

【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16年12月24日(2004.12.24)

【公表番号】特表2003-528811(P2003-528811A)

【公表日】平成15年9月30日(2003.9.30)

【出願番号】特願2001-522222(P2001-522222)

【国際特許分類第7版】

C 0 7 D 471/04

A 6 1 K 31/437

A 6 1 K 31/4418

A 6 1 K 31/444

A 6 1 K 31/496

A 6 1 K 31/506

A 6 1 K 31/5377

A 6 1 K 31/551

A 6 1 K 31/635

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 11/06

A 6 1 P 11/16

A 6 1 P 25/04

A 6 1 P 25/08

A 6 1 P 25/16

A 6 1 P 25/18

A 6 1 P 25/20

A 6 1 P 25/24

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 25/30

A 6 1 P 37/08

A 6 1 P 43/00

C 0 7 D 213/73

C 0 7 D 409/04

C 0 7 D 519/00

【F I】

C 0 7 D 471/04 1 0 1

A 6 1 K 31/437

A 6 1 K 31/4418

A 6 1 K 31/444

A 6 1 K 31/496

A 6 1 K 31/506

A 6 1 K 31/5377

A 6 1 K 31/551

A 6 1 K 31/635

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 11/06

A 6 1 P 11/16

A 6 1 P 25/04

A 6 1 P 25/08

A 6 1 P 25/16

A 6 1 P 25/18

A 6 1 P 25/20  
A 6 1 P 25/24  
A 6 1 P 25/28  
A 6 1 P 25/30  
A 6 1 P 37/08  
A 6 1 P 43/00 1 1 1  
C 0 7 D 213/73  
C 0 7 D 409/04  
C 0 7 D 519/00 3 1 1

## 【手続補正書】

【提出日】平成14年3月6日(2002.3.6)

## 【手続補正1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】特許請求の範囲

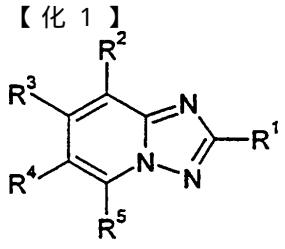
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

## 【請求項1】

一般式I:



(式中、

R<sup>1</sup>は、N、O又はSから選択される1～3個のヘテロ原子を含有する5若しくは6員ヘテロアリール基であって、場合により、低級アルキル、-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>OH、ハロゲン又は低級アルコキシである置換基の1又は2個により置換されており、前記ヘテロアリール基は、場合により、アルキレン基又はアルケニル基を介してピラゾール環に結合してもよいか、あるいは

場合により、低級アルキル、ヒドロキシ-低級アルキル、ハロゲン、ヒドロキシ又は低級アルコキシである置換基の1又は2個によって置換されているフェニルであるか、あるいは、

-O(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-フェニル、ベンゾフリル、インドリル又はベンゾチオフェニルであるか、あるいは

-S-低級アルキルであり、

R<sup>2</sup>及びR<sup>4</sup>は、互いに独立して、水素、シアノ又は-S(O)<sub>2</sub>-フェニルであり、

R<sup>3</sup>は、水素、ハロゲンであるか、あるいは

N、O又はSから選択される1～3個のヘテロ原子を含有する5若しくは6員ヘテロアリール基であって、場合により、低級アルキル、-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-アリール、ヒドロキシ、ハロゲン、低級アルコキシ、モルホリニル、アミノ、低級アルキルアミノ又は-C(O)NR<sub>2</sub>(ここで、R<sub>2</sub>は、低級アルキル又は水素である)である置換基の1又は2個により置換されているか、あるいは

場合により、ハロゲン、低級アルキル、低級アルコキシ、アミノ、ジ-低級アルキルアミノ、-CF<sub>3</sub>、-OCF<sub>3</sub>、-NHCO(O)低級アルキル、シアノ、-C(O)-低級アルキル、-C(O)O-低級アルキル、-S-低級アルキル、-S(O)<sub>2</sub>NH-フェニル、-S(O)<sub>2</sub>NH-メチルピペラジニルである置換基の1又は2個により置換されて

いるフェニルであるか、あるいは

- N R <sub>2</sub> R (ここで、R 及びR は、互いに独立して、水素、- (C H <sub>2</sub>)<sub>n</sub> フェニル(ここで、フェニル環は、場合により、ハロゲン又は低級アルコキシにより置換されている)、- C H (低級アルキル)- フェニル、インダン- 1 - イル、1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ- ナフタレン又はシクロアルキルである)であるか、あるいは

- O - フェニル(ここで、フェニル環は、場合により、ハロゲン、低級アルキル又は低級アルコキシにより置換されている)、- O - テトラヒドロナフタレン又は- O - C H <sub>2</sub> - 6 - メチルピリジン- 2 - イルであるか、あるいは

- ベンゾ[1 , 3]ジオキソリル、- 1 H - インドール- 5 - イル、ナフチル、ベンゾフラン- 2 - イル、1 , 3 , 4 , 9 - テトラヒドロ- - カルボリン- 2 - イル、ピペリジン- 1 - イル、ピロリジン- 1 - イル、ピベラジン- 4 - イル- メチル又はモルホリニルであり、

R <sup>5</sup> は、N R <sub>2</sub> (ここで、R は、同一又は異なっていてもよく、水素、低級アルキル、フェニル、ベンジル、- C O - 低級アルキル、- C O - 低級アルコキシ、- 低級アルケニル、- C O (C H <sub>2</sub>)<sub>n</sub> - フェニル又は- C O O (C H <sub>2</sub>)<sub>n</sub> - フェニル(ここで、フェニル環は、場合により、- C F <sub>3</sub>、低級アルコキシ、ハロゲン又は低級アルキルにより置換されている)、- C O (C H <sub>2</sub>)<sub>3</sub> - N H C O - 低級アルコキシ、- (C H <sub>2</sub>)<sub>n</sub> - フェニル(ここで、フェニル環は、場合により、低級アルコキシ、- C F <sub>3</sub> 又はハロゲンにより置換されている)であるか、又は4 , 5 - ジヒドロ- 1 H - イミダゾール- 2 - イル- 安息香酸、1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ- ピリミジン- 2 - イル- 安息香酸若しくは4 , 5 , 6 , 7 - テトラヒドロ- 1 H - [1 , 3]ジアゼピン- 2 - イル- 安息香酸であり、

n は、0 ~ 4 である)

で示される化合物、及びそれらの薬学的に許容されうる塩。

### 【請求項 2】

R <sup>1</sup> が、フル- 2 - イル、低級アルケニル- フル- 2 - イル、ベンゾフル- 2 - イル、チオフェン- 2 - イル、チアゾール- 2 - イル、ピロール- 2 - イル、ピリジン- 2 - イル、ピリジン- 4 - イル、テトラヒドロフラン- 2 - イル、1 H - インドール- 3 - イルであるか、又は場合により、低級アルキル、ヒドロキシ- 低級アルキル、ハロゲン、ヒドロキシ若しくは低級アルコキシである置換基の1 又は2 個によって置換されているフェニルであり、

R <sup>2</sup> 及びR <sup>4</sup> が、互いに独立して、水素又はシアノであり、

R <sup>3</sup> が、水素、ハロゲン、場合により、低級アルキル、ハロゲン若しくはオキシ基によって置換されているピリジン- 4 - イル、ピリジン- 3 - イル、ピリジン- 2 - イルであるか、又は場合によりハロゲン若しくは- C F <sub>3</sub> によって置換されているフェニルであり、R <sup>5</sup> が、- N R <sub>2</sub> (ここで、R は、同一又は異なっていてもよく、水素、低級アルキル、フェニル、ベンジル、- C O - 低級アルキル、- C O - 低級アルコキシ、- 低級アルケニル、- C O (C H <sub>2</sub>)<sub>n</sub> - フェニル若しくは- C O O (C H <sub>2</sub>)<sub>n</sub> - フェニル(ここで、フェニル環は、場合により、C F <sub>3</sub>、低級アルコキシ、ハロゲン又は低級アルキルにより置換されている)、- C O (C H <sub>2</sub>)<sub>3</sub> - N H C O - 低級アルコキシ、- (C H <sub>2</sub>)<sub>n</sub> - フェニル(ここで、フェニル環は、場合により、低級アルコキシ、C F <sub>3</sub> 又はハロゲンにより置換されている)である)、又は- (C H <sub>2</sub>)<sub>n</sub> - イソインドール- 1 , 3 - ジオンであり、

R が、水素、低級アルキル、フェニル又はベンジルであり、そして  
n が、0 ~ 4 である、

式I の化合物、及びそれらの薬学的に許容されうる塩。

### 【請求項 3】

R <sup>5</sup> が、非置換アミノ基である、請求項 1 記載の化合物。

### 【請求項 4】

R <sup>1</sup> が、フリルである、請求項 3 記載の化合物。

## 【請求項 5】

2 - フラン - 2 - イル - 7 ピリジン - 4 - イル - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリジン - 5 - イルアミン、  
2 - フラン - 2 - イル - 7 ピリジン - 3 - イル - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリジン - 5 - イルアミン、  
2 - フラン - 2 - イル - 7 ピリジン - 2 - イル - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリジン - 5 - イルアミン、  
7 - ( 3 , 5 - ビス - トリフルオロメチル - フェニル ) - 2 - フラン - 2 - イル - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリジン - 5 - イルアミン、  
7 - ( 3 , 5 - ジクロロ - フェニル ) - 2 - フラン - 2 - イル - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリジン - 5 - イルアミン、  
7 - ( 4 - クロロ - フェニル ) - 2 - フラン - 2 - イル - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリジン - 5 - イルアミン、  
2 - フラン - 2 - イル - 7 ( 2 - メチル - ピリジン - 4 - イル - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリジン - 5 - イルアミン、  
7 - ( 2 - エチル - ピリジン - 4 - イル ) - 2 - フラン - 2 - イル - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリジン - 5 - イルアミン、  
2 - フラン - 2 - イル - 7 ( 2 - プロピル - ピリジン - 4 - イル - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリジン - 5 - イルアミン、  
2 - フラン - 2 - イル - 7 ( 2 - イソプロピル - ピリジン - 4 - イル - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリジン - 5 - イルアミン、  
7 - ( 4 - フルオロ - フェニル ) - 2 - フラン - 2 - イル - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリジン - 5 - イルアミン、  
2 - フラン - 2 - イル - 7 ( 1 - オキシ - ピリジン - 4 - イル - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリジン - 5 - イルアミン、  
5 - アミノ - 2 - フラン - 2 - イル - 7 ピリジン - 4 - イル - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリジン - 6 - カルボニトリル、  
7 - ( 3 - アミノ - フェニル ) - 2 - フラン - 2 - イル - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリジン - 5 - イルアミン、  
7 - ( 3 , 4 - ジメトキシ - フェニル ) - 2 - フラン - 2 - イル - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリジン - 5 - イルアミン、  
7 - ( 3 , 4 - ジクロロ - フェニル ) - 2 - フラン - 2 - イル - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリジン - 5 - イルアミン、  
7 - ( 3 - フルオロ - フェニル ) - 2 - フラン - 2 - イル - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリジン - 5 - イルアミン、  
1 - [ 3 - ( 5 - アミノ - 2 - フラン - 2 - イル - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリジン - 7 - イル ) - フェニル ] - エタノン、  
7 - ( 2 - フルオロ - フェニル ) - 2 - フラン - 2 - イル - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリジン - 5 - イルアミン、  
2 - フラン - 2 - イル - 7 - m - トリル - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリジン - 5 - イルアミン、  
2 - フラン - 2 - イル - 7 - ( 4 - メチルスルファニル - フェニル ) - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリジン - 5 - イルアミン、  
2 - フラン - 2 - イル - 7 - チオフェン - 3 - イル - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリジン - 5 - イルアミン、  
2 - フラン - 2 - イル - 7 - ( 3 - トリフルオロメチル - フェニル ) - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリジン - 5 - イルアミン、  
2 - フラン - 2 - イル - 7 - ( 3 - メトキシ - フェニル ) - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリジン - 5 - イルアミン、  
N - [ 3 - ( 5 - アミノ - 2 - フラン - 2 - イル - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 1 , 5 -

a] ピリジン - 7 - イル) - フェニル] アセトアミド、  
 2 - フラン - 2 - イル - 7 - (1H - インドール - 5 - イル) - [1, 2, 4] トリアゾロ[1, 5 - a] ピリジン - 5 - イルアミン、  
 N - [4 - (5 - アミノ - 2 - フラン - 2 - イル - [1, 2, 4] トリアゾロ[1, 5 - a] ピリジン - 7 - イル) - 2 - メチル - フェニル] アセトアミド、  
 2 - フラン - 2 - イル - 7 - ピリジン - 1 - イル - [1, 2, 4] トリアゾロ[1, 5 - a] ピリジン - 5 - イルアミン、  
 2 - フラン - 2 - イル - 7 - ピロリジン - 1 - イル - [1, 2, 4] トリアゾロ[1, 5 - a] ピリジン - 5 - イルアミン、  
 2 - フラン - 2 - イル - 7 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - [1, 2, 4] トリアゾロ[1, 5 - a] ピリジン - 5 - イルアミン、  
 N - 7 - (2 - クロロ - ベンジル) - 2 - フラン - 2 - イル - [1, 2, 4] トリアゾロ[1, 5 - a] ピリジン - 5, 7 - ジアミン、  
 2 - フラン - 2 - イル - N - 7 - (1 - フェニル - エチル) - [1, 2, 4] トリアゾロ[1, 5 - a] ピリジン - 5, 7 - ジアミン、  
 7 - (5 - ブチル - ピリジン - 2 - イル) - 2 - フラン - 2 - イル - [1, 2, 4] トリアゾロ[1, 5 - a] ピリジン - 5 - イルアミン、  
 7 - (2 - フルオロ - ピリジン - 4 - イル) - 2 - フラン - 2 - イル - [1, 2, 4] トリアゾロ[1, 5 - a] ピリジン - 5 - イルアミン、  
 7 - (5 - クロロ - ピリジン - 2 - イル) - 2 - フラン - 2 - イル - [1, 2, 4] トリアゾロ[1, 5 - a] ピリジン - 5 - イルアミン、又は  
 2 - フラン - 2 - イル - 7 - (6 - メトキシ - ピリジン - 3 - イル - [1, 2, 4] トリアゾロ[1, 5 - a] ピリジン - 5 - イルアミンである、請求項4記載の化合物。

## 【請求項6】

R<sup>1</sup>が、メチル置換フリルである、請求項3記載の化合物。

## 【請求項7】

7 - (4 - クロロ - フェニル) - 2 - (5 - メチル - フラン - 2 - イル) - [1, 2, 4] トリアゾロ[1, 5 - a] ピリジン - 5 - イルアミン、  
 7 - (3 - メトキシ - フェニル) - 2 - (5 - メチル - フラン - 2 - イル) - [1, 2, 4] トリアゾロ[1, 5 - a] ピリジン - 5 - イルアミン、  
 7 - (3, 4 - ジメトキシ - フェニル) - 2 - (5 - メチル - フラン - 2 - イル) - [1, 2, 4] トリアゾロ[1, 5 - a] ピリジン - 5 - イルアミン、  
 N - {3 - [5 - アミノ - 2 - (5 - メチル - フラン - 2 - イル) - [1, 2, 4] トリアゾロ[1, 5 - a] ピリジン - 7 - イル] - フェニル} - アセトアミド、又は  
 N - {4 - [5 - アミノ - 2 - (5 - メチル - フラン - 2 - イル) - [1, 2, 4] トリアゾロ[1, 5 - a] ピリジン - 7 - イル] - フェニル} - アセトアミドである、請求項6記載の化合物。

## 【請求項8】

R<sup>1</sup>が、ピリジン - 2 - イルである、請求項3記載の化合物。

## 【請求項9】

7 - (4 - フルオロ - フェニル) - 2 - ピリジン - 2 - イル - [1, 2, 4] トリアゾロ[1, 5 - a] ピリジン - 5 - イルアミン、  
 7 - (3 - メトキシ - フェニル) - 2 - ピリジン - 2 - イル - [1, 2, 4] トリアゾロ[1, 5 - a] ピリジン - 5 - イルアミン、  
 7 - (3 - アミノ - フェニル) - 2 - ピリジン - 2 - イル - [1, 2, 4] トリアゾロ[1, 5 - a] ピリジン - 5 - イルアミン、  
 7 - (2 - エチル - ピリジン - 4 - イル) - 2 - ピリジン - 2 - イル - [1, 2, 4] トリアゾロ[1, 5 - a] ピリジン - 5 - イルアミン、

7 - ( 2 - メチル - ピリジン - 4 - イル ) - 2 - ピリジン - 2 - イル - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリジン - 5 - イルアミン、  
 7 - ( 5 - エチル - ピリジン - 2 - イル ) - 2 - ピリジン - 2 - イル - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリジン - 5 - イルアミン、  
 2 , 7 - ジ - ピリジン - 2 - イル - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリジン - 5 - イルアミン、  
 7 - ( 5 - クロロ - ピリジン - 2 - イル ) - 2 - ピリジン - 2 - イル - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリジン - 5 - イルアミン、又は  
 7 - ( 6 - クロロ - ピリジン - 2 - イル ) - 2 - ピリジン - 2 - イル - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリジン - 5 - イルアミンである、請求項 8 記載の化合物。

## 【請求項 10】

R<sup>1</sup> が、5 , 6 - ジヒドロ - フラン - 2 - イルである、請求項 3 記載の化合物。

## 【請求項 11】

7 - ( 3 , 4 - ジクロロ - フェニル ) - 2 - ( 4 , 5 - ジヒドロ - フラン - 2 - イル ) - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリジン - 5 - イルアミン、  
 2 - ( 4 , 5 - ジヒドロ - フラン - 2 - イル ) - 7 - ( 3 - フルオロ - フェニル ) - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリジン - 5 - イルアミン、  
 2 - ( 4 , 5 - ジヒドロ - フラン - 2 - イル ) - 7 - ( 4 - フルオロ - フェニル ) - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリジン - 5 - イルアミン、  
 2 - ( 4 , 5 - ジヒドロ - フラン - 2 - イル ) - 7 - m - トリル - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリジン - 5 - イルアミン、又は  
 2 - ( 4 , 5 - ジヒドロ - フラン - 2 - イル ) - 7 - ( 3 - トリフルオロメチル - フェニル ) - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリジン - 5 - イルアミンである、請求項 10 記載の化合物。

## 【請求項 12】

R<sup>1</sup> が、ピラゾール - 1 - イルである、請求項 3 記載の化合物。

## 【請求項 13】

2 - ピラゾール - 1 - イル - 7 - ピリジン - 2 - イル - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリジン - 5 - イルアミンである、請求項 12 記載の化合物。

## 【請求項 14】

R<sup>5</sup> が、置換アミノ基である、請求項 1 記載の化合物。

## 【請求項 15】

R<sup>1</sup> が、フェニルである、請求項 14 記載の化合物。

## 【請求項 16】

ブト - 3 - エニル - ( 2 - フェニル - 7 - ピリジン - 4 - イル - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリジン - 5 - イル ) - アミン、  
 エチル - ( 2 - フェニル - 7 - ピリジン - 4 - イル - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリジン - 5 - イル ) - アミン、  
 ( 2 - フェニル - 7 - ピリジン - 4 - イル - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリジン - 5 - イル ) - カルバミン酸エチルエステル、  
 N - ( 2 - フェニル - 7 - ピリジン - 4 - イル - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリジン - 5 - イル ) - トリフルオロメチル - ベンズアミド、  
 2 - ( 2 - クロロ - フェニル ) - N - ( 2 - フェニル - 7 - ピリジン - 4 - イル - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリジン - 5 - イル ) - アセトアミド、  
 2 - ( 2 , 4 - ジクロロ - フェニル ) - N - ( 2 - フェニル - 7 - ピリジン - 4 - イル - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリジン - 5 - イル ) - アセトアミド、  
 N - ( 2 - フェニル - 7 - ピリジン - 4 - イル - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリジン - 5 - イル ) - 2 - ( 2 - トリフルオロメチル - フェニル ) - アセトアミド、  
 N - ( 2 - フェニル - 7 - ピリジン - 4 - イル - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリジン - 5 - イル ) - 2 - ( 4 - トリフルオロメチル - フェニル ) - アセトアミド、

3 - フェニル - N - ( 2 - フェニル - 7 - ピリジン - 4 - イル - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリジン - 5 - イル ) - プロピオニアミド、  
 N - ( 2 - フェニル - 7 - ピリジン - 4 - イル - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリジン - 5 - イル ) - 2 - o - トリル - アセトアミド、  
 2 - ( 2 - ブロモ - フェニル ) - N - ( 2 - フェニル - 7 - ピリジン - 4 - イル - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリジン - 5 - イル ) - アセトアミド、  
 2 - ( 2 - ヨード - フェニル ) - N - ( 2 - フェニル - 7 - ピリジン - 4 - イル - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリジン - 5 - イル ) - アセトアミド、  
 3 - ( 2 - フェニル - 7 - ピリジン - 4 - イル - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリジン - 5 - イルカルバモイル ) - プロピル - カルバミン酸 t e r t - プチルエステル、  
 2 - ( 2 - クロロ - フェニル ) - エチル ] - ( 2 - フェニル - 7 - ピリジン - 4 - イル - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリジン - 5 - イル ) - アミン、  
 2 - ( 2 , 4 - ジクロロ - フェニル ) - エチル ] - ( 2 - フェニル - 7 - ピリジン - 4 - イル - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリジン - 5 - イル ) - アミン、  
 ( 2 - フェニル - 7 - ピリジン - 4 - イル - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリジン - 5 - イル ) - ( 4 - トリフルオロメチル - ベンジル ) - アミン、  
 ( 3 - フェニル - プロピル ) - ( 2 - フェニル - 7 - ピリジン - 4 - イル - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリジン - 5 - イル ) - アミン、又は  
 ジエチル - ( 2 - フェニル - 7 - ピリジン - 4 - イル - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリジン - 5 - イル ) - アミンである、請求項 15 記載の化合物。

## 【請求項 17】

請求項 1 ~ 16 のいずれか 1 項記載の化合物の 1 種以上と薬学的に許容されうる賦形剤とを含有する医薬。

## 【請求項 18】

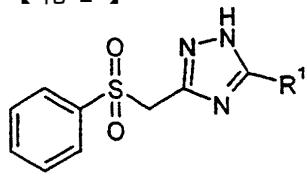
アデノシンレセプターに関連する疾患の処置のための、請求項 17 記載の医薬。

## 【請求項 19】

請求項 1 記載の式 I で示される化合物の製造方法であって、

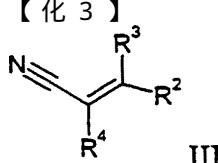
a) 式 II :

## 【化 2】



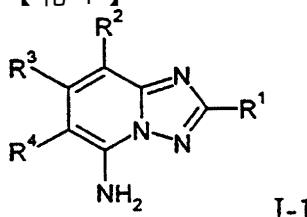
で示される化合物を、式 III :

## 【化 3】



で示される化合物と反応させ、式 I - 1 :

## 【化 4】

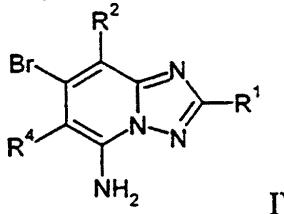


(式中、R<sup>1</sup> ~ R<sup>4</sup> は、請求項 1 で示された意味を有する) の化合物を得ること、又は

b) 式 I - 1 のアミノ基の 1 又は 2 個の水素原子を、R(ここで、R は、低級アルキル、フェニル、ベンジル、-CO-低級アルキル、-COO-低級アルコキシ、-低級アルケニル、-CO(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-フェニル又は-COO(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-フェニル(ここで、フェニル環は、場合により、CF<sub>3</sub>、低級アルコキシ、ハロゲン又は低級アルキルにより置換されている)、-CO(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>-NHC(O)-低級アルコキシ、-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-フェニル(ここで、フェニル環は、場合により、低級アルコキシ、CF<sub>3</sub>又はハロゲンにより置換されている)である)によって置換すること、又は

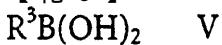
c) 式 I V :

【化 5】



で示される化合物を、式 V :

【化 6】



で示される化合物と反応させ、式 I - 1 で示される化合物を得ること(ここで、R<sup>1</sup> ~ R<sup>4</sup> は、請求項 1 で示された意味を有する)、又は

d) 置換基 R<sup>1</sup> ~ R<sup>5</sup> の 1 個以上を上記に示された定義の範囲内で修飾すること、及び、所望であれば、得られた化合物を薬学的に許容されうる酸付加塩に変換すること、を含む方法。

【請求項 20】

アデノシンレセプターに関連する疾患の処置用の医薬を製造するための、請求項 1 ~ 16 のいずれか 1 項記載の化合物の使用。

【請求項 21】

アデノシン A<sub>2A</sub> レセプターに関連する疾患の処置用の医薬を製造するための、請求項 1 ~ 16 のいずれか 1 項記載の化合物の使用。