

【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24年11月8日(2012.11.8)

【公表番号】特表2012-502979(P2012-502979A)

【公表日】平成24年2月2日(2012.2.2)

【年通号数】公開・登録公報2012-005

【出願番号】特願2011-527464(P2011-527464)

【国際特許分類】

C 07 D 471/04	(2006.01)
A 61 P 9/00	(2006.01)
A 61 P 11/00	(2006.01)
A 61 P 3/00	(2006.01)
A 61 P 17/00	(2006.01)
A 61 P 19/00	(2006.01)
A 61 P 25/00	(2006.01)
A 61 P 13/12	(2006.01)
A 61 P 15/00	(2006.01)
A 61 P 25/02	(2006.01)
A 61 P 27/16	(2006.01)
A 61 P 29/00	(2006.01)
A 61 P 1/16	(2006.01)
A 61 P 35/00	(2006.01)
A 61 P 37/00	(2006.01)
A 61 P 43/00	(2006.01)
A 61 P 1/04	(2006.01)
A 61 P 17/02	(2006.01)
A 61 K 31/5377	(2006.01)
A 61 K 31/437	(2006.01)
A 61 K 31/4439	(2006.01)
A 61 K 31/444	(2006.01)
A 61 K 31/443	(2006.01)
A 61 K 31/4433	(2006.01)
A 61 K 31/497	(2006.01)
A 61 K 31/496	(2006.01)

【F I】

C 07 D 471/04	1 0 6 H
C 07 D 471/04	C S P
A 61 P 9/00	
A 61 P 11/00	
A 61 P 3/00	
A 61 P 17/00	
A 61 P 19/00	
A 61 P 25/00	
A 61 P 13/12	
A 61 P 15/00	
A 61 P 25/02	
A 61 P 27/16	
A 61 P 29/00	
A 61 P 1/16	

A 6 1 P 35/00
A 6 1 P 37/00
A 6 1 P 43/00
A 6 1 P 1/04
A 6 1 P 17/02
A 6 1 K 31/5377
A 6 1 K 31/437
A 6 1 K 31/4439
A 6 1 K 31/444
A 6 1 K 31/443
A 6 1 K 31/4433
A 6 1 K 31/497
A 6 1 K 31/496

【手続補正書】

【提出日】平成24年9月21日(2012.9.21)

【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

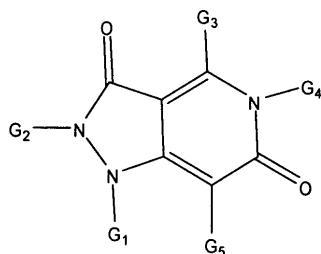
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I) :

【化44】



(I)

(式中、G₁は、H；場合により置換されているアシル；場合により置換されているアシルC₁～C₆アルキル；場合により置換されているアルキル；場合により置換されているC₃～C₈シクロアルキルアルキル；場合により置換されているヘテロシクロアルキルアルキル；場合により置換されているアリールアルキル及び場合により置換されているヘテロアリールアルキルから選択され；G₂は、H；場合により置換されているC₁～C₆アルキル；場合により置換されているC₂～C₆アルケニル；場合により置換されているC₂～C₆アルキニル；場合により置換されているアリール；場合により置換されているC₁～C₆アルキルアリール；場合により置換されているアリールC₁～C₆アルキル；場合により置換されているヘテロアリール；場合により置換されているアルキルヘテロアリール；場合により置換されているヘテロアリールC₁～C₆アルキル；場合により置換されているC₂～C₆アルケニルアリール；場合により置換されているアリールC₂～C₆アルケニル；場合により置換されているC₂～C₆アルケニルヘテロアリール；場合により置換されているヘテロアリールC₂～C₆アルケニル；場合により置換されているC₃～C₈シクロアルキル；場合により置換されているヘテロシクロアルキル；場合により

合により置換されているアリール；場合により置換されているC₁～C₆アルキルアリール；場合により置換されているアリールC₁～C₆アルキル；場合により置換されているヘテロアリール；場合により置換されているアルキルヘテロアリール；場合により置換されているヘテロアリールC₁～C₆アルキル；場合により置換されているC₂～C₆アルケニルアリール；場合により置換されているアリールC₂～C₆アルケニル；場合により置換されているC₂～C₆アルケニルヘテロアリール；場合により置換されているヘテロアリールC₂～C₆アルケニル；場合により置換されているC₃～C₈シクロアルキル；場合により置換されているヘテロシクロアルキル；場合により置換されているアルキルC₃～C₈シクロアルキル；場合により置換されているC₃～C₈シクロアルキルC₁～C₆アルキル；場合により置換されているC₁～C₆アルキルヘテロシクロアルキル及び場合により置換されているヘテロシクロアルキルC₁～C₆アルキルから独立して選択されるか、或いは-C H R⁶ R⁷は、場合により置換されているヘテロアリール、場合により置換されているシクロアルキル及び場合により置換されているヘテロシクロアルキルから選択される場合により置換されている環を形成し；nは、0～5から選択される整数であり；pは、3～5から選択される整数であり；G₄は、H；場合により置換されているアシル；場合により置換されているアシルアミノ；場合により置換されているアシルC₁～C₆アルキル；場合により置換されているC₁～C₆アルキル；場合により置換されているC₂～C₆アルケニル；場合により置換されているアリール；場合により置換されているC₁～C₆アルキルアリール；場合により置換されているアリールC₁～C₆アルキル；場合により置換されているヘテロアリール；場合により置換されているC₁～C₆アルキルヘテロアリール；場合により置換されているヘテロアリールC₁～C₆アルキル；場合により置換されているC₂～C₆アルケニルアリール；場合により置換されているアリールC₂～C₆アルケニル；場合により置換されているC₂～C₆アルケニルヘテロアリール；場合により置換されているヘテロアリールC₂～C₆アルケニル；場合により置換されているC₃～C₈シクロアルキル；場合により置換されているヘテロシクロアルキル；場合により置換されているC₁～C₆アルキルC₃～C₈シクロアルキル；場合により置換されているC₃～C₈シクロアルキルC₁～C₆アルキル；場合により置換されているC₁～C₆アルキルヘテロシクロアルキル及び場合により置換されているヘテロシクロアルキルC₁～C₆アルキルから選択され；G₅は、H；場合により置換されているC₁～C₆アルキル；場合により置換されているC₂～C₆アルケニル；場合により置換されているC₂～C₆アルキニル；場合により置換されているアリール；場合により置換されているC₁～C₆アルキルアリール；場合により置換されているアリールC₁～C₆アルキル；場合により置換されているヘテロアリール；場合により置換されているC₁～C₆アルキルヘテロアリール；場合により置換されているヘテロアリールC₁～C₆アルキル；場合により置換されているC₂～C₆アルケニルアリール；場合により置換されているアリールC₂～C₆アルケニル；場合により置換されているC₂～C₆アルケニルヘテロアリール；場合により置換されているヘテロアリールC₂～C₆アルケニル；場合により置換されているC₃～C₈シクロアルキル；場合により置換されているヘテロシクロアルキル；場合により置換されているC₁～C₆アルキルC₃～C₈シクロアルキル；場合により置換されているC₃～C₈シクロアルキルC₁～C₆アルキル；場合により置換されているC₁～C₆アルキルヘテロシクロアルキル及び場合により置換されているヘテロシクロアルキルC₁～C₆アルキルから選択される]で示されるピラゾロピリジン誘導体、並びにその薬学的に許容される塩及び薬学的に活性な誘導体。

【請求項2】

G₁がHである、請求項1記載の誘導体。

【請求項3】

G₃が-(C H₂)_n-R¹であり、R¹及びnが請求項1又は2に定義された通りである、請求項1又は2記載の誘導体。

【請求項4】

G_3 が - (CH₂)_n - R¹ であり、R¹ が - NR²R³ であり、R²、R³ 及び n が 請求項 1 又は 2 に定義された通りである、請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 項に記載の誘導体。

【請求項 5】

G_3 が - (CH₂)_n - R¹ であり、R¹ が - NR²R³ であり、R³ がアリール C₁ ~ C₆ アルキルであり、R² 及び n が 請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 項に定義された通りである、請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の誘導体。

【請求項 6】

G_3 が - (CH₂)_n - R¹ であり、R¹ がヘテロシクロアルキルであり、n が 請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に定義された通りである、請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 項に記載の誘導体。

【請求項 7】

G_3 が - (CH₂)_n - R¹ であり、R¹ がヘテロアリールであり、n が 請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項に定義された通りである、請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 項に記載の誘導体。

【請求項 8】

G_3 が - (CH₂)_n - R¹ であり、R¹ が - NR²R³ であり、R² が C₁ ~ C₆ アルキルであり、R³ 及び n が 請求項 1 ~ 7 のいずれか 1 項に定義された通りである、請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の誘導体。

【請求項 9】

G_3 が - (CH₂)_n - R¹ であり、n が 1 であり、R¹ が 請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に定義された通りである、請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の誘導体。

【請求項 10】

G_3 が - (CH₂)_p - R⁵ であり、R⁵ 及び p が 請求項 1 ~ 9 のいずれか 1 項に定義された通りである、請求項 1 ~ 2 のいずれか 1 項に記載の誘導体。

【請求項 11】

G_5 が H である、請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項に記載の誘導体。

【請求項 12】

以下の群：

5 - ベンジル - 2 - (2 - クロロフェニル) - 4 - (モルホリン - 4 - イルメチル) - 1 H - ピラゾロ [4, 3 - c] ピリジン - 3, 6 (2 H, 5 H) - ジオン；
 4 - プチル - 2 - メチル - 5 - (ピリジン - 2 - イルメチル) - 1 H - ピラゾロ [4, 3 - c] ピリジン - 3, 6 (2 H, 5 H) - ジオン；
 2 - [4 - (ベンジルオキシ) フェニル] - 4 - プチル - 5 - (4 - クロロベンジル) - 1 H - ピラゾロ [4, 3 - c] ピリジン - 3, 6 (2 H, 5 H) - ジオン；
 2 - [4 - (ベンジルオキシ) フェニル] - 4 - プチル - 5 - メチル - 1 H - ピラゾロ [4, 3 - c] ピリジン - 3, 6 (2 H, 5 H) - ジオン；
 2 - [4 - (ベンジルオキシ) フェニル] - 4 - プチル - 5 - (ピリジン - 2 - イルメチル) - 1 H - ピラゾロ [4, 3 - c] ピリジン - 3, 6 (2 H, 5 H) - ジオン；
 4 - プチル - 2 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - 5 - (フラン - 2 - イルメチル) - 1 H - ピラゾロ [4, 3 - c] ピリジン - 3, 6 (2 H, 5 H) - ジオン；
 4 - プチル - 2 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - 5 - (ピリジン - 2 - イルメチル) - 1 H - ピラゾロ [4, 3 - c] ピリジン - 3, 6 (2 H, 5 H) - ジオン；
 4 - プチル - 2 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - 5 - (2 - メトキシエチル) - 1 H - ピラゾロ [4, 3 - c] ピリジン - 3, 6 (2 H, 5 H) - ジオン；
 4 - プチル - 2 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - 5 - (2 - ピリジン - 2 - イルエチル) - 1 H - ピラゾロ [4, 3 - c] ピリジン - 3, 6 (2 H, 5 H) - ジオン；
 4 - プチル - 2 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - 5 - (3, 5 - ジメトキシベンジル) - 1 H - ピラゾロ [4, 3 - c] ピリジン - 3, 6 (2 H, 5 H) - ジオン；
 4 - { [ベンジル (メチル) アミノ] メチル } - 2 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - 5 - (3 - メトキシプロピル) - 1 H - ピラゾロ [4, 3 - c] ピリジン - 3,

6 (2 H , 5 H) - ジオン ;
2 - [4 - (ベンジルオキシ) フェニル] - 4 - ブチル - 5 - (2 - メトキシエチル) - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;
4 - ブチル - 2 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - 5 - [2 - (モルホリン - 4 - イルメチル) ベンジル] - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;
2 - (3 - クロロフェニル) - 4 - (メトキシメチル) - 5 - (ピリジン - 2 - イルメチル) - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;
2 - (3 - クロロフェニル) - 4 - (メトキシメチル) - 5 - [2 - (モルホリン - 4 - イルメチル) ベンジル] - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;
2 - ベンジル - 5 - (3 - エトキシプロピル) - 4 - { [(3 - フルオロベンジル) (メチル) アミノ] メチル } - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;
2 - (3 - クロロフェニル) - 5 - メチル - 4 - (ピロリジン - 1 - イルメチル) - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;
5 - (4 - クロロベンジル) - 2 - (3 - クロロフェニル) - 4 - { [(3 - フルオロベンジル) (メチル) アミノ] メチル } - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;
2 - (3 - クロロフェニル) - 4 - (メトキシメチル) - 5 - (2 - ピリジン - 2 - イルエチル) - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;
5 - (4 - クロロベンジル) - 4 - (メトキシメチル) - 2 - メチル - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;
2 - メチル - 4 - (3 - フエノキシプロピル) - 5 - (ピリジン - 2 - イルメチル) - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;
2 - ベンジル - 5 - (2 - メトキシエチル) - 4 - (ピロリジン - 1 - イルメチル) - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;
2 - ベンジル - 4 - { [(3 - フルオロベンジル) (メチル) アミノ] メチル } - 5 - (2 - メトキシエチル) - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;
2 - (3 - クロロフェニル) - 4 - { [(3 - フルオロベンジル) (メチル) アミノ] メチル } - 5 - (2 - ピリジン - 2 - イルエチル) - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;
2 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - 5 - (3 , 5 - ジメトキシベンジル) - 4 - (メトキシメチル) - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;
2 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - 5 - (2 - ピリジン - 2 - イルエチル) - 4 - (ピロリジン - 1 - イルメチル) - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;
2 - (3 - クロロフェニル) - 5 - (2 - ピリジン - 2 - イルエチル) - 4 - (ピロリジン - 1 - イルメチル) - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;
2 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - 5 - (フラン - 2 - イルメチル) - 4 - (メトキシメチル) - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;
2 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - 4 - (メトキシメチル) - 5 - (ピリジン - 2 - イルメチル) - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;
2 - ベンジル - 5 - (3 , 5 - ジメトキシベンジル) - 4 - (ピロリジン - 1 - イルメチル) - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;

2 - (3 - クロロフェニル) - 4 - { [(3 - フルオロベンジル) (メチル) アミノ] メチル } - 5 - (2 - メトキシエチル) - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;

2 - [4 - (ベンジルオキシ) フェニル] - 5 - (ピリジン - 3 - イルメチル) - 4 - (ピロリジン - 1 - イルメチル) - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;

4 - (メトキシメチル) - 2 - メチル - 5 - (2 - ピリジン - 2 - イルエチル) - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;

2 - (3 - クロロフェニル) - 5 - (2 - メトキシエチル) - 4 - (ピロリジン - 1 - イルメチル) - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;

2 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - 5 - (2 - メトキシエチル) - 4 - (ピロリジン - 1 - イルメチル) - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;

2 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - 5 - (3 - エトキシプロピル) - 4 - (ピロリジン - 1 - イルメチル) - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;

2 - (3 - クロロフェニル) - 5 - (3 - エトキシプロピル) - 4 - { [(3 - フルオロベンジル) (メチル) アミノ] メチル } - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;

2 - ベンジル - 5 - (3 - エトキシプロピル) - 4 - (ピロリジン - 1 - イルメチル) - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;

2 - [4 - (ベンジルオキシ) フェニル] - 5 - (4 - クロロベンジル) - 4 - (ピロリジン - 1 - イルメチル) - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;

2 - [4 - (ベンジルオキシ) フェニル] - 4 - { [(3 - フルオロベンジル) (メチル) アミノ] メチル } - 5 - (ピリジン - 3 - イルメチル) - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;

2 - [4 - (ベンジルオキシ) フェニル] - 5 - (4 - クロロベンジル) - 4 - { [(3 - フルオロベンジル) (メチル) アミノ] メチル } - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;

2 - [4 - (ベンジルオキシ) フェニル] - 5 - メチル - 4 - (ピロリジン - 1 - イルメチル) - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;

5 - (4 - クロロベンジル) - 2 - メチル - 4 - (ピロリジン - 1 - イルメチル) - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;

N - [3 - { 2 - [4 - (ベンジルオキシ) フェニル] - 3 , 6 - ジオキソ - 4 - (ピロリジン - 1 - イルメチル) - 1 , 2 , 3 , 6 - テトラヒドロ - 5 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 5 - イル } メチル] フェニル] アセトアミド ;

N - { 3 - [(2 - [4 - (ベンジルオキシ) フェニル] - 4 - { [(3 - フルオロベンジル) (メチル) アミノ] メチル } - 3 , 6 - ジオキソ - 1 , 2 , 3 , 6 - テトラヒドロ - 5 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 5 - イル } メチル] フェニル } アセトアミド ;

2 - (3 - クロロフェニル) - 5 - (3 - エトキシプロピル) - 4 - (ピロリジン - 1 - イルメチル) - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;

2 - メチル - 4 - (フェノキシメチル) - 5 - (ピリジン - 2 - イルメチル) - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;

4 - [(4 - フルオロフェノキシ) メチル] - 2 - メチル - 5 - (ピリジン - 2 - イルメチル) - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;

2 - (2 - クロロフェニル) - 4 - { (4 - フルオロフェノキシ) メチル } - 5 - (2

- メトキシエチル) - 1H - ピラゾロ[4,3-c]ピリジン-3,6(2H,5H)-ジオン;
 2-(2-クロロフェニル)-4-[(4-フルオロフェノキシ)メチル]-5-メチル-1H-ピラゾロ[4,3-c]ピリジン-3,6(2H,5H)-ジオン;
 2-(2,5-ジクロロフェニル)-4-[(4-フルオロフェノキシ)メチル]-5-メチル-1H-ピラゾロ[4,3-c]ピリジン-3,6(2H,5H)-ジオン;
 2-(2,5-ジクロロフェニル)-4-[(4-フルオロフェノキシ)メチル]-5-(2-メトキシエチル)-1H-ピラゾロ[4,3-c]ピリジン-3,6(2H,5H)-ジオン;
 5-(4-クロロベンジル)-4-[(4-フルオロフェノキシ)メチル]-2-メチル-1H-ピラゾロ[4,3-c]ピリジン-3,6(2H,5H)-ジオン;
 4-[(ベンジルオキシ)メチル]-2-メチル-5-(ピリジン-2-イルメチル)-1H-ピラゾロ[4,3-c]ピリジン-3,6(2H,5H)-ジオン;
 5-(2-メトキシベンジル)-2-メチル-4-(3-フェノキシプロピル)-1H-ピラゾロ[4,3-c]ピリジン-3,6(2H,5H)-ジオン;
 4-[(4-フルオロフェノキシ)メチル]-2-メチル-5-[(6-モルホリン-4-イルピリジン-2-イル)メチル]-1H-ピラゾロ[4,3-c]ピリジン-3,6(2H,5H)-ジオン;
 4-[(4-フルオロフェノキシ)メチル]-2-メチル-5-[2-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)エチル]-1H-ピラゾロ[4,3-c]ピリジン-3,6(2H,5H)-ジオン;
 4-[(4-フルオロフェノキシ)メチル]-2-メチル-5-(2-ピリジン-2-イルエチル)-1H-ピラゾロ[4,3-c]ピリジン-3,6(2H,5H)-ジオン;
 5-(3-メトキシベンジル)-2-メチル-4-(3-フェノキシプロピル)-1H-ピラゾロ[4,3-c]ピリジン-3,6(2H,5H)-ジオン;
 2-メチル-4-(3-フェノキシプロピル)-5-(2-ピリジン-2-イルエチル)-1H-ピラゾロ[4,3-c]ピリジン-3,6(2H,5H)-ジオン;
 4-[(4-クロロフェノキシ)メチル]-5-(3-メトキシベンジル)-2-メチル-1H-ピラゾロ[4,3-c]ピリジン-3,6(2H,5H)-ジオン;
 4-[(ベンジルオキシ)メチル]-5-(3-エトキシプロピル)-2-メチル-1H-ピラゾロ[4,3-c]ピリジン-3,6(2H,5H)-ジオン;
 4-[(ベンジルオキシ)メチル]-5-(3-メトキシベンジル)-2-メチル-1H-ピラゾロ[4,3-c]ピリジン-3,6(2H,5H)-ジオン;
 4-[(4-クロロフェノキシ)メチル]-5-(3-エトキシプロピル)-2-メチル-1H-ピラゾロ[4,3-c]ピリジン-3,6(2H,5H)-ジオン;
 4-[(4-クロロフェノキシ)メチル]-2-メチル-5-(ピリジン-2-イルメチル)-1H-ピラゾロ[4,3-c]ピリジン-3,6(2H,5H)-ジオン;
 4-[(ベンジルオキシ)メチル]-2-メチル-5-(2-ピリジン-2-イルエチル)-1H-ピラゾロ[4,3-c]ピリジン-3,6(2H,5H)-ジオン;
 N-[3-({4-[(ベンジルオキシ)メチル]-2-メチル-3,6-ジオキソ-1,2,3,6-テトラヒドロ-5H-ピラゾロ[4,3-c]ピリジン-5-イル} メチル)フェニル]アセトアミド;
 N-[3-({4-[(4-クロロフェノキシ)メチル]-2-メチル-3,6-ジオキソ-1,2,3,6-テトラヒドロ-5H-ピラゾロ[4,3-c]ピリジン-5-イル} メチル)フェニル]アセトアミド;
 4-[(4-フルオロフェノキシ)メチル]-2-メチル-5-(ピリジン-3-イルメチル)-1H-ピラゾロ[4,3-c]ピリジン-3,6(2H,5H)-ジオン;
 2-(2-クロロフェニル)-4-[(4-フルオロフェノキシ)メチル]-5-(ピリジン-2-イルメチル)-1H-ピラゾロ[4,3-c]ピリジン-3,6(2H,5H)-ジオン;

H) - ジオン ;

2 - (2 - クロロフェニル) - 4 - [(4 - フルオロフェノキシ) メチル] - 5 - (ピリジン - 3 - イルメチル) - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;

4 - [(ベンジルオキシ) メチル] - 2 - メチル - 5 - (ピリジン - 3 - イルメチル) - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;

2 - (2 - クロロフェニル) - 4 - [(4 - フルオロフェノキシ) メチル] - 5 - [(5 - メチル - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) メチル] - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;

4 - [(ベンジルオキシ) メチル] - 2 - (2 - クロロフェニル) - 5 - メチル - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;

4 - (4 - ベンジルモルホリン - 2 - イル) - 2 - (2 - クロロフェニル) - 5 - メチル - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;

2 - (2 - クロロフェニル) - 5 - (3 - エトキシプロピル) - 4 - [(4 - フルオロフェノキシ) メチル] - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;

2 - (2 - クロロフェニル) - 4 - [(4 - フルオロフェノキシ) メチル] - 5 - (2 - ピリジン - 2 - イルエチル) - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;

4 - [(4 - クロロフェノキシ) メチル] - 2 - (2 - クロロフェニル) - 5 - (ピリジン - 2 - イルメチル) - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;

2 - (2 - クロロフェニル) - 4 - [(4 - フルオロフェノキシ) メチル] - 5 - [(2 - メチル - 1 , 3 - チアゾール - 4 - イル) メチル] - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;

4 - [(ベンジルオキシ) メチル] - 2 - (2 - クロロフェニル) - 5 - (2 - ピリジン - 2 - イルエチル) - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;

4 - [(ベンジルオキシ) メチル] - 2 - (2 - クロロフェニル) - 5 - (3 - エトキシプロピル) - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;

N - [3 - { 2 - (2 - クロロフェニル) - 4 - [(4 - フルオロフェノキシ) メチル] - 3 , 6 - ジオキソ - 1 , 2 , 3 , 6 - テトラヒドロ - 5 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 5 - イル } メチル) フェニル] アセトアミド ;

4 - [(4 - クロロフェノキシ) メチル] - 2 - (2 - クロロフェニル) - 5 - メチル - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;

2 - (2 - クロロフェニル) - 4 - { [メチル (フェニル) アミノ] メチル } - 5 - (2 - ピリジン - 2 - イルエチル) - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;

2 - (2 - クロロフェニル) - 5 - (3 - エトキシプロピル) - 4 - { [メチル (フェニル) アミノ] メチル } - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;

2 - (2 - クロロフェニル) - 4 - { [メチル (フェニル) アミノ] メチル } - 5 - (ピリジン - 4 - イルメチル) - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;

4 - [(4 - クロロフェノキシ) メチル] - 2 - (2 - クロロフェニル) - 5 - (ピリジン - 3 - イルメチル) - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;

4 - [(ベンジルオキシ) メチル] - 2 - (2 - クロロフェニル) - 5 - [(3 - エチル - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 5 - イル) メチル] - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c]

] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;
4 - [(ベンジルオキシ)メチル] - 2 - (2 - クロロフェニル) - 5 - (ピリジン - 4 - イルメチル) - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;
4 - [(ベンジルオキシ)メチル] - 2 - (2 - クロロフェニル) - 5 - (1 , 3 - チアゾール - 2 - イルメチル) - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;
tert - ブチル 4 - ({ 4 - [(ベンジルオキシ)メチル] - 2 - (2 - クロロフェニル) - 3 , 6 - ジオキソ - 1 , 2 , 3 , 6 - テトラヒドロ - 5 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 5 - イル } メチル) ピペリジン - 1 - カルボキシレート ;
4 - [(ベンジルオキシ)メチル] - 2 - (2 - クロロフェニル) - 5 - (ピペリジン - 4 - イルメチル) - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;
4 - [(ベンジルオキシ)メチル] - 2 - (2 - クロロフェニル) - 5 - [3 - (ジエチルアミノ) プロピル] - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;
4 - [(ベンジルオキシ)メチル] - 2 - (2 - クロロフェニル) - 5 - (ピリジン - 2 - イルメチル) - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;
4 - [(ベンジルオキシ)メチル] - 2 - (2 - クロロフェニル) - 5 - (2 - メトキシエチル) - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;
4 - [(4 - クロロフェノキシ) メチル] - 2 - (2 - クロロフェニル) - 5 - (ピリジン - 4 - イルメチル) - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;
4 - [(ベンジルオキシ)メチル] - 2 - (2 - クロロフェニル) - 5 - [(1 - メチルピペリジン - 4 - イル) メチル] - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;
4 - [(3 - クロロフェノキシ) メチル] - 2 - (2 - クロロフェニル) - 5 - メチル - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;
2 - (2 - クロロフェニル) - 5 - メチル - 4 - (3 - フェノキシプロピル) - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;
4 - [(ベンジルオキシ)メチル] - 2 - (2 - クロロフェニル) - 5 - (ピリジン - 3 - イルメチル) - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;
4 - [(ベンジルオキシ)メチル] - 2 - (2 - クロロフェニル) - 5 - [(5 - メチル - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) メチル] - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;
4 - [(ベンジルオキシ)メチル] - 2 - (2 - クロロフェニル) - 5 - [(2 - メチル - 1 , 3 - チアゾール - 4 - イル) メチル] - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;
4 - [(ベンジルオキシ)メチル] - 2 - (2 - クロロフェニル) - 5 - (ピラジン - 2 - イルメチル) - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;
2 - (2 - クロロフェニル) - 4 - { [(3 - フルオロベンジル) (メチル) アミノ] メチル } - 5 - メチル - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;
2 - (2 - クロロフェニル) - 5 - メチル - 4 - [(4 - フェニルピペリジン - 1 - イ

ル)メチル] - 1H - ピラゾロ[4, 3-c]ピリジン-3, 6(2H, 5H) - ジオン;
2 - {4 - [(ベンジルオキシ)メチル] - 2 - (2 - クロロフェニル) - 3, 6 - ジオキソ-1, 2, 3, 6 - テトラヒドロ-5H - ピラゾロ[4, 3-c]ピリジン-5 - イル} - N, N - ジメチルアセトアミド;
2 - (2 - クロロフェニル) - 4 - [(3 - メトキシフェノキシ)メチル] - 5 - メチル - 1H - ピラゾロ[4, 3-c]ピリジン-3, 6(2H, 5H) - ジオン;
2 - (2 - クロロフェニル) - 4 - [(4 - フルオロフェノキシ)メチル] - 5 - (ピリジン-4 - イルメチル) - 1H - ピラゾロ[4, 3-c]ピリジン-3, 6(2H, 5H) - ジオン;
2 - (2 - クロロフェニル) - 4 - {[(3 - メトキシベンジル)オキシ]メチル} - 5 - メチル - 1H - ピラゾロ[4, 3-c]ピリジン-3, 6(2H, 5H) - ジオン;
2 - (2 - クロロフェニル) - 5 - メチル - 4 - {3 - [メチル(フェニル)アミノ]プロピル} - 1H - ピラゾロ[4, 3-c]ピリジン-3, 6(2H, 5H) - ジオン;
2 - (2 - クロロフェニル) - 4 - {[(4 - メトキシベンジル)オキシ]メチル} - 5 - メチル - 1H - ピラゾロ[4, 3-c]ピリジン-3, 6(2H, 5H) - ジオン;
4 - {[(2 - クロロベンジル)オキシ]メチル} - 2 - (2 - クロロフェニル) - 5 - メチル - 1H - ピラゾロ[4, 3-c]ピリジン-3, 6(2H, 5H) - ジオン;
2 - (2 - クロロフェニル) - 4 - {3 - (2, 3 - ジヒドロ-1H - インドール-1 - イル)プロピル} - 5 - メチル - 1H - ピラゾロ[4, 3-c]ピリジン-3, 6(2H, 5H) - ジオン;
4 - [(ベンジルオキシ)メチル] - 2 - (2 - クロロフェニル) - 5 - [(1 - メチル - 1H - ピラゾール-3 - イル)メチル] - 1H - ピラゾロ[4, 3-c]ピリジン-3, 6(2H, 5H) - ジオン;
2 - (2 - クロロフェニル) - 5 - メチル - 4 - [(ナフタレン-1 - イルオキシ)メチル] - 1H - ピラゾロ[4, 3-c]ピリジン-3, 6(2H, 5H) - ジオン;
4 - {[(4 - クロロベンジル)オキシ]メチル} - 2 - (2 - クロロフェニル) - 5 - メチル - 1H - ピラゾロ[4, 3-c]ピリジン-3, 6(2H, 5H) - ジオン;
2 - (2 - クロロフェニル) - 4 - {[2 - (4 - クロロフェニル)エトキシ]メチル} - 5 - メチル - 1H - ピラゾロ[4, 3-c]ピリジン-3, 6(2H, 5H) - ジオン;
4 - {[ベンジル(メチル)アミノ]メチル} - 2 - (2 - クロロフェニル) - 5 - メチル - 1H - ピラゾロ[4, 3-c]ピリジン-3, 6(2H, 5H) - ジオン;
4 - [(ベンジルオキシ)メチル] - 2 - (2 - クロロフェニル) - 5 - [(4 - メチルモルホリン-2 - イル)メチル] - 1H - ピラゾロ[4, 3-c]ピリジン-3, 6(2H, 5H) - ジオン;
4 - [(ベンジルオキシ)メチル] - 2 - (2 - クロロフェニル) - 5 - (ピペリジン-3 - イルメチル) - 1H - ピラゾロ[4, 3-c]ピリジン-3, 6(2H, 5H) - ジオン;
2 - (2 - クロロフェニル) - 4 - {[3 - (ジメチルアミノ)フェノキシ]メチル} - 5 - メチル - 1H - ピラゾロ[4, 3-c]ピリジン-3, 6(2H, 5H) - ジオン;
2 - (2 - クロロフェニル) - 5 - メチル - 4 - {[メチル(ピリジン-2 - イルメチル)アミノ]メチル} - 1H - ピラゾロ[4, 3-c]ピリジン-3, 6(2H, 5H) - ジオン;
4 - {[(2 - クロロベンジル)オキシ]メチル} - 2 - (2 - クロロフェニル) - 5 - (ピリジン-4 - イルメチル) - 1H - ピラゾロ[4, 3-c]ピリジン-3, 6(2H, 5H) - ジオン;
4 - {[(2 - クロロベンジル)オキシ]メチル} - 2 - (2 - クロロフェニル) - 5 - (ピリジン-3 - イルメチル) - 1H - ピラゾロ[4, 3-c]ピリジン-3, 6(2H, 5H) - ジオン;

H , 5 H) - ジオン；

4 - { [(2 - クロロベンジル) オキシ] メチル } - 2 - (2 - クロロフェニル) - 5 - (2 - メトキシエチル) - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン；

2 - (2 - クロロフェニル) - 5 - (2 - メトキシエチル) - 4 - { (3 - メトキシフェノキシ) メチル } - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン；

2 - (2 - クロロフェニル) - 4 - { [(3 - フルオロベンジル) (メチル) アミノ] メチル } - 5 - (2 - メトキシエチル) - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン；

2 - (2 - クロロフェニル) - 4 - { (3 - メトキシフェノキシ) メチル } - 5 - (ピリジン - 4 - イルメチル) - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン；

4 - { [(3 - クロロベンジル) オキシ] メチル } - 2 - (2 - クロロフェニル) - 5 - メチル - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン；

2 - (2 - クロロフェニル) - 4 - { [(3 - (ジメチルアミノ) ベンジル) オキシ] メチル } - 5 - メチル - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン；

2 - (2 - クロロフェニル) - 4 - { (ジフェニルメトキシ) メチル } - 5 - メチル - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン；

2 - (2 - クロロフェニル) - 4 - { (3 - メトキシフェノキシ) メチル } - 5 - (ピリジン - 3 - イルメチル) - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン；

2 - (2 - クロロフェニル) - 4 - { [(3 - メトキシベンジル) (メチル) アミノ] メチル } - 5 - メチル - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン；

2 - (2 - クロロフェニル) - 4 - { [(3 - フルオロベンジル) (メチル) アミノ] メチル } - 5 - (1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イル) メチル] - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン；

4 - { [(2 - クロロベンジル) (メチル) アミノ] メチル } - 2 - (2 - クロロフェニル) - 5 - (2 - メトキシエチル) - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン；

4 - { [(2 - クロロベンジル) オキシ] メチル } - 2 - (2 - クロロフェニル) - 5 - { (1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イル) メチル } - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン；

2 - (2 - クロロフェニル) - 5 - メチル - 4 - { [メチル (ピリジン - 3 - イルメチル) アミノ] メチル } - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン；

4 - { [(2 - クロロベンジル) (メチル) アミノ] メチル } - 2 - (2 - クロロフェニル) - 5 - { (1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イル) メチル } - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン；

2 - (2 - クロロフェニル) - 4 - { [(3 - メトキシベンジル) (メチル) アミノ] メチル } - 5 - { (1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イル) メチル } - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン；

2 - (2 - クロロフェニル) - 4 - { [(3 - メトキシベンジル) オキシ] メチル } - 5 - { (1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イル) メチル } - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン；

2 - (2 - クロロフェニル) - 4 - { [(3 - メトキシフェノキシ) メチル] - 5 - { (1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イル) メチル } - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン；

2 - (2 - クロロフェニル) - 4 - [(3 - メトキシフェノキシ) メチル] - 5 - (ピラジン - 2 - イルメチル) - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;

2 - (2 - クロロフェニル) - 5 - (2 - メトキシエチル) - 4 - { [(3 - メトキシフェニル) (メチル) アミノ] メチル } - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;

2 - (2 - クロロフェニル) - 4 - { [(3 - メトキシフェニル) (メチル) アミノ] メチル } - 5 - [(1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イル) メチル] - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;

4 - { [(2 - クロロベンジル) (メチル) アミノ] メチル } - 2 - (2 - クロロフェニル) - 5 - (ピリジン - 3 - イルメチル) - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;

2 - (2 - クロロフェニル) - 4 - { [(3 - メトキシベンジル) オキシ] メチル } - 5 - (ピラジン - 2 - イルメチル) - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;

2 - (2 - クロロフェニル) - 4 - { [(3 - メトキシベンジル) オキシ] メチル } - 5 - (ピリジン - 3 - イルメチル) - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;

2 - (2 - クロロフェニル) - 4 - { [(3 - メトキシベンジル) オキシ] メチル } - 5 - (2 - メトキシエチル) - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;

2 - (2 - クロロフェニル) - 4 - { [(3 - フルオロベンジル) (メチル) アミノ] メチル } - 5 - (ピリジン - 3 - イルメチル) - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;

4 - { [(2 - クロロベンジル) (メチル) アミノ] メチル } - 2 - (2 - クロロフェニル) - 5 - (ピラジン - 2 - イルメチル) - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;

2 - (2 - クロロフェニル) - 4 - { [(3 - メトキシベンジル) (メチル) アミノ] メチル } - 5 - (ピリジン - 3 - イルメチル) - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;

2 - (2 - クロロフェニル) - 4 - [(3 - メトキシフェノキシ) メチル] - 5 - [(4 - メチルモルホリン - 2 - イル) メチル] - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;

2 - (2 - クロロフェニル) - 4 - { [4 - (3 - メトキシフェニル) ピペラジン - 1 - イル] メチル } - 5 - メチル - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;

2 - (2 - クロロフェニル) - 4 - { [(3 - メトキシフェニル) (メチル) アミノ] メチル } - 5 - (ピリジン - 3 - イルメチル) - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;

2 - (2 - クロロフェニル) - 4 - { [4 - (2 - クロロフェニル) ピペラジン - 1 - イル] メチル } - 5 - メチル - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;

2 - (2 - クロロフェニル) - 4 - { [4 - (3 - クロロフェニル) ピペラジン - 1 - イル] メチル } - 5 - メチル - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;

4 - { [(2 - クロロベンジル) オキシ] メチル } - 2 - (2 - メトキシフェニル) - 5 - (ピリジン - 3 - イルメチル) - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;

4 - { [(2 - クロロベンジル) オキシ] メチル } - 2 - (2 - クロロフェニル) - 5 - (ピラジン - 2 - イルメチル) - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2

H , 5 H) - ジオン ;
 2 - (2 - クロロフェニル) - 4 - { [メチル (ピリジン - 2 - イルメチル) アミノ] メチル } - 5 - (ピリジン - 3 - イルメチル) - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;
 2 - (2 - クロロフェニル) - 5 - [(1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イル) メチル] - 4 - { [メチル (ピリジン - 2 - イルメチル) アミノ] メチル } - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;
 4 - { [(3 - メトキシベンジル) オキシ] メチル } - 2 - (2 - メトキシフェニル) - 5 - (ピラジン - 2 - イルメチル) - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;
 4 - { [(3 - メトキシベンジル) オキシ] メチル } - 2 - (2 - メトキシフェニル) - 5 - [(1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イル) メチル] - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;
 2 - (2 - クロロフェニル) - 4 - { [(3 - メトキシベンジル) (メチル) アミノ] メチル } - 5 - (ピラジン - 2 - イルメチル) - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;
 4 - [(ベンジルオキシ) メチル] - 2 - (2 - メトキシフェニル) - 5 - [(1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イル) メチル] - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;
 4 - [(3 - メトキシフェノキシ) メチル] - 2 - (2 - メトキシフェニル) - 5 - [(1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イル) メチル] - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;
 2 - (2 - クロロフェニル) - 5 - [(1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イル) メチル] - 4 - { [メチル (ピリジン - 3 - イルメチル) アミノ] メチル } - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;
 2 - (2 - クロロフェニル) - 4 - { [メチル (ピリジン - 2 - イルメチル) アミノ] メチル } - 5 - (ピラジン - 2 - イルメチル) - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;
 2 - (2 - メトキシフェニル) - 4 - { [4 - (3 - メトキシフェニル) ピペラジン - 1 - イル] メチル } - 5 - メチル - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;
 2 - (2 - メトキシフェニル) - 5 - メチル - 4 - [(4 - ピリジン - 2 - イルピペラジン - 1 - イル) メチル] - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;
 2 - (2 - クロロフェニル) - 5 - メチル - 4 - [(4 - ピリジン - 2 - イルピペラジン - 1 - イル) メチル] - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;
 4 - { [(2 - クロロベンジル) オキシ] メチル } - 2 - (2 - メトキシフェニル) - 5 - (ピラジン - 2 - イルメチル) - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;
 4 - [(ベンジルオキシ) メチル] - 2 - (2 - メトキシフェニル) - 5 - (ピラジン - 2 - イルメチル) - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ;
 2 - (2 - クロロフェニル) - 5 - [(1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イル) メチル] - 4 - [(ピリジン - 3 - イルメトキシ) メチル] - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン ; 及び
 2 - (2 - クロロフェニル) - 5 - (ピラジン - 2 - イルメチル) - 4 - [(ピリジン - 3 - イルメトキシ) メチル] - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 , 6 (2 H , 5 H) - ジオン

から選択される、請求項 1 ~ 11 のいずれか 1 項に記載の誘導体。

【請求項 1 3】

請求項 1 ~ 12 のいずれか 1 項に記載の少なくとも 1 つの誘導体と、その薬学的に許容される担体、希釈剤又は賦形剤とを含有する医薬組成物。

【請求項 1 4】

薬剤として使用される、請求項 1 ~ 12 のいずれか 1 項記載の誘導体。

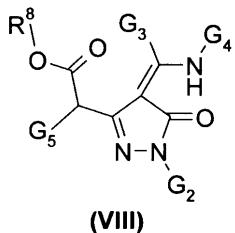
【請求項 1 5】

心血管障害、呼吸障害、代謝障害、皮膚の障害、骨の障害、神経炎症性及び／若しくは神経変性障害、腎疾患、生殖障害、眼及び／若しくは水晶体に影響する疾患、及び／又は内耳に影響する状態、炎症性障害、肝疾患、疼痛、癌、アレルギー性障害、外傷性全身障害、敗血症性、出血性及びアナフィラキシー性ショック、胃腸系の疾患若しくは障害、血管新生、血管新生依存状態、並びにニコチニアミドアデニンジヌクレオチドリン酸オキシダーゼ (NADPH オキシダーゼ) に関する他の疾患及び／又は障害から選択される疾患又は状態の治療に使用するための、請求項 1 ~ 12 のいずれか 1 項に記載のピラゾロピリジン誘導体を含む医薬組成物。

【請求項 1 6】

式 (VII) :

【化 4 5】



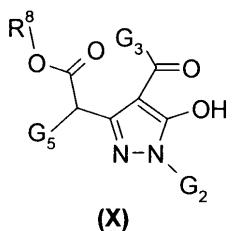
[式中、R⁸ は、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル又はブチルのような C₁ ~ C₆ アルキルであり、G₂、G₃、G₄ 及び G₅ は、請求項 1 ~ 14 のいずれか 1 項に定義された通りである]

で示される中間体。

【請求項 1 7】

式 (X) :

【化 4 6】



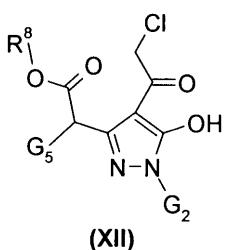
[式中、R⁸ は、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル又はブチルのような C₁ ~ C₆ アルキルであり、G₂、G₃ 及び G₅ は、請求項 1 ~ 14 のいずれか 1 項に定義された通りである]

で示される中間体。

【請求項 1 8】

式 (XI) :

【化 4 7】



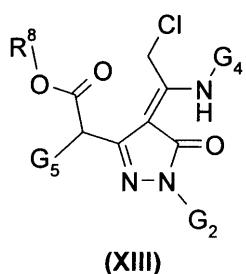
[式中、R⁸は、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル又はブチルのようなC₁～C₆アルキルであり、G₂及びG₅は、請求項1～14のいずれか1項に定義された通りである]

で示される中間体。

【請求項 19】

式 (X I I I) :

【化 4 8】



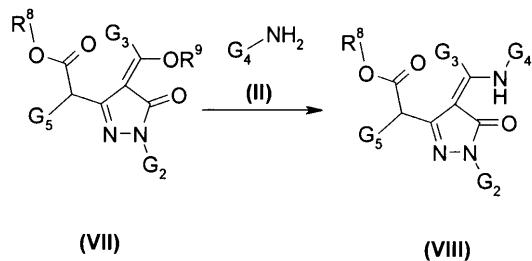
[式中、R⁸は、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル又はブチルのようなC₁～C₆アルキルであり、G₂、G₄及びG₅は、請求項1～14のいずれか1項に定義された通りである]

で示される中間体。

【請求項 20】

式 (II) のアミンによる式 (VII) の中間体の調製方法であって、

【化 4 9】

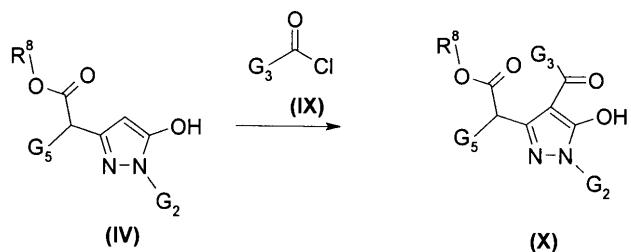


ここで、R⁸及びR⁹が、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル又はブチルのようなC₁～C₆アルキルであり、G₂、G₃、G₄、G₅が、請求項1～14のいずれか1項に定義された通りである方法。

【請求項 21】

式(X)の中間体の調製方法であって、式(IV)の化合物を、式(IX)の塩化アシリルと反応させる工程を含み、

【化 5 0】

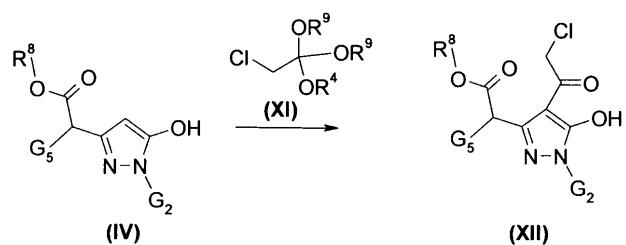


ここで、 R^8 が、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル又はブチルのような $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、 G_2 、 G_3 、 G_5 が、請求項 1 ~ 14 のいずれか 1 項に定義された通りである方法。

【請求項 22】

式(XII)の中間体の調製方法であって、式(IV)の化合物を、式(IX)のトリアルキルオルトエステルと反応させる工程を含み、

【化 5 1】

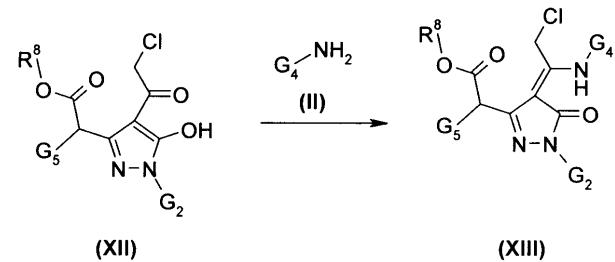


ここで、R⁸及びR⁹が、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル又はブチルのようなC₁～C₆アルキルであり、G₂及びG₅が、請求項1～14のいずれか1項に定義された通りである方法。

【請求項 2 3】

式(XIII)の中間体の調製方法であって、式(XII)の化合物を、式(II)のアミンと反応させる工程を含み、

【化 5 2】

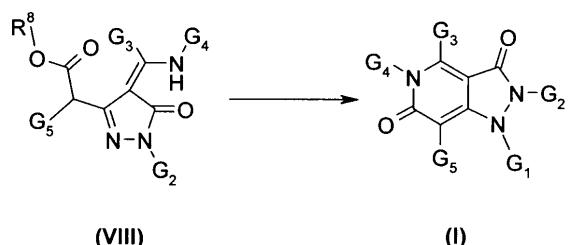


ここで、R⁸が、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル又はブチルのようなC₁～C₆アルキルであり、G₂、G₄及びG₅が、請求項1～14のいずれか1項に定義された通りである方法。

【請求項 24】

式(Ⅰ)の化合物の調製方法であって、塩基の存在下、式(ⅥⅢ)の化合物を環化する工程を含み、

【化 5 3】



ここで、R⁸が、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル又はブチルのようなC₁～C₆アルキルであり、G¹がHであり、G₂、G₃、G₄及びG₅が、請求項1～14のいずれか1項に定義された通りである方法。

【手續補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】 0014

【補正方法】変更

【補正の内容】

[0 0 1 4]

本発明の第1態様は、 G_1 、 G_2 、 G_3 、 G_4 及び G_5 が下記に定義されている通りである式(I)のピラゾロピリジン誘導体、並びにその薬学的に許容される塩及び薬学的に活性な誘導体を提供する。

本発明の第2態様は、 G_1 、 G_2 、 G_3 、 G_4 及び G_5 が下記に定義されている通りである式(I)のピラゾロピリジン誘導体、並びにその薬学的に許容される塩及び薬学的に活性な誘導体の薬剤としての使用に関する。

本発明の第3態様は、本発明の少なくとも1つのピラゾロピリジン誘導体を含有する医薬組成物、並びにその薬学的に許容される塩及び薬学的に活性な誘導体、及びその薬学的に許容される担体、希釈剤又は賦形剤に関する。

本発明の第4の態様は、心血管障害、呼吸障害、代謝障害、皮膚の障害、骨の障害、神経炎症性及び／若しくは神経変性障害、腎疾患、生殖障害、眼及び／若しくは水晶体に影響する疾患、及び／又は内耳に影響する状態、炎症性障害、肝疾患、疼痛、癌、アレルギー性障害、外傷性全身障害、敗血症性、出血性及びアナフィラキシー性ショック、胃腸系の疾患若しくは障害、血管新生及び血管新生依存、並びに／又はニコチンアミドアデニンジヌクレオチドリン酸オキシダーゼ（NADPHオキシダーゼ）に関連する他の疾患及び障害から選択される疾患又は状態の治療又は予防のための医薬組成物の調製における、本発明のピラゾロピリジン誘導体、並びにその薬学的に許容される塩及び薬学的に活性な誘導体の使用である。

本発明の第5態様は、心血管障害、呼吸障害、代謝障害、皮膚の障害、骨の障害、神経炎症性及び／若しくは神経変性障害、腎疾患、生殖障害、眼及び／若しくは水晶体に影響する疾患、及び／又は内耳に影響する状態、炎症性障害、肝疾患、疼痛、癌、アレルギー性障害、外傷性全身障害、敗血症性、出血性及びアナフィラキシー性ショック、胃腸系の疾患若しくは障害、血管新生及び血管新生依存、並びにニコチンアミドアデニンジヌクレオチドリン酸オキシダーゼ（NADPHオキシダーゼ）に関連する他の疾患及び／又は障害から選択される疾患又は状態に罹患している患者を治療する方法に関する。この方法は、 G_1 、 G_2 、 G_3 、 G_4 及び G_5 が下記に定義されている通りである式（I）のピラゾロピリジン誘導体、並びにその薬学的に許容される塩及び薬学的に活性な誘導体を、それが必要な患者に投与することを含む。

本発明の第6態様は、心血管障害、呼吸障害、代謝障害、皮膚の障害、骨の障害、神経炎症性及び／若しくは神経変性障害、腎疾患、生殖障害、眼及び／若しくは水晶体に影響する疾患、及び／又は内耳に影響する状態、炎症性障害、肝疾患、疼痛、癌、アレルギー性障害、外傷性全身障害、敗血症性、出血性及びアナフィラキシー性ショック、胃腸系の

疾患若しくは障害、血管新生及び血管新生依存、並びにニコチンアミドアデニンジヌクレオチドリン酸オキシダーゼ（NADPHオキシダーゼ）に関連する他の疾患及び／又は障害から選択される疾患又は状態の治療のための、G₁、G₂、G₃、G₄及びG₅が下記に定義されている通りである式（I）のピラゾロピリジン誘導体、並びにその薬学的に許容される塩及び薬学的に活性な誘導体に関する。

本発明の第7態様は、G₂、G₃、G₄、G₅及びR⁸が下記に定義されている通りである式（VII）の中間体に関する。

本発明の第8態様は、G₂、G₃、G₅及びR⁸が下記に定義されている通りである式（X）の中間体に関する。

本発明の第9態様は、G₂、G₅及びR⁸が下記に定義されている通りである式（XI）の中間体に関する。

本発明の第10態様は、G₂、G₄、G₅及びR⁸が下記に定義されている通りである式（XII）の中間体に関する。

本発明の第11態様は、本発明の式（VII）、（X）、（XI）又は（XIII）の中間体化合物の調製方法に関する。

本発明の第12態様は、本発明の式（I）の化合物の調製方法に関する。

【手続補正3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0017

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0017】

また、含まれるものは、無機酸（例えば、塩酸、臭化水素酸、硫酸、リン酸、硝酸等）により形成される酸付加塩から形成される塩、並びに酢酸、シュウ酸、酒石酸、コハク酸、リンゴ酸、フマル酸、マレイン酸、アスコルビン酸、安息香酸、タンニン酸、パモ酸、アルギン酸、ポリグルタミン酸、ナフタレンスルホン酸、ナフタレンジスルホン酸及びポリガラクトロン酸のような有機酸により形成される塩である。

「薬学的に活性な誘導体」は、摂取者に投与されると、本明細書に開示された活性を、直接的に又は間接的に提供することができる任意の化合物を意味する。用語「間接的」は、内在性酵素又は代謝によって薬剤の活性形態に変換されうるプロドラッグも包含する。プロドラッグは、化学的又は代謝的に分解されうる基を有する、本発明による化合物であり、NADPHオキシダーゼ阻害活性を表す化合物の誘導体、及び生理学的条件下での加溶媒分解によりインビボで薬学的に活性な化合物に変換されうる化合物である。本発明は、更に、本発明の化合物の任意の互変異性体を包含する。

用語「心血管障害又は疾患」は、アテローム動脈硬化症、特に、高血圧症、I型又はII型糖尿病の心血管性合併症、内膜肥厚、冠状動脈性心疾患、脳血管、心血管又は動脈痙攣、内皮性機能不全、うっ血性心不全を含む心不全、末梢動脈疾患、再狭窄、ステント、卒中、虚血発作により引き起こされる外傷、臓器移植後のような血管性合併症、心筋梗塞、高血圧症、アテローム性動脈硬化巣の形成、血小板凝集、狭心症、動脈瘤、大動脈解離、虚血性心疾患、心肥大、肺塞栓症、深部静脈血栓症を含む血栓症の症例、臓器移植、直視下心臓手術、血管形成術のときの虚血後の血流又は酸素運搬の回復により引き起こされる傷害、出血性ショック、心臓、脳、肝臓、腎臓、網膜及び腸を含む虚血臓器の血管形成術が含まれるが、これらに限定されない内皮性機能不全に関連する疾患又は障害を含む。

用語「呼吸障害又は疾患」は、気管支喘息、気管支炎、アレルギー性鼻炎、成人呼吸症候群、囊胞性線維症、肺ウイルス感染（インフルエンザ）、肺高血圧症、特発性肺線維症及び慢性閉塞性肺疾患（COPD）を含む。

用語「アレルギー性疾患」には、枯草熱及び喘息が含まれる。

用語「外傷性全身障害」には、多発性外傷が含まれる。

用語「代謝に影響する疾患又は障害」には、肥満、代謝症候群及びII型糖尿病が含まれる。

れる。

用語「皮膚の疾患又は障害」には、乾癬、湿疹、皮膚炎、創傷治癒及び瘢痕形成が含まれる。

用語「骨の障害」には、骨粗鬆症、オステオポラシス (osteoporosis)、骨硬化症、歯周炎及び上皮小体機能亢進症が含まれる。

用語「神経変性疾患又は障害」は、特に、アルツハイマー病、パーキンソン病、ハンチントン病、筋萎縮性側索硬化症、てんかん及び筋ジストロフィーのようなニューロンのレベルにおける中枢神経系 (CNS) の変性又は変調により特徴付けられる疾患又は状態を含む。更に、白質脳症及び白質萎縮のような神經炎症性及び脱髓性の状態又は疾患を含む。

用語「脱髓性」は、軸索の周囲のミエリンの分解を含むCNSの状態又は疾患を意味する。本発明の文脈において、脱髓性疾患という用語は、多発性硬化症、進行性多病巣性白質脳症 (PML)、脊髄症、CNS内の自己反応性白血球を伴う任意の神經炎症性状態、先天性代謝障害、異常髓鞘形成による神經障害、薬剤誘発性脱髓、放射線誘発性脱髓、遺伝性脱髓状態、プリオン誘発性脱髓状態、脳炎誘発性脱髓又は脊髄損傷のような細胞を脱髓する過程を含む状態を含むことが意図される。好ましくは、状態は多発性硬化症である。

用語「腎疾患又は障害」には、糖尿病性腎障害、腎不全、糸球体腎炎、アミノグリコシド及び白金化合物の腎毒性、並びに過活動膀胱が含まれる。特定の実施態様において、本発明の用語には、慢性腎疾患又は障害が含まれる。

用語「生殖障害又は疾患」には、勃起不全、妊性障害、前立腺肥大症及び良性前立腺肥大症が含まれる。

用語「眼及び／又は水晶体に影響する疾患又は障害」には、糖尿病性白内障を含む白内障、白内障手術後の水晶体の再不透明化、糖尿病性又は他の形態の網膜症が含まれる。

用語「内耳に影響する状態」には、老人性難聴、耳鳴、メニエール病及び他の平衡の問題、卵形囊結石症、前庭性偏頭痛、並びに騒音誘発性難聴及び薬剤誘発性難聴（聴器毒性）が含まれる。

用語「炎症性障害又は疾患」は、炎症性腸疾患、敗血症、敗血症性ショック、成人呼吸促迫症候群、肺炎、外傷により誘発されたショック、気管支喘息、アレルギー性鼻炎、リウマチ様関節炎、慢性リウマチ様関節炎、動脈硬化症、脳内出血、脳梗塞、心不全、心筋梗塞、乾癬、囊胞性線維症、卒中、急性気管支炎、慢性気管支炎、急性細気管支炎、慢性細気管支炎、骨関節症、痛風、脊髄炎、強直性脊椎炎、ロイター症候群、乾癬性関節炎、脊椎関節炎、若年性関節炎又は若年性強直性脊椎炎、反応性関節炎、感染性関節炎若しくは感染後関節炎、淋菌性関節、梅毒性関節炎、ライム病、「脈管炎症候群」により誘発された関節炎、結節性多発性動脈炎、アナフィラキシー性脈管炎、Luegenec肉芽腫症、リウマチ性多発性筋痛、関節細胞リウマチ、カルシウム結晶沈着関節炎、偽痛風、非関節炎性リウマチ、滑液囊炎、腱滑膜炎、上顆炎症（テニス肘）、手根管症候群、反復使用（タイミング）による障害、混合型関節炎、神経障害性関節症、出血性関節炎、血管性紫斑病、肥厚性骨関節症、多中心性網内系組織球症、特定の疾患、血液色素沈着、鎌状赤血球疾患及び他のヘモグロビン異常により誘発される関節炎、高リポタンパク血症、異常ガンマグロブリン血症、上皮小体機能亢進症、先端巨大症、家族性地中海熱、ベーチェット病、全身性自己免疫疾患、紅斑性狼瘡、多発性硬化症及びクローン病若しくは再発性多発性軟骨炎のような疾患、慢性炎症性腸疾患（IBD）又は式（I）により表されている化合物の治療有効量を、NADPHオキシダーゼを阻害するのに十分な用量で哺乳動物に投与することを必要とする関連する疾患を意味する。

肝疾患又は障害という用語には、肝線維症、アルコール誘発性線維症、脂肪症及び非アルコール性脂肪性肝炎が含まれる。

用語「関節炎」は、急性リウマチ性関節炎、慢性関節リウマチ、クラミジア関節炎、慢性吸收性関節炎、乳び関節炎、腸疾患に基づく関節炎、フィラリア性関節炎、淋菌性関節炎、痛風性関節炎、血友病関節炎、肥厚性関節炎、若年性慢性関節炎、ライム関節炎、新生子馬関節炎、結節性関節炎、アルカプトン尿性関節炎、乾癬性関節炎若しくは化膿性關

節炎、又は式(Ⅰ)により表されている化合物の治療有効量を、NADPHオキシダーゼを阻害するのに十分な用量で哺乳動物に投与することを必要とする関連する疾患を意味する。

用語「疼痛」には、炎症性疼痛に関連する痛覚過敏症が含まれる。

用語「癌」は、癌腫(例えば、線維肉腫、粘液肉腫、脂肪肉腫、軟骨肉腫、骨原性肉腫、脊索腫、血管肉腫、内皮肉腫、リンパ管肉腫、リンパ管内皮腫、骨膜腫、中皮腫、ユーリング腫瘍、平滑筋肉腫、横紋筋肉腫、結腸癌、膀胱癌、乳癌、卵巣癌、腎癌、前立腺癌、扁平上皮癌、基底細胞癌、腺癌、汗腺癌、皮脂腺癌、乳頭状癌、乳頭状腺癌、囊胞腺癌、髓様癌、気管支原性癌、腎細胞癌、肝細胞癌、肝内胆管癌、絨毛癌、精上皮腫、胎児性癌、ウィルムス腫瘍、子宮頸癌、睾丸腫瘍、肺癌、小細胞肺癌、肺腺癌、膀胱癌若しくは上皮癌)又は式(Ⅰ)により表されている化合物の治療有効量を、NADPHオキシダーゼを阻害するのに十分な用量で哺乳動物に投与することを必要とする関連する疾患を意味する。

用語「胃腸系の疾患又は障害」には、胃粘膜障害、虚血性腸疾患管理、腸炎/結腸炎、癌化学療法又は好中球減少症が含まれる。

用語「血管新生」には、新芽形成血管新生、重積性血管新生、脈管形成、動脈新生及びリンパ脈管新生が含まれる。血管新生は、既存の毛細血管又は後毛細血管細静脈から新たな血管が形成されることであり、癌、関節炎及び炎症のような病理状態において生じる。皮膚、筋肉、消化管、結合組織、関節、骨等及び血管が血管新生刺激を受けて侵入することができる同様の組織を含む多種多様な組織又は器質化組織から構成される臓器は、疾患状態で血管新生を支持する可能性がある。本明細書で使用されるとき、用語「血管新生依存状態」は、血管新生又は脈管形成の過程が病理状態を維持又は増大する状態を意味することが意図される。脈管形成は、内皮細胞前駆体である血管芽細胞から生じる新たな血管の形成によりもたらされる。両方の過程は、新たな血管の形成をもたらし、血管新生依存状態という用語の意味に含まれる。同様に、本明細書で使用されるとき、用語「血管新生」は、脈管形成により生じるもの、並びに現存の血管、毛細血管及び細静脈からの分岐及び新芽形成により生じるもののような、血管の新規形成も含まれることが意図される。

用語「血管新生阻害」は、新血管形成の程度、量又は速度の減少に有効であることを意味する。組織における内皮細胞繁殖又は移動の程度、量又は速度に減少を生じることは、血管新生を阻害する特定の例である。血管新生阻害活性は、腫瘍増殖過程を標的にし、腫瘍組織の新血管形成の不在下では、腫瘍組織が、必要な栄養素を得ることがなく、増殖が遅くなり、更なる増殖を停止し、退行し、最終的に壊死して、腫瘍の死滅をもたらすので、あらゆる癌の治療に特に有用である。更に、血管新生阻害活性は、転移の形成に対して特に有効であり、それはその形成が、転移性癌細胞が原発性腫瘍に存在できるようになるために原発性腫瘍の血管形成も必要とし、二次部位における確立が、転移の増殖を支持する新血管形成を必要とするので、あらゆる癌の治療に特に有用である。

本明細書で使用されるとき、「治療」及び「治療する」等は、一般に、所望の薬理学的及び生理学的效果を得ることを意味する。効果は、疾患、症状若しくはその状態を予防する若しくは部分的に予防するという観点から予防的であってもよい、及び/又は疾患、状態、症状若しくは疾患が原因の有害な作用の部分的な若しくは完全な治癒の観点から治療的であってもよい。用語「治療」は、本明細書で使用されるとき、哺乳動物、特にヒトにおける疾患のあらゆる治療を網羅し、(a)疾患に罹患しやすくなっているが、まだ疾患有するとは診断されていない被験者において疾患が生じるのを予防すること；(b)疾患を抑制すること、即ちその発症を阻止すること；又は疾患を緩和すること、即ち疾患及び/若しくはその症状若しくは状態を退行させること、を含む。

用語「被験者」は、本明細書で使用されるとき、哺乳動物を意味する。例えば、本発明により考慮されている哺乳動物には、ヒト、靈長類、ウシ、ヒツジ、ブタ、ウマ等のような家畜動物が含まれる。

用語「インヒビター」は、本発明の文脈で使用されるとき、NADPHオキシダーゼの活性を完全に若しくは部分的に阻害する分子、及び/又は反応性酸素種(ROS)の生成

を阻害若しくは低減する分子として定義される。

【手続補正4】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0020

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0020】

[式中、G₁は、H；場合により置換されているアシル；場合により置換されているアシルC₁～C₆アルキル；アミノカルボニルアルキル（例えば、フェニルアセトアミド）のような場合により置換されているアルキル；場合により置換されているC₃～C₈シクロアルキルアルキル；場合により置換されているヘテロシクロアルキルアルキル；場合により置換されているフェニルメチル（例えば、フェニルメチル又は3-メチルフェニルメチル又は4-フルオロベンジル又は2-クロロベンジル又は4-クロロベンジル又は4-メチルベンジル又は4-ブロモベンジル）のような場合により置換されているフェニルのような、場合により置換されているアリールアルキル；及びピリジン-2-イルメチルのような場合により置換されているピリジンアルキルのような、場合により置換されているヘテロアリールアルキルから選択され；G₂は、H；場合により置換されているメチル（例えば、メチル）のような場合により置換されているC₁～C₆アルキル；場合により置換されているC₂～C₆アルケニル；場合により置換されているC₂～C₆アルキニル；場合により置換されているフェニル（例えば、フェニル又は4-フルオロフェニル又は3-クロロ-フェニル又は4-メトキシフェニル又は4-ニトロフェニル又は2-クロロフェニル又は2-メチルフェニル又は4-(トリフルオロメチル)フェニル又は4-(トリフルオロメトキシ)フェニル又は2,5-ジフルオロフェニル又は2,5-ジクロロフェニル又は2-メトキシフェニル又は4-(ベンジルオキシ)フェニル又は3-ベンゾニトリル又は3-フェニルアセトアミド又は2-クロロ-4-フルオロフェニル）のような、場合により置換されているアリール；場合により置換されているC₁～C₆アルキルアリール；場合により置換されているベンジル（例えば、ベンジル）のような場合により置換されているアリールC₁～C₆アルキル；場合により置換されているベンゾチアゾリル（例えば、1,3-ベンゾチアゾリル-2-イル）又は場合により置換されているピリジニル（例えば、ピリジン-2-イル若しくは(4-メチルピペラジン-1-イル)スルホニルピリジン-2-イル）又は場合により置換されているチアゾリル（例えば、4-フェニル-1,3-チアゾール-2-イル）のような、場合により置換されているヘテロアリール；場合により置換されているアルキルヘテロアリール；場合により置換されているヘテロアリールC₁～C₆アルキル；場合により置換されているC₂～C₆アルケニルアリール；場合により置換されているアリールC₂～C₆アルケニル；場合により置換されているC₂～C₆アルケニルヘテロアリール；場合により置換されているヘテロアリールC₂～C₆アルケニル；場合により置換されているシクロヘキシリル（例えば、シクロヘキシリル）のような場合により置換されているC₃～C₈シクロアルキル；場合により置換されているヘテロシクロアルキル；場合により置換されているアルキルC₃～C₈シクロアルキル；場合により置換されているC₃～C₈シクロアルキルヘテロシクロアルキル及び場合により置換されているヘテロシクロアルキルC₁～C₆アルキルから選択され；G₃は、-(CH₂)_n-R¹及び-(CH₂)_p-R⁵から選択され；R¹は、-NR²R³；-OR⁴；場合により置換されているモルホリニル（例えば、4-モルホリン-4-イル又は4-ベンジルモルホリニル-2-イル）、場合により置換されているピロリジニル（例えば、4-ピロリジン-1-イル）、場合により置換されているピペリジニル（例えば、4-フェニルピペリジン-1-イル）、場合により置換されているジヒドロインドリル（例えば、2,3-ジヒドロ-1H-インドール-1-イル）、場合により置換されているピペラジニル（例えば、3-メトキシフェニルピペラジン-1-イル又は2-クロロフェニルピペラジン-1-イル又は3-クロロフェニルピペラジン-1-イル又は4-ピリジン-2-イルピペラ

ジン - 1 - イル) のような、場合により置換されているヘテロシクロアルキル; 場合により置換されているヘテロアリール; - C H R ⁶ R ⁷; 場合により置換されているアシリ及び - C (O) N R ² R ³ から選択され; R ² 及び R ³ は、H; メチルのような場合により置換されている C ₁ ~ C ₆ アルキル; 場合により置換されている C ₂ ~ C ₆ アルケニル; 場合により置換されている C ₂ ~ C ₆ アルキニル; 場合により置換されているフェニル(例えば、フェニル又は 2 - メトキシフェニル)のような、場合により置換されているアリール; 場合により置換されている C ₁ ~ C ₆ アルキルアリール; 場合により置換されているベンジル(例えば、ベンジル又は 3 - フルオロベンジル又は 2 - クロロベンジル又は 3 - メトキシベンジル)のような場合により置換されているフェニル C ₁ ~ C ₆ アルキルのような、場合により置換されているアリール C ₁ ~ C ₆ アルキル; 場合により置換されているヘテロアリール; 場合により置換されているアルキルヘテロアリール; 場合により置換されているピリジンメチル(例えば、4 - メチルピリジン - 2 - イル又はピリジン - 3 - イルメチル)のような場合により置換されているピリジン C ₁ ~ C ₆ アルキルのような、場合により置換されているヘテロアリール C ₁ ~ C ₆ アルキル; 場合により置換されている C ₂ ~ C ₆ アルケニルアリール; 場合により置換されている C ₂ ~ C ₆ アルケニルヘテロアリール; 場合により置換されているヘテロアリール C ₂ ~ C ₆ アルケニル; 場合により置換されている C ₃ ~ C ₈ シクロアルキル; 場合により置換されているヘテロシクロアルキル; 場合により置換されているアルキル C ₃ ~ C ₈ シクロアルキル; 場合により置換されている C ₃ ~ C ₈ シクロアルキル C ₁ ~ C ₆ アルキル; 場合により置換されている C ₁ ~ C ₆ アルキルヘテロシクロアルキル及び場合により置換されているヘテロシクロアルキル C ₁ ~ C ₆ アルキルから独立して選択されるか、或いは N R ² R ³ は、場合により置換されているヘテロアリール及び、場合により置換されているモルホリニル(例えば、モルホリン - 4 - イル又は 4 - モルホリン - 1 - イル)、場合により置換されているピペリジン(例えば、4 - フェニルピペリジン - 1 - イル)、場合により置換されているジヒドロインドリル(例えば、2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インドール - 1 - イル)、場合により置換されているピペラジニル(例えば、3 - メトキシフェニルピペラジン - 1 - イル又は 2 - クロロフェニルピペラジン - 1 - イル又は 3 - クロロフェニルピペラジン - 1 - イル)のような、場合により置換されているヘテロシクロアルキルから選択される環を形成し; R ⁴ は、H; 場合により置換されているアルコキシ C ₁ ~ C ₆ アルキル; 場合により置換されているメチル(例えば、メチル)のような場合により置換されている C ₁ ~ C ₆ アルキル; 場合により置換されている C ₂ ~ C ₆ アルケニル; 場合により置換されている C ₂ ~ C ₆ アルキニル; 場合により置換されているフェニル(例えば、フェニル又は 4 - フルオロフェニル又は 4 - クロロフェニル又は 3 - クロロフェニル又は 3 - メトキシフェニル又は 3 - ジメチルアミノフェニル)、場合により置換されているナフタレンイル(例えば、4 - ナフタレン - 1 - イル)のような、場合により置換されているアリール; 場合により置換されている C ₁ ~ C ₆ アルキルアリール; 場合により置換されているベンジル(例えば、ベンジル又は 2 , 2 , 2 - トリフルオロ - 1 - フェニルメチル又は 3 - メトキシベンジル又は 4 - メトキシベンジル又は 2 - クロロベンジル又は 4 - クロロベンジル又は 3 - ジメチルアミノベンジル又はジフェニルメチル)のような、場合により置換されているフェニルエチル(例えば、4 - クロロフェニルエチル)のような、場合により置換されているフェニル C ₁ ~ C ₆ アルキルのような場合により置換されているアリール C ₁ ~ C ₆ アルキル; 場合により置換されているヘテロアリール; 場合により置換されているアルキルヘテロアリール; 場合により置換されているピリジンメチル(例えば、ピリジン - 3 - イルメチル)のような場合により置換されているピリジン C ₁ ~ C ₆ アルキルのような、場合により置換されているヘテロアリール C ₁ ~ C ₆ アルキル; 場合により置換されている C ₂ ~ C ₆ アルケニルアリール; 場合により置換されているアリール C ₂ ~ C ₆ アルケニル; 場合により置換されている C ₂ ~ C ₆ アルケニルヘテロアリール; 場合により置換されているヘテロアリール C ₂ ~ C ₆ アルケニル; 場合により置換されている C ₃ ~ C ₈ シクロアルキル; 場合により置換されているヘテロシクロアルキル; 場合により置換されているアルキル C ₃ ~

C₈シクロアルキル；場合により置換されているC₃～C₈シクロアルキルC₁～C₆アルキル；場合により置換されているC₁～C₆アルキルヘテロシクロアルキル及び場合により置換されているヘテロシクロアルキルC₁～C₆アルキルから選択され；R⁵は、H；場合により置換されているアルコキシ；場合により置換されているアルコキシC₁～C₆アルキル；場合により置換されているメチルのような場合により置換されているC₁～C₆アルキル；場合により置換されているC₂～C₆アルケニル；場合により置換されているC₂～C₆アルキニル；場合により置換されているアリール；場合により置換されているC₁～C₆アルキルアリール；場合により置換されているアリールC₁～C₆アルキル；場合により置換されているヘテロアリール；場合により置換されているアルキルヘテロアリール；場合により置換されているC₂～C₆アルケニルアリール；場合により置換されているアリールC₂～C₆アルケニル；場合により置換されているC₂～C₆アルケニルヘテロアリール；場合により置換されているC₃～C₈シクロアルキル；場合により置換されているヘテロシクロアルキル；場合により置換されているC₃～C₈シクロアルキルC₁～C₆アルキル；場合により置換されているC₁～C₆アルキルヘテロシクロアルキル及び場合により置換されているヘテロシクロアルキルC₁～C₆アルキルから選択され；R⁶及びR⁷は、場合により置換されているC₂～C₆アルケニル；場合により置換されているC₂～C₆アルキニル；場合により置換されているフェニル（例えば、3-メトキシフェニル）のような場合により置換されているアリール；場合により置換されているC₁～C₆アルキルアリール；場合により置換されているアリールC₁～C₆アルキル；場合により置換されているヘテロアリール；場合により置換されているアルキルヘテロアリール；場合により置換されているヘテロアリールC₁～C₆アルキル；場合により置換されているC₂～C₆アルケニルアリール；場合により置換されているアリールC₂～C₆アルケニル；場合により置換されているC₂～C₆アルケニルヘテロアリール；場合により置換されているC₃～C₈シクロアルキル；場合により置換されているヘテロシクロアルキルC₁～C₆アルキル；場合により置換されているC₁～C₆アルキルヘテロシクロアルキル及び場合により置換されているヘテロシクロアルキルC₁～C₆アルキルから独立して選択されるか、或いは-C H R⁶R⁷は、場合により置換されているヘテロアリール、場合により置換されているシクロアルキル及び場合により置換されているヘテロシクロアルキルから選択される場合により置換されている環を形成し；nは、0～5から選択される整数であり；pは、3～5から選択される整数であり；G₄は、H；場合により置換されているアシル；場合により置換されているアシルアミノ（例えば、4-フルオロフェノキシアセトアミド）；場合により置換されているアシルC₁～C₆アルキル（例えば、N-(ピリジン-2-イルメチル)アセトアミド又は(4-メチルピペラジン-1-イル)-4-オキソブチル又は(4-メチルピペラジン-1-イル)-4-オキソブチル又は2-モルホリン-4-イル-2-オキソエチル又は(4-ベンジルピペラジン-1-イル)-2-オキソエチル又はN,N-ジメチルアセトアミド）；場合により置換されているアミノアルキル（例えば、3-(ジエチルアミノ)プロピル又はエチルアセトアミド又はベンジルメチルアミノメチル）；場合により置換されているペンチル（例えばイソペンチル）若しくは場合により置換されているメチル（例えば、メチル）のような、場合により置換されているC₁～C₆アルキル、又は場合により置換されているメトキシ（例えば、2-メトキシエチル若しくは3-メトキシプロピル）、場合により置換されているエトキシ（例えば、3-エトキシプロピル）のような場合により置換されているアルコキシC₁～C₆アルキルのような、場合により置換されているヘテロアルキル；場合により置換されているC₂～C₆アルケニル；場合により置換されているC₂～C₆アルキニル；場合により置換されているアリール；場合により置換されているC₁～C₆アルキルアリール；場合により置換されて

いるフェニルメチル（例えば、安息香酸メチル若しくはベンジル若しくは2 - モルホリニル - 4 - イルベンジル若しくは2 - モルホリニル - 4 - イルメチル - ベンジル若しくは(4 - メチルピペラジン - 1 - イル)メチルベンジル若しくは3 , 5 - ジメチルオキシベンジル若しくは3 - フエノキシベンジル若しくは4 - メトキシベンジル若しくは2 - メトキシベンジル若しくは3 - メトキシベンジル若しくは4 - クロロベンジル若しくはメチルフェニルアセトアミドメチル）又は場合により置換されているフェニルエチル（例えば、2 - フエニルエチル、4 - メトキシフェニルエチル若しくは3 - メトキシフェニルエチル若しくは4 - ヒドロキシフェニルエチル）のような、場合により置換されているアリールC₁ ~ C₆アルキル；場合により置換されているヘテロアリール；場合により置換されているC₁ ~ C₆アルキルヘテロアリール；場合により置換されているチオフェニルメチル（例えば、チオフェン - 2 - イルメチル若しくは2 - メチル - 1 , 3 - チアゾール - 4 - イル）のような場合により置換されているチオフェニルC₁ ~ C₆アルキルのような、又は場合により置換されているイミダゾリルエチル（例えば、イミダゾール - 4 - イルエチル）のような場合により置換されているイミダゾリルC₁ ~ C₆アルキルのような、又は場合により置換されているインドリルエチル（例えば、インドール - 3 - イルエチル）のような場合により置換されているインドリルC₁ ~ C₆アルキルのような、又は場合により置換されているフラニルメチル（例えば、フラン - 2 - イルメチル）のような場合により置換されているフラニルC₁ ~ C₆アルキルのような、又は場合により置換されているベンゾジオキソリルメチル（例えば、1 , 3 - ベンゾジオキソール - 5 - イルメチル）のような場合により置換されているベンゾジオキソリルC₁ ~ C₆アルキルのような、又は場合により置換されているピリジニルメチル（例えば、ピリジン - 3 - イルメチル若しくはピリジン - 2 - イルメチル若しくは6 - モルホリン - 4 - イルピリジン - 2 - イル）メチル）、場合により置換されているピリジニルエチル（例えば、2 - ピリジン - 2 - イルエチル）のような場合により置換されているピリジニルC₁ ~ C₆アルキルのような、又は場合により置換されているオキサジアゾリルメチル（例えば、3 - エチル - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 5 - イルメチル）のような場合により置換されているオキサジアゾリルC₁ ~ C₆アルキルのような、又は場合により置換されているピラジニルメチル（例えば、ピラジン - 2 - イルメチル）のような場合により置換されているピラジニルC₁ ~ C₆アルキルのような、又は場合により置換されているピラゾリルメチル（例えば、1 - メチルピラゾール - 3 - イルメチル）のような場合により置換されているピラゾリルC₁ ~ C₆アルキルのような、場合により置換されているヘテロアリールC₁ ~ C₆アルキル；場合により置換されているC₂ ~ C₆アルケニルアリール；場合により置換されているアリールC₂ ~ C₆アルケニル；場合により置換されているフェニルC₂ ~ C₆アルキニル（例えば、3 - フエニルプロパ - 2 - イン - 1 - イル）のような場合により置換されているアリールC₂ ~ C₆アルキニル；場合により置換されているC₂ ~ C₆アルケニルヘテロアリール；場合により置換されているヘテロアリールC₂ ~ C₆アルケニル；場合により置換されているC₃ ~ C₈シクロアルキル；場合により置換されているモルホリニル（例えば、5 - モルホリン - 4 - イル）又は場合により置換されているピペラジニル（例えば、4 - メチルピペラジニル）又は場合により置換されているピペリジニル（例えば、4 - メチルベンジル）ピペリジン - 4 - イル）のような、場合により置換されているヘテロシクロアルキル；場合により置換されているC₁ ~ C₆アルキルC₃ ~ C₈シクロアルキル；場合により置換されているシクロヘキシリルC₁ ~ C₆アルキル（例えば、シクロヘキシリルメチル）のような場合により置換されているC₃ ~ C₈シクロアルキルC₁ ~ C₆アルキル；場合により置換されているC₁ ~ C₆アルキルヘテロシクロアルキル及び、場合により置換されているモルホリニルプロピル（例えば、3 - (モルホリン - 4 - イル)プロピル若しくは3 - モルホリン - 4 - イル - 3 - フエニルプロピル）、場合により置換されているモルホリニルエチル（例えば、2 - モルホリン - 4 - イルエチル若しくは2 - モルホリン - 4 - イル - 2 - フエニルエチル）、場合により置換されているモルホリニルメチル（例えば、4 - メチルモルホリン - 2 - イル）のような、場合により置換されているモルホリニルC₁ ~ C₆アルキルのような、又は場合により

置換されているピペラジニルエチル（例えば、2 - (4 - アセチルピペラジン - 1 - イル)エチル若しくは2 - (4 - ヘキサノイルピペラジン - 1 - イル)エチル）のような場合により置換されているピペラジニルC₁ ~ C₆アルキルのような、又は場合により置換されているピロリジニルプロピル（例えば、3 - (2 - オキソピロリジン - 1 - イル)プロピル）のような場合により置換されているピロリジニルC₁ ~ C₆アルキルのような、又は場合により置換されているテトラヒドロフラニルメチル（例えば、テトラヒドロフラン - 2 - イルメチル）のような場合により置換されているテトラヒドロフラニルC₁ ~ C₆アルキルのような、又は場合により置換されているテトラヒドロピラニルエチル（例えば、2 - テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - イルエチル）のような場合により置換されているテトラヒドロピラニルC₁ ~ C₆アルキルのような、又は場合により置換されているピペリジンメチル（例えば、ピペリジン - 4 - イルメチル、ピペリジン - 3 - イルメチル、1 - メチルピペリジン - 4 - イルメチル、1 - tert - プチル - 1 - カルボキシレートピペリジン - 4 - イルメチルの）ような場合により置換されているピリジニルC₁ ~ C₆アルキルのような、場合により置換されているヘテロシクロアルキルC₁ ~ C₆アルキルから選択され；G₅は、H；場合により置換されているC₁ ~ C₆アルキル；場合により置換されているC₂ ~ C₆アルケニル；場合により置換されているC₂ ~ C₆アルキニル；場合により置換されているアリール；場合により置換されているC₁ ~ C₆アルキル；場合により置換されているヘテロアリール；場合により置換されているC₁ ~ C₆アルキルヘテロアリール；場合により置換されているヘテロアリールC₁ ~ C₆アルキル；場合により置換されているC₂ ~ C₆アルケニルアリール；場合により置換されているアリールC₂ ~ C₆アルケニル；場合により置換されているC₂ ~ C₆アルケニルヘテロアリール；場合により置換されているヘテロアリールC₂ ~ C₆アルケニル；場合により置換されているC₃ ~ C₈シクロアルキル；場合により置換されているヘテロシクロアルキル；場合により置換されているC₁ ~ C₆アルキルC₃ ~ C₈シクロアルキル；場合により置換されているC₃ ~ C₈シクロアルキルC₁ ~ C₆アルキル；場合により置換されているC₁ ~ C₆アルキルヘテロシクロアルキル及び場合により置換されているヘテロシクロアルキルC₁ ~ C₆アルキルから選択される）で示されるピラゾロピリジン誘導体、並びにその薬学的に許容される塩及び薬学的に活性な誘導体を提供する。

【手続補正5】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0129

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0129】

分取HPLC精製は、Prep Nova-Pak（登録商標）HR C1 86 μm、60、40 × 30 mm（最大100mg）又はXTerra（登録商標）Prep MS C8、10 μm、50 × 300 mm（最大1g）のカラムを備えたHPLC Waters Prep LC 4000 Systemで実施する。全ての精製は、MeCN / H₂O 0.09% TFAの勾配；UV検出254 nm及び220 nm；流速2.0 mL/min（最大50mg）で実施する。TLC分析は、Merck Precoated 60 F₂₅₄プレートで実施する。フラッシュクロマトグラフィーによる精製は、溶離剤としてシクロヘキサン / EtOAc又はDCM / MeOH混合物を使用して、SiO₂支持体で実施する。