

【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21年4月9日(2009.4.9)

【公開番号】特開2008-285464(P2008-285464A)

【公開日】平成20年11月27日(2008.11.27)

【年通号数】公開・登録公報2008-047

【出願番号】特願2007-175769(P2007-175769)

【国際特許分類】

C 0 7 D 487/04 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/18 (2006.01)

A 6 1 P 25/32 (2006.01)

A 6 1 P 25/34 (2006.01)

A 6 1 P 25/36 (2006.01)

A 6 1 P 25/20 (2006.01)

A 6 1 K 31/519 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 487/04 1 4 2

C 0 7 D 487/04 C S P

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 25/18

A 6 1 P 25/32

A 6 1 P 25/34

A 6 1 P 25/36

A 6 1 P 25/20

A 6 1 K 31/519

【手続補正書】

【提出日】平成21年2月23日(2009.2.23)

【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

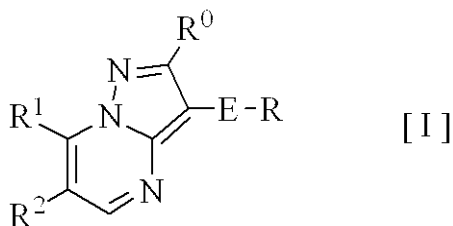
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

一般式 [I] :

【化1】



〔式中、

R¹ 及び R² は同一又は異なって、

(i) ハロゲン原子、シアノ基、1～3個のハロゲン原子で置換されていてもよいアルキル基、1～3個のハロゲン原子で置換されていてもよいアルキルオキシ基、1～2

個のアルキル基で置換されていてもよいアミノ基、アルキルチオ基、アルキルスルフィニル基及びアルキルスルホニル基から選ばれる1～3個の基で置換されていてもよい6～10員単環もしくは二環式アリール基、或いは

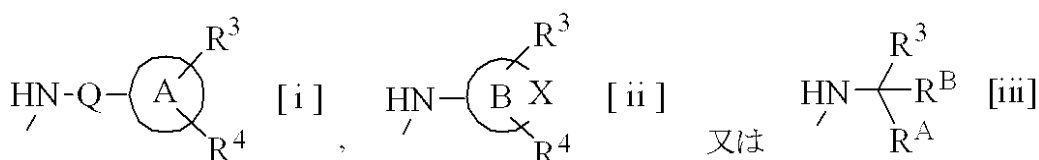
(i i) ハロゲン原子、シアノ基、オキソ基、1～3個のハロゲン原子で置換されていてもよいアルキル基、1～3個のハロゲン原子で置換されていてもよいアルキルオキシ基、1～2個のアルキル基で置換されていてもよいアミノ基、アルキルチオ基、アルキルスルフィニル基及びアルキルスルホニル基から選ばれる1～3個の基で置換されていてもよい飽和もしくは不飽和含酸素、含硫もしくは含窒素5～7員複素単環式基、

R^0 は (a) 水素原子 ; (b) 1～3個のハロゲン原子で置換されていてもよいアルキル基 ; (c) アルキルオキシアルキル基 ; (d) 式 : $-CON(R^e)(R^f)$ で示される基 ; (e) アミノアルキル基 (該基のアミノ基部分は1～2個のアルキル基で置換されていてもよい) ; (f) アルキル基、アルキルカルボニル基及びアルキルスルホニル基から選ばれる基で置換されていてもよいアミノ基 ; (g) 4～6員含窒素脂肪族複素環式基 ; (h) 式 : $-SO_2N(R^{01})(R^{02})$ で示される基 ; (i) 式 : $-NHCONHR^{03}$ で示される基 ; (j) 水酸基で置換されていてもよいアルキルオキシ基 ; (k) ヒドロキシアルキル基 ; 又は (l) カルボキシル基、 R^e 及び R^f は、同一又は異なって水素原子、アルキル基又はジアルキルアミノ基、 R^{01} 及び R^{02} は同一又は異なって水素原子、アルキル基又はカルバモイルアルキル基、 R^{03} は水素原子又はアルキル基、

E は式 : $-C(=O)-$ 又は $-SO_2-$ で示される基、

R は、(A) R^0 が (a) 水素原子 ; (b) 1～3個のハロゲン原子で置換されていてもよいアルキル基 ; (c) アルキルオキシアルキル基 ; (e) アミノアルキル基 (該基のアミノ基部分は1～2個のアルキル基で置換されていてもよい) ; (f) アルキル基、アルキルカルボニル基及びアルキルスルホニル基から選ばれる基で置換されていてもよいアミノ基 ; (g) 4～6員含窒素脂肪族複素環式基 ; 又は (j) 水酸基で置換されていてもよいアルキルオキシ基であるときは、下式 [i]、[ii] 又は [iii] :

【化 1】



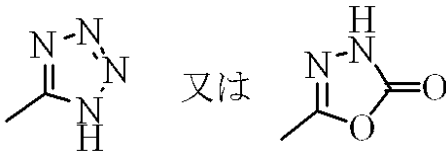
で示される基であり、且つ (B) R^0 が式 : $-SO_2N(R^{01})(R^{02})$ 、式 : $-NHCONHR^{03}$ で示される基、式 : $-CON(R^e)(R^f)$ で示される基、カルボキシル基又はヒドロキシアルキル基であるときは、(a) アルキルオキシ基又は (b) 式 : $-N(R^5)(R^6)$ で示される基であることを表し、

環 A は $C_3 \sim 8$ シクロアルキル基 (該シクロアルキル基はベンゼン環と縮合していてもよい) 又はベンゼン環、Q は単結合手又はメチレン基、

環 B はその環構成炭素原子を介して隣接窒素原子と結合する4～7員脂肪族複素環式基、X は硫黄原子、 $-SO-$ 、 $-SO_2-$ 、酸素原子又は $-NR^k-$ で示される基、 R^k はアルキル基、アルキルカルボニル基、アルキルオキシカルボニル基、アルキルスルホニル基、1～2個のアルキル基で置換されていてもよいアミノスルホニル基、又は1～2個のアルキル基で置換されていてもよいカルバモイル基、

R^3 は (a) 水酸基、アミノ基、アシルアミノ基、ジアルキルカルバモイルアミノ基、アルキルスルホニルアミノ基及びジアルキルスルファモイルアミノから選ばれる基で置換されていてもよいアルキル基 ; (b) シアノ基 ; (c) カルボキシル基 ; (d) アルキルオキシカルボニル基 ; (e) 式 : $-N(R^a)(R^b)$ で示される基 ; (f) 式 : $-CON(R^a)(R^b)$ で示される基 ; (g) 下式 :

【化 1】



で示される基；又は（h）水酸基、

R^a 及び R^b は同一又は異なって水素原子、水酸基、シアノ基、アルキル基、シアノアルキル基、トリハロゲノアルキル基、ヒドロキシアルキル基、アルキルオキシアルキル基、シクロアルキル基、アシル基、アルキルスルホニル基又はアミノアルキル基（該基のアミノ基部分は 1 ~ 2 個のアルキル基で置換されていてもよい）を表すか、或いは R^a 及び R^b の両者が互いに末端で結合して隣接窒素原子と共に飽和もしくは不飽和 5 ~ 6 員含窒素複素環式基（該複素環式基は窒素原子以外に硫黄原子及び酸素原子から選ばれる異項原子を含有していてもよい）を形成し、

R^4 は（a）水素原子；（b）アルキル基；（c）シアノ基；（d）カルボキシル基；（e）アルキルカルボニル基；（f）アルキルオキシカルボニル基；（g）式： $-CO-N(R^c)(R^d)$ で示される基；（h）フェニル基；（i）ベンジル基；又は（j）アシルアミノ基、 R^c 及び R^d は、同一又は異なって水素原子又はアルキル基、

R^A 及び R^B は、一方が（a）アルキル基（水酸基、アルキルオキシ基、アミノ基、アルキルアミノ基又はジアルキルアミノ基で置換されていてもよい）；（b）フェニル基（該フェニル基はハロゲン原子、アルキルオキシ基及びトリハロゲノアルキル基から選ばれる 1 ~ 2 個の基で置換されていてもよい）；（c）ベンジル基；（d）5 ~ 6 員含窒素単環式ヘテロアリアル基；又は（e）シクロアルキル基であり、他方が（a）水素原子；又は（b）アルキル基（水酸基、アルキルオキシ基、アミノ基、アルキルアミノ基又はジアルキルアミノ基で置換されていてもよい）、

R^5 及び R^6 は、

（A）一方が水素原子又はアルキル基であり、他方が（1）a）ハロゲン原子、b）水酸基、c）シアノ基、d）アルキルオキシ基、e）シクロアルキル基、f）1 ~ 2 個のアルキル基で置換されていてもよいアミノ基、g）アルキルチオ基、h）アルキルスルフィニル基、i）アルキルスルホニル基、j）アシル基、k）1 ~ 2 個のハロゲン原子で置換されていてもよい 6 ~ 10 員単環もしくは二環式アリアル基及び l）飽和もしくは不飽和 4 ~ 7 員複素単環式基（該複素単環式基は酸素原子、硫黄原子及び窒素原子から選ばれる 1 ~ 4 個のヘテロ原子を含み、且つハロゲン原子、水酸基、シアノ基、オキソ基、アルキル基、1 ~ 3 個のハロゲン原子で置換されたアルキル基、アルキルオキシアルキル基、アミノアルキル基、シクロアルキル基、6 ~ 10 員単環もしくは二環式アリアル-アルキル基、アルキルオキシ基、1 ~ 3 個のハロゲン原子で置換されたアルキルオキシ基、アシル基、1 ~ 2 個のアルキル基で置換されていてもよいアミノ基、アシルアミノ基、アルキルスルホニル基、1 ~ 2 個のアルキル基で置換されていてもよいアミノスルホニル基、1 ~ 2 個のハロゲン原子で置換されていてもよい 6 ~ 10 員単環もしくは二環式アリアル基および飽和もしくは不飽和 5 ~ 6 員含窒素複素環式基から選ばれる 1 ~ 4 個の基で置換されていてもよい）から選ばれる 1 ~ 3 個の基で置換されていてもよいアルキル基；（2）a）シアノ基、b）アルキル基、c）カルボキシル基、d）アルキルオキシカルボニル基、e）アミノ基（該アミノ基は 1 ~ 2 個のアルキル基で置換されていてもよい）及び f）カルバモイル基（該カルバモイル基は 1 ~ 2 個のアルキル基で置換されていてもよい）から選ばれる 1 ~ 2 個の基で置換されていてもよいシクロアルキル基；（3）式： $-N(R^8)(R^9)$ で示される基；（4）1 ~ 2 個のハロゲン原子で置換されていてもよい 6 ~ 10 員単環もしくは二環式アリアル基；又は（5）飽和もしくは不飽和 4 ~ 7 員複素単環式基（該複素単環式基は酸素原子、硫黄原子及び窒素原子から選ばれる 1 ~ 4 個のヘテロ原子を含み、且つハロゲン原子、水酸基、シアノ基、オキソ基、アルキル基、1 ~ 3 個のハロゲン原子で置換されたアルキル基、アルキルオキシアルキル基、アミノアルキル基

、シクロアルキル基、6～10員単環もしくは二環式アリール-アルキル基、アルキルオキシ基、1～3個のハロゲン原子で置換されたアルキルオキシ基、アシル基、1～2個のアルキル基で置換されていてもよいアミノ基、アシルアミノ基、アルキルスルホニル基、1～2個のアルキル基で置換されていてもよいアミノスルホニル基、1～2個のハロゲン原子で置換されていてもよい6～10員単環もしくは二環式アリール基および飽和もしくは不飽和5～6員含窒素複素環式基から選ばれる1～4個の基で置換されていてもよい)であるか、或いは

(B) R^5 及び R^6 の両者が末端で互いに結合して隣接窒素原子と共に飽和もしくは不飽和4～7員含窒素複素単環式基(該複素単環式基は2個以上の窒素原子を含有していてもよく、かつ当該窒素原子以外に酸素原子及び硫黄原子から選ばれる1～2個のヘテロ原子を含有していてもよく、かつハロゲン原子、水酸基、シアノ基、オキソ基、アルキル基、1～3個のハロゲン原子で置換されたアルキル基、アルキルオキシアルキル基、アミノアルキル基、シクロアルキル基、6～10員単環もしくは二環式アリール-アルキル基、アルキルオキシ基、1～3個のハロゲン原子で置換されたアルキルオキシ基、アシル基、1～2個のアルキル基で置換されていてもよいアミノ基、アシルアミノ基、アルキルスルホニル基、1～2個のアルキル基で置換されていてもよいアミノスルホニル基、1～2個のハロゲン原子で置換されていてもよい6～10員単環もしくは二環式アリール基および飽和もしくは不飽和5～6員含窒素複素環式基から選ばれる1～4個の基で置換されていてもよい)を形成し、

R^8 及び R^9 は一方が水素原子又はアルキル基であり、他方が(1)ハロゲン原子、シアノ基及び6～10員単環もしくは二環式アリール基から選ばれる1～3個の基で置換されていてもよいアルキル基；(2) a)シアノ基、b)アルキル基、c)カルボキシル基、d)アルキルオキシカルボニル基、e)アミノ基(該アミノ基は1～2個のアルキル基で置換されていてもよい)及びf)カルバモイル基(該カルバモイル基は1～2個のアルキル基で置換されていてもよい)から選ばれる1～2個の基で置換されていてもよいシクロアルキル基；(3)1～2個のハロゲン原子で置換されていてもよい6～10員単環もしくは二環式アリール基；(4)アシル基；又は(5)飽和もしくは不飽和4～7員複素単環式基(該複素単環式基は酸素原子、硫黄原子及び窒素原子から選ばれる1～4個のヘテロ原子を含み、且つハロゲン原子、水酸基、シアノ基、オキソ基、アルキル基、1～3個のハロゲン原子で置換されたアルキル基、アルキルオキシアルキル基、アミノアルキル基、シクロアルキル基、6～10員単環もしくは二環式アリール-アルキル基、アルキルオキシ基、1～3個のハロゲン原子で置換されたアルキルオキシ基、アシル基、1～2個のアルキル基で置換されていてもよいアミノ基、アシルアミノ基、アルキルスルホニル基、1～2個のアルキル基で置換されていてもよいアミノスルホニル基、1～2個のハロゲン原子で置換されていてもよい6～10員単環もしくは二環式アリール基および飽和もしくは不飽和5～6員含窒素複素環式基から選ばれる1～4個の基で置換されていてもよい)であることを表す。]

で示される化合物(但し、6-フェニル-7-(4-クロロフェニル)-3-(N-イソプロピルカルバモイル)ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン；

6-(2-クロロフェニル)-7-(4-クロロフェニル)-3-(N-イソプロピルカルバモイル)ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン；

6-(2-クロロフェニル)-7-(4-クロロフェニル)-3-[N-(4-シアノ-4-テトラヒドロチオピラニル)カルバモイル]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン；

6-(2-クロロフェニル)-7-(4-クロロフェニル)-3-[N-(-ジメチルベンジル)カルバモイル]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン；

6-(2-クロロフェニル)-7-(4-クロロフェニル)-3-[N-(-メチルベンジル)カルバモイル]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン；

6-(2-クロロフェニル)-7-(4-クロロフェニル)-3-[N-[1-(2-ピリジル)エチル]カルバモイル]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン；

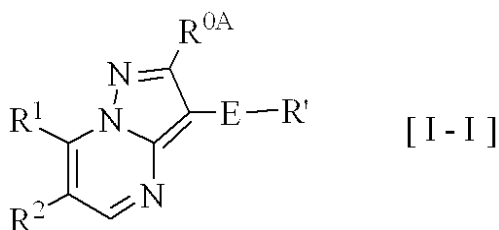
6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) - 3 - [N - [1 - (2 - ピリジル)エチル]カルバモイル]ピラゾロ [1 , 5 - a]ピリミジン ;
6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - クロロフェニル) - 3 - [N - (4 - シアノベンジル)カルバモイル]ピラゾロ [1 , 5 - a]ピリミジン ; および

6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - クロロフェニル) - 3 - [N - (1 , 1 - ジオキソテトラヒドロチエン - 3 - イル)カルバモイル] - 2 - (ヒドロキシメチル)ピラゾロ [1 , 5 - a]ピリミジンを除く) 又はその薬理的に許容し得る塩。

【請求項 2】

一般式 [I - I] :

【化 1】



〔式中、

R¹ 及び R² は同一又は異なって、

(i) ハロゲン原子、シアノ基、1 ~ 3 個のハロゲン原子で置換されていてもよいアルキル基、1 ~ 3 個のハロゲン原子で置換されていてもよいアルキルオキシ基、1 ~ 2 個のアルキル基で置換されていてもよいアミノ基、アルキルチオ基、アルキルスルフィニル基及びアルキルスルホニル基から選ばれる 1 ~ 3 個の基で置換されていてもよい 6 ~ 10 員単環もしくは二環式アリール基、或いは

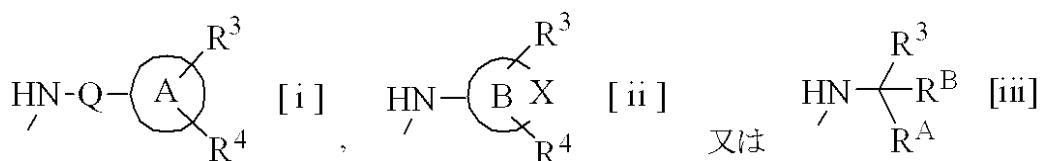
(i i) ハロゲン原子、シアノ基、オキソ基、1 ~ 3 個のハロゲン原子で置換されていてもよいアルキル基、1 ~ 3 個のハロゲン原子で置換されていてもよいアルキルオキシ基、1 ~ 2 個のアルキル基で置換されていてもよいアミノ基、アルキルチオ基、アルキルスルフィニル基及びアルキルスルホニル基から選ばれる 1 ~ 3 個の基で置換されていてもよい飽和もしくは不飽和含酸素、含硫もしくは含窒素 5 ~ 7 員複素単環式基、

R^{0 A} は (a) 水素原子 ; (b) 1 ~ 3 個のハロゲン原子で置換されていてもよいアルキル基 ; (c) アルキルオキシアルキル基 ; (d) アミノアルキル基 (該基のアミノ基部分は 1 ~ 2 個のアルキル基で置換されていてもよい) ; (e) アルキル基、アルキルカルボニル基及びアルキルスルホニル基から選ばれる基で置換されていてもよいアミノ基 ; (f) 4 ~ 6 員含窒素脂肪族複素環式基 ; 又は (g) 水酸基で置換されていてもよいアルキルオキシ基、

E は式 : - C (= O) - 又は - S O₂ - で示される基、

R' は下式 [i]、[i i] 又は [i i i] :

【化 1】



で示される基、

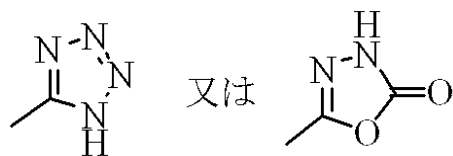
環 A は C₃ ~ 8 シクロアルキル基 (該シクロアルキル基はベンゼン環と縮合していてもよい) 又はベンゼン環、Q は単結合手又はメチレン基、

環 B はその環構成炭素原子を介して隣接窒素原子と結合する 4 ~ 6 員脂肪族複素環式基、X は硫黄原子、- S O -、- S O₂ -、酸素原子又は - N R^k - で示される基、R^k はアルキル基、アルキルカルボニル基、アルキルオキシカルボニル基、アルキルスルホニル基、1 ~ 2 個のアルキル基で置換されていてもよいアミノスルホニル基、又は 1 ~ 2 個

のアルキル基で置換されていてもよいカルバモイル基、

R³ は (a) 水酸基、アミノ基、アシルアミノ基、ジアルキルカルバモイルアミノ基、アルキルスルホニルアミノ基及びジアルキルスルファモイルアミノ基から選ばれる基で置換されていてもよいアルキル基；(b) シアノ基；(c) カルボキシル基；(d) アルキルオキシカルボニル基；(e) 式：-N(R^a)(R^b)で示される基；(f) 式：-CON(R^a)(R^b)で示される基；(g) 下式：

【化1】



で示される基；又は(h)水酸基、R^a及びR^bは同一又は異なって水素原子、水酸基、シアノ基、アルキル基、シアノアルキル基、トリハロゲンアルキル基、ヒドロキシアルキル基、アルキルオキシアルキル基、シクロアルキル基、アルキルスルホニル基又はアミノアルキル基(該基のアミノ基部分は1~2個のアルキル基で置換されていてもよい)を表すか、或いはR^a及びR^bの両者が互いに末端で結合して飽和もしくは不飽和5~6員含窒素複素環式基(該複素環式基は窒素原子以外に硫黄原子及び酸素原子から選ばれる異項原子を含有していてもよい)を形成し、

R⁴ は (a) 水素原子；(b) アルキル基；(c) シアノ基；(d) カルボキシル基；(e) アルキルカルボニル基；(f) アルキルオキシカルボニル基；(g) 式：-CON(R^c)(R^d)で示される基；(h) フェニル基；(i) ベンジル基；又は(j) アシルアミノ基、R^c及びR^dは、同一又は異なって水素原子又はアルキル基、

R^A及びR^Bは、一方が(a)アルキル基(水酸基、アルキルオキシ基、アミノ基、アルキルアミノ基又はジアルキルアミノ基で置換されていてもよい)；(b)フェニル基(該フェニル基はハロゲン原子、アルキルオキシ基及びトリハロゲンアルキル基から選ばれる1~2個の基で置換されていてもよい)；(c)ベンジル基；(d)5~6員含窒素単環式ヘテロアリアル基；又は(e)シクロアルキル基であり、他方が(a)水素原子；又は(b)アルキル基(水酸基、アルキルオキシ基、アミノ基、アルキルアミノ基又はジアルキルアミノ基で置換されていてもよい)であることを表す。]

で示される化合物(但し、6-フェニル-7-(4-クロロフェニル)-3-(N-イソプロピルカルバモイル)ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン；

6-(2-クロロフェニル)-7-(4-クロロフェニル)-3-(N-イソプロピルカルバモイル)ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン；

6-(2-クロロフェニル)-7-(4-クロロフェニル)-3-[N-(4-シアノノ-4-テトラヒドロチオピラニル)カルバモイル]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン；

6-(2-クロロフェニル)-7-(4-クロロフェニル)-3-[N-(-ジメチルベンジル)カルバモイル]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン；

6-(2-クロロフェニル)-7-(4-クロロフェニル)-3-[N-(-メチルベンジル)カルバモイル]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン；

6-(2-クロロフェニル)-7-(4-クロロフェニル)-3-[N-[1-(2-ピリジル)エチル]カルバモイル]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン；

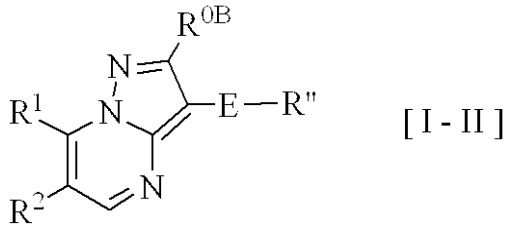
6-(2-クロロフェニル)-7-(4-トリフルオロメチルフェニル)-3-[N-[1-(2-ピリジル)エチル]カルバモイル]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン；

および6-(2-クロロフェニル)-7-(4-クロロフェニル)-3-[N-(4-シアノベンジル)カルバモイル]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジンを除く)又はその薬理的に許容し得る塩。

【請求項3】

一般式 [I - I I] :

【化 1】



〔式中、

R¹ 及び R² は同一又は異なって、

(i) ハロゲン原子、シアノ基、1～3個のハロゲン原子で置換されていてもよいアルキル基、1～3個のハロゲン原子で置換されていてもよいアルキルオキシ基、1～2個のアルキル基で置換されていてもよいアミノ基、アルキルチオ基、アルキルスルフィニル基及びアルキルスルホニル基から選ばれる1～3個の基で置換されていてもよい6～10員単環もしくは二環式アリール基、或いは

(i i) ハロゲン原子、シアノ基、オキソ基、1～3個のハロゲン原子で置換されていてもよいアルキル基、1～3個のハロゲン原子で置換されていてもよいアルキルオキシ基、1～2個のアルキル基で置換されていてもよいアミノ基、アルキルチオ基、アルキルスルフィニル基及びアルキルスルホニル基から選ばれる1～3個の基で置換されていてもよい飽和もしくは不飽和含酸素、含硫もしくは含窒素5～7員複素単環式基、

R^{0 B} は式： - SO₂ N (R^{0 1}) (R^{0 2}) で示される基、式： - NH C O N H R^{0 3} で示される基、式： - C O N (R^e) (R^f) で示される基、カルボキシル基又はヒドロキシアルキル基、R^{0 1} 及び R^{0 2} は同一もしくは異なって水素原子、アルキル基又はカルバモイルアルキル基、R^{0 3} は水素原子又はアルキル基、R^e 及び R^f は同一又は異なって水素原子、アルキル基又はジアルキルアミノ基、

E は式： - C (= O) - 又は - S O₂ - で示される基、R^{''} はアルキルオキシ基又は式： - N (R⁵) (R⁶) で示される基、R⁵ 及び R⁶ は、

(A) 一方が水素原子又はアルキル基であり、他方が (1) ハロゲン原子、水酸基、シアノ基、アルキルオキシ基、シクロアルキル基、1～2個のアルキル基で置換されていてもよいアミノ基、アルキルチオ基、アルキルスルフィニル基、アルキルスルホニル基、アシル基、1～2個のハロゲン原子で置換されていてもよい6～10員単環もしくは二環式アリール基及び飽和もしくは不飽和4～7員複素単環式基 (該複素単環式基は酸素原子、硫黄原子及び窒素原子から選ばれる1～4個のヘテロ原子を含み、且つハロゲン原子、水酸基、シアノ基、オキソ基、アルキル基、1～3個のハロゲン原子で置換されたアルキル基、アルキルオキシアルキル基、アミノアルキル基、シクロアルキル基、6～10員単環もしくは二環式アリール - アルキル基、アルキルオキシ基、1～3個のハロゲン原子で置換されたアルキルオキシ基、アシル基、1～2個のアルキル基で置換されていてもよいアミノ基、アシルアミノ基、アルキルスルホニル基、1～2個のアルキル基で置換されていてもよいアミノスルホニル基、1～2個のハロゲン原子で置換されていてもよい6～10員単環もしくは二環式アリール基および飽和もしくは不飽和5～6員含窒素複素環式基から選ばれる1～4個の基で置換されていてもよい) から選ばれる1～3個の基で置換されていてもよいアルキル基； (2) a) シアノ基、b) アルキル基、c) カルボキシル基、d) アルキルオキシカルボニル基、e) アミノ基 (該アミノ基は1～2個のアルキル基で置換されていてもよい) 及び f) カルバモイル基 (該カルバモイル基は1～2個のアルキル基で置換されていてもよい) から選ばれる1～2個の基で置換されていてもよいシクロアルキル基； (3) 式： - N (R⁸) (R⁹) で示される基； (4) 1～2個のハロゲン原子で置換されていてもよい6～10員単環もしくは二環式アリール基；又は (5) 飽和もしくは不飽和4～7員複素単環式基 (該複素単環式基は酸素原子、硫黄原子及び窒素原子から選ばれる1～4個のヘテロ原子を含み、ハロゲン原子、水酸基、シアノ基、オ

キソ基、アルキル基、1～3個のハロゲン原子で置換されたアルキル基、アルキルオキシアルキル基、アミノアルキル基、シクロアルキル基、6～10員単環もしくは二環式アリアル-アルキル基、アルキルオキシ基、1～3個のハロゲン原子で置換されたアルキルオキシ基、アシル基、1～2個のアルキル基で置換されていてもよいアミノ基、アシルアミノ基、アルキルスルホニル基、1～2個のアルキル基で置換されていてもよいアミノスルホニル基、1～2個のハロゲン原子で置換されていてもよい6～10員単環もしくは二環式アリアル基および飽和もしくは不飽和5～6員含窒素複素環式基から選ばれる1～4個の基で置換されていてもよい)であるか、或いは

(B) R^5 及び R^6 の両者が末端で互いに結合して隣接窒素原子と共に飽和もしくは不飽和4～7員含窒素複素単環式基(該複素単環式基は2個以上の窒素原子を含有していてもよく、かつ当該窒素原子以外に酸素原子及び硫黄原子から選ばれる1～2個のヘテロ原子を含有していてもよく、かつハロゲン原子、水酸基、シアノ基、オキソ基、アルキル基、1～3個のハロゲン原子で置換されたアルキル基、アルキルオキシアルキル基、アミノアルキル基、シクロアルキル基、6～10員単環もしくは二環式アリアル-アルキル基、アルキルオキシ基、1～3個のハロゲン原子で置換されたアルキルオキシ基、アシル基、1～2個のアルキル基で置換されていてもよいアミノ基、アシルアミノ基、アルキルスルホニル基、1～2個のアルキル基で置換されていてもよいアミノスルホニル基、1～2個のハロゲン原子で置換されていてもよい6～10員単環もしくは二環式アリアル基および飽和もしくは不飽和5～6員含窒素複素環式基から選ばれる1～4個の基で置換されていてもよい)を形成し、

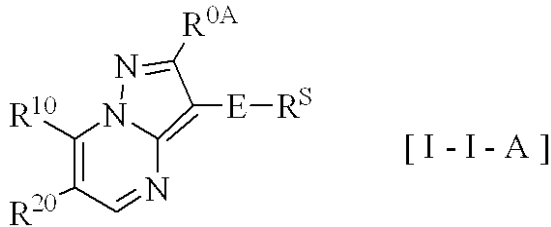
R^8 及び R^9 は一方が水素原子又はアルキル基であり、他方が(1)ハロゲン原子、シアノ基及び6～10員単環もしくは二環式アリアル基から選ばれる1～3個の基で置換されていてもよいアルキル基；(2) a)シアノ基、b)アルキル基、c)カルボキシル基、d)アルキルオキシカルボニル基、e)アミノ基(該アミノ基は1～2個のアルキル基で置換されていてもよい)及びf)カルバモイル基(該カルバモイル基は1～2個のアルキル基で置換されていてもよい)から選ばれる1～2個の基で置換されていてもよいシクロアルキル基；(3)1～2個のハロゲン原子で置換されていてもよい6～10員単環もしくは二環式アリアル基；(4)アシル基；又は(5)飽和もしくは不飽和4～7員複素単環式基(該複素単環式基は酸素原子、硫黄原子及び窒素原子から選ばれる1～4個のヘテロ原子を含み、ハロゲン原子、水酸基、シアノ基、オキソ基、アルキル基、1～3個のハロゲン原子で置換されたアルキル基、アルキルオキシアルキル基、アミノアルキル基、シクロアルキル基、6～10員単環もしくは二環式アリアル-アルキル基、アルキルオキシ基、1～3個のハロゲン原子で置換されたアルキルオキシ基、アシル基、1～2個のアルキル基で置換されていてもよいアミノ基、アシルアミノ基、アルキルスルホニル基、1～2個のアルキル基で置換されていてもよいアミノスルホニル基、1～2個のハロゲン原子で置換されていてもよい6～10員単環もしくは二環式アリアル基および飽和もしくは不飽和5～6員含窒素複素環式基から選ばれる1～4個の基で置換されていてもよい)であることを表す。]

で示される化合物又はその薬理的に許容し得る塩(但し、6-(2-クロロフェニル)-7-(4-クロロフェニル)-3-[N-(1,1-ジオキソテトラヒドロチエン-3-イル)カルバモイル]-2-(ヒドロキシメチル)ピラゾロ[1,5-a]ピリミジンを除く)。

【請求項4】

一般式 [I - I - A] :

【化 1】



〔式中、 R^{10} 及び R^{20} は同一又は異なって、

(i) 6 ~ 10 員単環もしくは二環式アリール基 (該アリール基はハロゲン原子、シアノ基、1 ~ 3 個のハロゲン原子で置換されていてもよいアルキル基、1 ~ 3 個のハロゲン原子で置換されていてもよいアルキルオキシ基、1 ~ 2 個のアルキル基で置換されていてもよいアミノ基、アルキルチオ基、アルキルスルフィニル基及びアルキルスルホニル基から選ばれる 1 ~ 3 個の基で置換されていてもよい) ; 又は

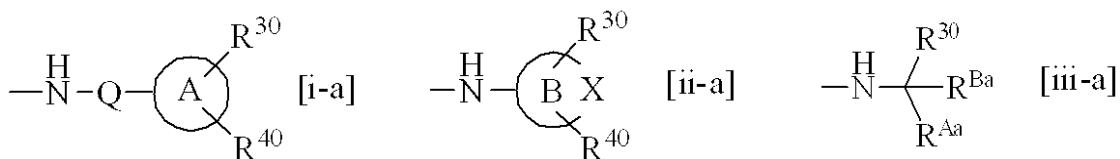
(ii) 飽和もしくは不飽和含硫、含酸素もしくは含窒素 4 ~ 7 員複素単環式基 (該複素環式基はハロゲン原子、シアノ基、オキソ基、1 ~ 3 個のハロゲン原子で置換されていてもよいアルキル基、1 ~ 3 個のハロゲン原子で置換されていてもよいアルキルオキシ基、1 ~ 2 個のアルキル基で置換されていてもよいアミノ基、アルキルチオ基、アルキルスルフィニル基及びアルキルスルホニル基から選ばれる 1 ~ 3 個の基で置換されていてもよい) 、

R^{0A} は (a) 水素原子 ; (b) 1 ~ 3 個のハロゲン原子で置換されていてもよいアルキル基 ; (c) アルキルオキシアルキル基 ; (d) アミノアルキル基 (該基のアミノ基部分は 1 ~ 2 個のアルキル基で置換されていてもよい) ; (e) アルキル基、アルキルカルボニル基及びアルキルスルホニル基から選ばれる基で置換されていてもよいアミノ基 ; (f) 4 ~ 6 員含窒素脂肪族複素環式基 ; 又は (g) 水酸基で置換されていてもよいアルキルオキシ基、

E は式 : $-C(=O)-$ 又は $-SO_2-$ で示される基、

R^S は下式 [i - a] 、 [ii - a] 又は [iii - a] :

【化 1】



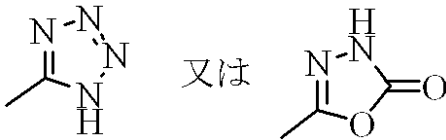
で示される基、

環 A は $C_3 \sim 8$ シクロアルキル基 (該シクロアルキル基はベンゼン環と縮合していてもよい) 又はベンゼン環、Q は単結合手又はメチレン基、

環 B はその環構成炭素原子を介して隣接窒素原子と結合する 4 ~ 7 員脂肪族複素環式基、X は硫黄原子、 $-SO-$ 、 $-SO_2-$ 、酸素原子又は $-NR^k-$ で示される基、 R^k はアルキル基、アルキルカルボニル基、アルキルオキシカルボニル基、アルキルスルホニル基、1 ~ 2 個のアルキル基で置換されていてもよいアミノスルホニル基、又は 1 ~ 2 個のアルキル基で置換されていてもよいカルバモイル基、

R^{30} は (a) アルキル基 (該アルキル基は水酸基、アミノ基、アシルアミノ基、ジアルキルカルバモイルアミノ基、アルキルスルホニルアミノ基及びジアルキルスルファモイルアミノ基から選ばれる基で置換されていてもよい) ; (b) シアノ基 ; (c) カルボキシル基 ; (d) アルキルオキシカルボニル基 ; (e) 式 : $-N(R^{aa})(R^{bb})$ で示される基 ; (f) 式 : $-CON(R^{aa})(R^{bb})$ で示される基 ; (g) 下式 :

【化 1】



で示される基；或いは (h) 水酸基、

$R^{a a}$ 及び $R^{b b}$ は同一又は異なって水素原子、水酸基、シアノ基、アルキル基、シアノアルキル基、トリハロゲノアルキル基、ヒドロキシアルキル基、アルキルオキシアルキル基、シクロアルキル基、式： $R^{x a}CO-$ で示される基、アルキルスルホニル基又はアミノアルキル基（該基のアミノ基部分は1～2個のアルキル基で置換されていてもよい）を表すか、或いは $R^{a a}$ 及び $R^{b b}$ の両者が互いに末端で結合して飽和もしくは不飽和5～6員含窒素複素単環式基（該複素単環式基は窒素原子以外に酸素原子及び硫黄原子から選ばれる異項原子を更に含有していてもよい）を形成し、 $R^{x a}$ は (a) 水素原子、(b) アルキル基（該アルキル基はハロゲン原子、シアノ基、アルキルスルホニル基及びピリジル基から選ばれる1～3個の基で置換されていてもよい）、(c) アルキルオキシ基（該アルキルオキシ基は6～10員単環もしくは二環式アリール基で置換されていてもよい）、(d) シクロアルキル基、(e) 6～10員単環もしくは二環式アリール基（該アリール基はハロゲン原子、シアノ基、アルキル基、トリハロゲノアルキル基及びアルキルオキシ基から選ばれる1～2個の基で置換されていてもよい）、(f) アミノ基（該アミノ基は1～2個のアルキル基で置換されていてもよい）又は (g) 飽和もしくは不飽和含硫、含酸素もしくは含窒素4～7員複素単環式基（該複素単環式基はハロゲン原子、シアノ基、アルキル基及びはトリハロゲノアルキル基から選ばれる1～2個の基で置換されていてもよい）、

$R^{4 0}$ は (a) 水素原子；(b) アルキル基；(c) シアノ基；(d) カルボキシル基；(e) アルキルカルボニル基；(f) アルキルオキシカルボニル基；(g) 式： $-CON(R^{c c})(R^{d d})$ で示される基；(h) フェニル基；(i) ベンジル基；又は (j) 式： $R^{x a}CONH-$ で示される基、 $R^{c c}$ 及び $R^{d d}$ は同一又は異なって、水素原子又はアルキル基、

$R^{A a}$ 及び $R^{B a}$ は一方が (a) アルキル基（該アルキル基は水酸基、アルキルオキシ基、アミノ基、アルキルアミノ基又はジアルキルアミノ基で置換されていてもよい）；(b) フェニル基（該フェニル基はハロゲン原子、アルキルオキシ基及びトリハロゲノアルキル基から選ばれる1～2個の基で置換されていてもよい）；(c) ベンジル基；(d) 5～6員含窒素ヘテロアリール基；又は (e) シクロアルキル基であり、他方が (a) 水素原子；又は (b) アルキル基（該アルキル基は水酸基、アルキルオキシ基、アミノ基、アルキルアミノ基又はジアルキルアミノ基で置換されていてもよい）であることを表す]

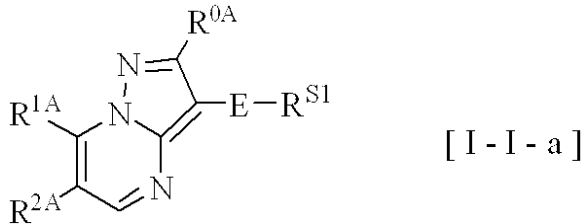
で示される化合物（但し、6-(2-クロロフェニル)-7-(4-クロロフェニル)-3-[N-(4-シアノベンジル)カルバモイル]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、6-(2-クロロフェニル)-7-(4-クロロフェニル)-3-[N-(4-シアノ-4-テトラヒドロチオピラニル)カルバモイル]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、6-フェニル-7-(4-クロロフェニル)-3-(N-イソプロピルカルバモイル)ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン；6-(2-クロロフェニル)-7-(4-クロロフェニル)-3-(N-イソプロピルカルバモイル)ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン；6-(2-クロロフェニル)-7-(4-クロロフェニル)-3-[N-(-ジメチルベンジル)カルバモイル]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン；6-(2-クロロフェニル)-7-(4-クロロフェニル)-3-[N-(-メチルベンジル)カルバモイル]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン；6-(2-クロロフェニル)-7-(4-クロロフェニル)-3-[N-[1-(2-ピリジル)エチル]カルバモイル]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン；6-(2-クロロフェニル)-7-(4-トリフルオロメチルフェニル)-3-[N-[1-(2-ピリジル)エチル]カルバモイル]ピラゾロ[1,5-a]ピ

リミジン；および 6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - クロロフェニル) - 3 - [N - (4 - シアノベンジル) カルバモイル] ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジンを除く) 又はその薬理的に許容し得る塩。

【請求項 5】

一般式 [I - I - a] :

【化 1】



〔式中、R^{1A}は

(a) ハロゲン原子、ジフルオロアルキル基、トリフルオロアルキル基及びジアルキルアミノ基から選ばれる 1 ~ 2 個の基で置換されていてもよいフェニル基、又は

(b) アルキル基、トリフルオロアルキル基及びアルキルオキシ基から選ばれる基で置換されていてもよい飽和もしくは不飽和 5 ~ 6 員含窒素複素環式基、

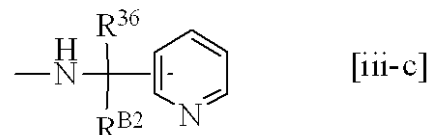
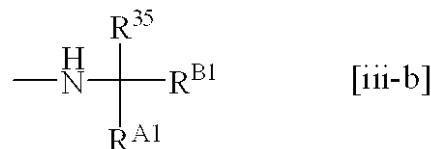
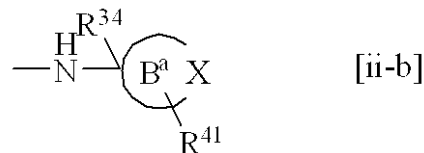
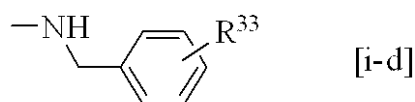
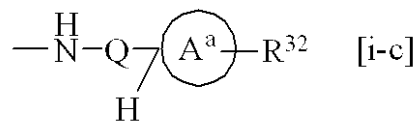
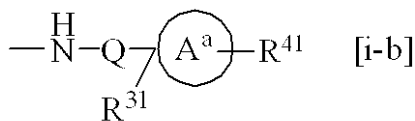
R^{2A} はハロゲン原子及びシアノ基から選ばれる 1 ~ 2 個の基で置換されていてもよいフェニル基、

R^{0A} は (a) 水素原子； (b) 1 ~ 3 個のハロゲン原子で置換されていてもよいアルキル基； (c) アルキルオキシアルキル基； (d) アミノアルキル基 (該基のアミノ基部分は 1 ~ 2 個のアルキル基で置換されていてもよい) ； (e) アルキル基、アルキルカルボニル基及びアルキルスルホニル基から選ばれる基で置換されていてもよいアミノ基； (f) 4 ~ 6 員含窒素脂肪族複素環式基；又は (g) 水酸基で置換されていてもよいアルキルオキシ基、

E は式： - C (= O) - 又は - S O₂ - で示される基、

R^{S1} は下式 [i - b]、[i - c]、[i - d]、[ii - b]、[iii - b] 又は [iii - c] :

【化 1】



で示される基、

環 A^a は (a) C₃ - 8 シクロアルキル基又は (b) ベンゼン環と縮合した C₅ - 6 シクロアルキル基、Q は単結合手又はメチレン基、

環 B^a はその環構成炭素原子を介して隣接窒素原子と結合する 4 ~ 7 員脂肪族複素単環式基、X は硫黄原子、- S O -、- S O₂ -、酸素原子又は - N R^k - で示される基、R^k はアルキル基、アルキルカルボニル基、アルキルオキシカルボニル基、アルキルスルホニル基、1 ~ 2 個のアルキル基で置換されていてもよいアミノスルホニル基、又は 1 ~ 2 個のアルキル基で置換されていてもよいカルバモイル基、

R^{31} はシアノ基、アルキル基、ヒドロキシアルキル基、アミノアルキル基（該基のアミノ部分はアルキルカルボニル基、ジアルキルスルファモイル基、アルキルスルホニル基又はジアルキルカルバモイル基で置換されていてもよい）、カルボキシアルキル基、カルボキシル基、アルキルオキシカルボニル基、カルバモイル基（該基のアミノ基部分はアルキル基及びジアルキルアミノアルキル基から選ばれる1～2個の基で置換されていてもよい）、或いは下記：

【化1】



で示される基、

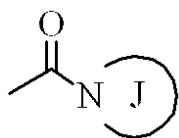
R^{41} は水素原子、アミノ基又は式： $R^{xa}CONH-$ で示される基、 R^{xa} は（a）水素原子、（b）アルキル基（該アルキル基はハロゲン原子、シアノ基、アルキルスルホニル基及びピリジル基から選ばれる1～3個の基で置換されていてもよい）、（c）アルキルオキシ基（該アルキルオキシ基は6～10員単環もしくは二環式アリール基で置換されていてもよい）、（d）シクロアルキル基、（e）6～10員単環もしくは二環式アリール基（該アリール基はハロゲン原子、シアノ基、アルキル基、トリハロゲノアルキル基及びアルキルオキシ基から選ばれる1～2個の基で置換されていてもよい）、（f）アミノ基（該アミノ基は1～2個のアルキル基で置換されていてもよい）又は（g）飽和もしくは不飽和含硫、含酸素もしくは含窒素4～7員複素単環式基（該複素単環式基はハロゲン原子、シアノ基、アルキル基及びトリハロゲノアルキル基から選ばれる1～2個の基で置換されていてもよい）、

R^{32} は水酸基、カルボキシル基、アルキルオキシカルボニル基、アミノ基又は式： $R^{xa}CONH-$ で示される基、

R^{33} はカルボキシル基又はアルキルオキシカルボニル基、

R^{34} はシアノ基、アルキル基、ヒドロキシアルキル基、アミノアルキル基、カルボキシアルキル基、カルボキシル基、アルキルオキシカルボニル基、カルバモイル基（該基のアミノ基部分はアルキル基、ヒドロキシアルキル基、シアノアルキル基、トリハロゲノアルキル基、アルキルオキシアルキル基、シクロアルキル基、アルキルスルホニル基及びジアルキルアミノアルキル基から選ばれる1～2個の基で置換されていてもよい）、式：

【化1】



で示される基、或いは下記：

【化1】



で示される基、環Jは飽和もしくは不飽和4～7員含窒素複素単環式基（該複素環式基は窒素原子以外に異項原子として酸素原子を含有していてもよい）、

R^{35} はヒドロキシアルキル基、カルボキシル基、アルキルオキシカルボニル基又はカルバモイル基（該基のアミノ基部分は1～2個のアルキル基で置換されていてもよい）、

R^{A1} はアルキル基、シクロアルキル基、フェニル基（該フェニル基は、ハロゲン原子、アルキルオキシ基及びトリハロゲノアルキル基から選ばれる1～2個の基で置換されていてもよい）又はベンジル基、 R^{B1} は水素原子又はアルキル基、

R^{36} はアルキル基又はカルバモイル基、 R^{B2} は水素原子又はアルキル基であるこ

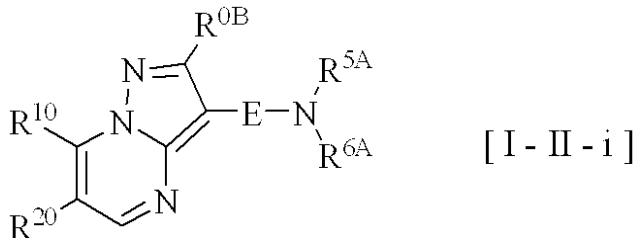
とを表す。]

で示される化合物(但し、6-(2-クロロフェニル)-7-(4-クロロフェニル)-3-[N-(4-シアノ-4-テトラヒドロチオピラニル)カルバモイル]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン、6-(2-クロロフェニル)-7-(4-クロロフェニル)-3-[N-[1-(2-ピリジル)エチル]カルバモイル]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジンおよび6-(2-クロロフェニル)-7-(4-トリフルオロメチルフェニル)-3-[N-[1-(2-ピリジル)エチル]カルバモイル]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジンを除く)又はその薬理的に許容し得る塩。

【請求項6】

一般式 [I - II - i] :

【化1】



[式中、 R^{10} 及び R^{20} は同一又は異なって、

(i) 6 ~ 10 員単環もしくは二環式アリール基(該アリール基はハロゲン原子、シアノ基、1 ~ 3 個のハロゲン原子で置換されていてもよいアルキル基、1 ~ 3 個のハロゲン原子で置換されていてもよいアルキルオキシ基、1 ~ 2 個のアルキル基で置換されていてもよいアミノ基、アルキルチオ基、アルキルスルフィニル基及びアルキルスルホニル基から選ばれる 1 ~ 3 個の基で置換されていてもよい); 又は

(ii) 飽和もしくは不飽和含硫、含酸素もしくは含窒素 4 ~ 7 員複素単環式基(該複素環式基はハロゲン原子、シアノ基、オキソ基、1 ~ 3 個のハロゲン原子で置換されていてもよいアルキル基、1 ~ 3 個のハロゲン原子で置換されていてもよいアルキルオキシ基、1 ~ 2 個のアルキル基で置換されていてもよいアミノ基、アルキルチオ基、アルキルスルフィニル基及びアルキルスルホニル基から選ばれる 1 ~ 3 個の基で置換されていてもよい)、

R^{0B} は式: $-SO_2N(R^{01})(R^{02})$ で示される基、式: $-NHCONHR^{03}$ で示される基、式: $-CON(R^e)(R^f)$ で示される基、カルボキシル基又はヒドロキシアルキル基、 R^{01} 及び R^{02} は同一もしくは異なって水素原子、アルキル基又はカルバモイルアルキル基、 R^{03} は水素原子又はアルキル基、 R^e 及び R^f は同一又は異なって水素原子、アルキル基又はジアルキルアミノ基、

E は式: $-C(=O)-$ 又は $-SO_2-$ で示される基、

R^{5A} は水素原子又はアルキル基、

R^{6A} は

(A) アルキル基(該基は(a)ハロゲン原子、(b)水酸基、(c)シアノ基、(d)アルキルオキシ基、(e)カルボキシル基、(f)カルバモイル基(該基は1 ~ 2 個のアルキル基で置換されていてもよい)、(g)アルキルチオ基、(h)アルキルスルホニル基(i)シクロアルキル基(該基はアルキル基及び水酸基から選ばれる 1 ~ 2 個の基で置換されていてもよい)、(j)1 ~ 2 個のアルキル基で置換されていてもよいアミノ基及び(k)飽和もしくは不飽和 4 ~ 10 員、単環もしくは二環式含窒素、含硫もしくは含酸素複素環式基から選ばれる 1 ~ 3 個の基で置換されていてもよい);

(B) シクロアルキル基(該シクロアルキル基はベンゼン環と縮合していてもよく、且つ(a)水酸基、カルボキシル基及びアミノ基から選ばれる基で置換されていてもよいアルキル基;(b)シアノ基;(c)カルボキシル基;(d)式: $R^{xa}CO-$ で示される基;(e)式: $-N(R^{a1})(R^{b1})$ で示される基;(f)式: $-CON(R^{a1})(R^{b1})$ で示される基;(g)6 ~ 10 員単環もしくは二環式アリール基;(h)

6 ~ 10員単環もしくは二環式アリール基で置換されたアルキル基；及び(i) 1 ~ 2個のオキソ基で置換されていてもよい飽和もしくは不飽和4 ~ 7員含窒素複素単環式基から選ばれる1 ~ 2個の基で置換されていてもよい)、 R^{a1} 及び R^{b1} は同一又は異なって水素原子、水酸基、シアノ基、アルキル基、式： $R^{x a}CO-$ で示される基、アルキルスルホニル基、アミノアルキル基、モノアルキルアミノアルキル基又はジアルキルアミノアルキル基；

(C) 6 ~ 10員単環もしくは二環式アリール基(該アリール基はシアノ基、トリハロゲンアルキル基、アルキルオキシ基及びカルボキシ基から選ばれる1 ~ 2個の基で置換されていてもよい)；

(D) 飽和もしくは不飽和4 ~ 10員単環もしくは二環式複素環式基(該複素環式基は硫黄原子、酸素原子及び窒素原子から選ばれる少なくとも1個のヘテロ原子を含有し、且つ(a)ハロゲン原子、(b)水酸基、(c)オキソ基、(d)シアノ基、(e)アルキル基、(f)トリハロゲンアルキル基、(g)ヒドロキシアルキル基、(h)アルキルオキシアルキル基、(i)アルキルオキシ基、(j)式： $R^{x a}CO-$ で示される基、(k)シクロアルキル基、(l)アルキルスルホニル基、(m)1 ~ 2個のアルキル基で置換されていてもよいアミノスルホニル基、(n)フェニルスルホニル基、(o)アミノ基、(p)式： $R^{x a}CONH-$ で示される基、(q)1 ~ 2個のアルキル基で置換されていてもよいカルバモイル基、(r)ハロゲン原子で置換されていてもよい6 ~ 10員単環もしくは二環式アリール基及び(s)アルキル基及びトリハロゲンアルキル基から選ばれる1 ~ 2個の基で置換されていてもよい飽和もしくは不飽和含硫、含酸素もしくは含窒素4 ~ 7員複素単環式基から選ばれる1 ~ 4個の基で置換されていてもよい)；

(E) 式： $-N(R^{81})(R^{91})$ で示される基、 R^{81} は水素原子又はアルキル基、 R^{91} は(a)アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、シアノ基及び6 ~ 10員単環もしくは二環式アリール基から選ばれる1 ~ 3個の基で置換されていてもよい)；(b)シクロアルキル基；(c)6 ~ 10員単環もしくは二環式アリール基(該アリール基はハロゲン原子、シアノ基、アルキル基、トリハロゲンアルキル基、アルキルオキシ基、トリハロゲンアルキルオキシ基、アルキルチオ基、アルキルスルホニル基及び式： $R^{x a}CO-$ で示される基から選ばれる基で置換されていてもよい)；(d)式： $R^{x a}CO-$ で示される基；又は(e)飽和もしくは不飽和含硫、含酸素もしくは含窒素4 ~ 7員複素単環式基(該複素環式基はハロゲン原子、アルキル基、トリハロゲンアルキル基及びアルキルオキシ基から選ばれる基で置換されていてもよい)；或いは

(F) R^{5A} と R^{6A} とが互いに結合して隣接窒素原子と共に飽和もしくは不飽和4 ~ 10員単環もしくは二環式含窒素複素環式基(該含窒素複素環式基は、窒素原子以外にも硫黄原子及び酸素原子から選ばれる1 ~ 2個のヘテロ原子を有していてもよく、且つハロゲン原子、オキソ基、アルキル基、式： $R^{x a}CO-$ で示される基及びジアルキルアミノスルホニル基から選ばれる1 ~ 2個の基で置換されていてもよい)を形成することを表し、

$R^{x a}$ は(a)水素原子、(b)アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、シアノ基、アルキルスルホニル基及びピリジル基から選ばれる1 ~ 3個の基で置換されていてもよい)、(c)アルキルオキシ基(該アルキルオキシ基は6 ~ 10員単環もしくは二環式アリール基で置換されていてもよい)、(d)シクロアルキル基、(e)6 ~ 10員単環もしくは二環式アリール基(該アリール基はハロゲン原子、シアノ基、アルキル基、トリハロゲンアルキル基及びアルキルオキシ基から選ばれる1 ~ 2個の基で置換されていてもよい)、(f)アミノ基(該アミノ基は1 ~ 2個のアルキル基で置換されていてもよい)又は(g)飽和もしくは不飽和含硫、含酸素もしくは含窒素4 ~ 7員複素単環式基(該複素単環式基はハロゲン原子、シアノ基、アルキル基及びはトリハロゲンアルキル基から選ばれる1 ~ 2個の基で置換されていてもよい)であることを表す。]

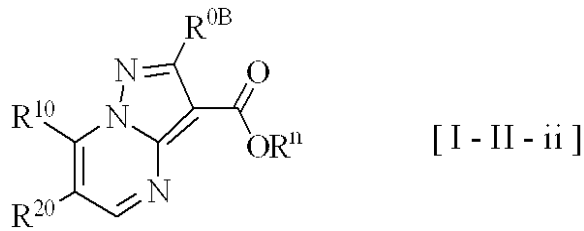
で示される化合物(但し、6-(2-クロロフェニル)-7-(4-クロロフェニル)-3-[N-(1,1-ジオキソテトラヒドロチエン-3-イル)カルバモイル]-2-(ヒドロキシメチル)ピラゾロ[1,5-a]ピリミジンを除く)又はその薬理的に許容し

得る塩。

【請求項 7】

一般式 [I - II - ii] :

【化 1】



〔式中、 R^{10} 及び R^{20} は同一又は異なって、

(i) 6 ~ 10 員単環もしくは二環式アリール基 (該アリール基はハロゲン原子、シアノ基、1 ~ 3 個のハロゲン原子で置換されていてもよいアルキル基、1 ~ 3 個のハロゲン原子で置換されていてもよいアルキルオキシ基、1 ~ 2 個のアルキル基で置換されていてもよいアミノ基、アルキルチオ基、アルキルスルフィニル基及びアルキルスルホニル基から選ばれる 1 ~ 3 個の基で置換されていてもよい) ; 又は

(ii) 飽和もしくは不飽和含硫、含酸素もしくは含窒素 4 ~ 7 員複素単環式基 (該複素環式基はハロゲン原子、シアノ基、オキソ基、1 ~ 3 個のハロゲン原子で置換されていてもよいアルキル基、1 ~ 3 個のハロゲン原子で置換されていてもよいアルキルオキシ基、1 ~ 2 個のアルキル基で置換されていてもよいアミノ基、アルキルチオ基、アルキルスルフィニル基及びアルキルスルホニル基から選ばれる 1 ~ 3 個の基で置換されていてもよい) 、

R^{0B} は式 : $-SO_2N(R^{01})(R^{02})$ で示される基、式 : $-NHCONHR^{03}$ で示される基、式 : $-CON(R^e)(R^f)$ で示される基、カルボキシ基又はヒドロキシアルキル基、 R^{01} 及び R^{02} は同一もしくは異なって水素原子、アルキル基又はカルバモイルアルキル基、 R^{03} は水素原子又はアルキル基、 R^e 及び R^f は同一又は異なって水素原子、アルキル基又はジアルキルアミノ基、

R^n はアルキル基であることを表す。〕

で示される化合物又はその薬理的に許容し得る塩。

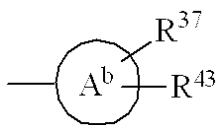
【請求項 8】

R^{10} が (i) ハロゲン原子、アルキル基、ジフルオロアルキル基、トリフルオロアルキル基及びジアルキルアミノ基から選ばれる 1 ~ 2 個の基で置換されていてもよいフェニル基又は (ii) アルキル基、トリフルオロアルキル基及びアルキルオキシ基から選ばれる基で置換されていてもよい飽和もしくは不飽和 5 ~ 6 員含窒素複素環式基、 R^{20} がハロゲン原子及びシアノ基から選ばれる 1 ~ 2 個の基で置換されていてもよいフェニル基、

R^{6A} が (A) アルキル基 (該アルキル基は 1 ~ 3 個のハロゲン原子、水酸基、シアノ基、カルボキシ基及びアルキルオキシカルボニル基から選ばれる基で置換されていてもよい) ;

(B) 下式 :

【化 1】



で示される環式基〔式中、環 A^b は (a) C_{3-8} シクロアルキル基又は (b) ベンゼン環と縮合した C_{5-6} シクロアルキル基、 R^{37} は水素原子、シアノ基、アルキル基、ヒドロキシアルキル基、アミノアルキル基、カルボキシアルキル基、カルボキシ基、アルキルオキシカルボニル基、カルバモイル基 (該基のアミノ基部分はアルキル基及びジアル

キルアミノアルキル基から選ばれる 1 ~ 2 個の基で置換されていてもよい) 又は下式:

【化 1】

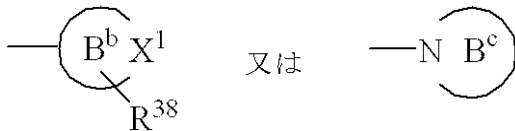


で示される基、 R^{43} は水素原子、アミノ基、アルキルオキシカルボニルアミノ基、又はベンジルオキシカルボニルアミノ基を表す];

(C) フェニル基 (該フェニル基はハロゲン原子、アルキルオキシ基、トリハロゲノアルキル基、カルボキシル基及びアルキルオキシカルボニル基から選ばれる 1 ~ 2 個の基で置換されていてもよい);

(D) 下式:

【化 1】



で示される環式基 [式中、環 B^b はその環構成炭素原子を介して隣接窒素原子と結合する 4 ~ 7 員脂肪族複素単環式基、環 B^c は 4 ~ 7 員脂肪族含窒素複素単環式基、 X^1 は硫黄原子、式: $-SO-$ で示される基、式: $-SO_2-$ で示される基、酸素原子又は式: $-NR^m-$ で示される基、 R^m はアルキル基、アルキルカルボニル基、アルキルオキシカルボニル基、アルキルスルホニル基、1 ~ 2 個のアルキル基で置換されていてもよいアミノスルホニル基又は 1 ~ 2 個のアルキル基で置換されていてもよいカルバモイル基、 R^{38} は水素原子、シアノ基、アルキル基、ヒドロキシアルキル基、アミノアルキル基、カルボキシルアルキル基、カルボキシル基、アルキルオキシカルボニル基、カルバモイル基 (該基のアミノ基部分はアルキル基及びジアルキルアミノアルキル基から選ばれる 1 ~ 2 個の基で置換されていてもよい) 又は下式:

【化 1】

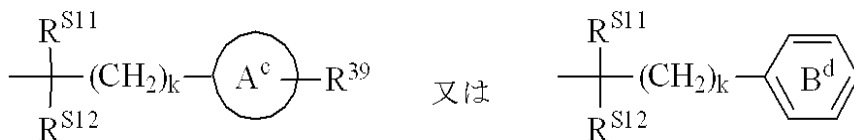


で示される基を表す];

(E) 式: $-N(R^{8a})(R^{9a})$ で示される基 [式中、 R^{8a} は水素原子又はアルキル基、 R^{9a} はアルキル基、トリハロゲノアルキル基、シアノアルキル基、ベンジル基、シクロアルキル基、フェニル基 (該フェニル基はハロゲン原子、シアノ基、アルキル基、トリハロゲノアルキル基、アルキルオキシ基、トリハロゲノアルキルオキシ基、アルキルチオ基、アルキルスルホニル基、アルキルオキシカルボニル基及びベンジルオキシカルボニル基から選ばれる基で置換されていてもよい)、アルキルオキシカルボニル基、ベンジルオキシカルボニル基又は 5 ~ 6 員含窒素ヘテロアリール基を表す]; 又は

(F) 下式:

【化 1】



で示される基 [式中、環 A^c はベンゼン環と縮合していてもよい C_{3-8} シクロアルキル基、環 B^d は (a) フェニル基 (該フェニル基はハロゲン原子、シアノ基、アルキルオキシ基、トリハロゲノアルキル基又はカルボキシル基で置換されていてもよい) 又は (b) ピリジル基、 R^{S11} は水素原子又はアルキル基、 R^{S12} は水素原子、アルキル基、カ

ルボキシシル基、カルバモイル基又はモノもしくはジアルキルカルバモイル基、 R^{39} は水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、アルキル基、ヒドロキシアルキル基、トリハロゲノアルキル基、アミノアルキル基、アルキルオキシ基、カルボキシアルキル基、カルボキシシル基、カルバモイル基（該基のアミノ基部分はアルキル基及びジアルキルアミノアルキル基から選ばれる1～2個の基で置換されているもよい）、アミノ基、アルキルオキシカルボニルアミノ基又はベンジルオキシカルボニルアミノ基、 k は0～2の整数を表す）である請求項6記載の化合物。

【請求項9】

R^{10} が(i)ハロゲン原子、アルキル基、ジフルオロアルキル基、トリフルオロアルキル基及びジアルキルアミノ基から選ばれる1～2個の基で置換されているもよいフェニル基又は(ii)アルキル基、トリフルオロアルキル基及びアルキルオキシ基から選ばれる基で置換されているもよい飽和もしくは不飽和5～6員含窒素複素環式基、 R^{20} がハロゲン原子及びシアノ基から選ばれる1～2個の基で置換されているもよいフェニル基である請求項7記載の化合物。

【請求項10】

R^1 及び R^2 が同一又は異なって、(a)ハロゲン原子、シアノ基、1～3個のハロゲン原子で置換されているもよいアルキル基及び1～2個のアルキル基で置換されているもよいアミノ基から選ばれる1～3個の基で置換されているもよいフェニル基、或いは(b)1～3個のハロゲン原子で置換されているもよいアルキル基及びアルキルオキシ基から選ばれる基で置換されているもよい飽和もしくは不飽和5～7員含窒素複素環式基であって、

A1) R' が式[i]で示される基、 R^3 が(a)水酸基及びアミノ基から選ばれる基で置換されているもよいアルキル基、(b)シアノ基、(c)カルボキシシル基、(d)アルキルオキシカルボニル基、(e)式： $-CON(R^e)(R^f)$ で示される基又は(f)アシルアミノ基、 R^e 及び R^f が同一又は異なって水素原子、アルキル基又はジアルキルアミノアルキル基、 R^4 が水素原子又はアシルアミノ基であるか、又は；

A2) R' が式[ii]で示される基、 X が硫黄原子、 SO_2 、酸素原子又は式： $N-R^k$ で示される基、 R^k がアルキルオキシカルボニル基、アルキルスルホニル基、アルキルカルボニル基又はジアルキルアミノスルホニル基、 R^3 が(a)水酸基で置換されているもよいアルキル基、(b)カルボキシシル基、(c)アルキルオキシカルボニル基又は(d)式： $-CON(R^e)(R^f)$ で示される基、 R^e および R^f が同一又は異なって水素原子、アルキル基又はトリハロゲノアルキル基、 R^4 が水素原子であるか；又は

A3) R' が式[iii]で示される基、 R^A が水酸基で置換されているもよいアルキル基、フェニル基（該フェニル基はハロゲン原子又はトリハロゲノアルキル基で置換されているもよい）又は含窒素5～6員ヘテロアリアル基、 R^B が水素原子又はアルキル基、 R^3 がアルキル基、カルボキシシル基又は式： $-CON(R^a)(R^b)$ で示される基、 R^a および R^b が水素原子又はアルキル基であり；かつ

R^{0A} が水素原子、1～3個のハロゲン原子で置換されているもよいアルキル基、水酸基で置換されているもよいアルキルオキシ基、ヒドロキシアルキル基、アミノ基（該アミノ基はアルキル基、アルキルカルボニル基及びアルキルスルホニル基から選ばれる1又は2個の基で置換されているもよい）又は4～6員含窒素脂肪族複素環式基である請求項2記載の化合物。

【請求項11】

R' が式[i]で示される基、 R^3 が(a) C_{1-6} アルキル基、(b)ヒドロキシ- C_{1-6} アルキル基、(c)アミノ- C_{1-6} アルキル基、(d)シアノ基、(e)カルボキシシル基、(f) C_{1-6} アルキルオキシ-カルボニル基、(g)カルバモイル基、(h)モノもしくはジ(C_{1-6} アルキル)カルバモイル基、(i)ジ(C_{1-6} アルキル)アミノ- C_{1-6} アルキル-カルバモイル基又は(j) C_{1-6} アルキルオキシ-カルボニルアミノ基であり、 R^4 が水素原子又はフェニル- C_{1-6} アルキルオキシ-カルボニルアミノ基である請求項10記載の化合物。

【請求項 1 2】

R' が式 [i i] で示される基、X が硫黄原子、SO₂、酸素原子又は N - R^k で示される基、R^k が C₁ - 6 アルキルオキシ - カルボニル基、C₁ - 6 アルキルスルホニル基、C₁ - 6 アルキル - カルボニル基又はジ (C₁ - 6 アルキル) アミノスルホニル基、R³ が (a) カルバモイル基、(b) モノもしくはジ (C₁ - 6 アルキル) - カルバモイル基、(c) モノ (トリハロゲン C₁ - 6 アルキル) カルバモイル基、(d) C₁ - 6 アルキルオキシ - カルボニル基、(e) C₁ - 6 アルキル基又は (f) ヒドロキシ - C₁ - 6 アルキル基、R⁴ が水素原子である請求項 1 0 記載の化合物。

【請求項 1 3】

R' が式 [i i i] で示される基、R^A が C₁ - 6 アルキル基、ヒドロキシ - C₁ - 6 アルキル基、フェニル基、ハロゲンフェニル基、トリハロゲン (C₁ - 6 アルキル) - フェニル基又はピリジル基、R^B が水素原子又は C₁ - 6 アルキル基、R³ が C₁ - 6 アルキル基、カルボキシル基、C₁ - 6 アルキルオキシ - カルボニル基又はカルバモイル基である請求項 1 0 記載の化合物。

【請求項 1 4】

R¹ がハロゲン原子、ジハロゲン - C₁ - 6 アルキル基、トリハロゲン - C₁ - 6 アルキル基及びジ (C₁ - 6 アルキル) アミノ基から選ばれる 1 ~ 2 個の基で置換されたフェニル基、C₁ - 6 アルキルオキシ - ピロリジニル基、C₁ - 6 アルキル - ペリリジル基又は C₁ - 6 アルキルオキシペリリジル基、R² が 1 ~ 2 個のハロゲン原子で置換されたフェニル基、シアノフェニル基又はトリハロゲン - C₁ - 6 アルキル - ピリジル基、R⁰ が水素原子、C₁ - 6 アルキル基、ジハロゲン - C₁ - 6 アルキル基、トリハロゲン - C₁ - 6 アルキル基、C₁ - 6 アルキルオキシ基、ヒドロキシ - C₁ - 6 アルキルオキシ基、アミノ基、C₁ - 6 アルキル - カルボニルアミノ基、モノ (C₁ - 6 アルキル) カルバモイル基又は 4 ~ 6 員含窒素脂肪族複素環式基である請求項 1 1、1 2 又は 1 3 記載の化合物。

【請求項 1 5】

6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - クロロフェニル) - 3 - [N - (1 - シアノシクロヘキシル) カルバモイル] ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン ;
 6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - クロロフェニル) - 3 - [N - (1 - シアノシクロペンチル) カルバモイル] ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン ;
 6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - クロロフェニル) - 3 - [N - (1 - メチルシクロヘキシル) カルバモイル] ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン ;
 6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - クロロフェニル) - 3 - [N - (1 - メチルシクロプロピル) カルバモイル] ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン ;
 6 - (2 - クロロフェニル) - 3 - [N - (1 - シアノシクロペンチル) カルバモイル] - 7 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) - 2 - メチルピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン ;
 6 - (2 - クロロフェニル) - 3 - [N - (1 - シアノシクロヘキシル) カルバモイル] - 7 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) - 2 - メチルピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン ;
 3 - [N - (4 - カルバモイル - 1 , 1 - ジオキソ - テトラヒドロチオピラン - 4 - イル) カルバモイル] - 6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - クロロフェニル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン ;
 2 - アセチルアミノ - 6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) - 3 - [N - [1 - (2 - ピリジル) エチル] カルバモイル] ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン ;
 6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - クロロ - 2 - フルオロフェニル) - 3 - [N - [1 - (2 - ピリジル) エチル] カルバモイル] ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン ;
 6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) - 3 - [N

- [1 - (2 - ピリジル) エチル] カルバモイル] - 2 - (1 - ピロリジニル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン ;
- 3 - [N - (1 - カルバモイルシクロヘキシル) カルバモイル] - 6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - クロロフェニル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン ;
- 6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - クロロフェニル) - 3 - [N - [1 - メチル - 1 - (2 - ピリジル) エチル] カルバモイル] ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン ;
- 6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) - 3 - [N - [1 - メチル - 1 - (2 - ピリジル) エチル] カルバモイル] ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン ;
- 3 - [N - (4 - カルバモイル - 1 , 1 - ジオキソ - テトラヒドロチオピラン - 4 - イル) カルバモイル] - 6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン ;
- 3 - [N - (1 - カルボキシシクロヘキシル) カルバモイル] - 6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - クロロフェニル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン ;
- 6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - クロロフェニル) - 3 - [[1 - [N - [2 - (N , N - ジメチルアミノ) エチル] カルバモイル] シクロヘキシル] カルバモイル] ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン ;
- 6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - クロロフェニル) - 3 - [N - [1 - (N - メチルカルバモイル) シクロヘキシル] カルバモイル] ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン ;
- 6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - クロロフェニル) - 3 - [N - [1 - (N , N - ジメチルカルバモイル) シクロヘキシル] カルバモイル] ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン ;
- (S) - 3 - [N - (1 - カルボキシ - 2 - メチルプロピル) カルバモイル] - 6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - クロロフェニル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン ;
- (S) - 3 - [N - (1 - カルボキシ - 2 - フェニルエチル) カルバモイル] - 6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン ;
- (S) - 3 - [N - (1 - カルボキシ - 2 - メチルプロピル) カルバモイル] - 6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン ;
- (S) - 3 - [N - (- カルボキシベンジル) カルバモイル] - 6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン ;
- (S) - 3 - [N - (1 - カルボキシ - 2 - メチルプロピル) カルバモイル] - 6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - クロロフェニル) - 2 - メチルピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン ;
- 3 - [N - (1 - カルボキシ - 1 - メチルエチル) カルバモイル] - 6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - クロロフェニル) - 2 - メチルピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン ;
- 3 - [N - (- カルボキシベンジル) カルバモイル] - 6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - クロロフェニル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン ;
- 3 - [N - (1 - カルボキシ - 1 - メチルエチル) カルバモイル] - 6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン ;
- 3 - [N - (1 - カルボキシ - 2 - フェニルエチル) カルバモイル] - 6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - クロロフェニル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン ;
- 3 - [N - (4 - カルボキシ - 1 - シクロヘキシル) カルバモイル] - 6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリ

ミジン；

3 - [N - (4 - カルボキシベンジル) カルバモイル] - 6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン；

3 - [N - (3 - カルボキシベンジル) カルバモイル] - 6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン；

6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - クロロフェニル) - 3 - [N - [1 - (2 - ピリジル) エチル] カルバモイル] ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン；

6 - (2 - クロロフェニル) - 3 - [N - (1 - シアノシクロヘキシル) カルバモイル] - 7 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン；

6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - クロロフェニル) - 3 - [N - (1 - メトキシカルボニルシクロヘキシル) カルバモイル] ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン；

6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - クロロフェニル) - 2 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - [N - [1 - (2 - ピリジル) エチル] カルバモイル] ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン；

6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - クロロフェニル) - 2 - [N - メチル - N - (メチルスルホニル) アミノ] - 3 - [N - [1 - (2 - ピリジル) エチル] カルバモイル] ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン；

6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - メチルピペリジン - 1 - イル) - 3 - [N - [1 - メチル - 1 - (2 - ピリジル) エチル] カルバモイル] ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン；

6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - メトキシピペリジン - 1 - イル) - 3 - [N - [1 - メチル - 1 - (2 - ピリジル) エチル] カルバモイル] ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン；

6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (3 - メトキシピロリジン - 1 - イル) - 3 - [N - [1 - メチル - 1 - (2 - ピリジル) エチル] カルバモイル] ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン；

6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) - 3 - [N - (1 - メトキシカルボニルシクロヘキシル) スルファモイル] - 2 - メチルピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン；

3 - [N - (1 - カルボキシシクロヘキシル) スルファモイル] - 6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) - 2 - メチルピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン；

6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) - 3 - [N - (4 - メトキシカルボニル - 1 , 1 - ジオキソテトラヒドロチオピラン - 4 - イル) カルバモイル] ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン；

6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) - 3 - [N - (4 - メチル - 1 , 1 - ジオキソテトラヒドロチオピラン - 4 - イル) カルバモイル] ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン；

6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - クロロフェニル) - 2 - メチル - 3 - [N - (4 - メチル - 1 , 1 - ジオキソテトラヒドロチオピラン - 4 - イル) カルバモイル] ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン；

6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) - 2 - メチル - 3 - [N - (4 - メチル - 1 , 1 - ジオキソテトラヒドロチオピラン - 4 - イル) カルバモイル] ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン；

6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - クロロフェニル) - 3 - [N - (3 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロプ - 2 - イル) カルバモイル] - 2 - メチルピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン；

6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) - 3 - [N - (4 - ヒドロキシメチル - 1 , 1 - ジオキソテトラヒドロチオピラン - 4 - イル) カルバモイル] ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン；

6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - クロロフェニル) - 2 - トリフルオロメチル - 3 - [N - (4 - メチル - 1, 1 - ジオキソテトラヒドロチオピラン - 4 - イル)カルバモイル]ピラゾロ[1, 5 - a]ピリミジン;

6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - クロロフェニル) - 2 - エトキシ - 3 - [N - (4 - メチル - 1, 1 - ジオキソテトラヒドロチオピラン - 4 - イル)カルバモイル]ピラゾロ[1, 5 - a]ピリミジン;

6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (2 - フルオロ - 4 - トリフルオロメチルフェニル) - 3 - [N - (4 - メチル - 1, 1 - ジオキソテトラヒドロチオピラン - 4 - イル)カルバモイル]ピラゾロ[1, 5 - a]ピリミジン;

6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) - 3 - [N - (3 - メトキシカルボニル - 1, 1 - ジオキソチエタン - 3 - イル)カルバモイル]ピラゾロ[1, 5 - a]ピリミジン;

6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - クロロフェニル) - 3 - [N - (1 - シアノシクロヘキシル)カルバモイル] - 2 - メチルピラゾロ[1, 5 - a]ピリミジン;

6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - クロロフェニル) - 2 - (2 - ヒドロキシエトキシ) - 3 - [N - (3 - メチル - 1, 1 - ジオキソテトラヒドロチエン - 3 - イル)カルバモイル]ピラゾロ[1, 5 - a]ピリミジン;

6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) - 2 - (2 - ヒドロキシエトキシ) - 3 - [N - (3 - メチル - 1, 1 - ジオキソテトラヒドロチエン - 3 - イル)カルバモイル]ピラゾロ[1, 5 - a]ピリミジン;

6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) - 3 - [N - (3 - メチル - 1, 1 - ジオキソテトラヒドロチエン - 3 - イル)カルバモイル]ピラゾロ[1, 5 - a]ピリミジン;

6 - (2 - クロロフェニル) - 2 - (ジフルオロメチル) - 7 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) - 3 - [N - (3 - メチル - 1, 1 - ジオキソテトラヒドロチエン - 3 - イル)カルバモイル]ピラゾロ[1, 5 - a]ピリミジン;

6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - クロロフェニル) - 2 - (トリフルオロメチル) - 3 - [N - (3 - メチル - 1, 1 - ジオキソテトラヒドロチエン - 3 - イル)カルバモイル]ピラゾロ[1, 5 - a]ピリミジン;

6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) - 3 - [N - [4 - (N - メチルカルバモイル) - 1, 1 - ジオキソテトラヒドロチオピラン - 4 - イル]カルバモイル]ピラゾロ[1, 5 - a]ピリミジン;

6 - (2 - クロロフェニル) - 3 - [N - [4 - [N - (2, 2, 2 - トリフルオロエチル)カルバモイル] - 1, 1 - ジオキソテトラヒドロチオピラン - 4 - イル]カルバモイル] - 7 - (4 - トリフルオロメチルフェニル)ピラゾロ[1, 5 - a]ピリミジン;
および

6 - (2 - クロロフェニル) - 3 - [N - [4 - [N - (2, 2, 2 - トリフルオロエチル)カルバモイル] - 1, 1 - ジオキソテトラヒドロチオピラン - 4 - イル]カルバモイル] - 7 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) - 2 - メチルピラゾロ[1, 5 - a]ピリミジン

から選ばれる化合物またはその薬理的に許容し得る塩。

【請求項 16】

R¹ 及び R² が同一又は異なってハロゲン原子、シアノ基、アルキル基、ジハロゲノアルキル基及びトリハロゲノアルキル基から選ばれる 1 ~ 2 個の基で置換されていてもよいフェニル基、R³ が式: -N(R⁵)(R⁶)で示される基、R⁵ が水素原子又はアルキル基、R⁶ が (a) アルキル基 (該アルキル基はハロゲン原子、水酸基、シアノ基、アルキルオキシ基、C₃ - 8 シクロアルキル基、ヒドロキシ - C₃ - 8 シクロアルキル基、アミノ - C₃ - 8 シクロアルキル基、1 ~ 2 個のハロゲン原子で置換された C₃ - 8 シクロアルキル基、ジアルキルアミノ基、カルボキシル基、1 ~ 2 個のアルキル基で置換されていてもよいカルバモイル基、1 ~ 2 個のハロゲン原子で置換されたフェニル基、トリハ

ロゲノアルキルフェニル基、アルキルオキシフェニル基、カルボキシフェニル基及び飽和もしくは不飽和 5 ~ 6 員含窒素もしくは含酸素複素環式基から選ばれる 1 ~ 3 個の基で置換されている(よい)、(b) C_{3-8} シクロアルキル基〔該シクロアルキル基はベンゼン環と縮合している(よい)、且つシアノ基、アルキル基、ヒドロキシアルキル基、カルボキシアルキル基、アミノアルキル基、アルキルカルボニルアミノ-アルキル基、ジ(アルキル)カルバモイル-アミノ-アルキル基、アルキルスルホニルアミノアルキル基、ジアルキルスルファモイルアミノアルキル基、カルボキシル基、アルキルオキシカルボニル基、フェニルアルキルオキシカルボニル基、式： $-CON(R^{a1})(R^{b1})$ で示される基(式中、 R^{a1} 及び R^{b1} は同一又は異なって水素原子、アルキル基またはジアルキルアミノアルキル基を表す)及びテトラゾリル基から選ばれる 1 ~ 2 個の基で置換されている(よい)、(c) 飽和もしくは不飽和 4 ~ 6 員含窒素、含硫もしくは含酸素複素環式基〔該複素環式基はオキソ基、水酸基、シアノ基、アルキル基、ヒドロキシアルキル基、カルボキシル基、アルキルオキシカルボニル基、アルキルスルホニル基、式： $-CON(R^{a2})(R^{b2})$ で示される基(式中、 R^{a2} 及び R^{b2} は同一又は異なって水素原子、アルキル基、トリハロゲノアルキル基、シアノアルキル基、ヒドロキシアルキル基、アルキルオキシアルキル基、アルキルスルホニル基または C_{3-8} シクロアルキル基を表す)、ピロリジニルカルボニル基及びモルホリノカルボニル基から選ばれる 1 ~ 3 個の基で置換されている(よい) 或いは (d) アミノ基(該アミノ基はアルキル基及びピリジル基から選ばれる 1 ~ 2 個の基で置換されている(よい))である請求項 3 記載の化合物(但し、6-(2-クロロフェニル)-7-(4-クロロフェニル)-3-[N-(1,1-ジオキソテトラヒドロチエン-3-イル)カルバモイル]-2-(ヒドロキシメチル)ピラゾロ[1,5-a]ピリミジンを除く)。

【請求項 17】

R^1 及び R^2 が同一又は異なって、ハロゲン原子、シアノ基、ジハロゲノアルキル基及びトリハロゲノアルキル基から選ばれる 1 ~ 2 個の基で置換されている(よい)フェニル基、 R^{0B} が式： $-SO_2N(R^{01})(R^{02})$ で示される基、 R'' がアルキルオキシ基である請求項 3 記載の化合物。

【請求項 18】

E が式： $-C(=O)-$ で示される基である請求項 16 又は 17 記載の化合物。

【請求項 19】

R^1 及び R^2 が同一又は異なって、ハロゲン原子、シアノ基、アルキル基、ジハロゲノアルキル基及びトリハロゲノアルキル基から選ばれる 1 ~ 2 個の基で置換されている(よい)フェニル基、 R^{0B} が式： $-NHCONHR^{03}$ で示される基、E が $-C(=O)-$ で示される基、 R'' が式： $-N(R^5)(R^6)$ で示される基、 R^5 が水素原子、 R^6 が (a) アルキル基、(b) トリハロゲノアルキル基、(c) C_{3-8} シクロアルキル基、(d) ジアルキルアミノ基又は (e) オキソ基、アルキル基及びカルバモイル基から選ばれる 1 ~ 3 個の基で置換されている(よい)飽和もしくは不飽和 5 ~ 6 員含硫複素環式基である請求項 3 記載の化合物。

【請求項 20】

R^1 及び R^2 が同一又は異なって、(i) ハロゲン原子、シアノ基、アルキル基、ジハロゲノアルキル基、トリハロゲノアルキル基及びアルキルオキシ基から選ばれる 1 ~ 2 個の基で置換されている(よい)フェニル基或いは (ii) 飽和もしくは不飽和 5 ~ 6 員含窒素複素単環式基、 R^{0B} が式： $-SO_2N(R^{01})(R^{02})$ で示される基、 R^{01} が水素原子又はアルキル基、 R^{02} が水素原子、アルキル基又はカルバモイルアルキル基、E が $-C(=O)-$ で示される基、 R'' が式： $-N(R^5)(R^6)$ で示される基、 R^5 が水素原子又はアルキル基、 R^6 が (a) ハロゲン原子、水酸基、シアノ基、アルキルオキシ基、1 ~ 2 個のハロゲン原子で置換されている(よい) C_{3-8} シクロアルキル基、1 ~ 2 個のアルキル基で置換されている(よい)アミノ基及びピリジル基から選ばれる 1 ~ 3 個の基で置換されている(よい)アルキル基、(b) アルキル基及びカルバモイル基から選ばれる基で置換されている(よい) C_{3-8} シクロアルキル基、(c) アルキル基及びピ

リジル基から選ばれる 1 ~ 2 個の基で置換されていてもよいアミノ基又は (d) オキソ基、アルキル基及びカルバモイル基から選ばれる 1 ~ 3 個の基で置換されていてもよい飽和もしくは不飽和 5 ~ 6 員含窒素もしくは含硫複素環式基である請求項 3 記載の化合物。

【請求項 2 1】

R^1 及び R^2 が同一又は異なって、ハロゲン原子及びトリハロゲノアルキル基から選ばれる 1 ~ 2 個の基で置換されていてもよいフェニル基、 R^{0B} が式： $-CON(R^e)$ (R^f) で示される基、 R^e が水素原子又はアルキル基、 R^f が水素原子、アルキル基又はジアルキルアミノ基、E が $-C(=O)-$ で示される基、 R'' が式： $-N(R^5)(R^6)$ で示される基、 R^5 が水素原子、 R^6 が (a) 1 ~ 3 個のハロゲン原子で置換されていてもよいアルキル基、(b) C_{3-8} シクロアルキル基又は (c) オキソ基及びアルキル基から選ばれる 1 ~ 3 個の基で置換されていてもよい飽和もしくは不飽和 4 ~ 6 員含硫複素環式基である請求項 3 記載の化合物。

【請求項 2 2】

R^1 及び R^2 が同一又は異なって、ハロゲン原子及びトリハロゲノアルキル基から選ばれる 1 ~ 2 個の基で置換されていてもよいフェニル基、 R^{0B} がヒドロキシアルキル基、E が $-C(=O)-$ で示される基、 R'' が式： $-N(R^5)(R^6)$ で示される基、 R^5 が水素原子、 R^6 が (a) 1 ~ 3 個のハロゲン原子で置換されていてもよいアルキル基、(b) ピリジル基で置換されたアルキル基、(c) シアノ基及びカルバモイルから選ばれる基で置換されていてもよい C_{3-8} シクロアルキル基又は (d) オキソ基及びアルキル基から選ばれる 1 ~ 3 個の基で置換されていてもよい飽和もしくは不飽和 4 ~ 6 員含窒素もしくは含硫複素環式基である請求項 3 記載の化合物 (但し、6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - クロロフェニル) - 3 - [N - (1, 1 - ジオキソテトラヒドロチエン - 3 - イル)カルバモイル] - 2 - (ヒドロキシメチル)ピラゾロ [1, 5 - a]ピリミジンを除く)。

【請求項 2 3】

R^1 及び R^2 が同一又は異なって、ハロゲン原子及びトリハロゲノアルキル基から選ばれる 1 ~ 2 個の基で置換されていてもよいフェニル基、 R^{0B} がカルボキシル基、E が $-C(=O)-$ で示される基、 R'' が式： $-N(R^5)(R^6)$ で示される基、 R^5 が水素原子、 R^6 がオキソ基及びアルキル基から選ばれる 1 ~ 3 個の基で置換されていてもよい飽和もしくは不飽和 5 ~ 6 員含硫複素環式基である請求項 3 記載の化合物。

【請求項 2 4】

R^1 及び R^2 が同一又は異なってハロゲノフェニル基、 R^{0B} が 1 ~ 2 個のアルキル基で置換されていてもよいスルファモイル基、E が $-C(=O)-$ で示される基、 R'' がアルキルオキシ基である請求項 3 記載の化合物。

【請求項 2 5】

R^1 が (i) ハロゲン原子、 C_{1-6} アルキル基、ジハロゲノ C_{1-6} アルキル基及びトリハロゲノ C_{1-6} アルキル基から選ばれる 1 ~ 2 個の基で置換されていてもよいフェニル基或いは (ii) ピペリジノ基、 R^2 がハロゲン原子及びシアノ基から選ばれる 1 ~ 2 個の基で置換されていてもよいフェニル基、 R^{0B} が式： $-SO_2N(R^{01})(R^{02})$ で示される基、 R^{01} が水素原子又は C_{1-6} アルキル基、 R^{02} が水素原子、 C_{1-6} アルキル基又はカルバモイル - C_{1-6} アルキル基、 R^5 が水素原子、 R^6 が (a) ハロゲン原子、 C_{1-6} アルキルオキシ基、 C_{3-8} シクロアルキル基及びピリジル基から選ばれる 1 ~ 3 個の基で置換されていてもよい C_{1-6} アルキル基、(b) C_{1-6} アルキル基で置換されていてもよい C_{3-8} シクロアルキル基、(c) C_{1-6} アルキル基及びピリジル基から選ばれる 1 ~ 2 個の基で置換されていてもよいアミノ基又は (d) 1 ~ 2 個のオキソ基で置換されていてもよい飽和もしくは不飽和 5 ~ 6 員含窒素もしくは含硫複素環式基である請求項 2 0 記載の化合物。

【請求項 2 6】

R^1 がトリハロゲノ C_{1-6} アルキル - フェニル基、 R^2 がハロゲノフェニル基、 R^{0B} が式： $-CON(R^e)(R^f)$ で示される基、 R^e が水素原子又は C_{1-6} アルキ

ル基、 R^f が水素原子又は C_{1-6} アルキル基、 R^5 が水素原子、 R^6 が (a) 1~3 個のハロゲン原子で置換されているもよい C_{1-6} アルキル基、又は (b) オキソ基及び C_{1-6} アルキル基から選ばれる 1~3 個の基で置換されているもよい飽和もしくは不飽和 5~6 員含硫複素環式基である請求項 2.1 記載の化合物。

【請求項 2.7】

R^1 がトリハロゲノ C_{1-6} アルキル-フェニル基、 R^2 がハロゲノフェニル基、 R^{0B} がヒドロキシ C_{1-4} アルキル基、 R^5 が水素原子、 R^6 が (a) トリハロゲノ C_{1-6} アルキル基、(b) ピリジル- C_{1-6} アルキル基、(c) シアノ基及びカルバモイルから選ばれる基で置換された C_{5-7} シクロアルキル基又は (d) オキソ基及び C_{1-6} アルキル基から選ばれる 1~3 個の基で置換されているもよい飽和もしくは不飽和 5~6 員含硫複素環式基である請求項 2.2 記載の化合物 (但し、6-(2-クロロフェニル)-7-(4-クロロフェニル)-3-[N-(1,1-ジオキソテトラヒドロチエン-3-イル)カルバモイル]-2-(ヒドロキシメチル)ピラゾロ[1,5-a]ピリミジンを除く)。

【請求項 2.8】

R^1 及び R^2 が同一又は異なるハロゲノフェニル基、 R^{0B} が C_{1-6} アルキル-スルファモイル基、 R^3 が C_{1-6} アルキルオキシ基である請求項 2.4 記載の化合物。

【請求項 2.9】

6-(2-クロロフェニル)-7-(4-クロロフェニル)-3-エトキシカルボニル-2-(N-メチルスルファモイル)ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン；

6-(2-クロロフェニル)-7-(4-クロロフェニル)-3-エトキシカルボニル-2-(N,N-ジメチルスルファモイル)ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン；

(R)-6-(2-クロロフェニル)-7-(4-クロロフェニル)-2-(N-メチルスルファモイル)-3-[N-(1,1-ジオキソテトラヒドロチエン-3-イル)カルバモイル]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン；

6-(2-クロロフェニル)-7-(4-クロロフェニル)-3-[N-(シクロペンチル)カルバモイル]-2-(N-メチルスルファモイル)ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン；

6-(2-クロロフェニル)-7-(4-クロロフェニル)-3-[[N'-メチル-N'-(2-ピリジル)ヒドラジノ]カルボニル]-2-(N-メチルスルファモイル)ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン；

(R)-6-(2-クロロフェニル)-7-(4-クロロフェニル)-2-(N,N-ジメチルスルファモイル)-3-[N-(1,1-ジオキソテトラヒドロチエン-3-イル)カルバモイル]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン；

6-(2-クロロフェニル)-7-(4-クロロフェニル)-3-[N-(シクロペンチル)カルバモイル]-2-(N,N-ジメチルスルファモイル)ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン；

6-(2-クロロフェニル)-7-(4-クロロフェニル)-2-(N,N-ジメチルスルファモイル)-3-[N-(1-ピロリジニル)カルバモイル]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン；

6-(2-クロロフェニル)-7-(4-クロロフェニル)-3-[[N'-メチル-N'-(2-ピリジル)ヒドラジノ]カルボニル]-2-(N,N-ジメチルスルファモイル)ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン；

6-(2-クロロフェニル)-7-(4-クロロフェニル)-2-(N-メチルスルファモイル)-3-[N-(1-ピロリジニル)カルバモイル]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン；

(R)-6-(2-クロロフェニル)-7-(4-クロロフェニル)-3-[N-(1,1-ジオキソテトラヒドロチエン-3-イル)カルバモイル]-2-スルファモイルピラゾロ[1,5-a]ピリミジン；

6-(2-クロロフェニル)-7-(4-クロロフェニル)-3-[N-(1-ピロ

リジニル)カルバモイル] - 2 - スルファモイルピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン ;
 6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - クロロフェニル) - 3 - [[N ' - メチル
 - N ' - (2 - ピリジル) ヒドラジノ] カルボニル] - 2 - スルファモイルピラゾロ [1
 , 5 - a] ピリミジン ;
 (S) - 6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - クロロフェニル) - 3 - [N - (1 , 1 - ジオキソテトラヒドロチエン - 3 - イル) カルバモイル] - 2 - スルファモイル
 ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン ;
 6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - クロロフェニル) - 3 - [N - (シクロペ
 ンチル) カルバモイル] - 2 - スルファモイルピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン ;
 6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - クロロフェニル) - 3 - [N - (1 , 1 -
 ジオキソテトラヒドロチオピラン - 4 - イル) カルバモイル] - 2 - スルファモイルピラ
 ザロ [1 , 5 - a] ピリミジン ;
 (R) - 6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) -
 3 - [N - (1 , 1 - ジオキソテトラヒドロチエン - 3 - イル) カルバモイル] - 2 - ス
 ルファモイルピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン ;
 (S) - 6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) -
 3 - [N - (1 , 1 - ジオキソテトラヒドロチエン - 3 - イル) カルバモイル] - 2 - ス
 ルファモイルピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン ;
 6 - (2 - クロロフェニル) - 3 - [N - (シクロペンチル) カルバモイル] - 7 -
 (4 - トリフルオロメチルフェニル) - 2 - スルファモイルピラゾロ [1 , 5 - a] ピリ
 ミジン ;
 (R) - 7 - (4 - クロロフェニル) - 6 - (2 - シアノフェニル) - 3 - [N - (1 , 1 - ジオキソテトラヒドロチエン - 3 - イル) カルバモイル] - 2 - スルファモイル
 ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン ;
 7 - (4 - クロロフェニル) - 6 - (2 - シアノフェニル) - 3 - [N - (シクロペ
 ンチル) カルバモイル] - 2 - スルファモイルピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン ;
 7 - (4 - クロロフェニル) - 6 - (2 - シアノフェニル) - 3 - [[N ' - メチル
 - N ' - (2 - ピリジル) ヒドラジノ] カルボニル] - 2 - スルファモイルピラゾロ [1
 , 5 - a] ピリミジン ;
 (R) - 2 - [N - (カルバモイルメチル) スルファモイル] - 6 - (2 - クロロフ
 ェニル) - 7 - (4 - クロロフェニル) - 3 - [N - (1 , 1 - ジオキソテトラヒドロチ
 エン - 3 - イル) カルバモイル] ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン ;
 2 - [N - (カルバモイルメチル) スルファモイル] - 6 - (2 - クロロフェニル)
 - 7 - (4 - クロロフェニル) - 3 - [N - (シクロペンチル) カルバモイル] ピラゾロ
 [1 , 5 - a] ピリミジン ;
 2 - [N - (カルバモイルメチル) スルファモイル] - 6 - (2 - クロロフェニル)
 - 7 - (4 - クロロフェニル) - 3 - [[N ' - メチル - N ' - (2 - ピリジル) ヒドラ
 ジノ] カルボニル] ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン ;
 2 - [N - (カルバモイルメチル) スルファモイル] - 6 - (2 - クロロフェニル)
 - 7 - (4 - クロロフェニル) - 3 - [N - (1 - ピロリジニル) カルバモイル] ピラゾ
 ロ [1 , 5 - a] ピリミジン ;
 3 - [N - (1 - カルボキシシクロヘキシル) カルバモイル] - 6 - (2 - クロロフ
 ェニル) - 7 - (4 - クロロフェニル) - 2 - (N - メチルスルファモイル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン ;
 3 - [N - (1 - カルバモイルシクロヘキシル) カルバモイル] - 6 - (2 - クロロ
 フェニル) - 7 - (4 - クロロフェニル) - 2 - スルファモイルピラゾロ [1 , 5 - a]
 ピリミジン ;
 6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) - 2 - ヒド
 ロキシメチル - 3 - [N - [1 - メチル - 1 - (2 - ピリジル) エチル] カルバモイル]
 ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン ;

6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) - 2 - ヒドロキシメチル - 3 - [N - (3 - メチル - 1, 1 - ジオキソテトラヒドロチエン - 3 - イル)カルバモイル]ピラゾロ[1, 5 - a]ピリミジン;

6 - (2 - クロロフェニル) - 3 - [N - (1 - シアノシクロヘキシル)カルバモイル] - 7 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) - 2 - ヒドロキシメチルピラゾロ[1, 5 - a]ピリミジン;

6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) - 2 - ヒドロキシメチル - 3 - [N - (4 - メチル - 1, 1 - ジオキソテトラヒドロチオピラン - 4 - イル)カルバモイル]ピラゾロ[1, 5 - a]ピリミジン;

2 - カルバモイル - 6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) - 3 - [N - (4 - メチル - 1, 1 - ジオキソテトラヒドロチオピラン - 4 - イル)カルバモイル]ピラゾロ[1, 5 - a]ピリミジン;

6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) - 2 - (N - メチルカルバモイル) - 3 - [N - (4 - メチル - 1, 1 - ジオキソテトラヒドロチオピラン - 4 - イル)カルバモイル]ピラゾロ[1, 5 - a]ピリミジン;

6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - クロロフェニル) - 3 - [N - (2, 2 - ジメチルプロピル)カルバモイル] - 2 - スルファモイルピラゾロ[1, 5 - a]ピリミジン;

6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - クロロフェニル) - 3 - [N - (シクロヘキシルメチル)カルバモイル] - 2 - スルファモイルピラゾロ[1, 5 - a]ピリミジン;

6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - クロロフェニル) - 3 - [N - (2, 2, 2 - トリフルオロエチル)カルバモイル] - 2 - スルファモイルピラゾロ[1, 5 - a]ピリミジン;

6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - クロロフェニル) - 3 - [N - (3 - メチルプロピル)カルバモイル] - 2 - スルファモイルピラゾロ[1, 5 - a]ピリミジン;

6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - クロロフェニル) - 3 - [N - (2, 2 - ジフルオロエチル)カルバモイル] - 2 - スルファモイルピラゾロ[1, 5 - a]ピリミジン;

6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - クロロフェニル) - 3 - [N - (シクロプロピルメチル)カルバモイル] - 2 - スルファモイルピラゾロ[1, 5 - a]ピリミジン;

6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - クロロフェニル) - 3 - [N - (1 - メチルシクロプロピル)カルバモイル] - 2 - スルファモイルピラゾロ[1, 5 - a]ピリミジン;

6 - (2 - クロロフェニル) - 3 - [N - (2, 2, 2 - トリフルオロエチル)カルバモイル] - 7 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) - 2 - ヒドロキシメチルピラゾロ[1, 5 - a]ピリミジン;

6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - ジフルオロメチルフェニル) - 3 - [N - (イソブチル)カルバモイル] - 2 - スルファモイルピラゾロ[1, 5 - a]ピリミジン;

2 - カルバモイル - 6 - (2 - クロロフェニル) - 3 - [N - (2, 2, 2 - トリフルオロエチル)カルバモイル] - 7 - (4 - トリフルオロメチルフェニル)ピラゾロ[1, 5 - a]ピリミジン;

6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - クロロ - 2 - フルオロフェニル) - 3 - [N - (2, 2, 2 - トリフルオロエチル)カルバモイル] - 2 - スルファモイルピラゾロ[1, 5 - a]ピリミジン;

6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - ジフルオロメチルフェニル) - 3 - [N - (2, 2, 2 - トリフルオロエチル)カルバモイル] - 2 - スルファモイルピラゾロ[1, 5 - a]ピリミジン;

6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) - 3 - [N - (n - プロピル) カルバモイル] - 2 - スルファモイルピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン ;

6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) - 3 - [N - (イソブチル) カルバモイル] - 2 - スルファモイルピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン ;

6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) - 3 - [N - (1 - メチルプロピル) カルバモイル] - 2 - スルファモイルピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン ;

6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) - 3 - [N - (3 - メトキシプロブ - 2 - イル) カルバモイル] - 2 - スルファモイルピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン ;

6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) - 3 - [N - (1 - メチルシクロプロピル) カルバモイル] - 2 - スルファモイルピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン ;

6 - (2 - クロロフェニル) - 3 - [N - (2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル) カルバモイル] - 7 - (4 - フルオロフェニル) - 2 - スルファモイルピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン ;

6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) - 3 - [[N ' - メチル - N ' - (2 - ピリジル) ヒドラジノ] カルボニル] - 2 - スルファモイルピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン ;

6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) - 3 - [N - (2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル) カルバモイル] - 2 - (ジメチルカルバモイル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン ;

6 - (2 - クロロフェニル) - 7 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) - 3 - [N - [1 - メチル - 1 - (2 - ピリジル) エチル] カルバモイル] - 2 - スルファモイルピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン ;

6 - (2 - クロロフェニル) - 3 - [N - (3 - メトキシプロブ - 2 - イル) カルバモイル] - 7 - (4 - メチルフェニル) - 2 - スルファモイルピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン ;

6 - (2 - クロロフェニル) - 3 - [N - (2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル) カルバモイル] - 7 - (4 - メチルフェニル) - 2 - スルファモイルピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン ;

6 - (2 - クロロフェニル) - 3 - [N - (イソブチル) カルバモイル] - 7 - (4 - メチルフェニル) - 2 - スルファモイルピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン ; および

6 - (2 - クロロフェニル) - 3 - [N - シクロペンチルカルバモイル] - 7 - (4 - メチルフェニル) - 2 - スルファモイルピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン

から選ばれる化合物又はその薬理的に許容し得る塩。

【請求項 30】

請求項 1 記載の化合物又はその薬理的に許容し得る塩を有効成分としてなる医薬組成物。

【請求項 31】

精神分裂病を包含する精神病、不安障害、ストレス、鬱病、癲癇、神経変性、小脳及び旧小脳 (Spinocerebellar) 障害、認識障害、頭蓋外傷、パニック発作、末梢ニューロパシー、緑内障、片頭痛、パーキンソン病、アルツハイマー病、ハンチントン舞蹈病、レイノー症候群、振せん、強迫性障害、健忘症、老年痴呆、胸腺障害、ツーレット症候群、遅発性ジスキネシア、双極性障害、癌、薬剤誘発性運動障害、失調症、内毒素血症性ショック、出血性ショック、低血圧症、不眠症、炎症を包含する免疫学的疾患、多発性硬化症、嘔吐、下痢、喘息、食欲障害 (過食症、食欲不振)、肥満症、非インスリン依存性糖尿病 (NIDDM)、耐糖能障害、高インスリン血症、高脂血症、高コレス

テロール血症、高トリグリセリド血症、脂質代謝異常、動脈硬化、高血圧、冠疾患、記憶障害、泌尿器疾患、心血管疾患、不妊、感染症、髄鞘脱落性疾患、神経炎、ウイルス性脳炎、脳血管障害、肝硬変、又は腸通過障害 (i n t e s t i n a l t r a n s i t d i s o r d e r s) を包含する消化管疾患の予防・治療剤である請求項 3 0 に記載の医薬組成物。

【請求項 3 2】

慢性処置及び物質、物質依存又は薬物乱用からの離脱促進剤である請求項請求項 3 0 に記載の医薬組成物。

【請求項 3 3】

鎮痛薬もしくは麻酔性及び非麻酔性の薬剤の鎮痛活性の増強剤である請求項 3 0 に記載の医薬組成物。

【請求項 3 4】

禁煙補助剤（喫煙からの離脱促進剤）である請求項 3 0 に記載の医薬組成物。