

ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ

(12) ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ

(21)(22) Заявка: 2012139828/04, 17.02.2011

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:
18.02.2010 ЕР 10153927.8

(43) Дата публикации заявки: 27.03.2014 Бюл. № 9

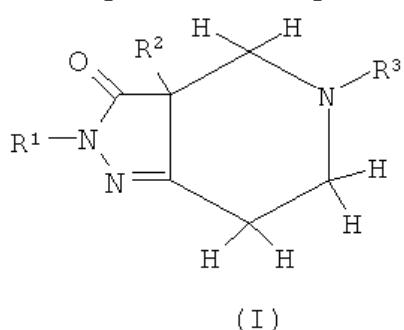
(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на
национальной фазе: 18.09.2012(86) Заявка РСТ:
IB 2011/050667 (17.02.2011)(87) Публикация заявки РСТ:
WO 2011/101804 (25.08.2011)Адрес для переписки:
109012, Москва, ул. Ильинка, 5/2, ООО
"Союзпатент"(71) Заявитель(и):
ЖЕНКИОТЕКС СА (CH)(72) Автор(ы):
ПАЖ Патрик (FR),
ЛАЛЁ Бенуа (FR),
ГАДЖИНИ Франческа (CH),
ОРЧАРД Майк (GB)

A

(54) ПРОИЗВОДНЫЕ ПИРАЗОЛОПИПЕРИДИНА В КАЧЕСТВЕ ИНГИБИТОРОВ NADPH-ОКСИДАЗЫ

(57) Формула изобретения

1. Производное пиразолопиперидина согласно формуле (I):



где R¹ означает H; необязательно замещенный алcoxикарбонил; необязательно замещенный C₁-C₆-алкил; необязательно замещенный C₂-C₆-алкенил; необязательно замещенный C₂-C₆-алкинил; необязательно замещенный алcoxил; необязательно замещенный алcoxи-C₁-C₆-алкил; необязательно замещенный аминоалкил; необязательно замещенный ацил; необязательно замещенный арил; необязательно замещенный C₁-C₆-алкиларил; необязательно замещенный арил-C₁-C₆-алкил; необязательно замещенный гетероарил; необязательно замещенный C₁-C₆

RU 2012139828 A

RU 2012139828 A

R U
2 0 1 2 1 3 9 8 2 8 A

гетероарил- C_2 - C_6 -алкенил; необязательно замещенный C_3 - C_8 -циклоалкил; необязательно замещенный гетероциклоалкил; необязательно замещенный C_1 - C_6 -алкил- C_3 - C_8 -циклоалкил; необязательно замещенный C_3 - C_8 -циклоалкил- C_1 - C_6 -алкил; необязательно замещенный C_1 - C_6 -алкилгетероциклоалкил; или необязательно замещенный гетероциклоалкил- C_1 - C_6 -алкил; а $-CR^8R^9R^{10}$, $-CR^{11}R^{12}R^{13}$ или $-CR^{14}R^{15}R^{16}$ могут независимо образовывать необязательно замещенное кольцо, выбранное из необязательно замещенного арила, необязательно замещенного гетероарила, необязательно замещенного C_3 - C_8 -циклоалкила или необязательно замещенного гетероциклоалкила; а также их таутомеры, геометрические изомеры, оптически активные формы, фармацевтически приемлемые соли и фармацевтически активные производные для лечения заболеваний из числа сердечно-сосудистых заболеваний, респираторных заболеваний, заболеваний, затрагивающих метаболизм, кожных заболеваний, костных заболеваний, нейровоспалительных и/или нейродегенеративных заболеваний, почечных заболеваний, репродуктивных заболеваний, глазных заболеваний, и/или заболеваний хрусталика, и/или заболеваний внутреннего уха, воспалительных заболеваний, заболеваний печени, боли, раковых заболеваний, аллергических заболеваний, травматических заболеваний, септического, геморрагического и анафилактического шока, желудочно-кишечных заболеваний и расстройств, ангиогенеза и связанных с ним заболеваний и других заболеваний, связанных с никотинамидадениндинуклеотид фосфатоксидазой (NADPH-оксидазой).

2. Производное пиразолопиперидина согласно формуле (I), где R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , R^9 , R^{10} , R^{11} , R^{12} , R^{13} , R^{14} , R^{15} , R^{16} и R^{17} определены в п.1, а также его таутомеры, геометрические изомеры, оптически активные формы, фармацевтически приемлемые соли и фармацевтически активные производные для применения в качестве медикамента.

3. Производное пиразолопиперидина по п.1, выбранное из следующей группы:

- 5-бензил-2-(4-хлорбензил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
5-бензил-2-(2-хлор-4-фторфенил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
5-бензил-2-[3-(бензилокси)фенил]-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
2-(2-хлор-4-фторфенил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
2-бензил-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
5-бензил-2-(3-хлорфенил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
5-бензил-2-[2-(4-хлорфенокси)этил]-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
5-бензил-2-метил-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
2-бензил-5-(4-хлорбензил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
2-бензил-5-(3-хлорбензил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
2-бензил-5-(4-метоксибензил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
2,5-дибензил-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
5-бензил-2-фенил-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
5-(4-хлорбензил)-2-метил-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
5-(4-метоксибензил)-2-метил-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
5-(3-хлорбензил)-2-метил-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
2-бензил-5-(3-метоксибензил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
2-бензил-5-(3,5-диметоксибензил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-

R U 2 0 1 2 1 3 9 8 2 8 A

3-он;
2-[2-(4-хлорфенокси)этил]-5-(4-метоксибензил)октагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
5-(4-хлорбензил)-2-фенил-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
2-бензил-5-(3,4-дихлорбензил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
2-бензил-5-(3,5-дихлорбензил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
2-бензил-5-(2,4-дихлорбензил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
5-бензил-2-(3-метоксифенил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
5-(4-хлорбензил)-2-(3-метоксифенил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
5-[4-(бензилокси)бензил]-2-(3-метоксифенил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
5-(3-хлорбензил)-2-(3-метоксифенил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
5-бензил-2-(2-метоксифенил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
5-(2-хлорбензил)-2-(3-метоксифенил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
4-{{[2-(3-метоксифенил)-3-оксо-1,2,3,4,6,7-гексагидро-5Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-5-ил]-метил}бензонитрил};
5-(4-хлорбензил)-2-(1-метилпиперидин-4-ил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
5-(4-хлорбензил)-2-(3-метоксибензил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
5-(4-хлорбензил)-2-(2-метоксибензил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
2-(3-метоксифенил)-5-(пиридин-2-илметил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
5-(4-метоксибензил)-2-(2-метоксиэтил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
5-(4-метоксибензил)-2-(1-метилпиперидин-4-ил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
5-(4-хлорбензил)-2-(2-метоксиэтил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
5-(4-метоксибензил)-2-(2-морфолин-4-илэтил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
2-(1,3-бензодиоксол-5-ил)-5-(4-хлорбензил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
2-(1,3-бензодиоксол-5-ил)-5-(4-метоксибензил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
5-(2,4-дихлорбензил)-2-(3-метоксифенил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
5-(4-хлорбензил)-2-(4-метоксифенил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
2-фенил-5-(пиридин-3-илметил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
2-(2-метоксибензил)-5-(4-метоксибензил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;

R U
2 0 1 2 1 3 9 8 2 8 A

2-(3-метоксибензил)-5-(4-метоксибензил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
4-[(2-бензил-3-оксо-1,2,3,4,6,7-гексагидро-5Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-5-ил)метил]-бензонитрил;
2-(2-гидроксиэтил)-5-(4-метоксибензил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
4-{[2-(1,3-бензодиоксол-5-ил)-3-оксо-1,2,3,4,6,7-гексагидро-5Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-5-ил]метил}бензонитрил;
3-[5-(4-хлорбензил)-3-оксо-1,3,4,5,6,7-гексагидро-2Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-2-ил]-бенzonитрил;
5-(4-хлорбензил)-2-(2-гидроксиэтил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
5-(4-хлорбензил)-2-(2-морфолин-4-илэтил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
3а-бензил-5-(4-хлорбензил)-2-метил-2,3а,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
5-(2-феноксиэтил)-2-фенил-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
4-{[2-(2-метил-1,3-бензотиазол-6-ил)-3-оксо-1,2,3,4,6,7-гексагидро-5Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-5-ил]метил}бенzonитрил;
N-{4-[(3-оксо-2-фенил-1,2,3,4,6,7-гексагидро-5Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-5-ил)метил]-фенил}ацетамид;
N-метил-4-[(3-оксо-2-фенил-1,2,3,4,6,7-гексагидро-5Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-5-ил)метил]бензамид;
4-[5-(4-хлорбензил)-3-оксо-1,3,4,5,6,7-гексагидро-2Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-2-ил]-бенzonитрил;
5-(метилсульфонил)-2-фенил-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
5-[(4-метилфенил)сульфонил]-2-фенил-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
4-{[2-(2-гидроксиэтил)-3-оксо-1,2,3,4,6,7-гексагидро-5Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-5-ил]метил}бенzonитрил;
4-{[2-(4-хлорфенил)-3-оксо-1,2,3,4,6,7-гексагидро-5Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-5-ил]метил}бенzonитрил;
2-(1,3-бензодиоксол-5-ил)-5-(3-хлор-4-фторбензил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
5-(3-хлор-4-фторбензил)-2-(2-метил-1,3-бензотиазол-6-ил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
4-{[2-(3-метоксибензил)-3-оксо-1,2,3,4,6,7-гексагидро-5Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-5-ил]метил}бенzonитрил;
2-(2-метил-1,3-бензотиазол-6-ил)-5-[4-(метилсульфонил)бензил]-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
5-(4-хлорбензил)-2-(2-метил-1,3-бензотиазол-6-ил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
2-бензил-5-(пиридин-2-илметил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
3-{[2-(2-метил-1,3-бензотиазол-6-ил)-3-оксо-1,2,3,4,6,7-гексагидро-5Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-5-ил]метил}бенzonитрил;
2-(2-метил-1,3-бензотиазол-6-ил)-5-(пиридин-3-илметил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
3-[(2-бензил-3-оксо-1,2,3,4,6,7-гексагидро-5Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-5-ил)метил]-бенzonитрил;

**A
2012139828
RU**

4- {[2-(4-метоксифенил)-3-оксо-1,2,3,4,6,7-гексагидро-5Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-5-ил]метил}бензонитрил;
3-фтор-4- {[2-(2-метил-1,3-бензотиазол-6-ил)-3-оксо-1,2,3,4,6,7-гексагидро-5Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-5-ил]метил}бензонитрил;
2-(1,3-бензодиоксол-5-ил)-5-[4-(метилсульфонил)бензил]-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
2-(1,3-бензодиоксол-5-ил)-5-[3-(трифторметил)бензил]-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
2-(3-метоксибензил)-5-(пиридин-3-илметил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
2-(2-метоксибензил)-5-(пиридин-3-илметил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
4- {[2-(2-метоксибензил)-3-оксо-1,2,3,4,6,7-гексагидро-5Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-5-ил]метил}бенzonитрил;
2-(4-хлорфенил)-5-(пиридин-3-илметил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
3-[3-оксо-5-(пиридин-3-илметил)-1,3,4,5,6,7-гексагидро-2Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-2-ил]бенzonитрил;
4- {[3-оксо-2-(2-пиперидин-1-илэтил)-1,2,3,4,6,7-гексагидро-5Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-5-ил]метил}бенzonитрил;
N-{3-[3-оксо-5-(пиридин-3-илметил)-1,3,4,5,6,7-гексагидро-2Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-2-ил]фенил}ацетамид;
2-(2-фторфенил)-5-(пиридин-3-илметил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
4- {[2-(2-фторфенил)-3-оксо-1,2,3,4,6,7-гексагидро-5Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-5-ил]метил}бенzonитрил;
5-[(6-хлорпиридин-3-ил)метил]-2-(2-метоксиэтил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
N-{3-[5-(3-хлор-4-фторбензил)-3-оксо-1,3,4,5,6,7-гексагидро-2Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-2-ил]фенил}ацетамид;
4- {[2-(4-метоксибензил)-3-оксо-1,2,3,4,6,7-гексагидро-5Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-5-ил]метил}бенzonитрил;
5-(4-хлорбензил)-2-метил-3а-(пиридин-3-илметил)-2,3а,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
2-(2-метил-1,3-бензотиазол-6-ил)-5-[3-(трифторметил)бензил]-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
5-(3-хлор-4-фторбензил)-2-(4-хлорфенил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
3-[5-(3-хлор-4-фторбензил)-3-оксо-1,3,4,5,6,7-гексагидро-2Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-2-ил]бенzonитрил;
3-{3-оксо-5-[3-(трифторметил)бензил]-1,3,4,5,6,7-гексагидро-2Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-2-ил}бенzonитрил;
3-{5-[(6-хлорпиридин-3-ил)метил]-3-оксо-1,3,4,5,6,7-гексагидро-2Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-2-ил}бенzonитрил;
2-бензил-5-(3-хлор-4-фторбензил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
2-(4-хлорфенил)-5-[(6-хлорпиридин-3-ил)метил]-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
5-[(6-хлорпиридин-3-ил)метил]-2-(2-фторфенил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;

**R
U
2012139828
A**

R U 2 0 1 2 1 3 9 8 2 8 A

5-[(6-хлорпиридин-3-ил)метил]-2-(1-метилпиперидин-4-ил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;

2-бензил-5-[(6-хлорпиридин-3-ил)метил]-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;

4-{5-[(6-хлорпиридин-3-ил)метил]-3-оксо-1,3,4,5,6,7-гексагидро-2Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-2-ил}бензонитрил;

2-бензил-5-(пиридин-3-илметил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;

2-(2-метил-1,3-бензотиазол-6-ил)-5-(пиридин-2-илметил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;

5-(2-хлорбензил)-2-(2-метил-1,3-бензотиазол-6-ил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;

2-бензил-5-(метилсульфонил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он; и

2-(имиазо[1,2-а]пиридин-2-илметил)-5-[(4-метилфенил)сульфонил]-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он.

4. Производное пиразолопиперидина по п.2, выбранное из следующей группы:

5-бензил-2-(4-хлорбензил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;

5-бензил-2-(2-хлор-4-фторфенил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;

5-бензил-2-[3-(бензилокси)фенил]-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;

2-(2-хлор-4-фторфенил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;

2-бензил-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;

5-бензил-2-(3-хлорфенил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;

5-бензил-2-[2-(4-хлорфенокси)этил]-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;

5-бензил-2-метил-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;

2-бензил-5-(4-хлорбензил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;

2-бензил-5-(3-хлорбензил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;

2-бензил-5-(4-метоксибензил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;

2,5-дibenзил-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;

5-бензил-2-фенил-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;

5-(4-хлорбензил)-2-метил-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;

5-(4-метоксибензил)-2-метил-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;

5-(3-хлорбензил)-2-метил-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;

2-бензил-5-(3-метоксибензил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;

2-бензил-5-(3,5-диметоксибензил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;

2-[2-(4-хлорфенокси)этил]-5-(4-метоксибензил)октагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;

5-(4-хлорбензил)-2-фенил-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;

2-бензил-5-(3,4-дихлорбензил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;

2-бензил-5-(3,5-дихлорбензил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;

2-бензил-5-(2,4-дихлорбензил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;

R U 2 0 1 2 1 3 9 8 2 8 A

5-бензил-2-(3-метоксифенил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
5-(4-хлорбензил)-2-(3-метоксифенил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
5-[4-(бензилокси)бензил]-2-(3-метоксифенил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
5-(3-хлорбензил)-2-(3-метоксифенил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
5-бензил-2-(2-метоксифенил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
5-(2-хлорбензил)-2-(3-метоксифенил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
4- {[2-(3-метоксифенил)-3-оксо-1,2,3,4,6,7-гексагидро-5Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-5-ил]-метил}бензонитрил;
5-(4-хлорбензил)-2-(1-метилпиперидин-4-ил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
5-(4-хлорбензил)-2-(3-метоксибензил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
5-(4-хлорбензил)-2-(2-метоксибензил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
2-(3-метоксифенил)-5-(пиридин-2-илметил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
5-(4-метоксибензил)-2-(2-метоксиэтил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
5-(4-метоксибензил)-2-(1-метилпиперидин-4-ил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
5-(4-хлорбензил)-2-(2-метоксиэтил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
5-(4-метоксибензил)-2-(2-морфолин-4-илэтил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
2-(1,3-бензодиоксол-5-ил)-5-(4-хлорбензил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
2-(1,3-бензодиоксол-5-ил)-5-(4-метоксибензил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
5-(2,4-дихлорбензил)-2-(3-метоксифенил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
5-(4-хлорбензил)-2-(4-метоксифенил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
2-фенил-5-(пиридин-3-илметил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
2-(2-метоксибензил)-5-(4-метоксибензил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
2-(3-метоксибензил)-5-(4-метоксибензил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
4- {[2-бензил-3-оксо-1,2,3,4,6,7-гексагидро-5Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-5-ил]метил}-бензонитрил;
2-(2-гидроксиэтил)-5-(4-метоксибензил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
4- {[2-(1,3-бензодиоксол-5-ил)-3-оксо-1,2,3,4,6,7-гексагидро-5Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-5-ил]метил}бензонитрил;
3-[5-(4-хлорбензил)-3-оксо-1,3,4,5,6,7-гексагидро-2Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-2-ил]-бензонитрил;

R U 2 0 1 2 1 3 9 8 2 8 A

5-(4-хлорбензил)-2-(2-гидроксиэтил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
5-(4-хлорбензил)-2-(2-морфолин-4-илэтил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
За-бензил-5-(4-хлорбензил)-2-метил-2,3а,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
5-(2-феноксиэтил)-2-фенил-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
4-{[2-(2-метил-1,3-бензотиазол-6-ил)-3-оксо-1,2,3,4,6,7-гексагидро-5Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-5-ил]метил}бензонитрил;
N-{4-[3-оксо-2-фенил-1,2,3,4,6,7-гексагидро-5Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-5-ил]метил}-фенил}ацетамид;
N-метил-4-[3-оксо-2-фенил-1,2,3,4,6,7-гексагидро-5Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-5-ил]метил]бензамид;
4-[5-(4-хлорбензил)-3-оксо-1,3,4,5,6,7-гексагидро-2Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-2-ил]-бензонитрил;
5-(метилсульфонил)-2-фенил-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
5-[(4-метилфенил)сульфонил]-2-фенил-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
4-{[2-(2-гидроксиэтил)-3-оксо-1,2,3,4,6,7-гексагидро-5Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-5-ил]метил}бензонитрил;
4-{[2-(4-хлорфенил)-3-оксо-1,2,3,4,6,7-гексагидро-5Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-5-ил]метил}бензонитрил;
2-(1,3-бензодиоксол-5-ил)-5-(3-хлор-4-фторбензил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
5-(3-хлор-4-фторбензил)-2-(2-метил-1,3-бензотиазол-6-ил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
4-{[2-(3-метоксибензил)-3-оксо-1,2,3,4,6,7-гексагидро-5Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-5-ил]метил}бензонитрил;
2-(2-метил-1,3-бензотиазол-6-ил)-5-[4-(метилсульфонил)бензил]-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
5-(4-хлорбензил)-2-(2-метил-1,3-бензотиазол-6-ил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
2-бензил-5-(пиридин-2-илметил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
3-{[2-(2-метил-1,3-бензотиазол-6-ил)-3-оксо-1,2,3,4,6,7-гексагидро-5Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-5-ил]метил}бензонитрил;
2-(2-метил-1,3-бензотиазол-6-ил)-5-(пиридин-3-илметил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
3-[(2-бензил-3-оксо-1,2,3,4,6,7-гексагидро-5Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-5-ил]метил]бензонитрил;
4-{[2-(4-метоксифенил)-3-оксо-1,2,3,4,6,7-гексагидро-5Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-5-ил]метил}бензонитрил;
3-фтор-4-{[2-(2-метил-1,3-бензотиазол-6-ил)-3-оксо-1,2,3,4,6,7-гексагидро-5Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-5-ил]метил}бензонитрил;
2-(1,3-бензодиоксол-5-ил)-5-[4-(метилсульфонил)бензил]-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
2-(1,3-бензодиоксол-5-ил)-5-[3-(трифторметил)бензил]-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
2-(3-метоксибензил)-5-(пиридин-3-илметил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;

R U 2 0 1 2 1 3 9 8 2 8 A

A
2 0 1 2 1 3 9 8 2 8 R U

- 2-(2-метоксибензил)-5-(пиридин-3-илметил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
- 4- {[2-(2-метоксибензил)-3-оксо-1,2,3,4,6,7-гексагидро-5Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-5-ил]метил}бензонитрил;
- 2-(4-хлорфенил)-5-(пиридин-3-илметил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
- 3-[3-оксо-5-(пиридин-3-илметил)-1,3,4,5,6,7-гексагидро-2Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-2-ил]-бензонитрил;
- 4- {[3-оксо-2-(2-пиперидин-1-илэтил)-1,2,3,4,6,7-гексагидро-5Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-5-ил]метил}бенzonитрил;
- N-{3-[3-оксо-5-(пиридин-3-илметил)-1,3,4,5,6,7-гексагидро-2Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-2-ил]фенил}ацетамид;
- 2-(2-фторфенил)-5-(пиридин-3-илметил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
- 4- {[2-(2-фторфенил)-3-оксо-1,2,3,4,6,7-гексагидро-5Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-5-ил]метил}бенzonитрил;
- 5-[(6-хлорпиридин-3-ил)метил]-2-(2-метоксиэтил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
- N-{3-[5-(3-хлор-4-фторбензил)-3-оксо-1,3,4,5,6,7-гексагидро-2Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-2-ил]фенил}ацетамид;
- 4- {[2-(4-метоксибензил)-3-оксо-1,2,3,4,6,7-гексагидро-5Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-5-ил]метил}бенzonитрил;
- 5-(4-хлорбензил)-2-метил-3а-(пиридин-3-илметил)-2,3а,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
- 2-(2-метил-1,3-бензотиазол-6-ил)-5-[3-(трифторметил)бензил]-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
- 5-(3-хлор-4-фторбензил)-2-(4-хлорфенил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
- 3-[5-(3-хлор-4-фторбензил)-3-оксо-1,3,4,5,6,7-гексагидро-2Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-2-ил]бенzonитрил;
- 3-{3-оксо-5-[3-(трифторметил)бензил]-1,3,4,5,6,7-гексагидро-2Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-2-ил}бенzonитрил;
- 3-{5-[(6-хлорпиридин-3-ил)метил]-3-оксо-1,3,4,5,6,7-гексагидро-2Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-2-ил}бенzonитрил;
- 2-бензил-5-(3-хлор-4-фторбензил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
- 2-(4-хлорфенил)-5-[(6-хлорпиридин-3-ил)метил]-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
- 5-[(6-хлорпиридин-3-ил)метил]-2-(2-фторфенил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
- 5-[(6-хлорпиридин-3-ил)метил]-2-(1-метилпиперидин-4-ил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
- 2-бензил-5-[(6-хлорпиридин-3-ил)метил]-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
- 4- {5-[(6-хлорпиридин-3-ил)метил]-3-оксо-1,3,4,5,6,7-гексагидро-2Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-2-ил}бенzonитрил;
- 2-бензил-5-(пиридин-3-илметил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
- 2-(2-метил-1,3-бензотиазол-6-ил)-5-(пиридин-2-илметил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;

R U
2 0 1 2 1 3 9 8 2 8
A

5-(2-хлорбензил)-2-(2-метил-1,3-бензотиазол-6-ил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;

2-бензил-5-(метилсульфонил)-1,2,4,5,6,7-гексагадро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он; и

2-(имиазо[1,2-а]пиридин-2-илметил)-5-[(4-метилфенил)сульфонил]-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он.

5. Производное пиразолопиперидина согласно формуле (I), где $R^1, R^2, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{14}, R^{15}, R^{16}$ и R^{17} определены в любом из пп.1-4, а R^3 означает $-S(O)-R^4, -S(O)_2-R^4$, необязательно замещенный C_3-C_8 -циклоалкил, необязательно замещенный гетероциклоалкил или $-CR^5R^6R^7$, а также его таутомеры, геометрические изомеры, оптически активные формы, фармацевтически приемлемые соли и фармацевтически активные производные при условии, что соединение не входит в группу, состоящую из:

5-метил-2-фенил-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-она;

5-этил-2-фенил-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-она;

2-фенил-5-пропил-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-она;

5-бутил-2-фенил-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-она;

5-(3-метилбутил)-2-фенил-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-она;

и

5-бензил-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-она.

6. Производное по любому из пп.1-5, в котором R^1 означает необязательно замещенный арил или необязательно замещенный гетероарил, а $R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{14}, R^{15}, R^{16}$ и R^{17} определены в любом из предыдущих пунктов.

7. Производное по любому из пп.1-5, в котором R^1 означает необязательно замещенный C_1-C_6 -алкил, необязательно замещенный C_2-C_6 -алкенил или необязательно замещенный C_2-C_6 -алкинил, а $R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{14}, R^{15}, R^{16}$ и R^{17} определены в любом из предыдущих пунктов.

8. Производное по любому из пп.1-5, в котором R^1 означает необязательно замещенный арил- C_1-C_6 -алкил или необязательно замещенный гетероарил- C_1-C_6 -алкил, а $R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{14}, R^{15}, R^{16}$ и R^{17} определены в любом из предыдущих пунктов.

9. Производное по любому из пп.1-5, в котором R^1 означает необязательно замещенный гетероциклоалкил, а $R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{14}, R^{15}, R^{16}$ и R^{17} определены в любом из предыдущих пунктов.

10. Производное по любому из пп.1-5, в котором R^1 означает необязательно замещенный гетероциклоалкил- C_1-C_6 -алкил, а $R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{14}, R^{15}, R^{16}$ и R^{17} определены в любом из предыдущих пунктов.

11. Производное по любому из пп.1-5, в котором R^1 означает необязательно замещенный аллокси- C_1-C_6 -алкил, а $R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{14}, R^{15}, R^{16}$ и R^{17} определены в любом из предыдущих пунктов.

12. Производное по любому из пп.1-5, в котором R^2 означает H , а $R^1, R^3, R^4, R^5, R^6,$

$R^7, R^8, R^9, R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{14}, R^{15}, R^{16}$ и R^{17} определены в любом из предыдущих пунктов.

13. Производное по любому из пп.1-5, в котором R^2 означает необязательно замещенный арил- C_1 - C_6 -алкил или необязательно замещенный гетероарил- C_1 - C_6 -алкил, а $R^1, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{14}, R^{15}, R^{16}$ и R^{17} определены в любом из предыдущих пунктов.

14. Производное по любому из пп.1-5, в котором R^3 означает $-CR^5R^6R^7$, а $R^1, R^2, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{14}, R^{15}, R^{16}$ и R^{17} определены в любом из предыдущих пунктов.

15. Производное по любому из пп.1-5, в котором R^3 означает $-S(O)_2R^4$, а R^1, R^2 и R^4 определены в любом из предыдущих пунктов.

16. Производное по п.15, в котором R^3 означает $-S(O)_2R^4$, R^4 означает необязательно замещенный C_1 - C_6 -алкил, необязательно замещенный C_2 - C_6 -алкенил или необязательно замещенный C_2 - C_6 -алкинил, а R^1 и R^2 определены в любом из предыдущих пунктов.

17. Производное по п.15, в котором R^3 означает $-S(O)_2R^4$, R^4 означает необязательно замещенный арил или необязательно замещенный гетероарил, а R^1 и R^2 определены в любом из предыдущих пунктов.

18. Производное по п.5, выбранное из следующей группы:

5-бензил-2-(4-хлорбензил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;

5-бензил-2-(2-хлор-4-фторфенил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;

5-бензил-2-[3-(бензилокси)фенил]-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;

5-бензил-2-(3-хлорфенил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;

5-бензил-2-[2-(4-хлорфенокси)этил]-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;

5-бензил-2-метил-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;

2-бензил-5-(4-хлорбензил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;

2-бензил-5-(3-хлорбензил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;

2-бензил-5-(4-метоксибензил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;

2,5-дibenзил-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;

5-бензил-2-фенил-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;

5-(4-хлорбензил)-2-метил-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;

5-(4-метоксибензил)-2-метил-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;

5-(3-хлорбензил)-2-метил-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;

2-бензил-5-(3-метоксибензил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;

2-бензил-5-(3,5-диметоксибензил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;

2-[2-(4-хлорфенокси)этил]-5-(4-метоксибензил)октагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;

5-(4-хлорбензил)-2-фенил-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;

2-бензил-5-(3,4-дихлорбензил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;

R
U
2
0
1
2
1
3
9
8
2
8
A

2-бензил-5-(3,5-дихлорбензил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
2-бензил-5-(2,4-дихлорбензил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
5-бензил-2-(3-метоксифенил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
5-(4-хлорбензил)-2-(3-метоксифенил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
5-[4-(бензилокси)бензил]-2-(3-метоксифенил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
5-(3-хлорбензил)-2-(3-метоксифенил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
5-бензил-2-(2-метоксифенил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
5-(2-хлорбензил)-2-(3-метоксифенил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
4-{[2-(3-метоксифенил)-3-оксо-1,2,3,4,6,7-гексагидро-5Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-5-ил]-метил}бензонитрил;
5-(4-хлорбензил)-2-(1-метилпиперидин-4-ил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
5-(4-хлорбензил)-2-(3-метоксибензил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
5-(4-хлорбензил)-2-(2-метоксибензил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
2-(3-метоксифенил)-5-(пиридин-2-илметил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
5-(4-метоксибензил)-2-(2-метоксиэтил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
5-(4-метоксибензил)-2-(1-метилпиперидин-4-ил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
5-(4-хлорбензил)-2-(2-метоксиэтил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
5-(4-метоксибензил)-2-(2-морфолин-4-илэтотиол)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
2-(1,3-бензодиоксол-5-ил)-5-(4-хлорбензил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
2-(1,3-бензодиоксол-5-ил)-5-(4-метоксибензил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
5-(2,4-дихлорбензил)-2-(3-метоксифенил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
5-(4-хлорбензил)-2-(4-метоксифенил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
2-фенил-5-(пиридин-3-илметил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
2-(2-метоксибензил)-5-(4-метоксибензил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
2-(3-метоксибензил)-5-(4-метоксибензил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
4-[(2-бензил-3-оксо-1,2,3,4,6,7-гексагидро-5Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-5-ил)метил]бензонитрил;
2-(2-гидроксиэтил)-5-(4-метоксибензил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;

A
2012139828
RU

4-{{[2-(1,3-бензодиоксол-5-ил)-3-оксо-1,2,3,4,6,7-гексагидро-5Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-5-ил]метил}бензонитрил; 3-[5-(4-хлорбензил)-3-оксо-1,3,4,5,6,7-гексагидро-2Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-2-ил]-бензонитрил; 5-(4-хлорбензил)-2-(2-гидроксиэтил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он; 5-(4-хлорбензил)-2-(2-морфолин-4-илэтил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он; За-бензил-5-(4-хлорбензил)-2-метил-2,3а,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он; 5-(2-феноксиэтил)-2-фенил-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он; 4-{{[2-(2-метил-1,3-бензотиазол-6-ил)-3-оксо-1,2,3,4,6,7-гексагидро-5Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-5-ил]метил}бензонитрил; N-{4-[(3-оксо-2-фенил-1,2,3,4,6,7-гексагидро-5Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-5-ил)метил]-фенил}ацетамид; N-метил-4-[(3-оксо-2-фенил-1,2,3,4,6,7-гексагидро-5Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-5-ил)метил]бензамид; 4-[5-(4-хлорбензил)-3-оксо-1,3,4,5,6,7-гексагидро-2Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-2-ил]-бенzonитрил; 5-(метилсульфонил)-2-фенил-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он; 5-[(4-метилфенил)сульфонил]-2-фенил-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он; 4-{{[2-(2-гидроксиэтил)-3-оксо-1,2,3,4,6,7-гексагидро-5Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-5-ил]метил}бенzonитрил; 4-{{[2-(4-хлорфенил)-3-оксо-1,2,3,4,6,7-гексагидро-5Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-5-ил]метил}бенzonитрил; 2-(1,3-бензодиоксол-5-ил)-5-(3-хлор-4-фторбензил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он; 5-(3-хлор-4-фторбензил)-2-(2-метил-1,3-бензотиазол-6-ил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он; 4-{{[2-(3-метоксибензил)-3-оксо-1,2,3,4,6,7-гексагидро-5Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-5-ил]метил}бенzonитрил; 2-(2-метил-1,3-бензотиазол-6-ил)-5-[4-(метилсульфонил)бензил]-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он; 5-(4-хлорбензил)-2-(2-метил-1,3-бензотиазол-6-ил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он; 2-бензил-5-(пиридин-2-илметил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он; 3-{{[2-(2-метил-1,3-бензотиазол-6-ил)-3-оксо-1,2,3,4,6,7-гексагидро-5Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-5-ил]метил}бенzonитрил; 2-(2-метил-1,3-бензотиазол-6-ил)-5-(пиридин-3-илметил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он; 3-{{[2-бензил-3-оксо-1,2,3,4,6,7-гексагидро-5Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-5-ил]метил}бенzonитрил; 4-{{[2-(4-метоксифенил)-3-оксо-1,2,3,4,6,7-гексагидро-5Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-5-ил]метил}бенzonитрил; 3-фтор-4-{{[2-(2-метил-1,3-бензотиазол-6-ил)-3-оксо-1,2,3,4,6,7-гексагидро-5Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-5-ил]метил}бенzonитрил; 2-(1,3-бензодиоксол-5-ил)-5-[4-(метилсульфонил)бензил]-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;

R U
2012139828
A

**A
2012139828**

2-(1,3-бензодиоксол-5-ил)-5-[3-(трифторметил)бензил]-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
2-(3-метоксибензил)-5-(пиридин-3-илметил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
2-(2-метоксибензил)-5-(пиридин-3-илметил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
4-{[2-(2-метоксибензил)-3-оксо-1,2,3,4,6,7-гексагидро-5Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-5-ил]метил} бензонитрил;
2-(4-хлорфенил)-5-(пиридин-3-илметил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
3-[3-оксо-5-(пиридин-3-илметил)-1,3,4,5,6,7-гексагидро-2Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-2-ил]-бензонитрил;
4-{[3-оксо-2-(2-пиперидин-1-илэтил)-1,2,3,4,6,7-гексагидро-5Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-5-ил]метил} бенzonитрил;
N-{3-[3-оксо-5-(пиридин-3-илметил)-1,3,4,5,6,7-гексагидро-2Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-2-ил]фенил}ацетамид;
2-(2-фторфенил)-5-(пиридин-3-илметил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
4-{[2-(2-фторфенил)-3-оксо-1,2,3,4,6,7-гексагидро-5Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-5-ил]метил} бенzonитрил;
5-[(6-хлорпиридин-3-ил)метил]-2-(2-метоксиэтил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
N-{3-[5-(3-хлор-4-фторбензил)-3-оксо-1,3,4,5,6,7-гексагидро-2Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-2-ил]фенил}ацетамид;
4-{[2-(4-метоксибензил)-3-оксо-1,2,3,4,6,7-гексагидро-5Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-5-ил]метил} бенzonитрил;
5-(4-хлорбензил)-2-метил-3а-(пиридин-3-илметил)-2,3а,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
2-(2-метил-1,3-бензотиазол-6-ил)-5-[3-(трифторметил)бензил]-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
5-(3-хлор-4-фторбензил)-2-(4-хлорфенил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
3-[5-(3-хлор-4-фторбензил)-3-оксо-1,3,4,5,6,7-гексагидро-2Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-2-ил]бенzonитрил;
3-{3-оксо-5-[3-(трифторметил)бензил]-1,3,4,5,6,7-гексагидро-2Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-2-ил}бенzonитрил;
3-{5-[(6-хлорпиридин-3-ил)метил]-3-оксо-1,3,4,5,6,7-гексагидро-2Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-2-ил}бенzonитрил;
2-бензил-5-(3-хлор-4-фторбензил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
2-(4-хлорфенил)-5-[(6-хлорпиридин-3-ил)метил]-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
5-[(6-хлорпиридин-3-ил)метил]-2-(2-фторфенил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
5-[(6-хлорпиридин-3-ил)метил]-2-(1-метилпиперидин-4-ил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
2-бензил-5-[(6-хлорпиридин-3-ил)метил]-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;
4-{5-[(6-хлорпиридин-3-ил)метил]-3-оксо-1,3,4,5,6,7-гексагидро-2Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-2-ил}бенzonитрил;

R U 2012139828 A

R U 2 0 1 2 1 3 9 8 2 8 A

2-бензил-5-(пиридин-3-илметил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;

2-(2-метил-1,3-бензотиазол-6-ил)-5-(пиридин-2-илметил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;

5-(2-хлорбензил)-2-(2-метил-1,3-бензотиазол-6-ил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он;

2-бензил-5-(метилсульфонил)-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он; и

2-(имидазо[1,2-а]пиридин-2-илметил)-5-[(4-метилфенил)сульфонил]-1,2,4,5,6,7-гексагидро-3Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-он.

19. Фармацевтическая композиция, содержащая по меньшей мере одно производное по любому из п.п.1-18 и фармацевтически приемлемый носитель, разбавитель или эксцизиент.

20. Способ лечения пациентов, страдающих заболеваниями или состояниями из числа сердечно-сосудистых заболеваний, респираторных заболеваний, заболеваний, затрагивающих метаболизм, кожных заболеваний, костных заболеваний, нейровоспалительных и/или нейродегенеративных заболеваний, почечных заболеваний, репродуктивных заболеваний, глазных заболеваний и/или заболеваний хрусталика, и/или заболеваний внутреннего уха, воспалительных заболеваний, заболеваний печени, боли, раковых заболеваний, аллергических заболеваний, травматических заболеваний, септического, геморрагического и анафилактического шока, желудочно-кишечных заболеваний, ангиогенеза и связанных с ним заболеваний и других заболеваний, связанных с никотинамидадениндинуклеотидфосфоксидазой (NADPH-оксидазой), который включает введение нуждающемуся в этом пациенту соединения по любому из пп.1-18.

21. Способ ингибирования ангиогенеза у нуждающегося в этом пациенте, включающий введение ингибирующей ангиогенез дозы соединения по любому из пп.1-18 нуждающемуся в этом пациенту.

22. Способ по п.20, в котором заболевание или состояние представляет собой рак.

23. Способ по п.20 или 21, в котором соединение по любому из пп.1-18 вводится в комбинации с другим средством, применимым при лечении рака.

24. Способ по п.20 или 21, в котором соединение по любому из пп.1-18 вводится в комбинации с лучевой терапией.