



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2860179 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07D 471/04 (2006.01)
A61K 31/437 (2006.01)
A61P 3/00 (2006.01)
A61P 9/00 (2006.01)
A61P 11/00 (2006.01)
A61P 13/00 (2006.01)
A61P 17/00 (2006.01)
A61P 19/00 (2006.01)
A61P 25/00 (2006.01)
A61P 27/00 (2006.01)
A61P 29/00 (2006.01)
A61P 35/00 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21)	Translation Published	2018.08.20
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2018.03.14
(86)	European Application Nr.	14190340.1
(86)	European Filing Date	2009.09.22
(87)	The European Application's Publication Date	2015.04.15
(30)	Priority	2008.09.23, EP, 08164857
(84)	Designated Contracting States:	AT ; BE ; BG ; CH ; CY ; CZ ; DE ; DK ; EE ; ES ; FI ; FR ; GB ; GR ; HR ; HU ; IE ; IS ; IT ; LI ; LT ; LU ; LV ; MC ; MK ; MT ; NL ; NO ; PL ; PT ; RO ; SE ; SI ; SK ; SM ; TR
	Designated Extension States:	AL; BA; RS
(62)	Divided application	EP2344492, filing date 2009.09.22
(73)	Proprietor	GenKyoTex Suisse SA, 16, chemin des Aulx, 1228 Plan-les-Ouates, CH-Sveits
(72)	Inventor	Page, Patrick, Naxos, Les Cyclades1 Avenue de Genève, 74160 Saint-Julien-en-Genevois, FR-Frankrike Orchard, Mike, 34 Spring LaneWatlington, Oxon, OX4 95QN, GB-Storbritannia Laleu, Benoît, c/o Mr Deflorin Pierre16, chemin Daniel-Ihly, 1213 Petit-Lancy, CH-Sveits Gaggini, Francesca, Rue des Pecheries, 14, 1205 Geneva, CH-Sveits
(74)	Agent or Attorney	OSLO PATENTKONTOR AS, Postboks 7007 M, 0306 OSLO, Norge

(54) Title **Pyrazolo pyridine derivatives as NADPH oxidase inhibitors**

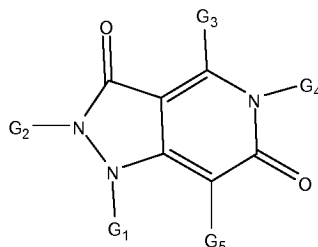
(56) References

Cited: JUNKER L M ET AL: "High-throughput screens for small-molecule inhibitors of *Pseudomonas aeruginosa* biofilm development", *ANTIMICROBIAL AGENTS AND CHEMOTHERAPY* 200710 US, vol. 51, no. 10, October 2007 (2007-10), pages 3582-3590, XP002514423, ISSN: 0066-4804, EP-A- 1 505 068, WO-A-2008/113856

Enclosed is a translation of the patent claims in Norwegian. Please note that as per the Norwegian Patents Acts, section 66i the patent will receive protection in Norway only as far as there is agreement between the translation and the language of the application/patent granted at the EPO. In matters concerning the validity of the patent, language of the application/patent granted at the EPO will be used as the basis for the decision. The patent documents published by the EPO are available through Espacenet (<http://worldwide.espacenet.com>) or via the search engine on our website here: <https://search.patentstyret.no/>

Patentkrav

1. Pyrazolpyridinderivat med formel (I):

**(I)**

hvor **G₁** er H; **G₂** er valgt fra valgfritt substituert valgfritt substituert aryl og
 5 valgfritt substituert heteroaryl; **G₃** er valgt fra H; valgfritt substituert amino;
 valgfritt substituert aminoalkyl; valgfritt substituert aminokarbonyl; valgfritt
 substituert alkoksy; valgfritt substituert alkoksy-C₁-C₆-alkyl; valgfritt substituert
 karbonyl; valgfritt substituert C₁-C₆-alkyl; valgfritt substituert C₂-C₆-alkenyl;
 valgfritt substituert C₂-C₆-alkynyl; valgfritt substituert aryl; valgfritt substituert
 10 aryl-C₁-C₆-alkyl; valgfritt substituert heteroaryl; valgfritt substituert C₁-C₆-alkyl-
 heteroaryl; valgfritt substituert heteroaryl-C₁-C₆-alkyl; valgfritt substituert C₂-C₆-
 alkenylaryl; valgfritt substituert aryl-C₂-C₆-alkenyl; valgfritt substituert C₂-C₆-
 alkenylheteroaryl; valgfritt substituert heteroaryl-C₂-C₆-alkenyl; valgfritt substituert
 C₃-C₈-cykloalkyl; valgfritt substituert heterocykloalkyl; valgfritt substituert C₁-C₆-
 15 alkyl-C₃-C₈-cykloalkyl; valgfritt substituert C₃-C₈-cykloalkyl-C₁-C₆-alkyl; valgfritt
 substituert C₁-C₆-alkylheterocykloalkyl og valgfritt substituert heterocykloalkyl-C₁-
 C₆-alkyl; **G₄** er valgt fra -NR²-C(O)-R¹ og -(CHR³)_m-(CH₂)_n-R⁴, hvor R¹ er valgt fra
 H; amino; -NR⁵R⁶; valgfritt substituert alkoksy; valgfritt substituert alkoksy-C₁-C₆-
 alkyl; valgfritt substituert aryl; valgfritt substituert C₁-C₆-alkylaryl; valgfritt
 20 substituert aryl-C₁-C₆-alkyl; heteroaryl; valgfritt substituert C₁-C₆-alkylheteroaryl;
 valgfritt substituert heteroaryl-C₁-C₆-alkyl; valgfritt substituert C₃-C₈-cykloalkyl;
 valgfritt substituert C₁-C₆-alkyl-C₃-C₈-cykloalkyl; valgfritt substituert C₃-C₈-
 cykloalkyl-C₁-C₆-alkyl; valgfritt substituert heterocykloalkyl; valgfritt substituert C₁-
 C₆-alkylheterocykloalkyl; og valgfritt substituert heterocykloalkyl-C₁-C₆-alkyl; R² er
 25 valgt fra H; valgfritt substituert alkoksy-C₁-C₆-alkyl; valgfritt substituert aryl;
 valgfritt substituert C₁-C₆-alkylaryl; valgfritt substituert aryl-C₁-C₆-alkyl; valgfritt
 substituert heteroaryl; valgfritt substituert C₁-C₆-alkylheteroaryl; valgfritt
 substituert heteroaryl-C₁-C₆-alkyl; valgfritt substituert C₃-C₈-cykloalkyl; valgfritt
 substituert C₁-C₆-alkyl-C₃-C₈-cykloalkyl; valgfritt substituert C₃-C₈-cykloalkyl-C₁-C₆-

alkyl; valgfritt substituert heterocykloalkyl; valgfritt substituert C₁-C₆-alkyl-heterocykloalkyl; valgfritt substituert heterocykloalkyl-C₁-C₆-alkyl; R³ er valgt fra H; halogen; valgfritt substituert alkoksy; valgfritt substituert alkoksy-C₁-C₆-alkyl-aryl; valgfritt substituert C₁-C₆-alkylaryl; valgfritt substituert aryl-C₁-C₆-alkyl;

5 substituert heteroaryl; valgfritt substituert C₁-C₆-alkylheteroaryl; valgfritt substituert heteroaryl-C₁-C₆-alkyl; valgfritt substituert C₃-C₈-cykloalkyl; valgfritt substituert C₁-C₆-alkyl-C₃-C₈-cykloalkyl; valgfritt substituert C₃-C₈-cykloalkyl-C₁-C₆-alkyl; valgfritt substituert heterocykloalkyl; valgfritt substituert C₁-C₆-alkyl-heterocykloalkyl; og valgfritt substituert heterocykloalkyl-C₁-C₆-alkyl; R⁴ er valgt

10 fra H; -C(O)R⁷; -A-B; -CHR⁸R⁹ og -(CH₂)_q-E; R⁵ og R⁶ er uavhengig valgt fra H; valgfritt substituert alkoksy-C₁-C₆-alkyl; valgfritt substituert aryl; valgfritt substituert C₁-C₆-alkylaryl; valgfritt substituert aryl-C₁-C₆-alkyl; valgfritt substituert heteroaryl; valgfritt substituert C₁-C₆-alkylheteroaryl; valgfritt substituert heteroaryl-C₁-C₆-alkyl; valgfritt substituert C₃-C₈-cykloalkyl; valgfritt substituert C₁-

15 C₆-alkyl-C₃-C₈-cykloalkyl; valgfritt substituert C₃-C₈-cykloalkyl-C₁-C₆-alkyl; valgfritt substituert heterocykloalkyl; valgfritt substituert C₁-C₆-alkylheterocykloalkyl; og valgfritt substituert heterocykloalkyl-C₁-C₆-alkyl eller -NR⁵R⁶ danner sammen en ring valgt fra valgfritt substituert heteroaryl og valgfritt substituert heterocykloalkyl; R⁷ er valgt fra valgfritt substituert amino; valgfritt substituert

20 alkoksy; valgfritt substituert aminoalkyl; valgfritt substituert alkoksy-C₁-C₆-alkyl; valgfritt substituert C₁-C₆-alkyl; valgfritt substituert C₂-C₆-alkenyl; valgfritt substituert C₂-C₆-alkynyl; -NR⁵R⁶; valgfritt substituert aryl; valgfritt substituert C₁-C₆-alkylaryl; valgfritt substituert aryl-C₁-C₆-alkyl; valgfritt substituert heteroaryl; valgfritt substituert C₁-C₆-alkylheteroaryl; valgfritt substituert heteroaryl-C₁-C₆-

25 alkyl; valgfritt substituert C₃-C₈-cykloalkyl; valgfritt substituert C₁-C₆-alkyl-C₃-C₈-cykloalkyl; valgfritt substituert C₃-C₈-cykloalkyl-C₁-C₆-alkyl; valgfritt substituert heterocykloalkyl; valgfritt substituert C₁-C₆-alkylheterocykloalkyl; og valgfritt substituert heterocykloalkyl-C₁-C₆-alkyl; R⁸ og R⁹ er uavhengig valgt fra valgfritt substituert aryl; valgfritt substituert heteroaryl; valgfritt substituert C₃-C₈-

30 cykloalkyl og valgfritt substituert heterocykloalkyl; R¹⁰ er valgt fra H; hydroksyl; valgfritt substituert amino-C₁-C₆-alkyl; valgfritt substituert alkoksy-C₁-C₆-alkyl; valgfritt substituert aryl; valgfritt substituert C₁-C₆-alkylaryl; valgfritt substituert aryl-C₁-C₆-alkyl; heteroaryl; valgfritt substituert C₁-C₆-alkylheteroaryl; valgfritt substituert heteroaryl-C₁-C₆-alkyl; valgfritt substituert C₃-C₈-cykloalkyl; valgfritt

35 substituert C₁-C₆-alkyl-C₃-C₈-cykloalkyl; valgfritt substituert C₃-C₈-cykloalkyl-C₁-C₆-alkyl; valgfritt substituert heterocykloalkyl; valgfritt substituert C₁-C₆-alkylheterocykloalkyl; og valgfritt substituert heterocykloalkyl-C₁-C₆-alkyl; R¹¹ og R¹² er uavhengig valgt fra H; valgfritt substituert acyl; valgfritt substituert C₁-C₆-

alkyl; valgfritt substituert C₂-C₆-alkenyl; valgfritt substituert C₂-C₆-alkynyl; valgfritt substituert aryl; valgfritt substituert C₁-C₆-alkylaryl; valgfritt substituert aryl-C₁-C₆-alkyl; valgfritt substituert heteroaryl; valgfritt substituert C₁-C₆-alkylheteroaryl; valgfritt substituert heteroaryl-C₁-C₆-alkyl; valgfritt substituert C₃-C₈-cykloalkyl; valgfritt substituert C₁-C₆-alkyl-C₃-C₈-cykloalkyl; valgfritt substituert C₃-C₈-cykloalkyl-C₁-C₆-alkyl; valgfritt substituert heterocykloalkyl; valgfritt substituert C₁-C₆-alkylheterocykloalkyl; og valgfritt substituert heterocykloalkyl-C₁-C₆-alkyl eller -NR¹¹R¹² danner sammen en ring valgt fra valgfritt substituert heteroaryl og valgfritt substituert valgfritt substituert heterocykloalkyl; R¹³ er valgt fra valgfritt substituert aryl; valgfritt substituert heteroaryl; valgfritt substituert C₃-C₈-cykloalkyl og valgfritt substituert heterocykloalkyl; R¹⁴, R¹⁵ og R¹⁶ er uavhengig valgt fra H og valgfritt substituert C₁-C₆-alkyl; R¹⁷ er valgt fra valgfritt substituert C₁-C₆-alkyl; valgfritt substituert C₂-C₆-alkenyl; valgfritt substituert C₂-C₆-alkynyl; valgfritt substituert aryl; valgfritt substituert C₁-C₆-alkylaryl; valgfritt substituert aryl-C₁-C₆-alkyl; valgfritt substituert heteroaryl; valgfritt substituert C₁-C₆-alkylheteroaryl; valgfritt substituert heteroaryl-C₁-C₆-alkyl; valgfritt substituert C₃-C₈-cykloalkyl; valgfritt substituert C₁-C₆-alkyl-C₃-C₈-cykloalkyl; valgfritt substituert C₃-C₈-cykloalkyl-C₁-C₆-alkyl; valgfritt substituert heterocykloalkyl; valgfritt substituert C₁-C₆-alkylheterocykloalkyl; og valgfritt substituert heterocykloalkyl-C₁-C₆-alkyl; A er valgt fra valgfritt substituert aryl, og valgfritt substituert heteroaryl; B er valgt fra -OR¹⁰, -NR¹¹R¹² og -(CH₂)_p-R¹³; E er valgt fra valgfritt substituert C₃-C₈-cykloalkyl; valgfritt substituert C₂-C₆-alkynyl; -NR¹⁴R¹⁵; -(CH₂)_r-OR¹⁵ og -NR¹⁶C(O)-R¹⁷; m, n, p og q er heltall valgt fra 0 til 5; r er et heltall valgt fra 3 til 5; **G**₅ er valgt fra H; valgfritt substituert C₁-C₆-alkyl; valgfritt substituert C₂-C₆-alkenyl; valgfritt substituert C₂-C₆-alkynyl; valgfritt substituert aryl; valgfritt substituert C₁-C₆-alkylaryl; valgfritt substituert aryl-C₁-C₆-alkyl; valgfritt substituert heteroaryl; valgfritt substituert C₁-C₆-alkylheteroaryl; valgfritt substituert heteroaryl-C₁-C₆-alkyl; valgfritt substituert C₂-C₆-alkenylaryl; valgfritt substituert aryl-C₂-C₆-alkenyl; valgfritt substituert C₂-C₆-alkenylheteroaryl; valgfritt substituert heteroaryl-C₂-C₆-alkenyl; valgfritt substituert C₃-C₈-cykloalkyl; valgfritt substituert heterocykloalkyl; valgfritt substituert C₁-C₆-alkyl-C₃-C₈-cykloalkyl; valgfritt substituert C₃-C₈-cykloalkyl-C₁-C₆-alkyl; valgfritt substituert C₁-C₆-alkylheterocykloalkyl og valgfritt substituert heterocykloalkyl-C₁-C₆-alkyl; tautomerer, geometriske isomerer, optisk aktive former så som enantiomerer, diastereomerer og racematformer, samt farmasøytisk akseptable salter derav.

2. Derivat ifølge krav 1, hvor G₂ er valgfritt substituert fenyl.

3. Derivat ifølge krav 1 eller 2, hvor G_3 er valgfritt substituert aryl.
4. Derivat ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 3, hvor G_4 er $-(CHR^3)_m-(CH_2)_n-R^4$; R^3 , R^4 , m og n har betydningene angitt i et hvilket som helst av de forutgående krav.
5. Derivat ifølge et hvilket som helst av de forutgående kravene, hvor R^4 er $-(CH_2)_q-E$; E og q har betydningene angitt i et hvilket som helst av de forutgående kravene.
6. Derivat ifølge et hvilket som helst av de forutgående kravene, hvor G_5 er H.
7. Farmasøytisk sammensetning som inneholder minst ett derivat ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 6 og en farmasøytisk akseptabel bærer, et fortynningsmiddel eller en eksipiens derav.
8. Derivat ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 6, for anvendelse som et legemiddel.
9. Pyrazolpyridinderivat ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 6 for anvendelse ved forebyggelse og/eller behandling av en sykdom eller tilstand valgt fra kardiovaskulære forstyrrelser, respiratoriske forstyrrelser, forstyrrelser i metabolismen, hudforstyrrelser, benforstyrrelser, neuroinflammatoriske og/eller neurodegenerative forstyrrelser, nyresykdommer, reproduktive forstyrrelser, sykdommer som rammer øyet og/eller linsen og/eller tilstander som rammer det indre øre, inflammatoriske forstyrrelser, leversykdommer, smerte, kreft, allergiske forstyrrelser, traumatisme, septisk, hemoragisk og anafylaktisk sjokk, sykdommer eller forstyrrelser i mage/tarm-systemet, angiogenese, angiogenese-avhengige tilstander og andre sykdommer og/eller forstyrrelser forbundet med Nikotinamidadenin-dinukleotidfosfatoksidase (NADPH-Oksidase).
10. Pyrazolpyridinderivat for anvendelse ifølge krav 9, hvor nyresykdommen eller -forstyrrelsen er valgt fra diabetisk nefropati, nyresvikt, glomerulonefritt, nefrotoksisitet av aminoglykosider og platinforbindelser og hyperaktiv blære.
11. Pyrazolpyridinderivat for anvendelse ifølge krav 9, hvor leversykdommen eller -forstyrrelsen er valgt fra leverfibrose, alkoholindusert fibrose, steatose og ikke-alkoholsk steatohepatitt.

12. Pirazolpyridinderivat for anvendelse ifølge krav 9, hvor den respiratoriske forstyrrelse er valgt fra bronkial astma, bronkitt, allergisk rhinitt, respiratorisk syndrom hos voksne, viral lungebetennelse (influenza), pulmonær hypertensjon og kronisk obstruktive pulmonære sykdommer (COPD).
- 5 13. Pirazolpyridinderivat for anvendelse ifølge krav 9, hvor forstyrrelsen forbundet med Nikotinamidadenin-dinukleotidfosfatoksidase (NADPH-Oksidase) er idiopatisk pulmonær fibrose.
14. Pirazolpyridinderivat for anvendelse ifølge krav 9, hvor reproduksjonsforstyrrelsen eller -sykdommen er valgt fra erektil dysfunksjons-
- 10 fruktbarhetsforstyrrelser, prostatisk hypertrofi og godartet prostatahypertrofi.
15. Pirazolpyridinderivat for anvendelse ifølge krav 9, hvor kreftarten er valgt fra fibrosarkom, myxosarkom, liposarkom, kondrosarkom, osteogent sarkom, kordom, angiosarkom, endoteliumsarkom, lymfangiosarkom, lymfangioendoteliom, periosteom, mesoteliom, Ewings svulst, leiomyosarkom, rabdomyosarkom, kolon-
- 15 karsinom, bukspyttkjertelkreft, brystkreft, eggstokkreft, nyrekreft, prostata-
- karsinom, plateepitelkarsinom, basalcellekarsinom, adenokarsinom, svettkjertel-
- karsinom, talkjertelkarsinom, papillært karsinom, papillært adenokarsinom, cystadenokarsinom, medullært karsinom, bronkogent karsinom, nyrecellekarsinom, hepatocellulært karsinom, kolangiokarsinom, koriokarsinom, seminoma, embryonalt
- 20 karsinom, Wilms svulst, livmorhalskreft, orchioncus, lungekreft, småcellet lunge-
- kreft, lungeadenokarsinom, blærekreft og epitelkreft.
16. Pirazolpyridinderivat for anvendelse ifølge krav 9, hvor smerten er en hyperalgesi forbundet med inflammatorisk smerte.
17. Pirazolpyridinderivat for anvendelse ifølge krav 9, hvor benforstyrrelsen er
- 25 valgt fra osteoporose, osteoporase, osteosklerose, periodontitt og hyperparatyreoidisme.
18. Pirazolpyridinderivat for anvendelse ifølge krav 9, hvor sykdommen eller forstyrrelsen som rammer øyet og/eller linsen er valgt fra katarakt medregnet diabetisk katarakt, re-opasifisering av linsen etter kataraktkirurgi, diabetisk og
- 30 andre former for retinopati.

19. Pyrazolpyridinderivat for anvendelse ifølge krav 9, hvor den kardiovaskulære forstyrrelse eller sykdom er valgt fra aterosklerose, spesielt sykdommer eller forstyrrelser forbundet med endoteldysfunksjon, medregnet, men ikke begrenset til, hypertensjon, kardiovaskulære komplikasjoner av diabetes Type I eller Type II, 5 intimal hyperplasi, koronær hjertesykdom, cerebral, koronær eller arteriell vasospasme, endoteldysfunksjon, hjertesvikt medregnet kongestiv hjertesvikt, perifer arteriesykdom, restenose, trauma forårsaket av en stent, slag, iskjemisk anfall, vaskulære komplikasjoner så som etter organtransplantasjon, myokardialt infarkt, hypertensjon, dannelse av aterosklerotisk plakk, blodplateaggregering, 10 angina pectoris, aneurysme, aortadisseksjon, iskjemisk hjertesykdom, hjertehypertrofi, lungeembolus, trombotiske hendelser medregnet dyp venetrombose, skade forårsaket etter iskjemi ved gjenoppretelse av blodstrømmen eller oksygenleveringen så som ved organtransplantasjon, åpen hjertekirurgi, angioplasti, hemorragisk sjokk, angioplasti av iskjemiske organer medregnet hjerte, 15 hjerne, lever, nyre, retina og tarm.

20. Pyrazolpyridinderivat for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 10 til 19, hvor pyrazolpyridinderivatet er valgt fra den følgende gruppe:

2-(2-klorfenyl)-4-metyl-5-(2-morfolin-4-ylbenzyl)-1H-pyrazol[4,3-c]pyridin-3,6(2H,5H)-dion;

20 2-(2-klorfenyl)-4-metyl-5-{4-[(4-metyl)piperazin-1-yl)metyl]benzyl}-1H-pyrazol-[4,3-c]pyridin-3,6(2H,5H)-dion;

2-(2-klorfenyl)-4-metyl-5-(2-morfolin-4-yl-2-fenyletyl)-1H-pyrazol[4,3-c]pyridin-3,6(2H,5H)-dion;

25 2-(2-klorfenyl)-5-[2-(4-hydroksyfenyl)etyl]-4-metyl-1H-pyrazol[4,3-c]pyridin-3,6(2H,5H)-dion;

5-(3-etoksypropyl)-4-metyl-2-(4-fenyl-1,3-tiazol-2-yl)-1H-pyrazol[4,3-c]pyridin-3,6(2H,5H)-dion;

2-(2-klorfenyl)-4,5-dimetyl-1H-pyrazol[4,3-c]pyridin-3,6(2H,5H)-dion;

2-(2-fluorfenyl)-4,5-dimetyl-1H-pyrazol[4,3-c]pyridin-3,6(2H,5H)-dion;

4-metyl-5-(3-fenoksybenzyl)-2-(4-fenyl-1,3-tiazol-2-yl)-1H-pyrazol[4,3-c]pyridin-3,6(2H,5H)-dion;

4,5-dimetyl-2-(4-fenyl-1,3-tiazol-2-yl)-1H-pyrazol[4,3-c]pyridin-3,6(2H,5H)-dion;

2-(3-klorfenyl)-4,5-dimetyl-1H-pyrazol[4,3-c]pyridin-3,6(2H,5H)-dion;

5 N-[2-(2-klorfenyl)-4-metyl-3,6-diokso-1,2,3,6-tetrahydro-5H-pyrazol[4,3-c]pyridin-5-yl]-2-(4-fluorfenoksy)acetamid;

2-(2-klorfenyl)-4-metyl-5-(3-fenoksybenzyl)-1H-pyrazol[4,3-c]pyridin-3,6(2H,5H)-dion;

10 5-(3-etoksypropyl)-2-(2-fluorfenyl)-4-metyl-1H-pyrazol[4,3-c]pyridin-3,6(2H,5H)-dion;

2-(3-klorfenyl)-5-(3-etoksypropyl)-4-metyl-1H-pyrazol[4,3-c]pyridin-3,6(2H,5H)-dion;

2-(3-klorfenyl)-4-metyl-5-[2-(morfolin-4-ylmetyl)benzyl]-1H-pyrazol[4,3-c]pyridin-3,6(2H,5H)-dion;

15 2-(2-fluorfenyl)-4-metyl-5-[2-(morfolin-4-ylmetyl)benzyl]-1H-pyrazol[4,3-c]pyridin-3,6(2H,5H)-dion;

2-(2-fluorfenyl)-4-metyl-5-[(6-morfolin-4-ylpyridin-2-yl)metyl]-1H-pyrazol[4,3-c]pyridin-3,6(2H,5H)-dion;

20 2-(2-fluorfenyl)-4-metyl-5-[4-(morfolin-4-ylmetyl)benzyl]-1H-pyrazol[4,3-c]pyridin-3,6(2H,5H)-dion;

2-(3-klorfenyl)-4-metyl-5-[(6-morfolin-4-ylpyridin-2-yl)metyl]-1H-pyrazol[4,3-c]pyridin-3,6(2H,5H)-dion;

3-(4,5-dimetyl-3,6-diokso-1,3,5,6-tetrahydro-2H-pyrazol[4,3-c]pyridin-2-yl)-benzonitril;

- 2-(2-fluorfenyl)-4-metyl-5-(3-fenoksybenzyl)-1H-pyrazol[4,3-c]pyridin-3,6(2H,5H)-dion;
- 2-(3-klorfenyl)-4-metyl-5-(3-fenoksybenzyl)-1H-pyrazol[4,3-c]pyridin-3,6(2H,5H)-dion;
- 5 2-(2-klorfenyl)-5-(3-etoksypropyl)-4-metyl-1H-pyrazol[4,3-c]pyridin-3,6(2H,5H)-dion;
- 2-(2-klorfenyl)-4-metyl-5-[(6-morfolin-4-ylpyridin-2-yl)metyl]-1H-pyrazol[4,3-c]pyridin-3,6(2H,5H)-dion;
- 10 2-(3-klorfenyl)-4-metyl-5-[4-(4-metylpiperazin-1-yl)-4-oksobutyl]-1H-pyrazol[4,3-c]pyridin-3,6(2H,5H)-dion;
- 2-(3-klorfenyl)-4-metyl-5-[4-(morfolin-4-ylmetyl)benzyl]-1H-pyrazol[4,3-c]pyridin-3,6(2H,5H)-dion;
- 2-[2-(2-fluorfenyl)-4-metyl-3,6-diokso-1,2,3,6-tetrahydro-5H-pyrazol[4,3-c]pyridin-5-yl]-N-(pyridin-2-ylmetyl)acetamid;
- 15 2-(2-klorfenyl)-4-metyl-5-[4-(morfolin-4-ylmetyl)benzyl]-1H-pyrazol[4,3-c]pyridin-3,6(2H,5H)-dion;
- 2-(2-klorfenyl)-4-metyl-5-[2-(morfolin-4-ylmetyl)benzyl]-1H-pyrazol[4,3-c]pyridin-3,6(2H,5H)-dion;
- 4-metyl-5-(3-fenoksybenzyl)-2-[1,2,4]triazolo[4,3-b]pyridazin-6-yl-1H-pyrazol[4,3-c]pyridin-3,6(2H,5H)-dion;
- 20 3-[5-(3-etoksypropyl)-4-metyl-3,6-diokso-1,3,5,6-tetrahydro-2H-pyrazol[4,3-c]pyridin-2-yl]benzonitril;
- 2-[4-(benzyloksy)fenyl]-4,5-dimetyl-1H-pyrazol[4,3-c]pyridin-3,6(2H,5H)-dion;
- 2-[4-(benzyloksy)fenyl]-4-metyl-5-(3-fenoksybenzyl)-1H-pyrazol[4,3-c]pyridin-3,6(2H,5H)-dion;
- 25

2-[4-(benzyloksy)fenyl]-5-(3-etoksypropyl)-4-metyl-1H-pyrazol[4,3-c]pyridin-3,6(2H,5H)-dion;

3-4-metyl-5-[4-(morfolin-4-ylmetyl)benzyl]-3,6-diokso-1,3,5,6-tetrahydro-2H-pyrazol[4,3-c]pyridin-2-yl}benzonitril;

5 2-(2-klorfenyl)-5-(3-hidroksypropyl)-4-metyl-1H-pyrazol[4,3-c]pyridin-3,6(2H,5H)-dion;

2-[2-(2-klorfenyl)-4-metyl-3,6-diokso-1,2,3,6-tetrahydro-5H-pyrazol[4,3-c]pyridin-5-yl]-N-(pyridin-2-ylmetyl)acetamid;

10 2-[2-(3-cyanofenyl)-4-metyl-3,6-diokso-1,2,3,6-tetrahydro-5H-pyrazol[4,3-c]pyridin-5-yl]-N-(pyridin-2-ylmetyl)acetamid;

2-[2-(3-klorfenyl)-4-metyl-3,6-diokso-1,2,3,6-tetrahydro-5H-pyrazol[4,3-c]pyridin-5-yl]-N-(pyridin-2-ylmetyl)acetamid;

2-(2-klorfenyl)-5-[3-(dietylamino)propyl]-4-metyl-1H-pyrazol[4,3-c]pyridin-3,6(2H,5H)-dion;

15 2-(2-klorfenyl)-5-(cykloheksylmetyl)-4-metyl-1H-pyrazol[4,3-c]pyridin-3,6(2H,5H)-dion;

2-(3-klorfenyl)-5-(3-hidroksypropyl)-4-metyl-1H-pyrazol[4,3-c]pyridin-3,6(2H,5H)-dion;

20 2-(2-klorfenyl)-4-metyl-5-[4-(4-metyl piperazin-1-yl)-4-oksobutyl]-1H-pyrazol[4,3-c]pyridin-3,6(2H,5H)-dion;

2-(2-klorfenyl)-5-(3-fenoksybenzyl)-1H-pyrazol[4,3-c]pyridin-3,6(2H,5H)-dion;

2-(3-klorfenyl)-4-metyl-5-(3-morfolin-4-yl-3-fenylpropyl)-1H-pyrazol[4,3-c]pyridin-3,6(2H,5H)-dion;

25 2-(3-klorfenyl)-4-metyl-5-(3-fenylprop-2-yn-1-yl)-1H-pyrazol[4,3-c]pyridin-3,6(2H,5H)-dion;

- 2-(2-klor-4-fluorfenyl)-4-metyl-5-[2-(morfolin-4-ylmetyl)benzyl]-1H-pyrazol-
[4,3-c]pyridin-3,6(2H,5H)-dion;
- 4,5-dimetyl-2-{5-[(4-metylpiperazin-1-yl)sulfonyl]pyridin-2-yl}-1H-pyrazol[4,3-c]-
pyridin-3,6(2H,5H)-dion;
- 5 2-(2-fluorfenyl)-4-metyl-5-(3-morfolin-4-yl-3-fenylpropyl)-1H-pyrazol[4,3-c]-
pyridin-3,6(2H,5H)-dion;
- 2-(2,5-diklorfenyl)-4-metyl-5-[2-(morfolin-4-ylmetyl)benzyl]-1H-pyrazol[4,3-c]-
pyridin-3,6(2H,5H)-dion;
- 10 2-[2-(benzyloksy)fenyl]-5-(3-etoksypropyl)-4-metyl-1H-pyrazol[4,3-c]pyridin-
3,6(2H,5H)-dion;
- 2-(2,5-diklorfenyl)-4-metyl-5-(2-morfolin-4-yl-2-oksoetyl)-1H-pyrazol[4,3-c]-
pyridin-3,6(2H,5H)-dion;
- N-{2-[2-(2,5-diklorfenyl)-4-metyl-3,6-diokso-1,2,3,6-tetrahydro-5H-pyrazol-
[4,3-c]pyridin-5-yl]etyl}acetamid;
- 15 2-(2-klor-4-fluorfenyl)-4-(metoksymetyl)-5-[2-(morfolin-4-ylmetyl)benzyl]-1H-
pyrazol[4,3-c]pyridin-3,6(2H,5H)-dion;
- 2-(2-klorfenyl)-5-[2-(dimetylamino)etyl]-4-metyl-1H-pyrazol[4,3-c]pyridin-
3,6(2H,5H)-dion;
- 20 2-[4-(benzyloksy)fenyl]-4-metyl-5-[2-(morfolin-4-ylmetyl)benzyl]-1H-pyrazol-
[4,3-c]pyridin-3,6(2H,5H)-dion;
- 2-(3-klorfenyl)-4-metyl-5-[2-(4-metylpiperazin-1-yl)benzyl]-1H-pyrazol[4,3-c]-
pyridin-3,6(2H,5H)-dion;
- 2-(3,4-diklorfenyl)-4-metyl-5-[4-(4-metylpiperazin-1-yl)-4-oksobutyl]-1H-pyrazol-
[4,3-c]pyridin-3,6(2H,5H)-dion;
- 25 5-[2-(4-benzylpiperazin-1-yl)-2-oksoetyl]-2-(2,5-diklorfenyl)-4-metyl-1H-pyrazol-
[4,3-c]pyridin-3,6(2H,5H)-dion;

2-(2-klorfenyl)-4-metyl-5-(3-fenylprop-2-yn-1-yl)-1H-pyrazol[4,3-c]pyridin-3,6(2H,5H)-dion;

N-{3-[5-(3-etoksypropyl)-4-metyl-3,6-diokso-1,3,5,6-tetrahydro-2H-pyrazol[4,3-c]pyridin-2-yl]fenyl}acetamid;

5 2-benzyl-4-metyl-5-[2-(morfolin-4-ylmetyl)benzyl]-1H-pyrazol[4,3-c]pyridin-3,6(2H,5H)-dion;

2-(3,4-diklorfenyl)-4-metyl-5-[2-(morfolin-4-ylmetyl)benzyl]-1H-pyrazol[4,3-c]-pyridin-3,6(2H,5H)-dion;

2-(2-klor-4-fluorfenyl)-4,5-dimetyl-1H-pyrazol[4,3-c]pyridin-3,6(2H,5H)-dion;

10 2-[4-(benzyloksy)fenyl]-4-metyl-5-(2-morfolin-4-yl-2-oksoetyl)-1H-pyrazol[4,3-c]-pyridin-3,6(2H,5H)-dion;

2-(3,4-diklorfenyl)-4-metyl-5-(2-morfolin-4-yl-2-oksoetyl)-1H-pyrazol[4,3-c]-pyridin-3,6(2H,5H)-dion;

15 metyl[2-(2,5-diklorfenyl)-4-metyl-3,6-diokso-1,2,3,6-tetrahydro-5H-pyrazol[4,3-c]-pyridin-5-yl]acetat;

N-{3-[2-(2,3-diklorfenyl)-4-metyl-3,6-diokso-1,2,3,6-tetrahydro-5H-pyrazol[4,3-c]pyridin-5-yl]fenyl}acetamid;

2-(2,3-diklorfenyl)-4-metyl-5-[4-(4-metyl piperazin-1-yl)-4-oksobutyl]-1H-pyrazol[4,3-c]pyridin-3,6(2H,5H)-dion;

20 N-{3-[2-(3-klor-4-fluorfenyl)-4-metyl-3,6-diokso-1,2,3,6-tetrahydro-5H-pyrazol[4,3-c]pyridin-5-yl]fenyl}acetamid;

5-[2-(4-benzyl piperazin-1-yl)-2-oksoetyl]-2-(3,4-diklorfenyl)-4-metyl-1H-pyrazol[4,3-c]pyridin-3,6(2H,5H)-dion;

25 N-{3-[2-(2-klor-4-fluorfenyl)-4-metyl-3,6-diokso-1,2,3,6-tetrahydro-5H-pyrazol[4,3-c]pyridin-5-yl]fenyl}acetamid;

- 2-(3-klorfenyl)-5-(3-etoksypropyl)-4-(3-metoksybenzyl)-1H-pyrazol[4,3-c]pyridin-3,6(2H,5H)-dion;
- 2-(3-klor-4-fluorfenyl)-4-metyl-5-(2-morfolin-4-yl-2-oksoetyl)-1H-pyrazol[4,3-c]-pyridin-3,6(2H,5H)-dion;
- 5 2-(3-klor-4-fluorfenyl)-4-metyl-5-[4-(4-metylpiperazin-1-yl)-4-oksobutyl]-1H-pyrazol[4,3-c]pyridin-3,6(2H,5H)-dion;
- 2-(2-klor-4-fluorfenyl)-4-metyl-5-(2-morfolin-4-yl-2-oksoetyl)-1H-pyrazol[4,3-c]-pyridin-3,6(2H,5H)-dion;
- 10 5-[2-(4-benzylpiperazin-1-yl)-2-oksoetyl]-2-(2-klor-4-fluorfenyl)-4-metyl-1H-pyrazol[4,3-c]pyridin-3,6(2H,5H)-dion;
- 2-[4-(benzyloksy)fenyl]-4-metyl-5-[4-(4-metylpiperazin-1-yl)-4-oksobutyl]-1H-pyrazol[4,3-c]pyridin-3,6(2H,5H)-dion;
- 2-(2,3-diklorfenyl)-4-metyl-5-[2-(morfolin-4-ylmetyl)benzyl]-1H-pyrazol[4,3-c]-pyridin-3,6(2H,5H)-dion;
- 15 2-(2-klor-4-fluorfenyl)-4-metyl-5-[2-(4-metylpiperazin-1-yl)benzyl]-1H-pyrazol[4,3-c]pyridin-3,6(2H,5H)-dion;
- N-(3-{[2-(3-klor-4-fluorofenyl)-4-metyl-3,6-diokso-1,2,3,6-tetrahydro-5H-pyrazol[4,3-c]pyridin-5-yl]metyl}fenyl)acetamid;
- 5-[2-(4-benzylpiperazin-1-yl)-2-oksoetyl]-2-(3-klor-4-fluorfenyl)-4-metyl-1H-pyrazol[4,3-c]pyridin-3,6(2H,5H)-dion
- 20 N-(3-{[2-(2-klor-4-fluorofenyl)-4-metyl-3,6-diokso-1,2,3,6-tetrahydro-5H-pyrazol[4,3-c]pyridin-5-yl]metyl}fenyl)acetamid;
- 2-(2-klor-4-fluorfenyl)-4-metyl-5-[4-(4-metylpiperazin-1-yl)-4-oksobutyl]-1H-pyrazol[4,3-c]pyridin-3,6(2H,5H)-dion;
- 25 3-{4-metyl-5-[2-(morfolin-4-ylmetyl)benzyl]-3,6-diokso-1,3,5,6-tetrahydro-2H-pyrazol[4,3-c]pyridin-2-yl}benzonitril;

- N-{2-[2-(3-klor-4-fluorfenyl)-4-metyl-3,6-diokso-1,2,3,6-tetrahydro-5H-pyrazol-[4,3-c]pyridin-5-yl]etyl}-4-fluorbenzamid;
- N-{2-[2-(2-klor-4-fluorfenyl)-4-metyl-3,6-diokso-1,2,3,6-tetrahydro-5H-pyrazol-[4,3-c]pyridin-5-yl]etyl}-4-fluorbenzamid;
- 5 2-[2-(2-klor-4-fluorfenyl)-4-metyl-3,6-diokso-1,2,3,6-tetrahydro-5H-pyrazol-[4,3-c]pyridin-5-yl]-N-(pyridin-2-ylmetyl)acetamid;
- N-(2-{2-[4-(benzyloksy)fenyl]-4-metyl-3,6-diokso-1,2,3,6-tetrahydro-5H-pyrazol-[4,3-c]pyridin-5-yl}etyl)-4-fluorbenzamid;
- 2-(3-klor-4-fluorfenyl)-4-metyl-5-[2-(morfolin-4-ylmetyl)benzyl]-1H-pyrazol-
- 10 [4,3-c]pyridin-3,6(2H,5H)-dion;
- N-(3-{4-metyl-5-[2-(morfolin-4-ylmetyl)benzyl]-3,6-diokso-1,3,5,6-tetrahydro-2H-pyrazol[4,3-c]pyridin-2-yl}fenyl)acetamid;
- 2-(4-klorfenyl)-4-metyl-5-(3-fenoksybenzyl)-1H-pyrazol[4,3-c]pyridin-3,6(2H,5H)-dion;
- 15 2-[2-(3-klor-4-fluorfenyl)-4-metyl-3,6-diokso-1,2,3,6-tetrahydro-5H-pyrazol-[4,3-c]pyridin-5-yl]-N-(pyridin-2-ylmetyl)acetamid;
- 2-[4-butyl-2-(3-klor-4-fluorfenyl)-3,6-diokso-1,2,3,6-tetrahydro-5H-pyrazol[4,3-c]-pyridin-5-yl]-N-(pyridin-2-ylmetyl)acetamid;
- 2-[2-(2,3-diklorfenyl)-4-metyl-3,6-diokso-1,2,3,6-tetrahydro-5H-pyrazol[4,3-c]-pyridin-5-yl]-N-(pyridin-2-ylmetyl)acetamid;
- 20 2-[2,4-bis(3-klorfenyl)-3,6-diokso-1,2,3,6-tetrahydro-5H-pyrazol[4,3-c]pyridin-5-yl]-N-(pyridin-2-ylmetyl)acetamid;
- 2,4-bis(3-klorfenyl)-5-(3-hidroksypropyl)-1H-pyrazol[4,3-c]pyridin-3,6(2H,5H)-dion;
- 25 2-(2-klorfenyl)-4-metyl-5-(2-morfolin-4-yl-2-oksoetyl)-1H-pyrazol[4,3-c]pyridin-3,6(2H,5H)-dion;

N-{3-[4-(3-klorfenyl)-5-(3-hydroksypropyl)-3,6-diokso-1,3,5,6-tetrahydro-2H-pyrazol[4,3-c]pyridin-2-yl]fenyl}acetamid;

2-(2-klorfenyl)-4-metyl-5-[2-(4-metyl piperazin-1-yl)-2-oksoetyl]-1H-pyrazol[4,3-c]pyridin-3,6(2H,5H)-dion;

- 5 2-(2-klorfenyl)-4-(4-klorfenyl)-5-(3-etoksypropyl)-1H-pyrazol[4,3-c]pyridin-3,6(2H,5H)-dion;

2-(2-klorfenyl)-4-(4-klorfenyl)-5-metyl-1H-pyrazol[4,3-c]pyridin-3,6(2H,5H)-dion;

2-(2-klorfenyl)-4-(2-fluorfenyl)-5-metyl-1H-pyrazol[4,3-c]pyridin-3,6(2H,5H)-dion;

- 10 2-(2-klorfenyl)-4-(4-klorfenyl)-5-[3-(dimetylamino)propyl]-1H-pyrazol[4,3-c]pyridin-3,6(2H,5H)-dion;

2-(2-klorfenyl)-4-[3-(dimetylamino)fenyl]-5-metyl-1H-pyrazol[4,3-c]pyridin-3,6(2H,5H)-dion;

2-(2-klorfenyl)-5-metyl-4-(3-morfolin-4-ylfenyl)-1H-pyrazol[4,3-c]pyridin-3,6(2H,5H)-dion;

- 15 2-(2-klorfenyl)-4-[1-(3,4-difluorfenoksy)etyl]-5-metyl-1H-pyrazol[4,3-c]pyridin-3,6(2H,5H)-dion;

4-[1-(benzyloksy)etyl]-2-(2-klorfenyl)-5-metyl-1H-pyrazol[4,3-c]pyridin-3,6(2H,5H)-dion; og

- 20 4-[3-(dimetylamino)fenyl]-2-(2-metoksyfenyl)-5-metyl-1H-pyrazol[4,3-c]pyridin-3,6(2H,5H)-dion.

21. Pyrazolpyridinderivat for anvendelse ifølge krav 20, hvor pyrazolpyridinderivatet er 2-(2-klorfenyl)-4-[3-(dimetylamino)fenyl]-5-metyl-1H-pyrazol[4,3-c]pyridin-3,6(2H,5H)-dion.