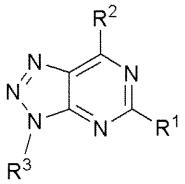
【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】平成23年2月24日(2011.2.24)

【公表番号】特表2010-515738(P2010-515738A)
【公表日】平成22年5月13日(2010.5.13)
【年通号数】公開・登録公報2010-019
【出願番号】特願2009-545618(P2009-545618)
【国際特許分類】
Ｃ０７Ｄ 487/04　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 43/00　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 25/00　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 25/16　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 25/14　(2006.01)
Ａ６１Ｋ 45/00　(2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/198　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 25/24　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 25/28　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 25/04　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 25/26　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 25/02　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 35/00　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 25/18　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 9/10　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 27/02　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 3/10　(2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/519　(2006.01)
【ＦＩ】
Ｃ０７Ｄ 487/04　１４６
Ｃ０７Ｄ 487/04　ＣＳＰ
Ａ６１Ｐ 43/00　１１１
Ａ６１Ｐ 25/00
Ａ６１Ｐ 25/16
Ａ６１Ｐ 25/14
Ａ６１Ｋ 45/00
Ａ６１Ｋ 31/198
Ａ６１Ｐ 25/24
Ａ６１Ｐ 25/28
Ａ６１Ｐ 25/04
Ａ６１Ｐ 25/26
Ａ６１Ｐ 25/02
Ａ６１Ｐ 35/00
Ａ６１Ｐ 25/18
Ａ６１Ｐ 9/10
Ａ６１Ｐ 27/02
Ａ６１Ｐ 3/10
Ａ６１Ｋ 31/519

【手続補正書】
【提出日】平成22年12月27日(2010.12.27)

【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
【化１】



(I)

（式中、R^1は、Ｈ、アルキル、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、アルキルチオ、アリールチオ、ヘテロアリールチオ、ハロゲン、－ＣＮ、－NR^5R^6、－Ｎ（R^a）Ｃ（Ｏ）R^4、－Ｎ（R^a）Ｃ（Ｏ）NR^5R^6、－Ｎ（R^a）CO_2R^4および－Ｎ（R^a）SO_2R^4から選択され；
R^2は、R^7から選択される１－３個の置換基によって任意に置換されたアリール、またはR^7から選択される１－３個の置換基によって任意に置換されたヘテロアリールであり；
R^3は、式－Ｌ－Ar^3－Ｎ（R^a）SO_3－R^b（式中、Ｌは、結合、－（CR^aR^b）$_n$－、－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（R^a）－、－（CR^aR^b）$_n$－Ｃ（Ｏ）Ｎ（R^a）－、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（R^a）－（CR^aR^b）$_n$－、－（CR^aR^b）$_n$－Ｏ－であり；Ar^3は、R^7から選択される１－３個の置換基によって任意に置換されたアリーレン、またはR^7から選択される１－３個の置換基によって任意に置換されたヘテロアリーレンである）を有し；
各R^4は、独立に、Ｈ、アルキルまたはアリールであり、ここで、アルキルおよびアリールは、各々独立に、R^7から選択される１－３個の置換基によって置換され；
各R^5および各R^6は、独立に、Ｈ、アルキルまたはアリールであり、ここで、アルキルおよびアリールは、各々独立に、R^7から選択される１－３個の置換基によって置換され；またはR^5およびR^6は、それらが結合する原子と一緒になって、R^7から選択される１－３個の置換基によって任意に置換される複素環式基を形成し；
各R^7は、独立に、Ｈ、オキソ、ＣＮ、ハロゲン、－CF_3、－CHF_2、－ＣＨＯ、－ＯＨ、－NO_2、－ＳＨ、－OCF_3、アルキル、アルコキシ、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、－CO_2R^a、－Ｏ－アルキル、－Ｏ－アルケニル、－Ｏ－アルキニル、－Ｏ－シクロアルキル、－Ｏ－アリール、－Ｏ－ヘテロアリール、－Ｏ－ヘテロシクリル、－（CH_2）$_n$－アルキル、－（CH_2）$_n$－アルコキシ、－（CH_2）$_n$－アルケニル、－（CH_2）$_n$－アルキニル、－（CH_2）$_n$－シクロアルキル、－（CH_2）$_n$－アリール、－（CH_2）$_n$－ヘテロアリール、－（CH_2）$_n$－ヘテロシクリル、－Ｎ（R^a）－アルキル、－Ｎ（R^a）－アルコキシ、－Ｎ（R^a）－アルケニル、－Ｎ（R^a）－アルキニル、－Ｎ（R^a）－シクロアルキル、－Ｎ（R^a）－アリール、－Ｎ（R^a）－ヘテロアリール、－Ｎ（R^a）－ヘテロシクリル、－SO_m－アルキル、－SO_m－アルコキシ、－SO_m－アルケニル、－SO_m－アルキニル、－SO_m－シクロアルキル、－SO_m－アリール、－SO_m－ヘテロアリール、－SO_m－ヘテロシクリル、－Ｎ（R^a）Ｃ（Ｏ）－アルキル、－Ｎ（R^a）Ｃ（Ｏ）－アルコキシ、－Ｎ（R^a）Ｃ（Ｏ）－アルケニル、－Ｎ（R^a）Ｃ（Ｏ

）－アルキニル、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（Ｏ）－シクロアルキル、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（Ｏ）－アリール、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（Ｏ）－ヘテロアリール、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（Ｏ）－ヘテロシクリル、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ^{a}）－アルキル、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ^{a}）－アルコキシ、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ^{a}）－アルケニル、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ^{a}）－アルキニル、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ^{a}）－シクロアルキル、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ^{a}）－アリール、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ^{a}）－ヘテロアリール、または－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ^{a}）－ヘテロシクリルであり；

各Ｒ^{a}は、独立に、Ｈ、ハロゲン、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{3}$－Ｃ$_{8}$シクロアルキル、フェニルまたはベンジルであり、それらの各々は、－ＯＨ、ハロ、－ＣＦ$_{3}$、－ＣＮ、－ＮＯ$_{2}$、オキソ、アルキル、アルコキシまたはシクロアルキルで任意に置換され；

各Ｒ^{b}は、独立に、Ｈ、ハロゲン、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{3}$－Ｃ$_{8}$シクロアルキル、フェニルまたはベンジルであり、それらの各々は、－ＯＨ、ハロ、－ＣＦ$_{3}$、－ＣＮ、－ＮＯ$_{2}$、オキソ、アルキル、アルコキシまたはシクロアルキルで任意に置換され；

各ｍは、独立に、０、１または２であり；

各ｎは、独立に、０、１、２、３または４である）

またはその製薬上許容される塩。

【請求項２】

Ｒ^{1}が、－ＮＲ^{5}Ｒ^{6}である、請求項１に記載の化合物。

【請求項３】

Ｒ^{1}が、－ＮＨ$_{2}$である、請求項２に記載の化合物。

【請求項４】

Ｒ^{2}が、フリル、チエニル、イミダゾリル、フェニル、ピリジル、チアゾリル、ピラゾリル、トリアゾリル、ピロリル、またはオキサゾリルであり、それらの各々は、Ｒ^{7}から選択される１－３個の置換基によって任意に置換される、請求項１に記載の化合物。

【請求項５】

Ｒ^{2}が、フリル、チエニル、フェニル、メチルフリル、またはメトキシフェニルである、請求項４に記載の化合物。

【請求項６】

Ｌが、－ＣＨ$_{2}$－であり；Ａｒ^{3}が、アリーレンである、請求項１に記載の化合物。

【請求項７】

Ａｒ^{3}が、フェニレン、メチルフェニレン、またはメトキシフェニレンである、請求項６に記載の化合物。

【請求項８】

Ｒ^{1}が、－ＮＲ^{5}Ｒ^{6}であり；Ｒ^{2}が、フリル、チエニル、イミダゾリル、フェニル、ピリジル、チアゾリル、ピラゾリル、トリアゾリル、ピロリル、またはオキサゾリルであり、それらの各々は、Ｒ^{7}から選択される１－３個の置換基によって任意に置換され；Ｌは、－ＣＨ$_{2}$－であり；Ａｒ^{3}は、Ｒ^{7}から選択される１－３個の置換基によって任意に置換されたアリーレンである、請求項１に記載の化合物。

【請求項９】

Ｒ^{1}が、－ＮＨ$_{2}$であり；Ｒ^{2}が、フリル、チエニル、フェニル、メチルフリル、またはメトキシフェニルであり；Ｌが、－ＣＨ$_{2}$－であり；Ａｒ^{3}が、フェニレン、メチルフェニレン、またはメトキシフェニレンである、請求項８に記載の化合物。

【請求項１０】

４－［（５－アミノ－７－（フラン－２－イル）－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－３－イル）メチル］－２－メチルフェニルスルファミン酸；

４－［（５－アミノ－７－（フラン－２－イル）－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－３－イル）メチル］フェニルスルファミン酸；

４－［（５－アミノ－７－フェニル，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－３－イル）メチル］フェニルスルファミン酸；

４－［（５－アミノ－７－（チオフェン－２－イル）－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－３－イル）メチル］フェニルスルファミン酸；

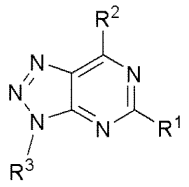
４－［（５－アミノ－７－（２－メトキシフェニル）－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－３－イル）メチル］フェニルスルファミン酸；
３－［（５－アミノ－７－（フラン－２－イル）－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－３－イル）メチル］－フェニルスルファミン酸；
３－［（５－アミノ－７－（チオフェン－２－イル）－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－３－イル）メチル］－フェニルスルファミン酸；
３－［（５－アミノ－７－（２－メトキシフェニル）－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－３－イル）メチル］－フェニルスルファミン酸；
３－［（５－アミノ－７－フェニル－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－３－イル）メチル］－フェニルスルファミン酸；
４－［（５－アミノ－７－（２－メトキシフェニル）－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－３－イル）メチル］－２－メチルフェニルスルファミン酸；
４－［（５－アミノ－７－（チオフェン－２－イル）－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－３－イル）メチル］－２－メチルフェニルスルファミン酸；
４－［（５－アミノ－７－フェニル－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－３－イル）メチル］－２－メチルフェニルスルファミン酸；
５－［（５－アミノ－７－（チオフェン－２－イル）－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－３－イル）メチル］－２－メチルフェニルスルファミン酸；
５－［（５－アミノ－７－（フラン－２－イル）－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－３－イル）メチル］－２－メチルフェニルスルファミン酸；
５－［（５－アミノ－７－フェニル－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－３－イル）メチル］－２－メチルフェニルスルファミン酸；
５－［（５－アミノ－７－（２－メトキシフェニル）－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－３－イル）メチル］－２－メチルフェニルスルファミン酸；
４－［（５－アミノ－７－（２－メトキシフェニル）－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－３－イル）メチル］－２－メトキシフェニルスルファミン酸；
４－［（５－アミノ－７－フェニル－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－３－イル）メチル］－２－メトキシフェニルスルファミン酸；
４－［（５－アミノ－７－（チオフェン－２－イル）－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－３－イル）メチル］－２－メトキシフェニルスルファミン酸；
４－［（５－アミノ－７－（フラン－２－イル）－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－３－イル）メチル］－２－メトキシフェニルスルファミン酸；
４－［（５－アミノ－７－（チオフェン－２－イル）－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－３－イル）メチル］－３－メトキシフェニルスルファミン酸；
４－［（５－アミノ－７－（フラン－２－イル）－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－３－イル）メチル］－３－メトキシフェニルスルファミン酸；
４－［（５－アミノ－７－フェニル－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－３－イル）メチル］－３－メトキシフェニルスルファミン酸；
４－［（５－アミノ－７－（２－メトキシフェニル）－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－３－イル）メチル］－３－メトキシフェニルスルファミン酸；
４－［（５－アミノ－７－（５－メチルフラン－２－イル）－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－３－イル）メチル］フェニルスルファミン酸；

３－［（５－アミノ－７－（５－メチルフラン－２－イル）－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－３－イル）メチル］フェニルスルファミン酸；
５－［（５－アミノ－７－（５－メチルフラン－２－イル）－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－３－イル）メチル］－２－メチルフェニルスルファミン酸；
４－［（５－アミノ－７－（５－メチルフラン－２－イル）－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－３－イル）メチル］－２－メチルフェニルスルファミン酸；
４－［（５－アミノ－７－（５－メチルフラン－２－イル）－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－３－イル）メチル］－２－メトキシフェニルスルファミン酸；
４－［（５－アミノ－７－（５－メチルフラン－２－イル）－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－３－イル）メチル］－３－メトキシフェニルスルファミン酸；からなる群より選択される、請求項１に記載の化合物、およびその製薬上許容される塩。

【請求項１１】

製薬上許容される担体および式（Ｉ）の化合物

【化２】



(I)

（式中、R^1は、Ｈ、アルキル、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、アルキルチオ、アリールチオ、ヘテロアリールチオ、ハロゲン、－ＣＮ、－NR^5R^6、－Ｎ（R^a）Ｃ（Ｏ）R^4、－Ｎ（R^a）Ｃ（Ｏ）NR^5R^6、－Ｎ（R^a）CO_2R^4および－Ｎ（R^a）SO_2R^4から選択され；
R^2は、R^7から選択される１－３個の置換基によって任意に置換されたアリール、またはR^7から選択される１－３個の置換基によって任意に置換されたヘテロアリールであり；
R^3は、式－Ｌ－Ar^3－Ｎ（R^a）SO_3－R^b（式中、Ｌは、結合、－（CR^aR^b）$_n$－、－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（R^a）－、－（CR^aR^b）$_n$－Ｃ（Ｏ）Ｎ（R^a）－、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（R^a）－（CR^aR^b）$_n$－、－（CR^aR^b）$_n$－Ｏ－であり；Ar^3は、R^7から選択される１－３個の置換基によって任意に置換されたアリーレン、またはR^7から選択される１－３個の置換基によって任意に置換されたヘテロアリーレンである）を有し；
各R^4は、独立に、Ｈ、アルキルまたはアリールであり、ここで、アルキルおよびアリールは、各々独立に、R^7から選択される１－３個の置換基によって置換され；
各R^5および各R^6は、独立に、Ｈ、アルキルまたはアリールであり、ここで、アルキルおよびアリールは、各々独立に、R^7から選択される１－３個の置換基によって置換され；またはR^5およびR^6は、それらが結合する原子と一緒になって、R^7から選択される１－３個の置換基によって任意に置換される複素環式基を形成し；
各R^7は、独立に、Ｈ、オキソ、ＣＮ、ハロゲン、－CF_3、－CHF_2、－ＣＨＯ、－ＯＨ、－NO_2、－ＳＨ、－OCF_3、アルキル、アルコキシ、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、－CO_2R^a、－Ｏ－アルキル、－Ｏ－アルケニル、－Ｏ－アルキニル、－Ｏ－シクロアルキル、－Ｏ－アリール、－Ｏ－ヘテロアリール、－Ｏ－ヘテロシクリル、－（CH_2）$_n$－アルキル、－（

$CH_2)_n$－アルコキシ、－（$CH_2)_n$－アルケニル、－（$CH_2)_n$－アルキニル、－（$CH_2)_n$－シクロアルキル、－（$CH_2)_n$－アリール、－（$CH_2)_n$－ヘテロアリール、－（$CH_2)_n$－ヘテロシクリル、－N（R^a）－アルキル、－N（R^a）－アルコキシ、－N（R^a）－アルケニル、－N（R^a）－アルキニル、－N（R^a）－シクロアルキル、－N（R^a）－アリール、－N（R^a）－ヘテロアリール、－N（R^a）－ヘテロシクリル、－SO_m－アルキル、－SO_m－アルコキシ、－SO_m－アルケニル、－SO_m－アルキニル、－SO_m－シクロアルキル、－SO_m－アリール、－SO_m－ヘテロアリール、－SO_m－ヘテロシクリル、－N（R^a）C（O）－アルキル、－N（R^a）C（O）－アルコキシ、－N（R^a）C（O）－アルケニル、－N（R^a）C（O）－アルキニル、－N（R^a）C（O）－シクロアルキル、－N（R^a）C（O）－アリール、－N（R^a）C（O）－ヘテロアリール、－N（R^a）C（O）－ヘテロシクリル、－C（O）N（R^a）－アルキル、－C（O）N（R^a）－アルコキシ、－C（O）N（R^a）－アルケニル、－C（O）N（R^a）－アルキニル、－C（O）N（R^a）－シクロアルキル、－C（O）N（R^a）－アリール、－C（O）N（R^a）－ヘテロアリール、または－C（O）N（R^a）－ヘテロシクリルであり；

各R^aは、独立に、H、ハロゲン、C_1－C_6アルキル、C_3－C_8シクロアルキル、フェニルまたはベンジルであり、それらの各々は、－OH、ハロ、－CF_3、－CN、－NO_2、オキソ、アルキル、アルコキシまたはシクロアルキルで任意に置換され；

各R^bは、独立に、H、ハロゲン、C_1－C_6アルキル、C_3－C_8シクロアルキル、フェニルまたはベンジルであり、それらの各々は、－OH、ハロ、－CF_3、－CN、－NO_2、オキソ、アルキル、アルコキシまたはシクロアルキルで任意に置換され；

各mは、独立に、０、１または２であり；

各ｎは、独立に、０、１、２、３または４である）

またはその製薬上許容される塩を含む、医薬組成物。

【請求項１２】

R^1が、－NR^5R^6である、請求項１１に記載の組成物。

【請求項１３】

R^1が、－NH_2である、請求項１２に記載の組成物。

【請求項１４】

R^2が、フリル、チエニル、イミダゾリル、フェニル、ピリジル、チアゾリル、ピラゾリル、トリアゾリル、ピロリル、またはオキサゾリルであり、それらの各々は、R^7から選択される１－３個の置換基によって任意に置換される、請求項１１に記載の組成物。

【請求項１５】

R^2が、フリル、チエニル、フェニル、メチルフリル、またはメトキシフェニルである、請求項１４に記載の組成物。

【請求項１６】

Lが、－CH_2－であり；Ar^3が、アリーレンである、請求項１１に記載の組成物。

【請求項１７】

Ar^3が、フェニレン、メチルフェニレン、またはメトキシフェニレンである、請求項１６に記載の組成物。

【請求項１８】

R^1が、－NR^5R^6であり；R^2が、フリル、チエニル、イミダゾリル、フェニル、ピリジル、チアゾリル、ピラゾリル、トリアゾリル、ピロリル、またはオキサゾリルであり、それらの各々は、R^7から選択される１－３個の置換基によって任意に置換され；Lは、－CH_2－であり；Ar^3は、R^7から選択される１－３個の置換基によって任意に置換されたアリーレンである、請求項１１に記載の組成物。

【請求項１９】

R^1が、－NH_2であり；R^2が、フリル、チエニル、フェニル、メチルフリル、またはメトキシフェニルであり；Lが、－CH_2－であり；Ar^3が、フェニレン、メチルフェニレン、またはメトキシフェニレンである、請求項１８に記載の組成物。

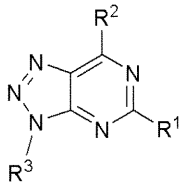
【請求項２０】
前記化合物が、
４－［（５－アミノ－７－（フラン－２－イル）－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－３－イル）メチル］－２－メチルフェニルスルファミン酸；
４－［（５－アミノ－７－（フラン－２－イル）－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－３－イル）メチル］フェニルスルファミン酸；
４－［（５－アミノ－７－フェニル，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－３－イル）メチル］フェニルスルファミン酸；
４－［（５－アミノ－７－（チオフェン－２－イル）－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－３－イル）メチル］フェニルスルファミン酸；
４－［（５－アミノ－７－（２－メトキシフェニル）－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－３－イル）メチル］フェニルスルファミン酸；
３－［（５－アミノ－７－（フラン－２－イル）－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－３－イル）メチル］－フェニルスルファミン酸；
３－［（５－アミノ－７－（チオフェン－２－イル）－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－３－イル）メチル］－フェニルスルファミン酸；
３－［（５－アミノ－７－（２－メトキシフェニル）－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－３－イル）メチル］－フェニルスルファミン酸；
３－［（５－アミノ－７－フェニル－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－３－イル）メチル］－フェニルスルファミン酸；
４－［（５－アミノ－７－（２－メトキシフェニル）－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－３－イル）メチル］－２－メチルフェニルスルファミン酸；
４－［（５－アミノ－７－（チオフェン－２－イル）－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－３－イル）メチル］－２－メチルフェニルスルファミン酸；
４－［（５－アミノ－７－フェニル－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－３－イル）メチル］－２－メチルフェニルスルファミン酸；
５－［（５－アミノ－７－（チオフェン－２－イル）－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－３－イル）メチル］－２－メチルフェニルスルファミン酸；
５－［（５－アミノ－７－（フラン－２－イル）－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－３－イル）メチル］－２－メチルフェニルスルファミン酸；
５－［（５－アミノ－７－フェニル－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－３－イル）メチル］－２－メチルフェニルスルファミン酸；
５－［（５－アミノ－７－（２－メトキシフェニル）－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－３－イル）メチル］－２－メチルフェニルスルファミン酸；
４－［（５－アミノ－７－（２－メトキシフェニル）－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－３－イル）メチル］－２－メトキシフェニルスルファミン酸；
４－［（５－アミノ－７－フェニル－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－３－イル）メチル］－２－メトキシフェニルスルファミン酸；
４－［（５－アミノ－７－（チオフェン－２－イル）－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－３－イル）メチル］－２－メトキシフェニルスルファミン酸；
４－［（５－アミノ－７－（フラン－２－イル）－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－３－イル）メチル］－２－メトキシフェニルスルファミン酸；
４－［（５－アミノ－７－（チオフェン－２－イル）－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－３－イル）メチル］－３－メトキシフェニルスルファミン

酸；
４－［（５－アミノ－７－（フラン－２－イル）－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－３－イル）メチル］－３－メトキシフェニルスルファミン酸；
４－［（５－アミノ－７－フェニル－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－３－イル）メチル］－３－メトキシフェニルスルファミン酸；
４－［（５－アミノ－７－（２－メトキシフェニル）－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－３－イル）メチル］－３－メトキシフェニルスルファミン酸；
４－［（５－アミノ－７－（５－メチルフラン－２－イル）－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－３－イル）メチル］フェニルスルファミン酸；
３－［（５－アミノ－７－（５－メチルフラン－２－イル）－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－３－イル）メチル］フェニルスルファミン酸；
５－［（５－アミノ－７－（５－メチルフラン－２－イル）－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－３－イル）メチル］－２－メチルフェニルスルファミン酸；
４－［（５－アミノ－７－（５－メチルフラン－２－イル）－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－３－イル）メチル］－２－メチルフェニルスルファミン酸；
４－［（５－アミノ－７－（５－メチルフラン－２－イル）－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－３－イル）メチル］－２－メトキシフェニルスルファミン酸；
４－［（５－アミノ－７－（５－メチルフラン－２－イル）－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－３－イル）メチル］－３－メトキシフェニルスルファミン酸；およびその製薬上許容される塩からなる群より選択される、請求項１１に記載の組成物。

【請求項２１】

プリン受容体遮断によって処置可能な障害の処置を必要とする被験者の障害を処置するための医薬組成物であって、化合物またはその製薬上許容される塩を含み、前記化合物が、式（Ｉ）

【化３】

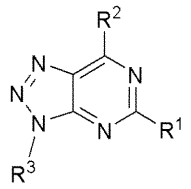


(I)

（式中、R^1は、Ｈ、アルキル、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、アルキルチオ、アリールチオ、ヘテロアリールチオ、ハロゲン、－ＣＮ、－ＮＲ^{5}Ｒ^6、－Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（Ｏ）Ｒ^4、－Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（Ｏ）ＮＲ^{5}Ｒ^6、－Ｎ（Ｒ^a）ＣＯ$_2$Ｒ^{4}および－Ｎ（Ｒ^a）ＳＯ$_2$Ｒ^{4}から選択され；
R^2は、R^7から選択される１－３個の置換基によって任意に置換されたアリール、またはR^7から選択される１－３個の置換基によって任意に置換されたヘテロアリールであり；
R^3は、式－Ｌ－Ａｒ^3－Ｎ（Ｒ^a）ＳＯ$_3$－Ｒ^b（式中、Ｌは、結合、－（ＣＲ^{a}Ｒ^b）$_n$－、－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ^a）－、－（ＣＲ^{a}Ｒ^b）$_n$－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ^a）－、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ^a）－（ＣＲ^{a}Ｒ^b）$_n$－、－（ＣＲ^{a}Ｒ^b）$_n$－Ｏ－であり；Ａｒ^{3}は、R^7から選択される１－３個の置換基によって任意に置換されたアリーレン、またはR^7から選択される１－３個の置換基によって任意に置換されたヘテロアリー

レンである）を有し；
各R^4は、独立に、Ｈ、アルキルまたはアリールであり、ここで、アルキルおよびアリールは、各々独立に、R^7から選択される１－３個の置換基によって置換され；
各R^5および各R^6は、独立に、Ｈ、アルキルまたはアリールであり、ここで、アルキルおよびアリールは、各々独立に、R^7から選択される１－３個の置換基によって置換され；またはR^5およびR^6は、それらが結合する原子と一緒になって、R^7から選択される１－３個の置換基によって任意に置換される複素環式基を形成し；
各R^7は、独立に、Ｈ、オキソ、ＣＮ、ハロゲン、CF_3、－ＣＨＯ、－ＯＨ、－ＮＯ、－ＳＨ、－OCF_3、アルキル、アルコキシ、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、－CO_2R^a、－Ｏ－アルキル、－Ｏ－アルケニル、－Ｏ－アルキニル、－Ｏ－シクロアルキル、－Ｏ－アリール、－Ｏ－ヘテロアリール、－Ｏ－ヘテロシクリル、－$(CH_2)_n$－アルキル、－$(CH_2)_n$－アルコキシ、－$(CH_2)_n$－アルケニル、－$(CH_2)_n$－アルキニル、－$(CH_2)_n$－シクロアルキル、－$(CH_2)_n$－アリール、－$(CH_2)_n$－ヘテロアリール、－$(CH_2)_n$－ヘテロシクリル、－Ｎ（R^a）－アルキル、－Ｎ（R^a）－アルコキシ、－Ｎ（R^a）－アルケニル、－Ｎ（R^a）－アルキニル、－Ｎ（R^a）－シクロアルキル、－Ｎ（R^a）－アリール、－Ｎ（R^a）－ヘテロアリール、－Ｎ（R^a）－ヘテロシクリル、－SO_m－アルキル、－SO_m－アルコキシ、－SO_m－アルケニル、－SO_m－アルキニル、－SO_m－シクロアルキル、－SO_m－アリール、－SO_m－ヘテロアリール、－SO_m－ヘテロシクリル、－Ｎ（R^a）Ｃ（Ｏ）－アルキル、－Ｎ（R^a）Ｃ（Ｏ）－アルコキシ、－Ｎ（R^a）Ｃ（Ｏ）－アルケニル、－Ｎ（R^a）Ｃ（Ｏ）－アルキニル、－Ｎ（R^a）Ｃ（Ｏ）－シクロアルキル、－Ｎ（R^a）Ｃ（Ｏ）－アリール、－Ｎ（R^a）Ｃ（Ｏ）－ヘテロアリール、－Ｎ（R^a）Ｃ（Ｏ）－ヘテロシクリル、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（R^a）－アルキル、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（R^a）－アルコキシ、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（R^a）－アルケニル、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（R^a）－アルキニル、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（R^a）－シクロアルキル、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（R^a）－アリール、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（R^a）－ヘテロアリール、または－Ｃ（Ｏ）Ｎ（R^a）－ヘテロシクリルであり；
各R^aは、独立に、Ｈ、ハロゲン、C_1－C_6アルキル、C_3－C_8シクロアルキル、フェニルまたはベンジルであり、それらの各々は、－ＯＨ、ハロ、－CF_3、－ＣＮ、－NO_2、オキソ、アルキル、アルコキシまたはシクロアルキルで任意に置換され；
各R^bは、独立に、Ｈ、ハロゲン、C_1－C_6アルキル、C_3－C_8シクロアルキル、フェニルまたはベンジルであり、それらの各々は、－ＯＨ、ハロ、－CF_3、－ＣＮ、－NO_2、オキソ、アルキル、アルコキシまたはシクロアルキルで任意に置換され；
各ｍは、独立に、０、１または２であり；
各ｎは、独立に、０、１、２、３または４である）
を有するか、またはその製薬上許容される塩である、前記医薬組成物。
【請求項２２】
前記障害が、プリン受容体の機能亢進に関連する、請求項２１に記載の医薬組成物。
【請求項２３】
前記被験者が、アデノシン受容体遮断を必要とする、請求項２１に記載の医薬組成物。
【請求項２４】
前記アデノシン受容体が、A_{2A}受容体である、請求項２３に記載の医薬組成物。
【請求項２５】
前記障害が、運動障害である、請求項２４に記載の医薬組成物。
【請求項２６】
前記運動障害が、パーキンソン病である、請求項２５に記載の医薬組成物。
【請求項２７】
前記運動障害が、薬剤誘発性パーキンソンニズム、脳炎後パーキンソンニズム、中毒によって誘発されるパーキンソンニズムまたは外傷後パーキンソン病である、請求項２６に記載の医薬組成物。

【請求項２８】
前記運動障害が、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パッツ病、進行性淡蒼球萎縮、ドーパ反応性ジストニアパーキンソンニズム、痙性またはジスキネジーを生じる大脳基底核の他の障害である、請求項２５に記載の医薬組成物。
【請求項２９】
前記運動障害の処置に有用なさらなる薬物をさらに含む、請求項２１に記載の医薬組成物。
【請求項３０】
前記運動障害の処置に有用な前記さらなる薬物が、パーキンソン病の処置に有用な薬物である、請求項２９に記載の医薬組成物。
【請求項３１】
前記さらなる薬物が、Ｌ－ＤＯＰＡまたはドーパミン作用薬である、請求項３０に記載の医薬組成物。
【請求項３２】
前記障害が、鬱病、認識機能障害または記憶障害、急性疼痛または慢性疼痛、ＡＤＨＤあるいは睡眠発作である、請求項２１に記載の医薬組成物。
【請求項３３】
前記認識機能障害または記憶障害が、アルツハイマー病である、請求項３２に記載の医薬組成物。
【請求項３４】
式（Ｉ）
【化４】



(I)

（式中、R^1は、Ｈ、アルキル、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、アルキルチオ、アリールチオ、ヘテロアリールチオ、ハロゲン、－ＣＮ、－NR^5R^6、－Ｎ（R^a）Ｃ（Ｏ）R^4、－Ｎ（R^a）Ｃ（Ｏ）NR^5R^6、－Ｎ（R^a）CO_2R^4および－Ｎ（R^a）SO_2R^4から選択され；
R^2は、R^7から選択される１－３個の置換基によって任意に置換されたアリール、またはR^7から選択される１－３個の置換基によって任意に置換されたヘテロアリールであり；
R^3は、式－Ｌ－Ar^3－NO_2（式中、Ｌは、結合、－（CR^aR^b）$_n$－、－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（R^a）－、－（CR^aR^b）$_n$－Ｃ（Ｏ）Ｎ（R^a）－、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（R^a）－（CR^aR^b）$_n$－、－（CR^aR^b）$_n$－Ｏ－であり；Ar^3は、R^7から選択される１－３個の置換基によって任意に置換されたアリーレン、またはR^7から選択される１－３個の置換基によって任意に置換されたヘテロアリーレンである）を有し；
各R^4は、独立に、Ｈ、アルキルまたはアリールであり、ここで、アルキルおよびアリールは、各々独立に、R^7から選択される１－３個の置換基によって置換され；
各R^5および各R^6は、独立に、Ｈ、アルキルまたはアリールであり、ここで、アルキルおよびアリールは、各々独立に、R^7から選択される１－３個の置換基によって置換され；またはR^5およびR^6は、それらが結合する原子と一緒になって、R^7から選択される１－３個の置換基によって任意に置換される複素環式基を形成し；

各R^7は、独立に、H、オキソ、CN、ハロゲン、$-CF_3$、$-CHF_2$、-CHO、-OH、$-NO_2$、-SH、$-OCF_3$、アルキル、アルコキシ、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、$-CO_2R^a$、-O-アルキル、-O-アルケニル、-O-アルキニル、-O-シクロアルキル、-O-アリール、-O-ヘテロアリール、-O-ヘテロシクリル、$-(CH_2)_n$-アルキル、$-(CH_2)_n$-アルコキシ、$-(CH_2)_n$-アルケニル、$-(CH_2)_n$-アルキニル、$-(CH_2)_n$-シクロアルキル、$-(CH_2)_n$-アリール、$-(CH_2)_n$-ヘテロアリール、$-(CH_2)_n$-ヘテロシクリル、$-N(R^a)$-アルキル、$-N(R^a)$-アルコキシ、$-N(R^a)$-アルケニル、$-N(R^a)$-アルキニル、$-N(R^a)$-シクロアルキル、$-N(R^a)$-アリール、$-N(R^a)$-ヘテロアリール、$-N(R^a)$-ヘテロシクリル、$-SO_m$-アルキル、$-SO_m$-アルコキシ、$-SO_m$-アルケニル、$-SO_m$-アルキニル、$-SO_m$-シクロアルキル、$-SO_m$-アリール、$-SO_m$-ヘテロアリール、$-SO_m$-ヘテロシクリル、$-N(R^a)C(O)$-アルキル、$-N(R^a)C(O)$-アルコキシ、$-N(R^a)C(O)$-アルケニル、$-N(R^a)C(O)$-アルキニル、$-N(R^a)C(O)$-シクロアルキル、$-N(R^a)C(O)$-アリール、$-N(R^a)C(O)$-ヘテロアリール、$-N(R^a)C(O)$-ヘテロシクリル、$-C(O)N(R^a)$-アルキル、$-C(O)N(R^a)$-アルコキシ、$-C(O)N(R^a)$-アルケニル、$-C(O)N(R^a)$-アルキニル、$-C(O)N(R^a)$-シクロアルキル、$-C(O)N(R^a)$-アリール、$-C(O)N(R^a)$-ヘテロアリール、または$-C(O)N(R^a)$-ヘテロシクリルであり；

各R^aは、独立に、H、ハロゲン、C_1-C_6アルキル、C_3-C_8シクロアルキル、フェニルまたはベンジルであり、それらの各々は、-OH、ハロ、$-CF_3$、-CN、$-NO_2$、オキソ、アルキル、アルコキシまたはシクロアルキルで任意に置換され；

各R^bは、独立に、H、ハロゲン、C_1-C_6アルキル、C_3-C_8シクロアルキル、フェニルまたはベンジルであり、それらの各々は、-OH、ハロ、$-CF_3$、-CN、$-NO_2$、オキソ、アルキル、アルコキシまたはシクロアルキルで任意に置換され；

各mは、独立に、0、1または2であり；

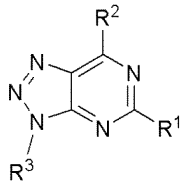
各nは、独立に、0、1、2、3または4である）

を有する化合物、またはその製薬上許容される塩と、亜ジチオン酸塩とを接触させることを含む、化合物の製造方法。

【請求項３５】

式（Ｉ）

【化５】



(I)

（式中、R^1は、H、アルキル、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、アルキルチオ、アリールチオ、ヘテロアリールチオ、ハロゲン、-CN、$-NR^5R^6$、$-N(R^a)C(O)R^4$、$-N(R^a)C(O)NR^5R^6$、$-N(R^a)CO_2R^4$および$-N(R^a)SO_2R^4$から選択され；

R^2は、R^7から選択される１－３個の置換基によって任意に置換されたアリール、またはR^7から選択される１－３個の置換基によって任意に置換されたヘテロアリールであり；

R^3は、式$-L-Ar^3-NH_2$（式中、Lは、結合、$-(CR^aR^b)_n-$、-C(O)-、$-C(O)N(R^a)-$、$-(CR^aR^b)_n-C(O)N(R^a)-$、-C(

Ｏ）Ｎ（Ｒ^{a}）－（ＣＲ^{a}Ｒ^{b}）$_{n}$－、－（ＣＲ^{a}Ｒ^{b}）$_{n}$－Ｏ－であり；Ａｒ^{3}は、Ｒ^{7}から選択される１－３個の置換基によって任意に置換されたアリーレン、またはＲ^{7}から選択される１－３個の置換基によって任意に置換されたヘテロアリーレンである）を有し；

各Ｒ^{4}は、独立に、Ｈ、アルキルまたはアリールであり、ここで、アルキルおよびアリールは、各々独立に、Ｒ^{7}から選択される１－３個の置換基によって置換され；

各Ｒ^{5}および各Ｒ^{6}は、独立に、Ｈ、アルキルまたはアリールであり、ここで、アルキルおよびアリールは、各々独立に、Ｒ^{7}から選択される１－３個の置換基によって置換され；またはＲ^{5}およびＲ^{6}は、それらが結合する原子と一緒になって、Ｒ^{7}から選択される１－３個の置換基によって任意に置換される複素環式基を形成し；

各Ｒ^{7}は、独立に、Ｈ、オキソ、ＣＮ、ハロゲン、－ＣＦ$_{3}$、－ＣＨＦ$_{2}$、－ＣＨＯ、－ＯＨ、－ＮＯ$_{2}$、－ＳＨ、－ＯＣＦ$_{3}$、アルキル、アルコキシ、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、－ＣＯ$_{2}$Ｒ^{a}、－Ｏ－アルキル、－Ｏ－アルケニル、－Ｏ－アルキニル、－Ｏ－シクロアルキル、－Ｏ－アリール、－Ｏ－ヘテロアリール、－Ｏ－ヘテロシクリル、－（ＣＨ$_{2}$）$_{n}$－アルキル、－（ＣＨ$_{2}$）$_{n}$－アルコキシ、－（ＣＨ$_{2}$）$_{n}$－アルケニル、－（ＣＨ$_{2}$）$_{n}$－アルキニル、－（ＣＨ$_{2}$）$_{n}$－シクロアルキル、－（ＣＨ$_{2}$）$_{n}$－アリール、－（ＣＨ$_{2}$）$_{n}$－ヘテロアリール、－（ＣＨ$_{2}$）$_{n}$－ヘテロシクリル、－Ｎ（Ｒ^{a}）－アルキル、－Ｎ（Ｒ^{a}）－アルコキシ、－Ｎ（Ｒ^{a}）－アルケニル、－Ｎ（Ｒ^{a}）－アルキニル、－Ｎ（Ｒ^{a}）－シクロアルキル、－Ｎ（Ｒ^{a}）－アリール、－Ｎ（Ｒ^{a}）－ヘテロアリール、－Ｎ（Ｒ^{a}）－ヘテロシクリル、－ＳＯ$_{m}$－アルキル、－ＳＯ$_{m}$－アルコキシ、－ＳＯ$_{m}$－アルケニル、－ＳＯ$_{m}$－アルキニル、－ＳＯ$_{m}$－シクロアルキル、－ＳＯ$_{m}$－アリール、－ＳＯ$_{m}$－ヘテロアリール、－ＳＯ$_{m}$－ヘテロシクリル、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（Ｏ）－アルキル、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（Ｏ）－アルコキシ、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（Ｏ）－アルケニル、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（Ｏ）－アルキニル、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（Ｏ）－シクロアルキル、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（Ｏ）－アリール、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（Ｏ）－ヘテロアリール、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（Ｏ）－ヘテロシクリル、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ^{a}）－アルキル、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ^{a}）－アルコキシ、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ^{a}）－アルケニル、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ^{a}）－アルキニル、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ^{a}）－シクロアルキル、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ^{a}）－アリール、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ^{a}）－ヘテロアリール、または－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ^{a}）－ヘテロシクリルであり；

各Ｒ^{a}は、独立に、Ｈ、ハロゲン、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{3}$－Ｃ$_{8}$シクロアルキル、フェニルまたはベンジルであり、それらの各々は、－ＯＨ、ハロ、－ＣＦ$_{3}$、－ＣＮ、－ＮＯ$_{2}$、オキソ、アルキル、アルコキシまたはシクロアルキルで任意に置換され；

各Ｒ^{b}は、独立に、Ｈ、ハロゲン、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{3}$－Ｃ$_{8}$シクロアルキル、フェニルまたはベンジルであり、それらの各々は、－ＯＨ、ハロ、－ＣＦ$_{3}$、－ＣＮ、－ＮＯ$_{2}$、オキソ、アルキル、アルコキシまたはシクロアルキルで任意に置換され；

各ｍは、独立に、０、１または２であり；

各ｎは、独立に、０、１、２、３または４である）

を有する化合物、またはその製薬上許容される塩と、クロロスルホン酸とを接触させることを含む、化合物の製造方法。

【請求項３６】

Ｒ^{1}が、－ＮＲ^{5}Ｒ^{6}である、請求項３４または３５に記載の方法。

【請求項３７】

Ｒ^{1}が、－ＮＨ$_{2}$である、請求項３６に記載の方法。

【請求項３８】

Ｒ^{2}が、フリル、チエニル、イミダゾリル、フェニル、ピリジル、チアゾリル、ピラゾリル、トリアゾリル、ピロリル、またはオキサゾリルであり、それらの各々は、Ｒ^{7}から選択される１－３個の置換基によって任意に置換される、請求項３４または３５に記載の方法。

【請求項３９】

R^2が、フリル、チエニル、フェニル、メチルフリルまたはメトキシフェニルである、請求項３８に記載の方法。
【請求項４０】
Ｌが、－CH_2－であり；Ar^3が、アリーレンである、請求項３４または３５に記載の方法。
【請求項４１】
Ar^3が、フェニレン、メチルフェニレン、またはメトキシフェニレンである、請求項４０に記載の方法。
【請求項４２】
R^1が、－NR^5R^6であり；R^2が、フリル、チエニル、イミダゾリル、フェニル、ピリジル、チアゾリル、ピラゾリル、トリアゾリル、ピロリル、またはオキサゾリルであり、それらの各々は、R^7から選択される１－３個の置換基によって任意に置換され；Ｌが、－CH_2－であり；そしてAr^3が、R^7から選択される１－３個の置換基によって任意に置換されたアリーレンである、請求項３４または３５に記載の方法。
【請求項４３】
R^1が、－NH_2であり；R^2が、フリル、チエニル、フェニル、メチルフリル、またはメトキシフェニルであり；Ｌが、－CH_2－であり；そしてAr^3が、フェニレン、メチルフェニレン、またはメトキシフェニレンである、請求項４２に記載の方法。
【請求項４４】
前記式（Ｉ）の化合物が、
７－（フラン－２－イル）－３－（３－メチル－４－ニトロベンジル）－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－５－アミン；
７－（フラン－２－イル）－３－（４－ニトロベンジル）－３Ｈ－［１，２，３，］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－５－アミン；
３－（４－ニトロベンジル）－７－（フェニル）－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－５－アミン；
３－（４－ニトロベンジル）－７－（チオフェン－２－イル）－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－５－アミン；
７－（２－メトキシフェニル）－３－（４－ニトロベンジル）－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－５－アミン；
７－（フラン－２－イル）－３－（３－ニトロベンジル）－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－５－アミン；
３－（３－ニトロベンジル）－７－（チオフェン－２－イル）－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－５－アミン；
７－（２－メトキシフェニル）－３－（３－ニトロベンジル）－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－５－アミン；
３－（３－ニトロベンジル）－７－フェニル－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－５－アミン；
７－（２－メトキシフェニル）－３－（３－メチル－４－ニトロベンジル）－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－５－アミン；
３－（３－メチル－４－ニトロベンジル）－７－（チオフェン－２－イル）－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－５－アミン；
３－（４－メチル－３－ニトロベンジル）－７－（チオフェン－２－イル）－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－５－アミン；
７－（フラン－２－イル）－３－（４－メチル－３－ニトロベンジル）－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－５－アミン；
３－（４－メチル－３－ニトロベンジル）－７－フェニル－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－５－アミン；
７－（２－メトキシフェニル）－３－（４－メチル－３－ニトロベンジル）－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－５－アミン；

３－（３－メトキシ－４－ニトロベンジル）－７－（２－メトキシフェニル）－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－５－アミン；
３－（３－メトキシ－４－ニトロベンジル）－７－フェニル－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－５－アミン；
３－（３－メトキシ－４－ニトロベンジル）－７－（チオフェン－２－イル）－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－５－アミン；
７－（フラン－２－イル）－３－（３－メトキシ－４－ニトロベンジル）－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－５－アミン；
３－（２－メトキシ－４－ニトロベンジル）－７－（チオフェン－２－イル）－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－５－アミン；
７－（フラン－２－イル）－３－（２－メトキシ－４－ニトロベンジル）－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－５－アミン；
３－（２－メトキシ－４－ニトロベンジル）－７－フェニル－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－５－アミン；
３－（２－メトキシ－４－ニトロベンジル）－７－（２－メトキシフェニル）－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－（４－ニトロベンジル）－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－（３－ニトロベンジル）－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－５－アミン；
３－（４－メチル－３－ニトロベンジル）－７－（５－メチルフラン－２－イル）－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－５－アミン；
３－（３－メチル－４－ニトロベンジル）－７－（５－メチルフラン－２－イル）－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－５－アミン；
３－（３－メトキシ－４－ニトロベンジル）－７－（５－メチルフラン－２－イル）－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－５－アミン；および
３－（２－メトキシ－４－ニトロベンジル）－７－（５－メチルフラン－２－イル）－３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－５－アミンからなる群より選択される、請求項３４または３５に記載の方法。