

【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

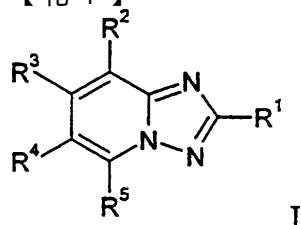
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

一般式I：

【化1】



(式中、

$R^1$  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、 $-(CH_2)_nOH$ 、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いてもよいが、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、

$-O(CH_2)_n$ -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、

$R^2$  及び  $R^4$  は、互いに独立して、水素、シアノ又は $-S(O)_2$ -フェニルであり、 $R^3$  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、 $-(CH_2)_n$ -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 $-C(O)NR_2$  (ここで、R 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、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-NHC(O)$ 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、 $-S(O)_2NH$ -フェニル、 $-S(O)_2NH$ -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

- NR<sub>2</sub> R<sub>1</sub> (ここで、R<sub>1</sub> 及び R<sub>2</sub> は、互いに独立して、水素、- (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、ハロゲン又は低級アルコキシにより置換されている)、- CH<sub>3</sub> (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ニル又は - O - CH<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、ピペラジン - 4 - イル - メチル又はモルホリニルであり、

R<sup>5</sup> は、NR<sub>2</sub> (ここで、R は、同一又は異なっているとしてもよく、水素、低級アルキル、フェニル、ベンジル、- CO - 低級アルキル、- CO - 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> - NHCO - 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) 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 - CF<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、- NR<sub>2</sub> (ここで、R は、同一又は異なっているとしてもよく、水素、低級アルキル、フェニル、ベンジル、- CO - 低級アルキル、- CO - 低級アルコキシ、- 低級アルケニル、- CO (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> - フェニル若しくは - 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> - NHCO - 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)、又は - (CH<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 - (2 - メトキシ - ベンジル) - [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 ) - プロピオンアミド、  
 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 *tert* - ブチルエステル、  
 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】

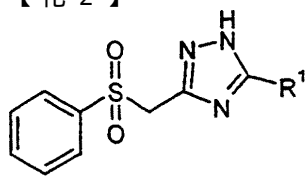
アデノシンレセプターに関連する疾患の処置のための、請求項 17 記載の医薬。

【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、

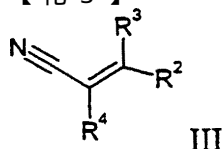
a) 式 I I :

【化 2】



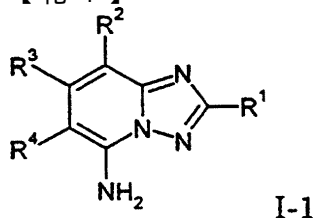
で示される化合物を、式 I I I :

【化 3】



で示される化合物と反応させ、式 I - 1 :

【化 4】

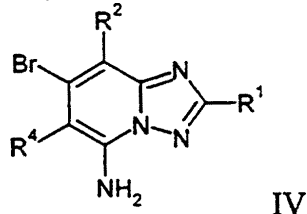


( 式中、 $R^1 \sim R^4$  は、請求項 1 で示された意味を有する ) の化合物を得ること、又は

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、-CO-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>-NHCO-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

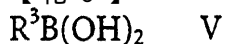
c) 式 I V :

【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。