキシメチルピリド-

2 - イルメチル) - 3 H - [1 , 2 , 3] トリアゾロ [4 , 5 - d] ピリミジン - 5 - アミン ;

7 - フェニル - 3 - (6 - [1 - ヒドロキシ - 1 - メチルエチル] ピリド - 2 - イルメチル) - 3H - [1 , 2 , 3] トリアゾロ [4 , 5 - d] ピリミジン - 5 - アミン ;

7 - フェニル - 3 - (6 - [1 - ヒドロキシ - 1 - シクロペンチル] ピリド - 2 - イルメチル) - 3 H - [1 , 2 , 3] トリアゾロ [4 , 5 - d] ピリミジン - 5 - アミン ;

7 - フェニル - 3 - (6 - [1 - ヒドロキシシクロブチル] ピリド - 2 - イルメチル) - 3 H - [1 , 2 , 3] トリアゾロ [4 , 5 - d] ピリミジン - 5 - アミン ;

7 - フェニル - 3 - (6 - [メトキシメチル] ピリド - 2 - イルメチル) - 3 H - [1 ,
2 , 3] トリアゾロ [4 , 5 - d] ピリミジン - 5 - アミン ;

S - 7 - (3 - メトキシフェニル) - 3 - (6 - [テトラヒドロフラン - 3 - イル] オキシメチルピリド - 2 - イルメチル) - 3 H - [1 , 2 , 3] トリアゾロ [4 , 5 - d] ピ

リミジン - 5 - アミン ;
S - 7 - (5 - メチルフラン - 2 - イル) - 3 - (6 - [テトラヒドロフラン - 3 - イル

] オキシメチルピリド - 2 - イルメチル) - 3 H - [1 , 2 , 3] トリアゾロ [4 , 5 - d] ピリミジン - 5 - アミン ;
7 - (3 - メトキシフェニル) - 3 - (6 - [1 - ヒドロキシ - 1 - シクロペンチル] ピ

リド - 2 - イルメチル) - 3 H - [1 , 2 , 3] トリアソロ [4 , 5 - d] ヒリミシン - 5 - アミン ;

1 - (3 - メトキシフェニル) - 3 - (6 - [4 - ヒドロキシテトラヒドロピラン - 4 - イル] ピリド - 2 - イルメチル) - 3 H - [1 , 2 , 3] トリアゾロ [4 , 5 - d] ピリ

ミシブ - 5 - アミン ;
 7 - (3 - メトキシフェニル) - 3 - (6 - [1 - ヒドロキシシクロブチル] ピリド - 2
 - イルメチル) - 3 H - [1 , 2 , 3] トリアゾロ [4 , 5 - d] ピリミジン - 5 - アミ
 ノ :

7 - (3 - メトキシフェニル) - 3 - (6 - [メトキシメチル] ピリド - 2 - イルメチル) - 3 H - [1 - 2 - 3] トリアゾロ [4 - 5 - d] ピリミジン - 5 - アミン :

7 - (5 - メチルフラン - 2 - イル) - 3 - (6 - [1 - ヒドロキシ - 1 - シクロヘキシリ] ピリド - 2 - イルメチル) - 3 H - [1 , 2 , 3] トリアゾロ [4 , 5 - d] ピリミジン - 5 - アミン :

S - 7 - (3 - シアノフェニル) - 3 - (6 - [テトラヒドロフラン - 3 - イル] オキシメチルピリド - 2 - イルメチル) - 3 H - [1 , 2 , 3] トリアゾロ [4 , 5 - d] ピリミジン - 5 - アミン ;

7 - (3 - シアノフェニル) - 3 - (6 - [1 - ヒドロキシ - 1 - メチルエチル] ピリド - 2 - イルメチル) - 3 H - [1 , 2 , 3] トリアゾロ [4 , 5 - d] ピリミジン - 5 - アミン :

ノーマン、
7 - (3 - シアノフェニル) - 3 - (6 - [4 - ヒドロキシテトラヒドロピラン - 4 - イル] ピリド - 2 - イルメチル) - 3 H - [1 , 2 , 3] トリアゾロ [4 , 5 - d] ピリミジン - 5 - アミン・

7 - (3 - シアノフェニル) - 3 - (6 - [1 - ヒドロキシシクロブチル] ピリド - 2 - イルメチル) - 3 H - [1 2 3] トリアゾロ [4 5 - d] ピリミジン - 5 - アミン

;
7 - (3 - メトキシフェニル) - 3 - (6 - [1 - ヒドロキシ - 1 - メチルエチル] ピリド - 2 - イルメチル) - 3 H - [1 , 2 , 3] トリアゾロ [4 , 5 - d] ピリミジン - 5

- アミン ;
7 - (3 - シアノフェニル) - 3 - (6 - [メトキシメチル] ピリド - 2 - イルメチル)

- 3 H - [1 , 2 , 3] トリアゾロ [4 , 5 - d] ピリミジン - 5 - アミン ;
S - 7 - (4 - メチルチアゾール - 2 - イル) - 3 - (6 - [テトラヒドロフラン - 3 -

イル] オキシメチルピリド - 2 - イルメチル) - 3 H - [1 , 2 , 3] トリアゾロ [4 ,
5 - d] ピリミジン - 5 - アミン ;

7 - (4 - メチルチアゾール - 2 - イル) - 3 - (6 - [1 - ヒドロキシ - 1 - シクロペンチル] ピリド - 2 - イルメチル) - 3 H - [1 , 2 , 3] トリアゾロ [4 , 5 - d] ピリミジン - 5 - アミン ;

7 - (4 - メチルチアゾール - 2 - イル) - 3 - (6 - [4 - ヒドロキシテトラヒドロピラン - 4 - イル] ピリド - 2 - イルメチル) - 3 H - [1 , 2 , 3] トリアゾロ [4 , 5 - d] ピリミジン - 5 - アミン ;

7 - (5 - メチルフラン - 2 - イル) - 3 - (6 - [1 - ヒドロキシシクロブチル] ピリド - 2 - イルメチル) - 3 H - [1 , 2 , 3] トリアゾロ [4 , 5 - d] ピリミジン - 5 - アミン ;

7 - (4 - メチルチアゾール - 2 - イル) - 3 - (6 - [1 - ヒドロキシシクロブチル] ピリド - 2 - イルメチル) - 3 H - [1 , 2 , 3] トリアゾロ [4 , 5 - d] ピリミジン - 5 - アミン ;

7 - (4 - メチルチアゾール - 2 - イル) - 3 - (6 - [メトキシメチル] ピリド - 2 - イルメチル) - 3 H - [1 , 2 , 3] トリアゾロ [4 , 5 - d] ピリミジン - 5 - アミン ;

7 - (5 - メチルフラン - 2 - イル) - 3 - (6 - [ジフルオロメチルオキシメチル] - ピリド - 2 - イルメチル) - 3 H - [1 , 2 , 3] トリアゾロ [4 , 5 - d] ピリミジン - 5 - アミン ;

7 - フェニル - 3 - (6 - [4 - ヒドロキシテトラヒドロピラン - 4 - イル] ピリド - 2 - イルメチル) - 3 H - [1 , 2 , 3] トリアゾロ [4 , 5 - d] ピリミジン - 5 - アミン ;

7 - (5 - メチルフラン - 2 - イル) - 3 - (6 - [2 - エトキシエトキシメチル] ピリド - 2 - イルメチル) - 3 H - [1 , 2 , 3] トリアゾロ [4 , 5 - d] ピリミジン - 5 - アミン ;

7 - (5 - メチルフラン - 2 - イル) - 3 - (6 - [テトラヒドロフラン - 2 - イルメチル] オキシメチルピリド - 2 - イルメチル) - 3 H - [1 , 2 , 3] トリアゾロ [4 , 5 - d] ピリミジン - 5 - アミン ;

7 - (5 - メチルフラン - 2 - イル) - 3 - (6 - [テトラヒドロフラン - 3 - イルメチル] オキシメチルピリド - 2 - イルメチル) - 3 H - [1 , 2 , 3] トリアゾロ [4 , 5 - d] ピリミジン - 5 - アミン ;

7 - (5 - メチルフラン - 2 - イル) - 3 - (6 - [1 - メトキシ - 1 - メチルエチル] オキシメチルピリド - 2 - イルメチル) - 3 H - [1 , 2 , 3] トリアゾロ [4 , 5 - d] ピリミジン - 5 - アミン ;

7 - (3 - シアノフェニル) - 3 - (6 - [1 - ヒドロキシ - 1 - シクロペンチル] ピリド - 2 - イルメチル) - 3 H - [1 , 2 , 3] トリアゾロ [4 , 5 - d] ピリミジン - 5 - アミン ;

7 - (5 - メチルフラン - 2 - イル) - 3 - (6 - [2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル] オキシメチルピリド - 2 - イルメチル) - 3 H - [1 , 2 , 3] トリアゾロ [4 , 5 - d] ピリミジン - 5 - アミン ;

S - 7 - (チアゾール - 2 - イル) - 3 - (6 - [テトラヒドロフラン - 3 - イル] オキシメチルピリド - 2 - イルメチル) - 3 H - [1 , 2 , 3] トリアゾロ [4 , 5 - d] ピリミジン - 5 - アミン ;

7 - (4 - メチルチアゾール - 2 - イル) - 3 - (6 - [1 - ヒドロキシ - 1 - メチルエチル] ピリド - 2 - イルメチル) - 3 H - [1 , 2 , 3] トリアゾロ [4 , 5 - d] ピリミジン - 5 - アミン .

(項目 9)

薬学的に許容される担体と、項目 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはそれらの薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物を含む薬学的組成物。

(項目 10)

有効用量の項目 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはそれらの薬学的に許容され

る塩もしくは溶媒和物を、プリン受容体の遮断によって処置することができる障害の処置が必要な被験体に投与することを含む、障害の処置方法。

(項目11)

項目1～8のいずれか1項に記載の化合物、またはそれらの薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物の、プリン受容体の遮断によって処置することができる障害の処置のための医薬品の製造における使用。

(項目12)

上記プリン受容体がアデノシンA_{2A}受容体である、項目10に記載の方法または項目11に記載の使用。

(項目13)

上記障害が、パーキンソン病、不穏下肢症候群、夜間ミオクロヌス、薬剤誘発性のパーキンソニズム、脳炎後のパーキンソニズム、中毒によって誘導されたパーキンソニズム、または外傷後のパーキンソン病、進行性核上性麻痺、ハンチントン病、多系統萎縮症、大脳皮質基底核変性症、ウィルソン病、ハレルフォルデン・スペツツ病、進行性淡蒼球萎縮、ドーパ反応性ジストニー・パーキンソニズム、およびジスキネジーを生じる脳幹神経節の痙攣または他の障害から選択される運動障害である、項目10に記載の方法または項目11に記載の使用。

(項目14)

上記運動障害がパーキンソン病である、項目10に記載の方法または項目11に記載の使用。

(項目15)

上記処置に、上記被験体に上記運動障害の処置に有用な追加薬を投与することがさらに含まれる、項目10に記載の方法または項目11に記載の使用。

(項目16)

上記運動障害の処置に有用な上記追加薬が、パーキンソン病の処置に有用な薬物である、項目15に記載の方法または使用。

(項目17)

上記追加薬が、L-DOPAまたはドーパミンアゴニストである、項目16に記載の方法または使用。

(項目18)

上記障害が、鬱病、認知障害もしくは記憶障害、急性もしくは慢性の疼痛、ADHD、またはナルコレプシーである、項目10に記載の方法または項目11に記載の使用。

(項目19)

上記認知障害もしくは記憶障害がアルツハイマー病である、項目18に記載の方法または使用。

(発明の詳細な説明)

本発明の化合物は選択的アデノシンA_{2A}アンタゴニストである。したがって、これらは、アデノシンA_{2A}受容体に対して特有の親和性を有し、この受容体に対して、他のタイプのアデノシン受容体(A₁、A_{2B}、A₃)を上回る選択性を示す。重大なことは、本発明の化合物が、既知のアデノシンA_{2A}受容体アンタゴニストと比較して、アデノシンA_{2A}受容体に対してアデノシンA_{2B}受容体よりも大きな選択性を示すことである。アデノシンA_{2B}受容体を上回る選択性は、以下で議論される理由から有利である。