

【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1月27日(2011.1.27)

【公表番号】特表2010-515756(P2010-515756A)

【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2009-545699(P2009-545699)

【国際特許分類】

C 07 D 237/24 (2006.01)

A 61 P 43/00 (2006.01)

A 61 P 7/06 (2006.01)

A 61 P 9/10 (2006.01)

A 61 K 31/50 (2006.01)

C 07 D 401/10 (2006.01)

A 61 K 31/501 (2006.01)

C 07 D 417/06 (2006.01)

C 07 D 403/04 (2006.01)

C 07 D 409/04 (2006.01)

【F I】

C 07 D 237/24 C S P

A 61 P 43/00 1 1 1

A 61 P 7/06

A 61 P 9/10

A 61 K 31/50

C 07 D 401/10

A 61 K 31/501

C 07 D 417/06

C 07 D 403/04

C 07 D 409/04

【手続補正書】

【提出日】平成22年12月3日(2010.12.3)

【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

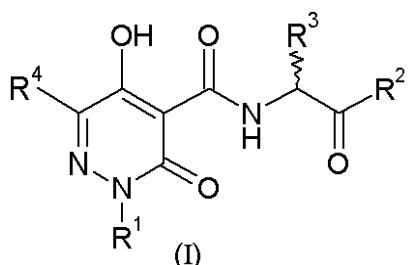
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)：

【化1】



[式中、

R^1 は、水素、 $-NR^5R^6$ 、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_2 \sim C_{10}$ アルケニル、 $C_2 \sim C_{10}$ アルキニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル- $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_5 \sim C_8$ シクロアルケニル、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル- $C_5 \sim C_8$ シクロアルケニル、 $C_3 \sim C_8$ ヘテロシクロアルキル、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル- $C_3 \sim C_8$ ヘテロシクロアルケニル、アリール、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル-アリール、ヘテロアリールおよび $C_1 \sim C_{10}$ アルキル-ヘテロアリールからなる群から選択され；

R^4 は、水素、 $COOR^9$ 、 $CONR^7R^8$ 、 $-NR^5R^6$ 、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_2 \sim C_{10}$ アルケニル、 $C_2 \sim C_{10}$ アルキニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル- $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_5 \sim C_8$ シクロアルケニル、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル- $C_5 \sim C_8$ シクロアルケニル、 $C_3 \sim C_8$ ヘテロシクロアルキル、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル- $C_3 \sim C_8$ ヘテロシクロアルケニル、アリール、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル-アリール、ヘテロアリールおよび $C_1 \sim C_{10}$ アルキル-ヘテロアリールからなる群から選択され；

R^2 は、 $-NR^7R^8$ または $-OR^9$ であり；

R^3 は、Hまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^5 および R^6 は、各々、水素、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル- $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ヘテロシクロアルキル、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル- $C_3 \sim C_8$ ヘテロシクロアルキル、アリール、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル-アリール、ヘテロアリール、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル-ヘテロアリール、 $-CO(C_1 \sim C_4$ アルキル)、 $-CO(C_3 \sim C_6$ シクロアルキル)、 $-CO(C_3 \sim C_6$ ヘテロシクロアルキル)、 $-CO(アリール)$ 、 $-CO(ヘテロアリール)$ 、および $-SO_2(C_1 \sim C_4$ アルキル)からなる群から独立して選択されるか；または、 R^5 および R^6 は、それらが結合している窒素と一緒にになって、酸素、窒素および硫黄からなる群から選択されるヘテロ原子をもう1個含有していてもよい5員または6員または7員飽和環を形成し；

R^7 および R^8 は、各々、水素、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_2 \sim C_{10}$ アルケニル、 $C_2 \sim C_{10}$ アルキニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ヘテロシクロアルキル、アリールおよびヘテロアリールからなる群から独立して選択され；

R^9 は、Hまたは陽イオンであるか、あるいは、非置換であるか、または $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールおよびヘテロアリールからなる群から独立して選択される1個またはそれ以上の置換基で置換されている $C_1 \sim C_{10}$ アルキルである；

ここで、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 の炭素またはヘテロ原子は、非置換であるか、または、可能な場合には、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、ハロゲン、 $-OR^{10}$ 、 $-NR^5R^6$ 、シアノ、ニトロ、 $-C(O)R^{10}$ 、 $-C(O)OR^{10}$ 、 $-SR^{10}$ 、 $-S(O)R^{10}$ 、 $-S(O)_2R^{10}$ 、 $-NR^5R^6$ 、 $-CONR^5R^6$ 、 $-N(R^5)C(O)R^{10}$ 、 $-N(R^5)C(O)OR^{10}$ 、 $-OC(O)NR^5R^6$ 、 $-N(R^5)C(O)NR^5R^6$ 、 $-SO_2NR^5R^6$ 、 $-N(R^5)SO_2R^{10}$ 、 $C_1 \sim C_{10}$ アルケニル、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ ヘテロシクロアルキル、アリールおよびヘテロアリール基からなる群から独立して選択される1個またはそれ以上の置換基で置換されており；ここで、 R^5 および R^6 は、上記定義と同じであり、そして、 R^{10} は、水素、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_2 \sim C_{10}$ アルケニル、 $C_2 \sim C_{10}$ アルキニル、 $-CO(C_1 \sim C_4$ アルキル)、 $-CO(アリール)$ 、 $-CO(ヘテロアリール)$ 、 $-CO(C_3 \sim C_6$ シクロアルキル)、 $-CO(C_3 \sim C_6$ ヘテロシクロアルキル)、 $-SO_2(C_1 \sim C_4$ アルキル)、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ヘテロシクロアルキル、 $C_6 \sim C_{14}$ アリール、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル-アリール、ヘテロアリール、または $C_1 \sim C_{10}$ アルキル-ヘテロアリールである]

で示される化合物またはその医薬上許容される塩もしくは溶媒和物。

【請求項2】

R^1 が、水素、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_2 \sim C_{10}$ アルケニル、 $C_2 \sim C_{10}$ アルキニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル- $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_5 \sim C_8$ シクロアルケニル、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル- $C_5 \sim C_8$ シクロアルケニル、 $C_3 \sim C_8$ ヘテロシクロアルキル、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル- $C_3 \sim C_8$ ヘテロシクロアルキル、アリール、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキ

ル - アリール、ヘテロアリールおよびC₁ ~ C₁₀アルキル - ヘテロアリールからなる群から選択され；

R⁴が、水素、COOR⁹、CONR⁷R⁸、-NR⁵R⁶、C₁ ~ C₁₀アルキル、C₂ ~ C₁₀アルケニル、C₂ ~ C₁₀アルキニル、C₃ ~ C₈シクロアルキル、C₁ ~ C₁₀アルキル - C₃ ~ C₈シクロアルキル、C₅ ~ C₈シクロアルケニル、C₁ ~ C₁₀アルキル - C₅ ~ C₈シクロアルケニル、C₃ ~ C₈ヘテロシクロアルキル、C₁ ~ C₁₀アルキル - C₃ ~ C₈ヘテロシクロアルキル、アリール、C₁ ~ C₁₀アルキル - アリール、ヘテロアリールおよびC₁ ~ C₁₀アルキル - ヘテロアリールからなる群から選択され；

R²が、-NR⁷R⁸、-OR⁹であり；

R³が、HまたはC₁ ~ C₄アルキルであり；

R⁹が、Hまたは陽イオンであるか、あるいは、非置換であるか、またはC₃ ~ C₆シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、およびヘテロアリールからなる群から独立して選択される1個またはそれ以上の置換基で置換されているC₁ ~ C₁₀アルキルである；

ここで、R¹、R²、R³、R⁴、R⁹の炭素またはヘテロ原子は、非置換であるか、または、可能な場合には、C₁ ~ C₆アルキル、アリール、ヘテロアリール、ハロゲン、-OR¹⁰、-NR⁵R⁶、シアノ、ニトロ、-C(O)R¹⁰、-C(O)OR¹⁰、-SR¹⁰、-S(O)R¹⁰、-S(O)₂R¹⁰、-NR⁵R⁶、-CONR⁵R⁶、-N(R⁵)C(O)R¹⁰、-N(R⁵)C(O)OR¹⁰、-OC(O)NR⁵R⁶、-N(R⁵)C(O)NR⁵R⁶、-SO₂NR⁵R⁶、-N(R⁵)SO₂R¹⁰、C₁ ~ C₁₀アルケニル、C₁ ~ C₁₀アルキニル、C₃ ~ C₆シクロアルキル、C₃ ~ C₆ヘテロシクロアルキル、アリールおよびヘテロアリール基からなる群から独立して選択される1個またはそれ以上の置換基で置換されており、ここで、R⁵およびR⁶は、上記定義と同じであり、そして、R¹⁰は、水素、C₁ ~ C₁₀アルキル、C₂ ~ C₁₀アルケニル、C₂ ~ C₁₀アルキニル、-CO(C₁ ~ C₄アルキル)、-CO(アリール)、-CO(ヘテロアリール)、-CO(C₃ ~ C₆シクロアルキル)、-CO(C₃ ~ C₆ヘテロシクロアルキル)、-SO₂(C₁ ~ C₄アルキル)、C₃ ~ C₈シクロアルキル、C₃ ~ C₈ヘテロシクロアルキル、C₆ ~ C₁₄アリール、C₁ ~ C₁₀アルキル - アリール、ヘテロアリール、またはC₁ ~ C₁₀アルキル - ヘテロアリールである、

請求項1記載の化合物またはその医薬上許容される塩もしくは溶媒和物。

【請求項3】

R¹が、水素、C₁ ~ C₁₀アルキル、C₂ ~ C₁₀アルケニル、C₂ ~ C₁₀アルキニル、C₃ ~ C₈シクロアルキル、C₁ ~ C₁₀アルキル - C₃ ~ C₈シクロアルキル、C₅ ~ C₈シクロアルケニル、C₁ ~ C₁₀アルキル - C₅ ~ C₈シクロアルケニル、C₃ ~ C₈ヘテロシクロアルキル、C₁ ~ C₁₀アルキル - C₃ ~ C₈ヘテロシクロアルキル、アリール、C₁ ~ C₁₀アルキル - アリール、ヘテロアリールおよびC₁ ~ C₁₀アルキル - ヘテロアリールからなる群から選択され；

R⁴が、水素、COOR⁹、CONR⁷R⁸、-NR⁵R⁶、C₁ ~ C₁₀アルキル、C₂ ~ C₁₀アルケニル、C₂ ~ C₁₀アルキニル、C₃ ~ C₈シクロアルキル、C₁ ~ C₁₀アルキル - C₃ ~ C₈シクロアルキル、C₅ ~ C₈シクロアルケニル、C₁ ~ C₁₀アルキル - C₅ ~ C₈シクロアルケニル、C₃ ~ C₈ヘテロシクロアルキル、C₁ ~ C₁₀アルキル - C₃ ~ C₈ヘテロシクロアルキル、アリール、C₁ ~ C₁₀アルキル - アリール、ヘテロアリールおよびC₁ ~ C₁₀アルキル - ヘテロアリールからなる群から選択され；

R²が、-NR⁷R⁸、-OR⁹であり；

R³が、Hであり；

R⁹が、Hまたは陽イオンである；

ここで、R¹、R²、R³、R⁴の炭素またはヘテロ原子は、非置換であるか、または、可能な場合には、C₁ ~ C₆アルキル、アリール、ヘテロアリール、ハロゲン、-OR¹⁰、-NR⁵R⁶、シアノ、ニトロ、-C(O)R¹⁰、-C(O)OR¹⁰、-SR¹⁰、-S(O)R¹⁰、-S(O)₂R¹⁰、-NR⁵R⁶、-CONR⁵R⁶、-N(R⁵)C(O)R¹⁰、-N(R⁵)C(O)OR¹⁰、-OC(O)NR⁵R⁶、-N(R⁵)C(O)NR⁵R⁶、-SO₂NR⁵R⁶、-N(R⁵)

SO_2R^{10} 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$ アルケニル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$ アルキニル、 $\text{C}_3 \sim \text{C}_6$ シクロアルキル、 $\text{C}_3 \sim \text{C}_6$ ヘテロシクロアルキル、アリールまたはヘテロアリール基から独立して選択される1個またはそれ以上の置換基で置換されており、ここで、 R^5 および R^6 は、上記定義と同じであり、そして、 R^{10} は、水素、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$ アルキル、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_{10}$ アルケニル、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_{10}$ アルキニル、 $-\text{CO}(\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル)、 $-\text{CO}$ (アリール)、 $-\text{CO}$ (ヘテロアリール)、 $-\text{CO}(\text{C}_3 \sim \text{C}_6$ シクロアルキル)、 $-\text{CO}(\text{C}_3 \sim \text{C}_6$ ヘテロシクロアルキル)、 $-\text{SO}_2(\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル)、 $\text{C}_3 \sim \text{C}_8$ シクロアルキル、 $\text{C}_3 \sim \text{C}_8$ ヘテロシクロアルキル、 $\text{C}_6 \sim \text{C}_{14}$ アリール、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$ アルキル-アリール、ヘテロアリール、および $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$ アルキル-ヘテロアリールである。

請求項2記載の化合物またはその医薬上許容される塩。

【請求項4】

R^1 が、水素、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$ アルキル、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_{10}$ アルケニル、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_{10}$ アルキニル、 $\text{C}_3 \sim \text{C}_8$ シクロアルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$ アルキル- $\text{C}_3 \sim \text{C}_8$ シクロアルキル、 $\text{C}_5 \sim \text{C}_8$ シクロアルケニル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$ アルキル- $\text{C}_5 \sim \text{C}_8$ シクロアルケニル、 $\text{C}_3 \sim \text{C}_8$ ヘテロシクロアルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$ アルキル- $\text{C}_3 \sim \text{C}_8$ ヘテロシクロアルキル、アリール、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$ アルキル-アリール、ヘテロアリールおよび $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$ アルキル-ヘテロアリールからなる群から選択され；

R^4 が、水素、 COOR^9 、 CONR^7R^8 、 $-\text{NR}^5\text{R}^6$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$ アルキル、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_{10}$ アルケニル、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_{10}$ アルキニル、 $\text{C}_3 \sim \text{C}_8$ シクロアルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$ アルキル- $\text{C}_3 \sim \text{C}_8$ シクロアルキル、 $\text{C}_5 \sim \text{C}_8$ シクロアルケニル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$ アルキル- $\text{C}_5 \sim \text{C}_8$ シクロアルケニル、 $\text{C}_3 \sim \text{C}_8$ ヘテロシクロアルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$ アルキル- $\text{C}_3 \sim \text{C}_8$ ヘテロシクロアルキル、アリール、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$ アルキル-アリール、ヘテロアリールおよび $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$ アルキル-ヘテロアリールからなる群から選択され；

R^2 が、 $-\text{OR}^9$ であり；

R^3 が、Hであり；

R^9 が、Hまたは陽イオンである；

ここで、 R^1 、 R^4 の炭素またはヘテロ原子は、非置換であるか、または、可能な場合には、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、ハロゲン、 $-\text{OR}^{10}$ 、 $-\text{NR}^5\text{R}^6$ 、シアノ、ニトロ、 $-\text{C(O)R}^{10}$ 、 $-\text{C(O)OR}^{10}$ 、 $-\text{SR}^{10}$ 、 $-\text{S(O)R}^{10}$ 、 $-\text{S(O)}_2\text{R}^{10}$ 、 $-\text{NR}^5\text{R}^6$ 、 $-\text{CONR}^5\text{R}^6$ 、 $-\text{N(R}^5)\text{C(O)R}^{10}$ 、 $-\text{N(R}^5)\text{C(O)OR}^{10}$ 、 $-\text{OC(O)NR}^5\text{R}^6$ 、 $-\text{N(R}^5)\text{C(O)NR}^5\text{R}^6$ 、 $-\text{SO}_2\text{NR}^5\text{R}^6$ 、 $-\text{N(R}^5)\text{SO}_2\text{R}^{10}$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$ アルケニル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$ アルキニル、 $\text{C}_3 \sim \text{C}_6$ シクロアルキル、 $\text{C}_3 \sim \text{C}_6$ ヘテロシクロアルキル、アリールまたはヘテロアリール基から独立して選択される1個またはそれ以上の置換基で置換されており、ここで、 R^5 および R^6 は、上記定義と同じであり、そして、 R^{10} は、水素、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$ アルキル、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_{10}$ アルケニル、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_{10}$ アルキニル、 $-\text{CO}(\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル)、 $-\text{CO}$ (アリール)、 $-\text{CO}$ (ヘテロアリール)、 $-\text{CO}(\text{C}_3 \sim \text{C}_6$ シクロアルキル)、 $-\text{CO}(\text{C}_3 \sim \text{C}_6$ ヘテロシクロアルキル)、 $-\text{SO}_2(\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル)、 $\text{C}_3 \sim \text{C}_8$ シクロアルキル、 $\text{C}_3 \sim \text{C}_8$ ヘテロシクロアルキル、 $\text{C}_6 \sim \text{C}_{14}$ アリール、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$ アルキル-アリール、ヘテロアリール、および $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$ アルキル-ヘテロアリールである。

請求項2記載の化合物またはその医薬上許容される塩。

【請求項5】

R^1 が、2-フルオロ-4-ブロモベンジル、4-ブロモベンジル、4-(ハロフェニル)ベンジル、2-フルオロ-4-(ハロフェニル)ベンジル、2-フルオロ-4-トリフルオロメチルベンジル、4-トリフルオロベンジル、または2-フルオロ-4-($\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルコキシフェニル)ベンジルであり；

R^2 が、OHであり；

R^3 が、Hであり；

R^4 が、イソプロピル、t-ブチルまたはシクロヘキシルである、

請求項1記載の化合物またはその医薬上許容される塩。

【請求項 6】

N - { [5 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 3 - オキソ - 2 - (フェニルメチル) - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル]カルボニル } グリシン ;

N - { [5 - ヒドロキシ - 3 - オキソ - 6 - フェニル - 2 - (フェニルメチル) - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル]カルボニル } グリシン ;

N - { [5 - ヒドロキシ - 6 - (1 - メチルエチル) - 3 - オキソ - 2 - (フェニルメチル) - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル]カルボニル } グリシン ;

N - [(5 - ヒドロキシ - 3 - オキソ - 6 - フェニル - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル)カルボニル] グリシン ;

N - [(2 - { [4 - (1 , 1 - ジメチルエチル)フェニル]メチル } - 5 - ヒドロキシ - 3 - オキソ - 6 - フェニル - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル)カルボニル] グリシン ;

N - { [5 - ヒドロキシ - 3 - オキソ - 6 - フェニル - 2 - (2 - フェニルエチル) - 2 , 3 - ジヒドロピリダジン - 4 - イル]カルボニル } グリシン ;

N - { [2 - (2 - シクロプロピルエチル) - 5 - ヒドロキシ - 3 - オキソ - 6 - フェニル - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル]カルボニル } グリシン ;

N - { [2 - (2 - クロロベンジル) - 5 - ヒドロキシ - 3 - オキソ - 6 - フェニル - 2 , 3 - ジヒドロピリダジン - 4 - イル]カルボニル } グリシン ;

N - { [5 - ヒドロキシ - 3 - オキソ - 2 - (フェニルメチル) - 6 - (トリフルオロメチル) - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル]カルボニル } グリシン ;

N - { [6 - シクロヘキシル - 5 - ヒドロキシ - 3 - オキソ - 2 - (フェニルメチル) - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル]カルボニル } グリシン ;

N - [(6 - シクロヘキシル - 2 - { [4 - (1 , 1 - ジメチルエチル)フェニル]メチル } - 5 - ヒドロキシ - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル)カルボニル] グリシン ;

N - ({ 2 - [(2 - クロロフェニル)メチル] - 6 - シクロヘキシル - 5 - ヒドロキシ - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル } カルボニル) グリシン ;

N - [(2 , 6 - ジシクロヘキシル - 5 - ヒドロキシ - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル)カルボニル] グリシン ;

N - { [2 - { [4 - (1 , 1 - ジメチルエチル)フェニル]メチル } - 5 - ヒドロキシ - 6 - (1 - メチルエチル) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル]カルボニル } グリシン ;

N - { [2 - [(2 - クロロフェニル)メチル] - 5 - ヒドロキシ - 6 - (1 - メチルエチル) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル]カルボニル } グリシン ;

N - { [2 - [(3 , 5 - ジフルオロフェニル)メチル] - 5 - ヒドロキシ - 6 - (1 - メチルエチル) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル]カルボニル } グリシン ;

N - { [2 - (4 - ビフェニリルメチル) - 5 - ヒドロキシ - 6 - (1 - メチルエチル) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル]カルボニル } グリシン ;

N - { [2 - (2 - シクロヘキシルエチル) - 5 - ヒドロキシ - 6 - (1 - メチルエチル) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル]カルボニル } ;

N - { [2 - (4 - ビフェニリルメチル) - 6 - (4 - フルオロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル]カルボニル } グリシン ;

N - [(6 - (4 - クロロフェニル) - 2 - { [4 - (1 , 1 - ジメチルエチル)フェニル]メチル } - 5 - ヒドロキシ - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル)カルボニル] グリシン ;

N - { [2 - (4 - ビフェニリルメチル) - 6 - (4 - クロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル]カルボニル } グリシン ;

N - { [2 - [(2 - クロロフェニル)メチル] - 6 - (4 - フルオロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル]カルボニル } グリシン ;

N - ({ 6 - (4 - クロロフェニル) - 2 - [(2 - クロロフェニル)メチル] - 5 - ヒドロキシ - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル } カルボニル) グリシン ;

N - { [6 - (4 - クロロフェニル) - 2 - (2 - シクロヘキシルエチル) - 5 - ヒドロキシ - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル]カルボニル } グリシン ;
N - { [2 - (2 - シクロプロピルエチル) - 6 - (4 - フルオロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル]カルボニル } グリシン ;
N - [(6 - [4 - (1 , 1 - ジメチルエチル)フェニル] - 2 - { [4 - (1 , 1 - ジメチルエチル)フェニル]メチル } - 5 - ヒドロキシ - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル)カルボニル]グリシン ;
N - ({ 2 - [(2 - クロロフェニル)メチル] - 6 - [4 - (1 , 1 - ジメチルエチル)フェニル] - 5 - ヒドロキシ - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル } カルボニル) グリシン ;
N - ({ 5 - ヒドロキシ - 6 - メチル - 2 - [(2 - ニトロフェニル)メチル] - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル } カルボニル) グリシン ;
N - [(6 - (4 - フルオロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 3 - オキソ - 2 - { [2 - (トリフルオロメチル)フェニル]メチル } - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル)カルボニル] グリシン ;
N - { [2 - [(2 - クロロフェニル)メチル] - 6 - (3 , 5 - ジフルオロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル] カルボニル } グリシン ;
N - ({ 2 - [(2 - クロロフェニル)メチル] - 5 - ヒドロキシ - 6 - [4 - (メチルオキシ) フェニル] - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル } カルボニル) グリシン ;
N - ({ 2 - [(3 , 5 - ジフルオロフェニル)メチル] - 5 - ヒドロキシ - 6 - [4 - (メチルオキシ) フェニル] - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル } カルボニル) グリシン ;
N - { [2 - [(2 - クロロフェニル)メチル] - 5 - ヒドロキシ - 6 - (4 - ヒドロキシフェニル) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル] カルボニル } グリシン ;
N - { [2 - [(3 , 5 - ジフルオロフェニル)メチル] - 5 - ヒドロキシ - 6 - (4 - ヒドロキシフェニル) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル] カルボニル } グリシン ;
N - [(5 - ヒドロキシ - 6 - [3 - (メチルオキシ) フェニル] - 3 - オキソ - 2 - { [2 - (トリフルオロメチル)フェニル]メチル } - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル) カルボニル] グリシン ;
N - ({ 2 - [(2 - クロロフェニル)メチル] - 5 - ヒドロキシ - 6 - [3 - (メチルオキシ) フェニル] - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル } カルボニル) グリシン ;
N - ({ 2 - [(2 - クロロフェニル)メチル] - 5 - ヒドロキシ - 6 - [2 - (メチルオキシ) フェニル] - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル } カルボニル) グリシン ;
N - { [2 - [(2 , 6 - ジクロロフェニル)メチル] - 5 - ヒドロキシ - 6 - (1 - メチルエチル) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル] カルボニル } グリシン ;
N - { [2 - [(4 - フルオロフェニル)メチル] - 5 - ヒドロキシ - 6 - (1 - メチルエチル) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル] カルボニル } グリシン ;
N - [(5 - ヒドロキシ - 6 - (1 - メチルエチル) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル) カルボニル] グリシン ;
N - { [2 - [(3 - シアノフェニル)メチル] - 5 - ヒドロキシ - 6 - (1 - メチルエチル) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル] カルボニル } グリシン ;
N - ({ 5 - ヒドロキシ - 6 - (1 - メチルエチル) - 2 - [(2 - ニトロフェニル)メチル] - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル } カルボニル) グリシン ;
N - { [2 - [(2 - フルオロフェニル)メチル] - 5 - ヒドロキシ - 6 - (1 - メチルエチル) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル } カルボニル } グリシン ;

N - { [2 - [(2 , 5 - ジフルオロフェニル) メチル] - 5 - ヒドロキシ - 6 - (1 - メチルエチル) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル] カルボニル } グリシン ;
 N - { [2 - [(2 - クロロフェニル) メチル] - 6 - (1 , 1 - ジメチルエチル) - 5 - ヒドロキシ - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル] カルボニル } グリシン ;
 N - { [2 - [(4 - プロモ - 2 - フルオロフェニル) メチル] - 5 - ヒドロキシ - 6 - (1 - メチルエチル) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル] カルボニル } グリシン ;
 N - { [2 - [(3 , 4 ' - ジフルオロ - 4 - ビフェニリル) メチル] - 5 - ヒドロキシ - 6 - (1 - メチルエチル) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル] カルボニル } グリシン ;
 N - { [2 - { [2 - フルオロ - 4 - (4 - ピリジニル) フェニル] メチル } - 5 - ヒドロキシ - 6 - (1 - メチルエチル) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル] カルボニル } グリシン ;
 N - { (6 - (1 , 1 - ジメチルエチル) - 2 - { [4 - (1 , 1 - ジメチルエチル) フェニル] メチル } - 5 - ヒドロキシ - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル] カルボニル } グリシン ;
 N - { [2 - [(3 - フルオロ - 4 - ビフェニリル) メチル] - 5 - ヒドロキシ - 6 - (1 - メチルエチル) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル] カルボニル } グリシン ;
 N - { [2 - { [3 - フルオロ - 4 ' - ニトロ - 4 - ビフェニリル) メチル] - 5 - ヒドロキシ - 6 - (1 - メチルエチル) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル] カルボニル } グリシン ;
 N - { { 6 - シクロヘキシル - 5 - ヒドロキシ - 2 - [(2 - メチルフェニル) メチル } - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル } カルボニル } グリシン ;
 N - { { 6 - シクロヘキシル - 2 - [(2 - フルオロフェニル) メチル] - 5 - ヒドロキシ - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル } カルボニル } グリシン ;
 N - { (6 - シクロヘキシル - 5 - ヒドロキシ - 3 - オキソ - 2 - { [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] メチル } - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル } カルボニル } グリシン ;
 N - { { 6 - シクロヘキシル - 2 - [(3 , 4 - ジクロロフェニル) メチル] - 5 - ヒドロキシ - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル } カルボニル } グリシン ;
 N - { [2 - { [3 - フルオロ - 4 ' - (メチルチオ) - 4 - ビフェニリル] メチル } - 5 - ヒドロキシ - 6 - (1 - メチルエチル) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル] カルボニル } グリシン ;
 N - { [2 - { [3 - フルオロ - 2 ' - (メチルオキシ) - 4 - ビフェニリル] メチル } - 5 - ヒドロキシ - 6 - (1 - メチルエチル) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル] カルボニル } グリシン ;
 4 ' - { [5 - { [(カルボキシメチル) アミノ] カルボニル } - 4 - ヒドロキシ - 3 - (1 - メチルエチル) - 6 - オキソ - 1 (6 H) - ピリダジニル] メチル } - 3 ' - フルオロ - 4 - ビフェニルカルボン酸 ;
 N - { [2 - [(2 - プロモフェニル) メチル] - 6 - (1 , 1 - ジメチルエチル) - 5 - ヒドロキシ - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル] カルボニル } グリシン ;
 N - { [2 - [(4 - プロモフェニル) メチル] - 5 - ヒドロキシ - 6 - (1 - メチルエチル) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル] カルボニル } グリシン ;
 N - { [2 - [(4 ' - フルオロ - 4 - ビフェニリル) メチル] - 5 - ヒドロキシ - 6 - (1 - メチルエチル) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル] カルボニル } グリシン ;

N - ({ 5 - ヒドロキシ - 6 - (1 - メチルエチル) - 2 - [(4 ' - ニトロ - 4 - ピフェニリル) メチル] - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル } カルボニル) グリシン ;

N - [(5 - ヒドロキシ - 6 - (1 - メチルエチル) - 3 - オキソ - 2 - { [4 ' - (トリフルオロメチル) - 4 - ピフェニリル] メチル } - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル) カルボニル] グリシン ;

N - [(5 - ヒドロキシ - 6 - (1 - メチルエチル) - 3 - オキソ - 2 - { [4 - (4 - ピリジニル) フェニル] メチル } - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル) カルボニル] グリシン ;

N - [(5 - ヒドロキシ - 6 - (1 - メチルエチル) - 2 - { [2 ' - (メチルオキシ) - 4 - ピフェニリル] メチル } - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル) カルボニル] グリシン ;

4 ' - { [5 - { [(カルボキシメチル) アミノ] カルボニル } - 4 - ヒドロキシ - 3 - (1 - メチルエチル) - 6 - オキソ - 1 (6 H) - ピリダジニル] メチル } - 4 - ピフェニルカルボン酸 ;

N - { [2 - (4 - ピフェニリルメチル) - 6 - (1 , 1 - ジメチルエチル) - 5 - ヒドロキシ - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル] カルボニル } グリシン ;

N - { [2 - [(2 - クロロフェニル) メチル] - 6 - [3 - (エチルオキシ) - 5 - フルオロフェニル] - 5 - ヒドロキシ - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル] カルボニル } グリシン ;

N - { [2 - (2 - ピフェニリルメチル) - 5 - ヒドロキシ - 6 - (1 - メチルエチル) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル] カルボニル } グリシン ;

N - { [2 - (3 - ピフェニリルメチル) - 5 - ヒドロキシ - 6 - (1 - メチルエチル) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル] カルボニル } グリシン ;

N - { [6 - (1 , 1 - ジメチルエチル) - 5 - ヒドロキシ - 2 - [(2 - メチルフェニル) メチル] - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル] カルボニル } グリシン ;

N - [(6 - (3 , 5 - ジフルオロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 3 - オキソ - 2 - { [2 - (トリフルオロメチル) フェニル] メチル } - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル) カルボニル] グリシン ;

N - { [6 - (3 , 5 - ジフルオロフェニル) - 2 - [(3 , 5 - ジフルオロフェニル) メチル] - 5 - ヒドロキシ - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル] カルボニル } グリシン ;

N - [(6 - (1 , 1 - ジメチルエチル) - 5 - ヒドロキシ - 3 - オキソ - 2 - { [2 - (トリフルオロメチル) フェニル] メチル } - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル) カルボニル] グリシン ;

N - { [2 - (1 , 3 - ベンゾチアゾール - 2 - イルメチル) - 5 - ヒドロキシ - 6 - (1 - メチルエチル) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル] カルボニル } グリシン ;

N - [(6 - (1 , 1 - ジメチルエチル) - 2 - { [4 - フルオロ - 2 - (トリフルオロメチル) フェニル] メチル } - 5 - ヒドロキシ - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル] カルボニル] グリシン ;

N - { [2 - [(2 - プロモフェニル) メチル] - 5 - ヒドロキシ - 6 - (1 - メチルエチル) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル] カルボニル } グリシン ;

N - { [2 - [(3 - プロモフェニル) メチル] - 5 - ヒドロキシ - 6 - (1 - メチルエチル) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル] カルボニル } グリシン ;

N - [(6 - [3 - (エチルオキシ) - 5 - フルオロフェニル] - 5 - ヒドロキシ - 3 - オキソ - 2 - { [2 - (トリフルオロメチル) フェニル] メチル } - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル] カルボニル] グリシン ;

N - { [5 - ヒドロキシ - 6 - (1 - メチルエチル) - 2 - { [4 - [6 - (4 - メチル - 1 - ピペラジニル) - 3 - ピリジニル] フェニル] メチル } - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ -

4 - ピリダジニル]カルボニル}グリシン；

N - { { 2 - [(3 , 5 - ジフルオロフェニル)メチル] - 6 - [3 - (エチルオキシ) - 5 - フルオロフェニル] - 5 - ヒドロキシ - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル } カルボニル)グリシン；

N - { [5 - ヒドロキシ - 6 - (1 - メチルエチル) - 3 - オキソ - 2 - ({ 4 - [2 - (1 - ピペラジニル) - 4 - ピリジニル]フェニル } メチル) - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル]カルボニル } グリシン；

N - { [2 - { [4 - (2 , 6 - ジフルオロ - 4 - ピリジニル)フェニル]メチル} - 5 - ヒドロキシ - 6 - (1 - メチルエチル) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル]カルボニル } グリシン；

N - { [5 - ヒドロキシ - 6 - (1 - メチルエチル) - 2 - ({ 4 - [2 - (メチルオキシ) - 4 - ピリジニル]フェニル } メチル) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル]カルボニル } グリシン；

N - { [2 - { (4 ' - フルオロ - 2 - ビフェニリル)メチル] - 5 - ヒドロキシ - 6 - (1 - メチルエチル) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル]カルボニル } グリシン；

N - { [2 - [(2 , 4 - ジフルオロフェニル)メチル] - 5 - ヒドロキシ - 6 - (1 - メチルエチル) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル]カルボニル } グリシン；

N - { [2 - [(3 , 4 - ジクロロフェニル)メチル] - 5 - ヒドロキシ - 6 - (1 - メチルエチル) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル]カルボニル } グリシン；

N - { [5 - ヒドロキシ - 6 - (1 - メチルエチル) - 2 - [(4 ' - ニトロ - 2 - ビフェニリル)メチル] - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル]カルボニル } グリシン；

N - [(5 - ヒドロキシ - 6 - (1 - メチルエチル) - 3 - オキソ - 2 - { [4 ' - (トリフルオロメチル) - 2 - ビフェニリル]メチル} - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル]カルボニル] グリシン；

N - { [2 - [(2 , 3 - ジクロロフェニル)メチル] - 5 - ヒドロキシ - 6 - (1 - メチルエチル) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル]カルボニル } グリシン；

2 ' - { [5 - { [(カルボキシメチル)アミノ]カルボニル} - 4 - ヒドロキシ - 3 - (1 - メチルエチル) - 6 - オキソ - 1 (6 H) - ピリダジニル]メチル } - 4 - ビフェニルカルボン酸；

N - [(5 - ヒドロキシ - 6 - (1 - メチルエチル) - 2 - { [2 ' - (メチルオキシ) - 2 - ビフェニリル]メチル} - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル]カルボニル] グリシン；

N - { [2 - [(4 - クロロ - 2 - フルオロフェニル)メチル] - 5 - ヒドロキシ - 6 - (1 - メチルエチル) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル]カルボニル } グリシン；

N - { [2 - [(2 , 5 - ジクロロフェニル)メチル] - 5 - ヒドロキシ - 6 - (1 - メチルエチル) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル]カルボニル } グリシン；

N - { [2 - [(2 , 4 - ジクロロフェニル)メチル] - 5 - ヒドロキシ - 6 - (1 - メチルエチル) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル]カルボニル } グリシン；

N - { [2 - [(4 ' - アミノ - 2 - ビフェニリル)メチル] - 5 - ヒドロキシ - 6 - (1 - メチルエチル) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル]カルボニル } グリシン；

N - { [2 - シクロヘキシル - 5 - ヒドロキシ - 6 - (1 - メチルエチル) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル]カルボニル } グリシン；

N - { [2 - シクロヘキシル - 6 - (1 , 1 - ジメチルエチル) - 5 - ヒドロキシ - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル]カルボニル } グリシン；

N - { [5 - ヒドロキシ - 6 - (1 - メチルエチル) - 2 - ({ 3 - [6 - (4 - メチル - 1 - ピペラジニル) - 3 - ピリジニル]フェニル } メチル) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ -

4 - ピリダジニル]カルボニル}グリシン；

N - { [5 - ヒドロキシ - 6 - (1 - メチルエチル) - 3 - オキソ - 2 - ({ 3 - [2 - (1 - ピペラジニル) - 4 - ピリジニル] フェニル } メチル) - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル] カルボニル } グリシン；

N - { [5 - ヒドロキシ - 6 - (1 - メチルエチル) - 3 - オキソ - 2 - ({ 2 - [2 - (1 - ピペラジニル) - 4 - ピリジニル] フェニル } メチル) - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル] カルボニル } グリシン；

2 , 2 ' - { { 1 - [(2 - クロロフェニル) メチル] - 4 - ヒドロキシ - 6 - オキソ - 1 , 6 - ジヒドロピリダジン - 3 , 5 - ジイル } ビス [(オキソメタンジイル) イミノ] } ジ酢酸；

N - { [5 - ヒドロキシ - 6 - (1 - メチルエチル) - 3 - オキソ - 2 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル) - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル] カルボニル } グリシン；

N - ({ 2 - [(2 - クロロフェニル) メチル] - 6 - [(エチルオキシ) カルボニル] - 5 - ヒドロキシ - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル } カルボニル) グリシン；

N - { [2 - { [2 - フルオロ - 4 - (トリフルオロメチル) フェニル] メチル } - 5 - ヒドロキシ - 6 - (1 - メチルエチル) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル] カルボニル } グリシン；

N - { [5 - ヒドロキシ - 6 - (1 - メチルエチル) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル] カルボニル } グリシン；

N - { [5 - ヒドロキシ - 6 - (1 H - インドール - 3 - イル) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル] カルボニル } グリシン；

N - { [5 - ヒドロキシ - 3 - オキソ - 6 - (2 - チエニル) - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 - ピリダジニル] カルボニル } グリシン

である、請求項 1 記載の化合物またはその医薬上許容される塩。

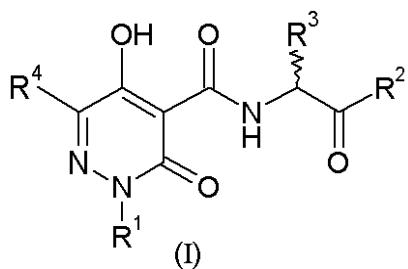
【請求項 7】

請求項 1 記載の式 (I) で示される化合物またはその塩もしくは溶媒和物、および 1 種類またはそれ以上の医薬上許容される担体、希釈剤および賦形剤を含む医薬組成物。

【請求項 8】

式 (I) :

【化 2】



[式中、

R¹ および R⁴ は、各々、水素、-NR⁵R⁶、C₁ ~ C₁₀ アルキル、C₂ ~ C₁₀ アルケニル、C₂ ~ C₁₀ アルキニル、C₃ ~ C₈ シクロアルキル、C₁ ~ C₁₀ アルキル - C₃ ~ C₈ シクロアルキル、C₅ ~ C₈ シクロアルケニル、C₁ ~ C₁₀ アルキル - C₅ ~ C₈ シクロアルケニル、C₃ ~ C₈ ヘテロシクロアルキル、C₁ ~ C₁₀ アルキル - C₃ ~ C₈ ヘテロシクロアルキル、アリール、C₁ ~ C₁₀ アルキル - アリール、ヘテロアリールまたは C₁ ~ C₁₀ アルキル - ヘテロアリールからなる群から独立して選択され；

R² は、-NR⁷R⁸ または -OR⁹ であり；

R³ は、H または C₁ ~ C₄ アルキルであり；

R⁵ および R⁶ は、各々、水素、C₁ ~ C₁₀ アルキル、C₃ ~ C₈ シクロアルキル、C₁ ~ C₁₀ アルキル - C₃ ~ C₈ シクロアルキル、C₃ ~ C₈ ヘテロシクロアルキル、C₁ ~ C₁₀ アルキル - C₃ ~ C₈ ヘテロシクロアルキル、アリール、C₁ ~ C₁₀ アルキル - アリール、ヘテロアリール、C₁ ~ C₁₀ アルキル - ヘテロアリール、-CO(C₁ ~ C₄ アルキル)、-CO(

$C_3 \sim C_6$ シクロアルキル)、-CO($C_3 \sim C_6$ ヘテロシクロアルキル)、-CO(アリール)、-CO(ヘテロアリール)、-SO₂($C_1 \sim C_4$ アルキル)からなる群から独立して選択されるか; または、R⁵およびR⁶は、それらが結合している窒素と一緒にになって、酸素、窒素および硫黄からなる群から選択されるヘテロ原子をもう1個含有していてもよい5員または6員または7員飽和環を形成し;

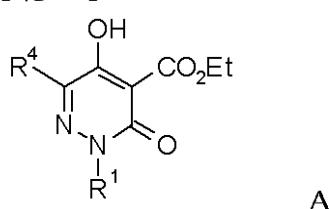
R⁷およびR⁸は、各々、水素、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_2 \sim C_{10}$ アルケニル、 $C_2 \sim C_{10}$ アルキニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ヘテロシクロアルキル、アリールおよびヘテロアリールからなる群から独立して選択され;

R⁹は、Hまたは陽イオンであるか、あるいは、非置換であるか、または $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールおよびヘテロアリールからなる群から独立して選択される1個またはそれ以上の置換基で置換されている $C_1 \sim C_{10}$ アルキルである;

ここで、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R⁷、R⁸、R⁹の炭素またはヘテロ原子は、非置換であるか、または、可能な場合には、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、ハロゲン、-OR¹⁰、-NR⁵R⁶、シアノ、ニトロ、-C(O)R¹⁰、-C(O)OR¹⁰、-SR¹⁰、-S(O)R¹⁰、-S(O)₂R¹⁰、-NR⁵R⁶、-CONR⁵R⁶、-N(R⁵)C(O)R¹⁰、-N(R⁵)C(O)OR¹⁰、-OC(O)NR⁵R⁶、-N(R⁵)C(O)NR⁵R⁶、-SO₂NR⁵R⁶、-N(R⁵)SO₂R¹⁰、 $C_1 \sim C_{10}$ アルケニル、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ ヘテロシクロアルキル、アリールまたはヘテロアリール基から独立して選択される1個またはそれ以上の置換基で置換されており、ここで、R⁵およびR⁶は、上記定義と同じであり、そして、R¹⁰は、水素、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_2 \sim C_{10}$ アルケニル、 $C_2 \sim C_{10}$ アルキニル、-CO($C_1 \sim C_4$ アルキル)、-CO(アリール)、-CO(ヘテロアリール)、-CO($C_3 \sim C_6$ シクロアルキル)、-CO($C_3 \sim C_6$ ヘテロシクロアルキル)、-SO₂($C_1 \sim C_4$ アルキル)、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ヘテロシクロアルキル、 $C_6 \sim C_{14}$ アリール、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル-アリール、ヘテロアリールおよび $C_1 \sim C_{10}$ アルキル-ヘテロアリールである]

で示される化合物の製造方法であって、慣用的な熱的条件下またはマイクロ波照射によって、2-メトキシエタノールのような適当な溶媒中にて、式A:

【化3】



[式中、R¹およびR⁴は、式(I)におけるこれらの基と同じである]

で示される化合物を-アミノ酸ナトリウムで処理して、R²が-OHである式(I)で示される化合物を形成することを含む方法。