РОССИЙСКАЯ ФЕДЕРАЦИЯ

(19) **RU** (11) **2003 121 304** (13) **A**

(51) МПК[7] **C 07 D 513/00**

ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ,
ПАТЕНТАМ И ТОВАРНЫМ ЗНАКАМ

(12) ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ

(21), (22) Заявка: **2003121304/04, 19.12.2001**

(30) Приоритет: **20.12.2000 US 60/256,740**

(43) Дата публикации заявки: **27.01.2005 Бюл. № 3**

(85) Дата перевода заявки PCT на национальную фазу: **21.07.2003**

(86) Заявка PCT:
US 01/49371 (19.12.2001)

(87) Публикация PCT:
WO 02/05912 (01.08.2002)

Адрес для переписки:
119034, Москва, Пречистенский пер., 14, стр.1, 4-й эт., В.Н.Дементьеву

(71) Заявитель(и):
БРИСТОЛ-МАЕРС СКВИББ КОМПАНИ (US)

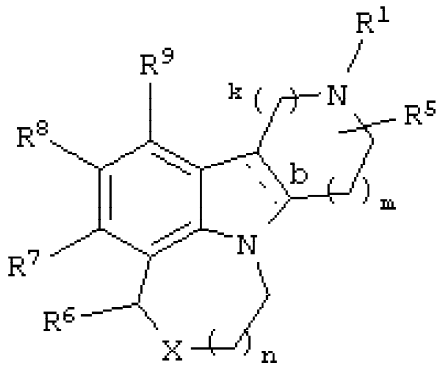
(72) Автор(ы):
РОБИЧОД Альберт (US),
ФЕВИГ Джон М. (US),
МИТЧЕЛЛ Йен С. (US),
ЛИ Таекиу (US),
ЧЕН Вентинг (US),
КЭКСИОЛА Джозеф (US)

(74) Патентный поверенный:
Дементьев Владимир Николаевич

(54) ЗАМЕЩЕННЫЕ ПИРИДОИНДОЛЫ В КАЧЕСТВЕ АГОНИСТОВ И АНТАГОНИСТОВ СЕРОТОНИНА

Формула изобретения

1. Соединение формулы (I)



(I)

его стереоизомеры или его фармацевтически приемлемая соль,
где b представляет собой простую или двойную связь;
X представляет собой -O-, -S-, -S(=O)-, $-S(=O)_2-$ или $-NR^{10}-$;
R^1 выбран из
H,
$C(=O)R^2$,
$C(=O)OR^2$,

RU 2003121304 A

RU 2003121304 A

C_{1-8} алкила,
C_{2-8} алкенила,
C_{2-8} алкинила,
C_{3-7} циклоалкила,
C_{1-6} алкила, замещенного Z,
C_{2-6} алкенила, замещенного Z,
C_{2-6} алкинила, замещенного Z,
C_{3-6} циклоалкила, замещенного Z,
арила, замещенного Z,
5-6-членной гетероциклической кольцевой системы, содержащей, по крайней мере, один гетероатом, выбранный из группы, состоящей из N, O и S, указанная гетероциклическая кольцевая система, замещена Z;
C_{1-3} алкила, замещенного Y,
C_{2-3} алкенила, замещенного Y,
C_{2-3} алкинила, замещенного Y,
C_{1-6} алкила, замещенного 0-2 R^2,
C_{2-6} алкенила, замещенного 0-2 R^2,
C_{2-6} алкинила, замещенного 0-2 R^2,
арила, замещенного 0-2 R^2 и
5-6-членной гетероциклической кольцевой системы, содержащей, до крайней мере, один гетероатом, выбранный из группы, состоящей из N, O и S, указанная гетероциклическая кольцевая система, замещена 0-2 R^2;
Y выбран из
C_{3-6} циклоалкила, замещенного Z,
арила, замещенного Z,
5-6-членной гетероциклической кольцевой системы, содержащей, по крайней мере, один гетероатом, выбранный из группы, состоящей из N, O и S, указанной гетероциклической кольцевой системы, замещенной Z;
C_{3-6} циклоалкила, замещенного -(C_{1-3} алкил)-Z, арила, замещенного -(C_{1-3} алкил)-Z и 5-6-членной гетероциклической кольцевой системы, содержащей, по крайней мере, один гетероатом, выбранной из группы, состоящей из N, O и S, указанной гетероциклической кольцевой системы, замещенной -(C_{1-3} алкил)-Z;
Z выбран из H,
$-CH(OH)R^2$,
-C(этилендиокси)R^2,
$-OR^2$,
$-SR^2$,
$-NR^2R^3$,
$-C(O)R^2$,
$-C(O)NR^2R^3$,
$-NR^3C(O)R^2$,
$-C(O)OR^2$,
$-OC(O)R^2$,
$-CH(=NR^4)NR^2R^3$,
$-NHC(=NR^4)NR^2R^3$,
$-S(O)R^2$,
$-S(O)_2R^2$,
$-S(O)_2NR^2R^3$ и $-NR^3S(O)_2R^2$;
R^2, в случае присутствия, независимо является выбранным из галогена,
C_{1-3}галогеналкила,
C_{1-4} алкила,

RU 2003121304 A
RU 2003121304 A

C_{2-4} алкенила,

C_{2-4} алкинила,

C_{3-6} диклоалкила,

арила, замещенного 0-5 R^{42};

C_{3-10} карбоциклического остатка, замещенного 0-3 R^{41} и 5-10-членной гетероциклической кольцевой системы, содержащей 1-4 гетероатомов, выбранных из группы, состоящей из N, O и S, замещенной 0-3 R^{41};

R^3, в случае присутствия, независимо является выбранным из

H, C_{1-4} алкила, C_{2-4} алкенила, C_{2-4} алкинила и C_{1-4} алкокси;

альтернативно, R^2 и R^3 объединяются, чтобы образовать 5- или 6-членное кольцо, необязательно замещенное -O- или -N(R^4)-;

R^4, в случае присутствия, независимо является выбранным из H и C_{1-4} алкила;

R^5 представляет собой H или C_{1-4} алкил; R^6 представляет собой H или C_{1-4} алкил;

R^7 и R^9, в случае присутствия,независимо являются выбранными из

H, галогена, $-CF_3$, $-OCF_3$, -OH, -CN, $-NO_2$, $-NR^{46}R^{47}$, C_{1-8} алкила, C_{2-8} алкенила, C_{2-8} алкинила, C_{1-4} галогеналкила, C_{1-8} алкокси, (C_{1-4} галогеналкил) окси, C_{3-10} циклоалкила, замещенного 0-2 R^{33}, C_{1-4} алкила, замещенного 0-2 R^{11}, C_{3-10} карбоциклического остатка, замещенного 0-3 R^{33}, арила, замещенного 0-5 R^{33}, 5-10-членной гетероциклической кольцевой системы, содержащей 1-4 гетероатомов, выбранных из группы, состоящей из N, O и S, замещенных 0-3 R^{31};

OR^{12}, SR^{12}, $NR^{12}R^{13}$, C(O)H, $C(O)R^{12}$, $C(O)NR^{12}R^{13}$, $NR^{14}C(O)R^{12}$, $C(O)OR^{12}$, $OC(O)R^{12}$, $OC(O)OR^{12}$, $CH(=NR^{14})NR^{12}R^{13}$, $NHC(=NR^{14})NR^{12}R^{13}$; $S(O)R^{12}$, $S(O)_2R^{12}$, $S(O)NR^{12}R^{13}$, $S(O)_2NR^{12}R^{13}$, $NR^{14}S(O)R^{12}$, $NR^{14}S(O)^2R^{12}$, $NR^{12}C(O)_2R^{15}$, $NR^{12}C(O)R^{15}$, $NR^{12}S(O)_2R^{15}$ и $NR^{12}C(O)NHR^{15}$;

R^8 выбран из

H, галогена, $-CF_3$, $-OCF_3$, -OH, -CN, $-NO_2$,

C_{1-8} алкила, C_{2-8} алкенила, C_{2-8} алкинила, C_{1-4} галогеналкила,

C_{1-8} алкокси, (C_{1-4} галогеналкил)окси, C_{3-10} циклоалкила, замещенного 0-2 R^{33}, C_{1-4} алкила, замещенного 0-2 R^{11}, C_{2-4} алкенила, замещенного 0-2 R^{11}, C_{2-4} алкинила, замещенного 0-1 R^{11}, C_{3-10} карбоциклического остатка, замещенного 0-3 R^{33}, арила, замещенного 0-5 R^{33}, 5-10-членной гетероциклической кольцевой системы, содержащей 1-4 гетероатомов, выбранных из группы, состоящей из N, O и S, замещенных 0-3 R^{31};

OR^{12}, SR^{12}, $NR^{12}R^{13}$, C(O)H, $C(O)R^{12}$, $C(O)NR^{12}R^{13}$, $NR^{14}C(O)R^{12}$, $C(O)OR^{12}$, $OC(O)R^{12}$, $OC(O)OR^{12}$, $CH(=HR^{14})NR^{12}R^{13}$, $NHC(=NR^{14})NR^{12}R^{13}$, $S(O)R^{12}$, $S(O)_2R^{12}$, $S(O)NR^{12}R^{13}$, $S(O)_2NR^{12}R^{13}$, $NR^{14}S(O)R^{12}$, $NR^{14}S(O)_2R^{12}$, $NR^{12}C(O)R^{15}$, $NR^{12}C(O)OR^{15}$, $NR^{12}S(O)_2R^{15}$ и $NR^{12}C(O)NHR^{15}$;

R^{10} выбран из H,

C_{1-4} алкила, замещенного 0-2 R^{10A},

C_{2-4} алкенила, замещенного 0-2 R^{10A},

C_{2-4} алкинила, замещенного 0-1 R^{10A} и

C_{1-4} алкокси;

R^{10A} выбран из C_{1-4} алкокси,

C_{3-6} карбоциклического остатка, замещенного 0-3 R^{33}, фенила, замещенного 0-3 R^{33} и

5-6-членной гетероциклической кольцевой системы, содержащей 1, 2 или 3 гетероатомов, выбранных из группы, состоящей из N, O и S; замещенной 0-2 R^{44};

R^{11} выбран из

H, галогена, $-CF_3$, -CN, $-NO_2$,

C_{1-6} алкила, C_{2-8} алкенила, C_{2-8} алкинила, C_{1-4} галогеналкила,

C_{1-8} алкокси, C_{3-10} циклоалкила,

RU 2003121304 A

RU 2003121304 A

C_{3-10} карбоциклического остатка, замещенного 0-3 R^{33}, арила, замещенного 0-5 R^{33},

5-10-членной гетероциклической кольцевой системы, содержащей 1-4 гетероатомов, выбранных из группы, состоящей из N, O и S, замещенной 0-3 R^{31};

OR^{12}, SR^{12}, $NR^{12}R^{13}$, C(O)H, $C(O)R^{12}$, $C(O)NR^{12}R^{13}$, $NR^{14}C(O)R^{12}$, $C(O)OR^{12}$, $OC(O)R^{12}$, $OC(O)OR^{12}$, $CH(=NR^{14})NR^{12}R^{13}$, $NHC(=NR^{14})NR^{12}R^{13}$, $S(O)R^{12}$, $S(O)_2R^{12}$, $S(O)NR^{12}R^{l3}$, $S(O)_2NR^{12}R^{13}$, $NR^{14}S(O)R^{12}$, $NR^{14}S(O)_2R^{12}$, $NR^{12}C(O)^{15}$, $NR^{12}C(O)OR^{15}$, $NR^{12}S(O)_2R^{15}$ и $NR^{12}C(O)NHR^{15}$;

R^{12}, в случае присутствия, независимо является выбранным из C_{1-4} алкила, замещенного 0-1R^{12a}, C_{2-4} алкенила, замещенного 0-1 R^{12a}, C_{2-4} алкинила, замещенного 0-1 R^{12a}, C_{3-6}циклоалкила, замещенного 0-3 R^{33}, арила, замещенного 0-5 R^{33};

C_{3-10}карбоциклического остатка, замещенного 0-3 R^{33} и 5-10-членной гетероциклической кольцевой системы, содержащей 1-4 гетероатомов, выбранных из группы, состоящей из N, O и S, замещенной 0-3 R^{31};

R^{12a}, в случае присутствия, независимо является выбранным из фенила, замещенного 0-5 R^{33}; C_{3-10} карбоциклического остатка, замещенного 0-3 R^{33} и 5-10-членной гетероциклической кольцевой системы, содержащей 1-4 гетероатомов, выбранных из группы, состоящей из N, O и S, замещенной 0-3 R^{31};

R^{13}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, C_{1-4} алкила, C_{2-4} алкенила и C_{2-4} алкинила;

альтернативно, R^{12} и R^{13} объединяются, чтобы образовать 5- или 6-членное кольцо, необязательно замещенное –O- или -$N(R^{14})$-;

альтернативно, R^{12} и R^{13}, когда присоединены к N, могут быть объединены, чтобы образовывать 9- или 10-членную бициклическую гетероциклическую кольцевую систему, содержащую 1-3 гетероатомов, выбранных из группы, состоящей из N, O и S, где указанная бициклическая гетероциклическая кольцевая система является ненасыщенной или частично ненасыщенной, где указанная бициклическая гетероциклическая кольцевая система является замещенной 0-3 R^{16};

R^{14}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H и C_{1-4} алкила;

R^{15}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, C_{1-4} алкила, C_{2-4} алкенила и C_{2-4} алкинила;

R^{16}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, OH, галогена, CN, NO_2, CF_3, SO_2R^{45}, $NR^{46}R^{47}$, -C(=O)H, C_{1-4} алкила, C_{2-4} алкенила, C_{2-4} алкинила, C_{1-4} галогеналкила, C_{1-3} галогеналкил-окси-, C_{1-3} алкилокси- и =O;

R^{31}, в случае присутствия, независимо является выбранным из

H, OH, галогена, CF_3, SO_2R^{45}, $NR^{46}R^{47}$, C_{1-4} алкила и =O;

R^{33}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, OH, галогена, CN, NO_2, CF_3, -OCF_3, SO_2R^{45}, $NR^{46}R^{47}$, -C(=O)H,=O, -$C(=O)NH_2$, -$C(=O)OCH_3$, фенила, C_{1-6} алкила, C_{2-6} алкенила, C_{2-6} алкинила, C_{3-6} циклоалкила, C_{1-4} галогеналкила, C_{1-4} галогеналкила-окси-, C_{1-4} алкилокси-, C_{1-4} алкилтио-, C_{1-4} алкил-C(=O)-, C_{1-4} алкил-OC(=O)-, C_{1-4} алкил-C(=O)O-, C_{1-4} алкил-C(=O)NH-, C_{1-4} алкил-NHC(=O)-, $(C_{1-4}алкил)_2NC(=O)$-, C_{3-6} циклоалкила-окси-, C_{3-6}циклоалкилметила-окси-;

C_{1-6} алкила, замещенного OH, метокси, этокси, пропокси, бутокси, -SO_2R^{45}, -$NR^{46}R^{47}$, $NR^{46}R^{47}C(=O)$-или $(C_{1-4}алкил)CO_2$-; и

C_{2-6} алкенила, замещенного OH, метокси, этокси, пропокси, бутокси, -SO_2R^{45}, -$NR^{46}R^{47}$, $NR^{46}R^{47}C(=O)$- или $(C_{1-4}$ алкил$)CO_2$-;

R^{41}, в случае присутствия, независимо является выбранным из

H, CF_3, галогена, OH, CO_2H, SO_2R^{45}, $NR^{46}R^{47}$, NO_2, CN, =O;

C_{2-8} алкенила, C_{2-8} алкинила, C_{1-4} алкоксиа, C_{1-4} галогеналкила

C_{1-4} алкила, замещенного 0-1 R^{43},

RU 2003121304 A

RU 2003121304 A

арила, замещенного 0-3 R^{42} и

5-10-членной гетероциклической кольцевой системы, содержащей 1-4 гетероатомов, выбранных из группы, состоящей из N, O и S, замещенной 0-3 R^{44};

R^{42}, в случае присутствия, независимо является выбранным из

H, CF_3 галогена, OH, CO_2H, SO_2R^{45}, SOR^{45}, SR^{45}, $NR^{46}SO_2R^{45}$, $NR^{46}COR^{45}$, $NR^{45}R^{47}$, NO_2, CN, $CH(=NH)NH_2$, $NHC(=NH)NH_2$,

C_{2-6} алкенила, C_{2-6} алкинила, C_{1-4} алкокси, C_{1-4} галогеналкила, C_{3-6} циклоалкила,

C_{1-4} алкила, замещенного 0-1 R^{43},

арила, замещенного 0-3 R^{44} и

5-10-членной гетероциклической кольцевой системы, содержащей 1-4 гетероатомов, выбранных из группы, состоящей из N, O и S, замещенной 0-3 R^{44};

R^{43} представляет собой C_{3-6} циклоалкил или арил, замещенный 0-3 R^{44};

R^{44}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, галогена, -OH, $NR^{46}R^{47}$, CO_2H, SO_2R^{45}, $-CF_3$, $-OCF_3$, -CN, $-NO_2$, C_{1-4} алкил и C_{1-4} алкокси;

R^{45} представляет собой C_{1-4} алкил;

R^{46}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H и C_{1-4} алкила;

R^{47}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, C_{1-4} алкила, $-C(=O)NH(C_{1-4}$ алкила), $-SO_2(C_{1-4}$ алкила), $-C(=O)O(C_{1-4}$ алкила), $-C(=O)(C_{1-4}$ алкила) и -C(=O)H;

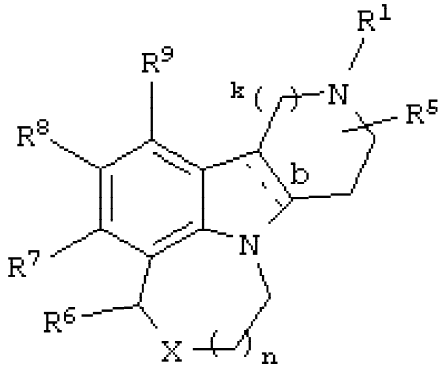
k имеет значение 1 или 2;

m имеет значение 0 или 1; и

n имеет значение 1 или 2;

при условии, что когда b представляет собой двойную связь; n имеет значение 1; m имеет значение 1; k имеет значение 1; X имеет значение -O-, -S-, -S(=O) или $-SO_2$-; и три заместителя R^7, R^8 и R^9 представляют собой i) три водорода, ii) два водорода и один хлор или iii) два водорода и один метил; тогда R^1 должен содержать заместитель Z или Y.

2. Соединение по п. 1 формулы (I-a):



(I-a)

где X представляет собой -O-, -S-, -S(=O)-, $-S(=O)_2$ или $-NR^{10}$-;

R^1 выбран из

H,

C(=O)R2,

$C(=O)OR^2$,

C_{1-8} алкила,

C_{2-8} алкенила,

C_{2-8} алкинила,

C_{3-7} циклоалкила,

C_{1-6} алкила, замещенного 0-2 R^2,

C_{2-6} алкенила, замещенного 0-2 R^2,

RU 2003121304 A

RU 2003121304 A

C_{2-6} алкинила, замещенного 0-2 R^2,

арила, замещенного 0-2 R^2 и

5-6-членной гетероциклической кольцевой системы, содержащей, по крайней мере, один гетероатом, выбранный из группы, состоящей из N, O и S, указанной гетероциклической кольцевой системы, замещенной 0-2 R^2;

R^2, в случае присутствия, независимо является выбранным из F, Cl, CH_2F, CHF_2, CF_3,

C_{1-4} алкила,

C_{2-4} алкенила,

C_{2-4} алкинила,

C_{3-6} циклоалкила,

фенила, замещенного 0-5 R^{42};

C_{3-10} карбоциклического остатка, замещенного 0-3 R^{41} и

5-10-членной гетероциклической кольцевой системы, содержащей 1-4 гетероатомов, выбранных из группы, состоящей из N, O и S, замещенной 0-3 R^{41};

R^5 представляет собой H, метил, этил, пропил или бутил;

R^6 представляет собой H, метил, этил, пропил или бутил;

R^7 и R^9, в случае присутствия, являются независимо выбранными из H, галогена, $-CF_3$, $-OCF_3$, -OH, -CN, $-NO_2$, $-NR^{46}R^{47}$,

C_{1-8} алкила, C_{2-8} алкенила, C_{2-8} алкинила, C_{1-4} галогеналкила, C_{1-8} алкокси, (C_{1-4} галогеналкил) окси,

C_{3-10} циклоалкила, замещенного 0-2 R^{33},

C_{1-4} алкила, замещенного 0-2 R^{11},

C_{3-10} карбоциклического остатка, замещенного 0-3 R^{33},

арила, замещенного 0-5 R^{33},

5-10-членной гетероциклической кольцевой системы, содержащей 1-4 гетероатомов, выбранных из группы, состоящей из N, O и S, замещенной 0-3 R^{31};

OR^{12}, SR^{12}, $NR^{12}R^{13}$, C(O)H, $C(O)R^{12}$, $C(O)NR^{12}R^{13}$, $NR^{14}C(O)R^{12}$, $C(O)OR^{12}$, $OC(O)R^{12}$, $OC(O)OR^{12}$, $CH(=NR^{14})NR^{12}R^{13}$, $NHC(=NR^{14})NR^{12}R^{13}$, $S(O)R^{12}$, $S(O)_2R^{12}$, $S(O)NR^{12}R^{13}$, $S(O)_2NR^{12}R^{13}$, $NR^{14}S(O)R^{12}$, $NR^{14}S(O)_2R^{12}$, $NR^{12}C(O)R^{15}$, $NR^{12}C(O)OR^{15}$, $NR^{12}S(O)_2R^{15}$ и $NR^{12}C(O)NHR^{15}$;

R^8 выбран из

H, галогена, $-CF_3$, $-OCF_3$, -OH, -CN, $-NO_2$,

C_{1-8} алкила, C_{2-8} алкенила, C_{2-8} алкинила, C_{1-4} галогеналкиал, C_{1-8} алкокси, (C_{1-4} галогеналкил) окси,

C_{3-10} циклоалкила, замещенного 0-2 R^{33},

C_{1-4} алкила, замещенного 0-2 R^{11},

C_{2-4} алкенила, замещенного 0-2 R^{11},

C_{2-4} алкинила, замещенного 0-1 R^{11},

C_{3-10} карбоциклического остатка, замещенного 0-3 R^{33},

арила, замещенного 0-5 R^{33},

5-10-членной гетероциклической кольцевой системы, содержащей 1-4 гетероатомов, выбранных из группы, состоящей из N, O и S, замещенной 0-3R^3;

OR^{12}, SR^{12}, $NR^{12}R^{13}$, C(O)H, $C(O)R^{12}$, C, $NR^{14}C(O)R^{12}$, $C(O)OR^{12}$, $OC(O)R^{12}$, $OC(O)OR^{12}$, $CH(=NR^{14})NR^{12}R^{13}$, $NHC(=NR^{14})NR^{12}R^{13}$, $S(O)R^{12}$, $S(O)_2R^{12}$, $S(O)NR^{12}R^{13}$, $S(O)_2NR^{12}R^{13}$, $NR^{14}S(O)^{12}$, $NR^{14}S(O)_2R^{12}$, $NR^{12}C(O)R^{15}$, $NR^{12}C(O)OR^{15}$, $NR^{12}S(O)_2R^{15}$ и $NR^{12}C(O)NHR^{15}$;

R^{10} выбран из H, C_{1-4} алкила, C_{2-4} алкенила, C_{2-4} алкинила и C_{1-4} алкокси;

R^{11} выбран из

H, галогена, $-CF_3$, -CN, $-NO_2$,

C_{1-8} алкила, C_{2-8} алкенила, C_{2-8} алкинила, C_{1-4} галогеналкила, C_{1-8} алкокси, C_{3-10} циклоалкила,

RU 2003121304 A

RU 2003121304 A

C_{3-10} карбоциклического остатка, замещенного 0-3 R^{33},

арила, замещенного 0-5 R^{33},

5-10-членной гетероциклической кольцевой системы, содержащей 1-4 гетероатомов, выбранных из группы состоящей из N, O и S, замещенной 0-3 R^{31};

OR^{12}, SR^{12} $NR^{12}R^{13}$, C(O)H, $C(O)R^{12}$, $C(O)NR^{12}R^{13}$, $NR^{14}C(O)R^{12}$, $C(O)OR^{12}$, $OC(O)R^{12}$, $OC(O)OR^{12}$, $CH(=NR^{14})NR^{12}R^{13}$, $NHC(=NR^{14})NR^{12}R^{13}$, $S(O)R^{12}$, $S(O)_2R^{12}$, $S(O)NR^{12}R^{13}$, $S(O)_2NR^{12}R^{13}$, $NR^{14}S(O)R^{12}$, $NR^{14}S(O)_2R^{12}$, $NR^{12}C(O)R^{15}$, $NR^{12}C(O)OR^{15}$, $NR^{12}S(O)_2R^{1S}$ и $NR^{12}C(O)NHR^{15}$;

R^{12}, в случае присутствия, независимо является выбранным из C_{1-4} алкила, замещенного 0-1 R^{12a}, C_{2-4} алкенила, замещенного 0-1 R^{12a}, C_{2-4} алкинила, замещенного 0-1 R^{12a}, C_{3-6} циклоалкила, замещенного 0-3 R^{33}, арила, замещенного 0-5 R^{33}; C_{3-10} карбоциклического остатка, замещенного 0-3 R^{33} и

5-10-членной гетероциклической кольцевой системы, содержащей 1-4 гетероатомов, выбранных из группы, состоящей из N, O и S, замещенной 0-3 R^{31}.

R^{12a}, в случае присутствия, независимо является выбранным из фенила, замещенного 0-5 R^{33}; C_{3-10} карбоциклического остатка, замещенного 0-3 R^{33} и 5-10-членной гетероциклической кольцевой системы, содержащей 1-4 гетероатомов, выбранных из группы, состоящей из N, O и S, замещенной 0-3 R^{31};

R^{13}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, C_{1-4} алкила, C_{3-10} алкенила и C_{2-4} алкинила;

альтернативно, R^{12} и R^{13} объединяются, чтобы образовать 5- или 6-членное кольцо, необязательно замещенное -O- или $-N(R^{14})-$;

альтернативно, R^{12} и R^{13}, когда присоединены к N, могут быть объединены, чтобы образовывать 9- или 10-членную бициклическую гетероциклическую кольцевую систему, содержащую 1-3 гетероатомов, выбранных из группы, состоящей из N, O и S, где указанная бициклическая гетероциклическая кольцевая система является ненасыщенной или частично ненасыщенной, где указанная бициклическая гетероциклическая кольцевая система является замещенной 0-3 R^{16};

R^{14}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H и C_{1-4} алкила;

R^{15}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, C_{1-4} алкила, C_{3-10} алкенила и C_{2-4} алкинила;

R^{16}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, OH, галогена, CN, NO_2, CF_3, SO_2R^{45}, $NR^{46}R^{47}$, -C(=O)H, C_{1-4} алкила, C_{2-4} алкенила, C_{2-4} алкинила, C_{1-4} галогеналкила, C_{1-3} галогеналкила-окси-, C_{1-4} алкилокси и =O;

R^{31}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, OH, галогена, CF_3, SO_2R^{45}, $NR^{46}R^{47}$, C_{1-4} алкил и =O;

R^{33}, в каждом случае; является независимым, выбранным из H, OH, галогена, CN, NO_2, CF_3, $-OCF_3$, SO_2R^{45}, $NR^{46}R^{47}$, -C(=O)H, =O, $-C(=O)NH_2$, $-C(=O)OCH_3$, фенила, C_{1-6} алкила,

C_{2-6} алкенила, C_{2-6} алкинила, C_{3-6} циклоалкила,

C_{1-4} галогеналкила, C_{1-4} галогеналкила-окси-, C_{1-4} алкилокси-,

C_{1-4} алкилтио-, C_{1-4} алкила-C(=O)-, C_{1-4} алкила-OC(=O)-,

C_{1-4} алкила-C(=O)O-, C_{1-4} алкила-C(=O)NH-,

C_{1-4} алкил-NHC(=O)-, $(C_{1-4}$ алкил$)_2HC(=O)$-,

C_{3-6} циклоалкил-окси-, C_{3-6} циклоалкилметил-окси-;

C_{3-6} циклоалкил-окси-, C_{3-6}циклоалкилметил-окси-;

C_{1-6} алкила, замещенного OH, метокси, этокси,

пропокси, бутокси, $-SO_2R^{45}$, $-NR^{46}R^{47}$, $NR^{46}R^{47}C(=O)$- или (C_{1-4} алкил)CO_2-; и

C_{2-6} алкенила, замещенного OH, метокси, этокси, пропокси, бутокси, $-SO_2R^{45}$, $-NR^{45}R^{47}$, $NR^{46}R^{47}C(=O)$- или (C_{1-4} алкил)CO_2-;

RU 2003121304 A

RU 2003121304 A

R^{41}, в случае присутствия, независимо является выбранным из
H, CF_3, галогена, OH, CO_2H, SO_2R^{45}, $NR^{46}R^{47}$, NO_2, CN;
C_{2-8} алкенила, C_{2-8} алкинила, C_{1-4} алкокси, C_{1-4} галогеналкила
C_{1-4} алкила, замещенного 0-1 R^{43},
арила, замещенного 0-3 R^{42} и
5-10-членной гетероциклической кольцевой системы, содержащей 1-4 гетероатомов, выбранных из группы, состоящей из N, O и S, замещенной 0-3 R^{44};
R^{42}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, CF_3, галогена, OH, CO_2H, SO_2R^{45}, $NR^{46}R^{47}$, NO_2, CN, $CH(=NH)NH_2$, $NHC(=NH)NH_2$, C_{2-6} алкенила, C_{2-6} алкинила, C_{1-4} алкокси, C_{1-4} галогеналкила, C_{3-6} циклоалкила,
C_{1-4} алкила, замещенного 0-1 R^{43}, арила, замещенного 0-3 R^{44} и
5-10- членной гетероциклической кольцевой системы, содержащей
1-4 гетероатомов, выбранных из группы, состоящей из N, O и S, замещенной 0-3 R^{44};
R^{43} представляет собой C_{3-6} циклоалкил или арил, замещенный 0-3 R^{44};
R^{44}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, галогена, -OH, $NR^{46}R^{47}$, CO_2H, SO_2R^{45}, $-CF_3$, $-OCF_3$, -CN, $-NO_2$, C_{1-4} алкил и C_{1-4} алкокси;
R^{45} представляет собой C_{1-4} алкил;
R^{46}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H и C_{1-4} алкила;
R^{47}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H и C_{1-4} алкила;
k имеет значение 1 или 2 и
n имеет значение 1 или 2.
3. Соединение по п. 2, у которого:
X представляет собой -O-, -S- или -NH-;
R^1 выбран из
H,
$C(=O)R^2$,
$C(=O)OR^2$,
C_{1-6} алкила,
C_{2-6} алкенила,
C_{2-6} алкинила,
C_{3-6} циклоалкила,
C_{1-4} алкила, замещенного 0-2 R^2,
C_{2-4} алкенила, замещенного 0-2 R^2 и
C_{2-4} алкинила, замещенного 0-2 R^2;
R^2, в случае присутствия, независимо является выбранным из
C_{1-4} алкила,
C_{2-4} алкенила,
C_{2-4} алкинила,
C_{3-6} циклоалкила,
фенила, замещенного 0-5 R^{42};
C_{3-10} карбоциклического остатка, замещенного 0-3 R^{41} и
5-10-членной гетероциклической кольцевой системы, содержащей 1-4 гетероатомов, выбранных из группы, состоящей из N, O и S, замещенной 0-3 R^{41};
R^5 представляет собой H, метил, этил, пропил или бутил;
R^6 представляет собой H, метил, этил, пропил или бутил;
R^7 и R^9, в случае присутствия, независимо являются выбранными из
H, галогена, $-CF_3$, $-OCF_3$, -OH, -CN, $-NO_2$, $-NR^{46}R^{47}$,
C_{1-6} алкила, C_{2-6} алкенила, C_{2-6} алкинила, C_{1-6} галогеналкила, C_{1-6} алкокси, (C_{1-4} галогеналкил)окси,
C_{3-10} циклоалкила, замещенного 0-2 R^{33},

RU 2003121304 A
RU 2003121304 A

C_{1-4} алкила, замещенного 0-2 R^{11},

C_{3-10} карбоциклического остатка, замещенного 0-3 R^{33},

арила, замещенного 0-5 R^{33},

5-10-членной гетероциклической кольцевой системы, содержащей 1-4 гетероатомов, выбранных из группы, состоящей из N, O и S, замещенной 0-3 R^{31};

OR^{12}, SR^{12}, $NR^{12}R^{13}$, C(O)H, $C(O)R^{12}$, $C(O)NR^{12}R^{13}$, $NR^{14}C(O)R^{12}$, $C(O)OR^{12}$, $OC(O)R^{12}$, $OC(O)OR^{12}$, $CH(=NR^{14})NR^{12}R^{13}$, $NHC(=NR^{14})NR^{12}R^{13}$, $S(O)R^{12}$, $S(O)_2R^{12}$, $S(O)NR^{12}R^{13}$, $S(O)_2NR^{12}R^{13}$, $NR^{14}S(O)R^{12}$ и $NR^{14}S(O)_2R^{12}$;

R^8 выбран из

H, галогена, $-CF_3$, -OC-F3, -OH, -CN, $-NO_2$,

C_{1-6} алкила, C_{2-6} алкенила, C_{2-6} алкинила, C_{1-6} галогеналкила, C_{1-6} алкокси, (C_{1-4} галогеналкил) окси,

C_{3-10} циклоалкила, замещенного 0-2 R^{33},

C_{1-4} алкила, замещенного 0-2 R^{11},

C_{2-4} алкенила, замещенного 0-2 R^{11},

C_{2-4} алкинила, замещенного 0-1 R^{11},

C_{3-10} карбоциклического остатка, замещенного 0-3 R^{33},

арила, замещенного 0-5 R^{33},

5-10-членной гетероциклической кольцевой системы, содержащей 1-4 гетероатомов, выбранных из группы, состоящей из N, O и S, замещенной 0-3 R^{31};

OR^{12}, SR^{12}, $NR^{12}R^{13}$, C(O)H, $C(O)R^{12}$, $C(O)NR^{12}R^{13}$, $NR^{14}C(O)R^{12}$, $C(O)OR^{12}$, $OC(O)R^{12}$, $OC(O)OR^{12}$, $CH(=NR^{14})NR^{12}R^{13}$, $NHC(=NR^{14})NR^{12}R^{13}$, $S(O)R^{12}$, $S(O)_2R^{12}$,

$S(O)NR^{12}R^{13}$, $S(O)_2NR^{12}R^{13}$, $NR^{14}S(O)R^{12}$, $NR^{14}S(O)_2R^{12}$, $NR^{12}C(O)R^{15}$, $NR^{12}C(O)OR^{15}$, $NR^{12}S(O)_2R^{15}$ $NR^{12}C(O)NHR^{15}$;

R^{11} выбран из

H, галогена, $-CF_3$, -CN, $-NO_2$, C_{1-6} алкила,

C_{2-6} алкенила, C_{2-6} алкинила, C_{1-4} галогеналкила, C_{1-6} алкокси,

C_{3-10} циклоалкила,

C_{3-10} карбоциклического остатка, замещенного 0-3 R^{33},

арила, замещенного 0-5 R^{33},

5-10-членной гетероциклической кольцевой системы, содержащей 1-4 гетероатомов, выбранных из группы, состоящей из N, O и S, замещенной 0-3 R^{31};

OR^{12}, SR^{12}, $NR^{12}R^{13}$, C(O)H, $C(O)R^{12}$, $C(O)NR^{12}R^{13}$, $NR^{14}C(O)R^{12}$, $C(O)OR^{12}$, $OC(O)R^{12}$, $OC(O)OR^{12}$, $CH(=NR^{14})NR^{12}R^{13}$, $NHC(=NR^{14})NR^{12}R^{13}$, $S(O)R^{12}$, $S(O)_2R^{12}$, $S(O)NR^{12}R^{13}$, $S(O)_2NR^{12}R^{13}$, $NR^{14}S(O)RI^2$ и $NR^{14}S(O)_2R^{12}$;

R^{12}, в случае присутствия, независимо является выбранным из

C_{1-4} алкила, замещенного 0-1 R^{12a},

C_{2-4} алкенила, замещенного 0-1 R^{12a},

C_{2-4} алкинила, замещенного 0-1 R^{12a},

C_{3-6} циклоалкила, замещенного 0-3 R^{33},

арила, замещенного 0-5 R^{33};

C_{3-10} карбоциклического остатка, замещенного 0-3 R^{33} и

5-10-членной гетероциклической кольцевой системы, содержащей 1-4 гетероатомов, выбранных из группы, состоящей из N, O и S, замещенной 0-3 R^{31};

R^{12a}, в случае присутствия, независимо является выбранным из фенила, замещенного 0-5 R^{33};

C_{3-10} карбоциклического остатка, замещенного 0-3 R^{33} и 5-10- членной гетероциклической кольцевой системы, содержащей 1-4 гетероатомов, выбранных из группы, состоящей из N, O и S, замещенной 0-3 R^{31};

RU 2003121304 A

RU 2003121304 A

R^{13}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, C_{1-4} алкила, C_{2-4} алкенила и C_{2-4} алкинила; альтернативно, R^{12} и R^{13} объединяются, чтобы образовать 5- или 6-членное кольцо, необязательно замещенное –O- или -N(R^{14})-;

альтернативно, R^{12} и R^{13}, когда присоединены к N, могут быть объединены, чтобы образовывать 9- или 10-членную бициклическую гетероциклическую кольцевую систему, содержащую 1-3 гетероатомов, выбранных из группы, состоящей из N, O и S, где указанная бициклическая гетероциклическая кольцевая система является ненасыщенной или частично ненасыщенной, где указанная бициклическая гетероциклическая кольцевая система является замещенной 0-3 R^{16};

R^{14}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, метила, этила, пропила и бутила;

R^{15}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, C_{1-4} алкила, C_{2-4} алкенила и C_{2-4} алкинила;

R^{16}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, OH, F, Cl, CN, NO_2, CF_3, SO_2R^{45}, $NR^{46}R^{47}$, -C(=O)H, метила, этила, метокси, этокси, трифторметила, трифторметокси и =O;

R^{31}, в случае присутствия, независимо является выбранным из

H, OH, галогена, CF_3, SO_2R^{45}, $NR^{46}R^{47}$, C_{1-4} алкил и =O;

R^{33}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, OH, галогена, CN, NO_2, CF_3, -OCF_3, SO_2R^{45}, $NR^{46}R^{47}$, -C(=O)H, =O, -C(=O)NH_2, -C(=O)OCH_3, фенила, C_{1-6} алкила, C_{2-6} алкенила, C_{2-6} алкинила, C_{3-5} циклоалкила, C_{1-4} галогеналкила, C_{1-4} галогеналкила-окси-, C_{1-4} алкилокси-, C_{1-4} алкилтио-, C_{1-4} алкил-C(=O)-, C_{1-4} алкил-OC(=O)-, C_{1-4} алкил-C(=O)O-, C_{1-4} алкил-C(=O)NH-, C_{1-4} алкил-NHC(=O)-, (C_{1-4} алкил)$_2$NC(=O)-,

C_{3-6} циклоалкила-окси-, C_{3-6} циклоалкилметил-окси-;

C_{1-6} алкила, замещенного OH, метокси, этокси, пропокси, бутокси, -SO_2R^{45}, -$NR^{46}R^{47}$, $NR^{46}R^{47}$C(=O)- или

(C_{1-4} алкил)CO_2-; и

C_2^{-6} алкенила, замещенного OH, метокси, этокси, пропокси, бутокси, -SO_2R^{45}, -$NR^{46}R^{47}$, $NR^{46}R^{47}$C(=O)- или

(C_{1-4} алкил)CO_2-;

R^{41}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, CF_3, галогена, OH, CO_2H, SO_2R^{45}, $NR^{46}R^{47}$, NO_2, CN,

C_{2-8} алкенила, C_{2-8} алкинила, C_{1-4} алкокси, C_{1-4} галогеналкила,

C_{1-4} алкила, замещенного 0-1 R^{43},

арила, замещенного 0-3 R^{42} и

5-10-членной гетероциклической кольцевой системы, содержащей 1-4 гетероатомов, выбранных из группы, состоящей из N, O и S, замещенной 0-3 R^{44};

R^{42}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, CF_3, галогена, OH, CO_2H, SO_2R^{45}, $NR^{46}R^{47}$, NO_2, CN,

CH(=NH)NH_2, NHC(=NH)NH_2, C_{2-6} алкенила, C_{2-6} алкинила, C_{1-4} алкокси, C_{1-4} галогеналкила, C_{3-6} циклоалкила,

C_{1-4} алкила, замещенного 0-1 R^{43},

арила, замещенного 0-3 R^{44} и

5-10-членной гетероциклической кольцевой системы, содержащей 1-4 гетероатомов, выбранных из группы состоящей из N, O и S, замещенной 0-3 R^{44};

R^{43} представляет собой C_{3-6} циклоалкил или арил, замещенный 0-3 R^{44};

R^{44}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, галогена, -OH, $NR^{46}R^{47}$, CO_2H, SO_2R^{45}, -CF_3, -OCF_3, -CN, -NO_2, C_{1-4} алкила и C_{1-4} алкокси;

RU 2003121304 A

RU 2003121304 A

R^{45} представляет собой C_{1-4} алкил;

R^{46}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H и C_{1-4} алкила;

R^{47}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H и C_{1-4} алкила;

k имеет значение 1 или 2; и n имеет значение 1 или 2.

4. Соединение по пункту 2, у которого:

X представляет собой -S-;

R^1 выбран из

H,

C_{1-4} алкила,

C_{2-4} алкенила,

C_{2-4} алкинила,

C_{3-4} циклоалкила,

C_{1-3} алкила, замещенного 0-1 R^2,

C_{2-6} алкенила, замещенного 0-1 R^2 и

C_{2-6} алкинила, замещенного 0-1 R^2;

R^2, в случае присутствия, независимо является выбранным из C_{1-4} алкила, C_{2-4} алкенила, C_{2-4} алкинила, C_{3-6} циклоалкила,

фенила, замещенного 0-5 R^{42};

C_{3-6} карбоциклического остатка, замещенного 0-3 R^{41} и

5-6-членной гетероциклической кольцевой системы, содержащей 1, 2 или 3 гетероатомов, выбранных из группы, состоящей из N, O и S, замещенной 0-3 R^{41};

R^5 представляет собой H, метил, этил, пропил или бутил;

R^6 представляет собой H;

R^7 и R^9, в случае присутствия, независимо являются выбранными из

H, галогена, $-CF_3$, $-OCF_3$, -OH, -CN, $-NO_2$, $-NR^{46}R^{47}$, C_{1-4} алкила, C_{3-10} алкенила, C_{2-4} алкинила, C_{1-4} галогеналкила,

C_{1-4} алкокси, (C_{1-4} галогеналкил)окси, C_{3-10} циклоалкила, замещенного 0-2 R^{33}, C_{1-4} алкила, замещенного 0-2 R^{11},

C_{3-10} карбоциклического остатка, замещенного 0-3 R^{33},

арила, замещенного 0-5 R^{33} и

5-6-членной гетероциклической кольцевой системы, содержащей 1, 2 или 3 гетероатомов, выбранных из группы, состоящей из N, O и S, замещенной 0-3 R^{31};

R^8 выбран из

галогена, $-CF_3$, $-OCF_3$, -OH, -CN, $-NO_2$,

C_{1-4} алкила, C_{2-4} алкенила, C_{2-4} алкинила, C_{1-4} галогеналкила,

C_{1-4} алкокси, (C_{1-4} галогеналкил)окси,

C_{3-10} циклоалкила, замещенного 0-2 R^{33}, C_{1-4} алкила, замещенного 0-2 R^{11},

C_{2-4} алкенила, замещенного 0-2 R^{11},

C_{2-4} алкинила, замещенного 0-1 R^{11},

C_{3-10} карбоциклического остатка, замещенного 0-3 R^{33},

арила, замещенного 0-5 R^{33},

5-6-членной гетероциклической кольцевой системы, содержащей 1, 2, или 3 гетероатомов, выбранных из группы,

состоящей из N, O и S, замещенной 0-3 R^{31}.

OR^{12}, SR^{12}, $NR^{12}R^{13}$, $NR^{12}C(O)R^{15}$, $NR^{12}C(O)OR^{15}$, $NR^{12}S(O)_2R^{15}$ и $NR^{12}C(O)NHR^{15}$;

R^{11} выбран из

H, галогена, $-CF_3$, -CN, $-NO_2$,

C_{1-4} алкила, C_{2-4} алкенила, C_{2-4} алкинила, C_{1-4} галогеналкила,

C_{1-4} алкокси, (C_{1-4} галогеналкил)окси,

C_{3-10} циклоалкила, замещенного 0-2 R^{33},

RU 2003121304 A

RU 2003121304 A

C_{3-10} карбоциклического остатка, замещенного 0-3 R^{33},

арила, замещенного 0-5 R^{33} и

5-6-членной гетероциклической кольцевой системы, содержащей 1, 2,

или 3 гетероатомов, выбранных из группы,

состоящей из N, O и S, замещенной 0-3 R^{31};

R^{12}, в случае присутствия, независимо является выбранным из

C_{1-4} алкила, замещенного 0-1 R^{12a},

C_{2-4} алкенила, замещенного 0-1 R^{12a},

C_{2-4} алкинила, замещенного 0-1 R^{12a},

C_{3-6} циклоалкила, замещенного 0-3 R^{33},

арила, замещенного 0-5 R^{33};

C_{3-10} карбоциклического остатка, замещенного 0-3 R^{33} и

5-10-членной гетероциклической кольцевой системы, содержащей 1-4 гетероатомов, выбранных из группы, состоящей из N, O и S, замещенной 0-3 R^{31};

R^{12a}, в случае присутствия, независимо является выбранным из фенила, замещенного 0-5 R^{33};

C_{3-10} карбоциклического остатка, замещенного 0-3 R^{33} и

5-10-членной гетероциклической кольцевой системы, содержащей 1-4 гетероатомов, выбранных из группы, состоящей из N, O и S, замещенной 0-3 R^{31};

R^{13}, в случае присутствия, независимо является выбранным из

H, C_{1-4} алкила, C_{2-4} алкенила и C_{2-4} алкинила;

альтернативно, R^{12} и R^{13} объединяются, чтобы образовать 5- или 6-членное кольцо, необязательно замещенное -O- или -N(R^{14})-;

альтернативно, R^{12} и R^{13}, когда присоединены к N, могут быть объединены, чтобы образовать 9- или 10-членную бициклическую гетероциклическую кольцевую систему, содержащую 1-3 гетероатомов, выбранных из группы, состоящей из одного N, двух N, трех N, одного N одного O и одного N одного S, где указанная бициклическая гетероциклическая кольцевая система является ненасыщенной или частично ненасыщенной, где указанная бициклическая гетероциклическая кольцевая система является замещенной 0-2 R^{16};

R^{14}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, метила, этила, пропила и бутила;

R^{15}, в случае присутствия, независимо является выбранным из

H, метила, этила, пропила и бутила;

R^{16}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, OH, F, Cl, CN, NO_2;, метила, этила, метокси, этокси, трифторметила и трифторметокси;

R^{31}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, OH, галогена, CF_3, метила, этила и пропила;

R^{33}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, OH, галогена, CN, NO_2, CF_3, SO_2R^{45}, $NR^{46}R^{47}$, -C(=O)H, фенила, C_{1-6} алкила,

C_{2-6} алкенила, C_{2-6} алкинила,

C_{3-6} циклоалкила, C_{1-4} галогеналкил, C_{1-4} галогеналкил-окси-,

C_{1-4} алкилокси-, C_{1-4} алкилтио-, C_{1-4} алкила-C(=O)-,

C_{1-4} алкила-C(=O)NH-, C_{1-4} алкила-OC(=O)-,

C_{1-4} алкила-C(=O)O-, C_{3-6} циклоалкила-окси-, C_{3-6} циклоалкилметил-окси-;

C_{1-6} алкила, замещенного OH, метокси, этокси,

пропокси, бутокси, -SO_2R^{45}, -$NR^{46}R^{47}$, $NR^{46}R^{47}$C(=O)- или (C_{1-4} алкил)CO_2-; и C_{2-6} алкенила, замещенного OH, метокси, этокси, пропокси, бутокси, -SO_2R^{45}, -$NR^{46}R^{47}$, $NR^{46}R^{47}$C(=O)или (C_{1-4} алкил)CO_2-;

R^{41}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, CF_3, галогена, OH, CO_2H, SO_2R^{45}, $NR^{46}R^{47}$, NO_2, CN, C_{2-4} алкенила, C_{2-4} алкинила, C_{1-3} алкокси,

RU 2003121304 A

RU 2003121304 A

C_{1-3} галогеналкил и C_{1-3} алкил;

R^{42}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, CF_3, галогенген, OH, CO_2H, SO_2R^{45}, $NR^{46}R^{47}$, NO_2, CN, $CH(=NH)NH_2$, $NHC(=NH)NH_2$, C_{2-4} алкенила, C_{2-4} алкинила, C_{1-3} алкокси, C_{1-3} галогеналкила,

C_{3-6} циклоалкила и C_{1-3} алкила;

R^{43} представляет собой циклопропил, циклобутил, циклопентил, циклогексил, фенил или пиридил, каждый замещен 0-3 R^{44};

R^{44}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, галогена, -OH, $NR^{46}R^{47}$, CO_2H, SO_2R^{45}, $-CF_3$, $-OCF_3$, -CN, $-NO_2$, метила, этила, пропила, бутила, метокси, этокси, пропокси и бутокси;

R^{45} представляет собой метил, этил, пропил или бутил;

R^{46}, в случае присутствия, независимо является выбранным из

H, метила, этила, пропила и бутила;

R^{47}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, метила, этила, пропила и бутила;

k имеет значение 1; и

n имеет значение 1 или 2.

5. Соединение по пункту 2, у которого:

X представляет собой -S-;

R^1 выбран из

H,

C_{1-4} алкила,

C_{2-4} алкенила,

C_{2-4} алкинила,

C_{3-4} циклоалкила,

C_{1-3} алкила, замещенного 0-1 R^2,

C_{2-3} алкенила, замещенного 0-1 R^2 и

C_{2-3} алкинила, замещенного 0-1 R^2;

R^2, в случае присутствия, независимо является выбранным из

C_{1-4} алкила,

C_{2-4} алкенила,

C_{2-4} алкинила,

C_{3-6} циклоалкила, фенила, замещенного 0-5 R^{42};

C_{3-6} карбоциклического остатка, замещенного 0-3 R^{41} и

5-6-членной гетероциклической кольцевой системы, содержащей 1, 2 или 3 гетероатомов, выбранных из группы, состоящей из N, O и S, замещенной 0-3 R^{41};

R^5 представляет собой H, метил, этил, пропил или бутил;

R^6 представляет собой H;

R^7 и R^9, в случае присутствия, независимо являются выбранными из

H, F, Cl, $-CH_3$, $-OCH_3$, $-CF_3$, $-OCF_3$, -CN и $-NO_2$,

R^8 выбран из

H, F, Cl, Br, $-CF_3$, $-OCF_3$, -OH, -CN, $-NO_2$,

C_{1-4} алкила, C_{2-4} алкенила, C_{2-4} алкинила,

C_{1-4} галогеналкила, C_{1-4} алкокси, (C_{1-4} галогеналкил)окси,

C_{3-10} пиклоалкила, замещенного 0-2 R^{33},

C_{1-4} алкила, замещенного 0-2 R^{11},

C_{2-4} алкенила, замещенного 0-2 R^{11},

C_{2-4} алкинила, замещенного 0-1 R^{11},

C_{3-10} карбоциклического остатка, замещенного 0-3 R^{33},

арила, замещенного 0-5 R^{33},

RU 2003121304 A

RU 2003121304 A

5-6-членной гетероциклической кольцевой системы, содержащей 1, 2 или 3 гетероатомов, выбранных из группы, состоящей из N, O и S, замещенной 0-3 R^{31};

OR^{12}, SR^{12}, $NR^{12}R^{13}$, $NR^{12}C(O)R^{15}$, $NR^{12}C(O)OR^{15}$, $NR^{12}S(O)_2R^{15}$, и $NR^{12}C(O)NHR^{15}$;

R^{11} является выбранными из

H, галогена, $-CF_3$, -CN, $-NO_2$,

C_{1-4} алкила, C_{2-4} алкенила, C_{2-4} алкинила, C_{1-4} галогеналкила,

C_{1-4} алкокси, (C_{1-4} галогеналкил)окси,

C_{3-10} циклоалкила, замещенного 0-2 R^{33},

C_{3-10} карбоциклического остатка, замещенного 0-3 R^{33},

арила, замещенного 0-5 R^{33} и

5-6-членной гетероциклической кольцевой системы, содержащей 1, 2 или 3 гетероатомов, выбранных из группы, состоящей из N, O и S, замещенной 0-3 R^{31};

R^{12}, в случае присутствия, независимо является выбранным из

C_{1-4} алкила, замещенного 0-1 R^{12a},

C_{2-4} алкенила, замещенного 0-1 R^{12a},

C_{2-4} алкинила, замещенного 0-1 R^{12a},

C_{3-6} циклоалкила, замещенного 0-3 R^{33},

арила, замещенного 0-5 R^{33};

C_{3-10} карбоциклического остатка, замещенного 0-3 R^{33} и

5-10-членной гетероциклической кольцевой системы, содержащей 1-4 гетероатомов, выбранных из группы, состоящей из N, O и S, замещенной 0-3 R^{31};

R^{12a}, в случае присутствия, независимо является выбранным из фенила, замещенного 0-5 R^{33};

C_{3-10} карбоциклического остатка, замещенного 0-3 R^{33} и

5-10-членной гетероциклической кольцевой системы, содержащей 1-4 гетероатомов, выбранных из группы, состоящей из N, O и S, замещенной 0-3 R^{31};

R^{13}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, C_{1-4} алкила, C_{3-10} алкенила и C_{3-10} алкинила;

альтернативно, R^{12} и R^{13} объединяются, чтобы образовать 5- или 6-членное кольцо, необязательно замещенное -O- или $-N(R^{14})-$;

альтернативно, R^{12} и R^{13}, когда присоединены к N, могут быть объединены, чтобы образовывать

9- или 10-членную бициклическую гетероциклическую кольцевую систему, содержащую 1-3 гетероатомов, выбранных из группы, состоящей из N, O и S, где указанная бициклическая гетероциклическая кольцевая система выбрана из индолила, индолинила, индазолила, бензимидазолила, бензимидазолинила, бензтриазолила, хинолинила, тетрагидрохинолинила, изохинолинила, тетрагидроизохинолинила, где указанная бициклическая гетероциклическая кольцевая система является замещенной 0-1 R^{16};

R^{14}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, метила, этила, пропила и бутила;

R^{15}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, метила, этила, пропила и бутила;

R^{16}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, OH, F, Cl, CN, NO_2, метила, этила, метокси, этокси, трифторметила и трифторметокси;

R^{31}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, OH, галогена, CF_3, метила, этила и пропила;

R^{33}, в случае, присутствия, независимо является выбранным из H, OH, галогена, CN, NO_2, CF_3, SO_2R^{45}, $NR^{46}R^{47}$, -C(=O)H, фенила, C_{1-6} алкила, C_{2-6} алкенила, C_{2-6} алкинила, C_{3-6} циклоалкила, C_{1-4} галогеналкила, C_{1-4} галогеналкил-окси-, C_{1-4} алкилокси-, C_{1-4} алкилтио-, C_{1-4} алкила-C(=O)-, C_{1-4} алкила-C(=O)NH-,

RU 2003121304 A

RU 2003121304 A

C_{1-4} алкила-OC(=O)-, C_{1-4} алкила-C(=O)O-, C_{3-6} циклоалкила-окси-, C_{3-6} циклоалкилметил-окси-; C_{1-6} алкила, замещенного OH, метокси, этокси, пропокси, бутокси, $-SO_2R^{45}$, $-NR^{46}R^{47}$, $NR^{46}R^{47}C(=O)$-, или (C_{1-4} алкил)CO_2-; и C_{2-6} алкенила, замещенного OH, метокси, этокси, пропокси, бутокси, $-SO_2R^{45}$, $-NR^{46}R^{47}$, $NR^{46}R^{47}C(=O)$или (

(C_{1-4} алкил)CO_2-;

R^{41}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, CF_3, галогена, OH, CO_2H, SO_2R^{45}, $NR^{46}R^{47}$, NO_2, CN, C_{2-4}, алкенила, C_{2-4} алкинила, C_{1-3} алкокси, C_{1-2} галогеналкила и C_{1-3} алкила;

R^{42}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, CF_3, галогена, OH, CO_2H, SO_2R^{45}, $NR^{46}R^{47}$, NO_2, CN, $CH(=NH)NH_2$, $NHC(=NH)NH_2$, C_{2-4} алкенила, C_{2-4} алкинила, C_{1-3} алкокси, C_{1-3} галогеналкила, C_{3-6} циклоалкила и C_{1-3} алкила;

R^{43} представляет собой циклопропил, циклобутил, циклопентил, циклогексил, фенил или пиридил, каждый замещен 0-3 R^{44};

R^{44}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, галогена, -OH, $NR^{46}R^{47}$, CO_2H, SO_2R^{45}, $-CF_3$, $-OCF_3$, -CN, $-NO_2$, метила, этила, пропила, бутила, метокси, этокси, пропокси и бутокси;

R^{45} представляет собой метил, этил, пропил или бутил;

R^{46}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, метила, этила, пропила и бутила;

R^{47}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, метила, этила, пропила и бутила;

k имеет значение 1; и

n имеет значение 1 или 2.

6. Соединение по пункту 2, в которой:

X представляет собой -S-;

R^1 выбран из H,

C_{1-5} алкила, замещенного 0-1 R^2, C_{2-5} алкенила, замещенного 0-1 R^2 и C_{2-3} алкинила, замещенного 0-1 R^2;

R^2 представляет собой C_{3-6} циклоалкил; R^5 представляет собой H, метил, этил или пропил; R^6 представляет собой H;

R^7 и R^9, в случае присутствия, являются независимо выбранными из H, F, Cl, $-CH_3$, $-OCH_3$, $-CF_3$, $-OCF_3$, -CN и $-NO_2$;

R^8 выбран из R^{11};

метила, замещенного R^{11};

фенила, замещенного 0-3 R^{33};

пиридила, замещенного 0-2 R^{33}; OR^{12}, SR^{12}, $NR^{12}R^{13}$, $NR^{12}C(O)R^{15}$, $NR^{12}C(O)OR^{15}$, $NR^{12}S(O)2R^{15}$ и $NR^{12}C(O)NHR^{15}$;

R^{11} выбран из

фенила-, замещенного 0-5 фтором;

пиридила, замещенного 0-2 R^{33};

нафтила-, замещенного 0-2 R^{33};

2-($H_3CCH_2C(=O)$)-фенила-, замещенного R^{33};

2-($H_3CC(=O)$)-фенила-, замещенного R^{33};

2-(HC(=O))-фенила-, замещенного R^{33};

2-($H_3CCH(OH)$)-фенила-, замещенного R^{33};

2-($H_3CCH_2CH(OH)$)-фенила-, замещенного R^{33};

2-($HOCH_2$)-фенила-, замещенного R^{33};

2-($HOCH_2CH_2$)-фенила-, замещенного R^{33};

RU 2003121304 A

RU 2003121304 A

2-(H_3COCH_2)-фенила-, замещенного R^{33};
2-($H_3COCH_2CH_2$)-фенила-, замещенного R^{33};
2-($H_3CCH(OMe)$)-фенила-, замещенного R^{33};
2-($H_3COC(=O)$)-фенила-, замещенного R^{33};
2-($HOCH_2CH=CH$)-фенила-, замещенного R^{33};
2-((MeOC=O)CH=CH)-фенила-, замещенного R^{33};
2-(метил)-фенила-, замещенного R^{33};
2-(этил)-фенила-, замещенного R^{33};
2-(изо-пропил)-фенила-, замещенного R^{33};
2-(F_3C}-фенила-, замещенного R^{33};
2-(NC)-фенила-, замещенного R^{33};
2-(H_3CO)-фенила-, замещенного R^{33};
2-(фтор)-фенила-, замещенного R^{33};
2-(хлор)-фенила-, замещенного R^{33};
3-(NC)-фенила-, замещенного R^{33};
3-(H_3CO)-фенила-, замещенного R^{33};
3-(фтор)-фенила-, замещенного R^{33};
3-(хлор)-фенила-, замещенного R^{33};
3-(H_3C)-фенила-, замещенного R^{33};
3-(F_3C)-фенила-, замещенного R^{33};
3-(H_3CS)-фенила-, замещенного R^{33};
4-(NC)-фенила-, замещенного R^{33};
4-(фтор)-фенила-, замещенного R^{33};
4-(хлор)-фенила-, замещенного R^{33};
4-(H_3CS)-фенила-, замещенного R^{33};
4-(H_3CO)-фенила-, замещенного R^{33};
4-(этокси)-фенила-, замещенного R^{33};
4-(изо-пропокси)-фенила-, замещенного R^{33};
4-(изо-бутокси)-фенила-, замещенного R^{33};
4-($H_3CCH_2CH_2C(=O)$)-фенила-, замещенного R^{33};
4-(($H_3C)_2CHC(=O)$)-фенила-, замещенного R^{33};
4-($H_3CCH_2C(=O)$)-фенила-, замещенного R^{33};
4-($H_3CC(=O)$)-фенила-, замещенного R^{33};
4-($H_3CCH_2CH_2CH(OH)$)-фенила-, замещенного R^{33};
4-(($H_3C)_2CHCH(OH)$)-фенила-, замещенного R^{33};
4-($H_3CCH_2CH(OH)$)-фенила-, замещенного R^{33};
4-($H_3CCH(OH)$)-фенила-, замещенного R^{33};
4-(циклопропилокси)-фенила-, замещенного R^{33};
4-(циклобутилокси)-фенила-, замещенного R^{33}; и
4-(циклоопентилокси)-фенила-, замещенного R^{33};
R^{12} выбран из
метила, замещенного R^{11};
фенила, замещенного 0-5 фторами;
пиридила, замещенного 0-2 R^{33};
нафтила, замещенного 0-2 R^{33};
2-($H_3CCH_2C(=O)$)-фенила-, замещенного R^{33};
2-($H_3CC(=O)$)-фенила-, замещенного R^{33};
2-(HC(=O))-фенила-, замещенного R^{33};

RU 2003121304 A
RU 2003121304 A

2-($H_3CCH(OH)$)-фенила-, замещенного R^{33};
2-($H_3CCH_2CH(OH)$)-фенила-, замещенного R^{33};
2-($HOCH_2$)-фенила-, замещенного R^{33};
2-($HOCH_2CH_2$)-фенила-, замещенного R^{33};
2-(H_3COCH_2)-фенила-, замещенного R^{33};
2-($H_3COCH_2CH_2$)-фенила-, замещенного R^{33};
2-($H_3CCH(OMe)$)-фенила-, замещенного R^{33};
2-($H_3COC(=O)$)-фенила-, замещенного R^{33};
2-($HOCH_2CH=CH$)-фенила-, замещенного R^{33};
2-((MeOC=O)CH=CH)-фенила-, замещенного R^{33};
2-(метил)-фенила-, замещенного R^{33};
2-(этил)-фенила-, замещенного R^{33};
2-(изо-пропил)-фенила-, замещенного R^{33};
2-(F_3C)-фенила-, замещенного R^{33};
2-(NC)-фенила-, замещенного R^{33},
2-(H_3CO)-фенила-, замещенного R^{33};
2-(фтор)-фенила-, замещенного R^{33};
2-(хлор)-фенила-, замещенного R^{33};
3-(NC)-фенила-, замещенного R^{33};
3-(H_3CO)-фенила-, замещенного R^{33};
3-(фтор)-фенила-, замещенного R^{33};
3-(хлор)-фенила-, замещенного R^{33};
3(H_3C)-фенила-, замещенного R^{33};
3-(F_3C)-фенила-, замещенного R^{33};
3-(H_3CS)-фенила-, замещенного R^{33};
4-(фтор)-фенила-, замещенного R^{33};
4-(хлор)-фенила-, замещенного R^{33};
4-(H_3CS)-фенила-, замещенного R^{33};
4-(H_3CO)-фенила-, замещенного R^{33};
4-(этокси)-фенила-, замещенного R^{33};
4-(изо-пропокси)-фенила-, замещенного R^{33};
4-(изо-бутокси)-фенила-, замещенного R^{33};
4-($H_3CCH_2CH_2C(=O)$)-фенила-, замещенного R^{33};
4-(($H_3C)_2CHC(=O)$)-фенила-, замещенного R^{33};
4-($H_3CCH_2C(=O)$)-фенила-, замещенного R^{33};
4-($H_3CC(=O)$)-фенила-, замещенного R^{33};
4-($H_3CCH_2CH_2CH(OH)$)-фенила-, замещенного R^{33};
4-(($H_3C)_2CHCH$ (OH))-фенила-, замещенного R^{33};
4-($H_3CCH_2CH(OH)$)-фенила-, замещенного R^{33};
4-($H_3CCH(OH)$)-фенила-, замещенного R^{33};
4-(циклопропилокси)-фенила-, замещенного R^{33};
4-(циклобутилокси)-фенила-, замещенного R^{33}; и
4-(циклопентилокси)-фенила-, замещенного R^{33};

R^{13} представляет собой H, метил или этил;

альтернативно, R^{12} и R^{13} объединяются, чтобы образовать 5- или 6-членное кольцо, выбранное из пирролила, пирролидинила, имидазолила, пиперидинила, пиперизинила, метилпиперизинила и морфолинила;

альтернативно, R^{12} и R^{13}, когда присоединены к N, могут быть объединены, чтобы

RU 2003121304 A
RU 2003121304 A

образовывать

9- или 10-членную бициклическую гетероциклическую кольцевую систему, содержащую 1-3 гетероатомов, выбранных из группы, состоящей из N, O и S, где указанная бициклическая гетероциклическая кольцевая система выбрана из индолила, индолинила, индазолила, бензимидазолила, бензимидазолинила, бензтриазолила; где указанная бициклическая гетероциклическая кольцевая система является замещенной 0-1 R^{16};

R^{15} представляет собой H, метил, этил, пропил или бутил;

R^{16}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, OH, F, Cl, CN, NO_2, метила, этила, метокси, этокси, трифторметила и трифторметокси;

R^{33}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, F, Cl, $-CH_3$, $-CH_2CH_3$, $-OCH_3$, $-SCH_3$, $-CF_3$, $-OCF_3$, -CN и $-NO_2$;

k имеет значение 1; и

n имеет значение 1 или 2.

7. Соединение по пункту 2, у которого:

X представляет собой -O-;

R^1 выбран из

H,

C_{1-4} алкила,

C_{2-4} алкенила,

C_{2-4} алкинила,

C_{3-4} циклоалкила,

C_{1-3} алкила, замещенного 0-1 R^2,

C_{2-3} алкенила, замещенного 0-1 R^2 и

C_{2-3} алкинила, замещенного 0-1 R^2;

R^2, в случае присутствия, независимо является выбранным из

C_{1-4} алкила,

C_{2-4} алкенила,

C_{2-4} алкинила,

C_{3-6} циклоалкила,

фенила, замещенного 0-5 R^{42};

C_{3-6} карбоциклического остатка, замещенного 0-3 R^{41} и

5-6-членной гетероциклической кольцевой системы, содержащей 1, 2 или 3 гетероатомов, выбранных из группы, состоящей из N, O и S, замещенной 0-3 R^{41};

R^5 представляет собой H, метил, этил, пропил или бутил;

R^6 представляет собой H;

R^7 и R^9, в случае присутствия, независимо являются выбранными из H, галогена, $-CF_3$, $-OCF_3$, -OH, -CN, $-NO_2$, $-NR^{46}R^{47}$,

C_{1-4} алкила, C_{2-4} алкенила, C_{2-4} алкинила, C_{1-4} галогеналкила,

C_{1-4} алкокси, (C_{1-4} галогеналкил)окси,

C_{3-10} циклоалкила, замещенного 0-2 R^{33},

C_{1-4} алкила, замещенного 0-2 R^{11},

C_{3-10} карбоциклического остатка, замещенного 0-3 R^{33},

арила, замещенного 0-5 R^{33} и

5-6-членной гетероциклической кольцевой системы, содержащей 1, 2 или 3 гетероатомов, выбранных из группы, состоящей из N, O и S, замещенной 0-3 R^{31};

R^8 выбран из

H, галогена, $-CF_3$, $-OCF_3$, -OH, -CN, $-NO_2$,

C_{1-4} алкила, C_{2-4} алкенила, C_{2-4} алкинила, C_{1-4} галогеналкила, C_{1-4} алкокси, (C_{1-4} галогеналкил)окси,

C_{3-10} циклоалкила, замещенного 0-2 R^{33},

C_{1-4} алкила, замещенного 0-2 R^{11},

RU 2003121304 A

RU 2003121304 A

C_{2-4} алкенила, замещенного 0-2 R^{11},

C_{2-4} алкинила, замещенного 0-1 R^{11},

C_{3-10} карбоциклического остатка, замещенного 0-3 R^{33},

арила, замещенного 0-5 R^{33},

5-6-членной гетероциклической кольцевой системы, содержащей 1, 2 или 3 гетероатомов, выбранных из группы, состоящей из N, O и S, замещенной 0-3 R^{31}

OR^{12}, SR^{12}, $NR^{12}R^{13}$, $NR^{12}C(O)R^{15}$, $NR^{12}C(O)OR^{15}$, $NR^{12}S(O)_2R^{15}$, и $NR^{12}C(O)NHR^{15}$;

R^{11} выбран из

H, галогена, $-CF_3$, -CN, $-NO_2$,

C_{1-4} алкила, C_{2-4} алкенила, C_{2-4} алкинила, C_{1-4} галогеналкила,

C_{1-4} алкокси, (C_{1-4} галогеналкил)окси,

C_{3-10} циклоалкила, замещенного 0-2 R^{33},

C_{3-10} карбоциклического остатка, замещенного 0-3 R^{33},

арила, замещенного 0-5 R^{33} и

5-6-членной гетероциклической кольцевой системы, содержащей 1, 2 или 3 гетероатомов, выбранных из группы, состоящей из M, 0 и S, замещенной 0-3 R^{31};

R^{12}, в случае присутствия, независимо является выбранным из

C_{1-4} алкила, замещенного 0-1 R^{12a},

C_{2-4} алкенила, замещенного 0-1 R^{12a},

C_{2-4} алкинила, замещенного 0-1 R^{12a},

C_{3-6} циклоалкила, замещенного 0-3 R^{33},

арила, замещенного 0-5'R^{33};

C_{3-10} карбоциклического остатка, замещенного 0-3 R^{33} и

5-10-членной гетероциклической кольцевой системы, содержащей 1-4 гетероатомов, выбранных из группы, состоящей из N, O и S, замещенной 0-3 R^{31};

R^{12a}, в случае присутствия, независимо является выбранным из фенила, замещенного 0-5 R^{33};

C_{3-10} карбоциклического остатка, замещенного 0-3 R^{33} и

5-10-членной гетероциклической кольцевой системы, содержащей 1-4 гетероатомов, выбранных из группы, состоящей из N, O и S, замещенной 0-3 R^{31};

R^{13} в случае присутствия, независимо является выбранным из H, C_{1-4} алкила, C_{2-4} алкенила и C_{2-4} алкинила;

альтернативно, R^{12} и R^{13} объединяются, чтобы образовать 5- или 6-членное кольцо, необязательно замещенное –O- или $-N(R^{14})-$;

альтернативно, R^{12} и R^{13}, когда присоединены к N, могут быть объединены, чтобы образовывать 9- или 10- членную бициклическую гетероциклическую кольцевую систему, содержащую 1-3 гетероатомов, выбранных из группы, состоящей из одного N, двух N, трех N, одного N одного O и одного N, одного S, где указанная бициклическая гетероциклическая кольцевая система является ненасыщенной или частично ненасыщенной, где указанная бициклическая гетероциклическая кольцевая система является замещенной 0-2 R^{16};

R^{14}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, метила, этила, пропила и бутила;

R^{15}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, метила, этила, пропила и бутила;

R^{16}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, OH, F, Cl, CN, NO_2, метила, этила, метокси, этокси, трифторметила и трифторметокси;

R^{31}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, OH, галогена, CF_3, метила, этила и пропила;

R^{33}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, OH, галогена, CN, NO_2, CF_3, SO_2R^{45}, $NR^{46}R^{47}$, -C(=O)H, фенила, C_{1-4} алкила, C_{2-6} алкенила,

RU 2003121304 A

RU 2003121304 A

C_{2-8} алкинила, C_{3-6} циклоалкила, C_{1-4} галогеналкила, C_{1-4} галогеналкила-окси-, C_{1-4} алкилокси-, C_{1-4} алкила тио-, C_{1-4} алкила-C(=O)-, C_{1-4} алкила-C(=O)MH-, C_{1-4} алкила-OC(=O)-, C_{1-4} алкил-C(=O)O-, C_{3-6} циклоалкил-окси-, C_{3-6} циклоалкилметил-окси-;

C_{1-6} алкила, замещенного OH, метокси, этокси, пропокси, бутокси, $-SO_2R^{45}$, $-NR^{46}R^{47}$, $NR^{46}R^{47}C(O)-$, или $(C_{1-4}$ алкил$)CO_2-$; и C_{2-6} алкенила, замещенного OH, метокси, этокси, пропокси, бутокси, $-SO_2R^{45}$, $-NR^{46}R^{47}$, $NR^{46}R^{47}C(=O)-$ или $(C_{1-4}$ алкил$)CO_2-$;

R^{41}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, CF_3, галогенген, OH, CO_2H, SO_2R^{45}, $NR^{46}R^{47}$, NO_2, CN, C_{2-4} алкенила, C_{3-10} алкинила, C_{1-3} алкокси, C_{1-3} галогеналкила и C_{1-3} алкила;

R^{42}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, CF_3, галогена, OH, CO_2H, SO_2R^{45}, $NR^{46}R^{47}$, NO_2, CN,

$CH(=NH)NH_2$, $NHC(=NH)NH_2$, C_{2-4} алкенила, C_{2-4} алкинила, C_{1-3} алкокси, C_{1-3} галогеналкила, C_{3-6} циклоалкила и C_{1-3} алкила;

R^{43} представляет собой циклопропил, циклобутил, циклопентил, циклогексил, фенил или пиридил, каждый замещен 0-3 R^{44};

R^{44}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, галогена, -OH, $NR^{46}R^{47}$, CO_2H, SO_2R^{45}, $-CF_3$, $-OCF_3$, -CN, $-NO_2$, метила, этила, пропила, бутила, метокси, этокси, пропокси и бутокси;

R^{45} представляет собой метил, этил, пропил или бутил;

R^{46}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, метила, этила, пропила и бутила;

R^{47}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, метила, этила, пропила и бутила;

k имеет значение 1; и

n имеет значение 1 или 2.

8. Соединение по пункту 2, у которого:

X представляет собой -O-;

R^1 выбран из

H,

C_{1-4} алкила,

C_{2-4} алкенила,

C_{2-4} алкинила,

C_{3-4} циклоалкила,

C_{1-3} алкила, замещенного 0-1 R^2,

C_{2-3} алкенила, замещенного 0-1 R^2 и

C_{2-3} алкинила, замещенного 0-1 R^2;

R^2, в случае присутствия, независимо является выбранным из

C_{1-4} алкила,

C_{2-4} алкенила,

C_{2-4} алкинила,

C_{3-6} циклоалкила,

фенила, замещенного 0-5 R^{42};

C_{3-6} карбоциклического остатка, замещенного 0-3 R^{41} и

5-6-членной гетероциклической кольцевой системы, содержащей 1, 2 или 3 гетероатомов, выбранных из группы, состоящей из N, O и S, замещенной 0-3 R^{41};

R^5 представляет собой H, метил, этил, пропил или бутил;

R^6 представляет собой H;

R^7 и R^9, в случае присутствия, независимо являются выбранными из H, F, Cl, $-CH_3$, $-OCH_3$, $-CF_3$, $-OCF_3$, -CN и $-NO_2$;

RU 2003121304 A

RU 2003121304 A

R^8 выбран из
H, F, Cl, Br, $-CF_3$, $-OCF_3$, -OH, -CN, $-NO_2$,
C_{1-4} алкила, C_{2-4} алкенила, C_{2-4} алкинила, C_{1-4} галогеналкила,
C_{1-4} алкокси, (C_{1-4} галогеналкил)окси,
C_{3-10} циклоалкила, замещенного 0-2 R^{33},
C_{1-4} алкила, замещенного 0-2 R^{11},
C_{2-4} алкенила, замещенного 0-2 R^{11},
C_{2-4} алкинила, замещенного 0-1 R^{11},
C_{3-10} карбоциклического остатка, замещенного 0-3 R^{33},
арила, замещенного 0-5 R^{33},
5-6-членной гетероциклической кольцевой системы, содержащей 1, 2 или 3 гетероатомов, выбранных из группы, состоящей из N, O и S, замещенной 0-3 R^{31};
OR^{12}, SR^{12}, $NR^{12}R^{13}$, $NR^{12}C(O)R^{15}$, $NR^{12}C(O)\ OR^{15}$, $NR^{12}S(O)2R^{15}$, и $NR^{12}C(O)NHR^{15}$;
R^{11} является выбранным из
H, галогена, $-CF_3$, -CN, $-NO_2$,
C_{1-4} алкила, C_{2-4} алкенила, C_{2-4} алкинила,
C_{1-4} галогеналкила, C_{1-4} алкокси, (C_{1-4} галогеналкил)окси,
C_{3-10} циклоалкила, замещенного 0-2 R^{33},
C_{3-10} карбоциклического остатка, замещенного 0-3 R^{33},
арила, замещенного 0-5 R^{33} и
5-6-членной гетероциклической кольцевой системы, содержащей 1, 2 или 3 гетероатомов, выбранных из группы, состоящей из N, O и S, замещенной 0-3
R^{12}, в случае присутствия, независимо является выбранным из
C_{1-4} алкила, замещенного 0-1 R^{12a},
C_{2-4} алкенила, замещенного 0-1 R^{12a},
C_{2-4} алкинила, замещенного 0-1 R^{12a},
C_{3-6} циклоалкила, замещенного 0-3 R^{33},
арила, замещенного 0-5 R^{33};
C_{3-10} карбоциклического остатка, замещенного 0-3 R^{33} и
5-10-членной гетероциклической кольцевой системы, содержащей 1-4 гетероатомов, выбранных из группы, состоящей из N, O и S, замещенной 0-3 R^{31};
R^{12a}, в случае присутствия, независимо является выбранным из фенила, замещенного 0-5 R^{33};
C_{3-10} карбоциклического остатка, замещенного 0-3 R^{33} и
5-10-членной гетероциклической кольцевой системы, содержащей 1-4 гетероатомов, выбранных из группы, состоящей из N, O и S, замещенной 0-3 R^{31};
R^{13}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, C_{1-4} алкила, C_{2-4} алкенила и C_{2-4} алкинила;
альтернативно, R^{12} и R^{13} объединяются, чтобы образовать 5- или 6-членное кольцо, необязательно замещенное –O- или -N(R^{14})-;
альтернативно, R^{12} и R^{13}, когда присоединены к N, могут быть объединены, чтобы образовывать
9- или 10-членную бициклическую гетероциклическую кольцевую систему, содержащую 1-3 гетероатомов, выбранных из группы, состоящей из N, O и S, где указанная бициклическая гетероциклическая кольцевая система выбрана из индолила, индолинила, индазолила, бензимидазолила, бензимидазолинила, бензтриазолила, бензоксазолила, бензоксазолинила, бензтиазолила, хинолинила, тетрагидрохинолинила, изохинолинила и тетрагидроизохинолинила; где указанная бициклическая гетероциклическая кольцевая система является замещенной 0-1 R^{16};
R^{14}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, метила, этила,

RU 2003121304 A
RU 2003121304 A

пропила и бутила;

R^{15}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, метила, этила, пропила и бутила;

R^{16}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, OH, F, Cl, CN, NO_2, метила, этила, метокси, этокси, трифторметила и трифторметокси;

R^{31}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, OH, галогена, CF_3, метила, этила и пропила;

R^{33}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, OH, галогена, CN, NO_2, CF_3, SO_2R^{45}, $NR^{46}R^{47}$, -C(=O)H, фенила, C_{1-6} алкила, C_{2-6} алкенила, C_{2-6} алкинила, C_{3-6} циклоалкил,

C_{1-4} галогеналкил, C_{1-4} галогеналкил-окси-,

C_{1-4} алкилокси-, C_{1-4} алкилтио-, C_{1-4} алкила-C(=O)-,

C_{1-4} алкила-C(=O)NH-, C_{1-4} алкила-OC(=O)-,

C_{1-4} алкила-C(=O)O-, C_{3-6} циклоалкил-окси-,

C_{3-6} циклоалкилметил-окси-;

C_{1-6} алкила, замещенного OH, метокси, этокси, пропокси, бутокси, $-SO_2R^{45}$, $-NR^{45}R^{47}$, $NR^{46}R^{47}C(=O)-$ или (C_{1-4} алкил)CO_2-; и

C_{2-6} алкенила, замещенного OH, метокси, этокси, пропокси, бутокси, $-SO_2R^{45}$, $-NR^{46}R^{47}$, $NR^{45}R^{47}C(=O)-$ или (C_{1-4} алкил)CO_2-;

R^{41}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, CF_3, галогена, OH, CO_2H, SO_2R^{45}, $NR^{46}R^{47}$, NO_2, CN, C_{2-4} алкенила, C_{2-4} алкинила, C_{1-3} алкокси, C_{1-3} галогеналкила и C_{1-3} алкила;

R^{42}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, CF_3, галогена, OH, CO_2H, SO_2R^{45}, $NR^{46}R^{47}$, NO_2, CN, $CH(=NH)NH_2$, $NHC(=NH)NH_2$, C_{2-4} алкенила, C_{2-4} алкинила, C_{1-3} алкокси, C_{1-3} галогеналкила, C_{3-6} циклоалкила и C_{1-3} алкила;

R^{43} представляет собой циклопропил, циклобутил, циклопентил, циклогексил, фенил или пиридил, каждый замещен 0-3 R^{44};

R^{44}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, галогена, -OH, $NR^{46}R^{47}$, CO_2H, SO_2R^{45}, $-CF_3$, $-OCF_3$, -CN, $-NO_2$, метила, этила, пропила, бутила, метокси, этокси, пропокси и бутокси;

R^{45} представляет собой метил, этил, пропил или бутил;

R^{46}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, метила, этила, пропила и бутила;

R^{47}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, метила, этила, пропила и бутила;

k имеет значение 1; и 5

n имеет значение 1 или 2.

9. Соединение по пункту 2, у которого:

X представляет собой -O-;

R^1 выбран из H,

C_{1-5} алкила, замещенного 0-1 R^2,

C_{2-5} алкенила, замещенного 0-1 R^2 и

C_{2-3} алкинила, замещенного 0-1 R^2;

R^2 представляет собой C_{3-6} циклоалкил;

R^5 представляет собой H, метил, этил или пропил;

R^6 представляет собой H;

R^7 и R^9, в случае присутствия, независимо являются выбранными из H, F, Cl, $-CH_3$, $-OCH_3$, $-CF_3$, $-OCF_3$, -CN и $-NO_2$;

R^8 выбран из R^{11};

метила, замещенного R^{11};

RU 2003121304 A

RU 2003121304 A

фенила, замещенного 0-3 R^{33};
пиридила, замещенного 0-2 R^{33};
OR^{12}, SR^{12}, $NR^{12}R^{13}$, $NR^{12}C(O)R^{15}$, $NR^{12}C(O)OR^{15}$, $NR^{12}S(O)_2R^{15}$ и $NR^{12}C(O)NHR^{15}$;
R^{11} выбран из
фенила, замещенного 0-5 фтором;
пиридила, замещенного 0-2 R^{33};
нафтила-, замещенного 0-2 R^{33};
2-($H_3CCH_2C(=O)$)-фенила-, замещенного R^{33};
2-($H_3CC(=O)$)-фенила-, замещенного R^{33};
2-(HC(=O))-фенила-, замещенного R^{33};
2-($H_3CCH(OH)$)-фенила-, замещенного R^{33};
2-($H_3CCH_2CH(OH)$)-фенила-, замещенного R^{33};
2-($HOCH_2$)-фенила-, замещенного R^{33};
2-($HOCH_2CH_2$)-фенила-, замещенного R^{33};
2-(H_3COCH_2)-фенила-, замещенного R^{33};
2-($H_3COCH_2CH_2$)-фенила-, замещенного R^{33};
2-($H_3CCH(OMe)$)-фенила-, замещенного R^{33};
2-($H_3COC(=O)$)-фенила-, замещенного R^{33};
2-($HOCH_2CH=CH$)-фенила-, замещенного R^{33};
2-((MeOC=O)CH=CH)-фенил-‘ замещен R^{33};
2-(метил)-фенила-, замещенного R^{33};
2-(этил)-фенила-, замещенного R^{33};
2-(изо-пропил)-фенила-, замещенного R^{33};
2-(F_3C)-фенила-, замещенного R^{33};
2-(NC)-фенила-, замещенного R^{33};
2-(H_3CO)-фенила-, замещенного R^{33};
2-(фтор)-фенила-, замещенного R^{33};
2-(хлор)-фенила-, замещенного R^{33};
3-(NC)-фенила-, замещенного R^{33};
3-(H_3CO)-фенила-, замещенного R^{33};
3-(фтор)-фенила-, замещенного R^{33};
3-(хлор)-фенила-, замещенного R^{33};
3-(H_3C)-фенила-, замещенного R^{33};
3-(F_3C)-фенила-, замещенного R^{33};
3-(H_3CS)-фенила-, замещенного R^{33};
4-(NC)-фенила-, замещенного R^{33};
4-(фтор)-фенила-, замещенного R^{33};
4-(хлор)-фенила-, замещенного R^{33};
4-(H_3CS)-фенила-, замещенного R^{33};
4-(H_3CO)-фенила-, замещенного R^{33};
4-(этокси)-фенила-, замещенного R^{33};
4-(изо-пропокси)-фенила-, замещенного R^{33};
4-(изо-бутокси)-фенила-, замещенного R^{33};
4-($H_3CCH_2CH_2C(=O)$)-фенила-, замещенного R^{33};
4-(($H_3C)_2CHC(=O)$)-фенила-, замещенного R^{33};
4-($H_3CCH_2C(=O)$)-фенила-, замещенного R^{33};
4-($H_3CC(=O)$)-фенила-, замещенного R^{33};
4-($H_3CCH_2CH_2CH(OH)$)-фенила-, замещенного R^{33};

RU 2003121304 A
RU 2003121304 A

4-(($H_3C)_2CHCH(OH)$)-фенила-, замещенного R^{33};
4-($H_3CCH_2CH(OH)$)-фенила-, замещенного R^{33};
4-($H_3CCH(OH)$)-фенила-, замещенного R^{33};
4-(циклопропилокси)-фенила-, замещенного R^{33};
4-(циклобутилокси)-фенила-, замещенного R^{33}; и
4-(циклопентилокси)-фенила-, замещенного R^{33};
R^{12} выбран из
метила, замещенного R^{11};
фенила, замещенного 0-5 фтор;
пиридила, замещенного 0-2 R^{33};
нафтила, замещенного 0-2 R^{33};
2-($H_3CCH_2C(=O)$)-фенила-, замещенного R^{33};
2-($H_3CC(=O)$)-фенила-, замещенного R^{33};
2-($HC(=O)$)-фенила-, замещенного R^{33};
2-($H_3CCH(OH)$)-фенила-, замещенного R^{33};
2-($H_3CCH_2CH(OH)$)-фенила-, замещенного R^{33};
2-($HOCH_2$)-фенила-, замещенного R^{33};
2-($HOCH_2CH_2$)-фенила-, замещенного R^{33};
2-(H_3COCH_2)-фенила-, замещенного R^{33};
2-($H_3COCH_2CH_2$)-фенила-, замещенного R^{33};
2-($H_3CCH(OMe)$)-фенила-, замещенного R^{33};
2-($H_3COC(=O)$)-фенила-, замещенного R^{33};
2-($HOCH_2CH=CH$)-фенила-, замещенного R^{33};
2-((MeOC=O)CH=CH)-фенила-, замещенного R^{33};
2-(метил)-фенила-, замещенного R^{33};
2-(этил)-фенила-, замещенного R^{33};
2-(изо-пропил)-фенила-, замещенного R^{33};
2-(F_3C)-фенила-, замещенного R^{33};
2-(NC)-фенила-, замещенного R^{33};
2-(H_3CO)-фенила-, замещенного R^{33};
2-(фтор)-фенила-, замещенного R^{33};
2-(хлор)-фенил- замещен R^{33};
3-(NC)-фенила-, замещенного R^{33};
3-(H_3CO)-фенила-, замещенного R^{33};
3-(фтор)-фенила-, замещенного R^{33};
3-(хлор)-фенила-, замещенного R^{33};
3-(H_3C)-фенила-, замещенного R^{33};
3-(F_3C)-фенила-, замещенного R^{33};
3-(H_3CS)-фенила-, замещенного R^{33};
4-(фтор)-фенила-, замещенного R^{33};
4-(хлор)-фенила-, замещенного R^{33};
4-(H_3CS)-фенила-, замещенного R^{33};
4-(H_3CO)-фенила-, замещенного R^{33};
4-(этокси)-фенила-, замещенного R^{33};
4-(изо-пропокси)-фенила-, замещенного R^{33};
4-(изо-бутокси)-фенила-, замещенного R^{33};
4-($H_3CCH_2CH_2C(=O)$)-фенила-, замещенного R^{33};
4-(($H_3C)_2CHC(=O)$)-фенила-, замещенного R^{33};

RU 2003121304 A
RU 2003121304 A

4-($H_3CCH_2C(=O)$)-фенила-, замещенного R^{33};

4-($H_3CC(=O)$)-фенила-, замещенного R^{33};

4-($H_3CCH_2CH_2CH(OH)$)-фенила-, замещенного R^{33};

4-($(H_3C)_2CHCH(OH)$)-фенила-, замещенного R^{33};

4-($H_3CCH_2CH(OH)$)-фенила-, замещенного R^{33};

4-($H_3CCH(OH)$)-фенила-, замещенного R^{33};

4-(циклопропилокси)-фенила-, замещенного R^{33};

4-(циклобутилокси)-фенила-, замещенного R^{33}; и

4-(циклопентилокси)-фенила-, замещенного R^{33};

R^{13} представляет собой H, метил или этил;

альтернативно, R^{12} и R^{13} объединяются, чтобы образовать 5- или 6-членное кольцо, выбранное из пирролила, пирролидинила, имидазолила, пиперидинила, пиперизинила, метилпиперизинила и морфолинила;

альтернативно, R^{12} и R^{13}, когда присоединены к N, могут быть объединены, чтобы образовывать

9- или 10-членную бициклическую гетероциклическую кольцевую систему, содержащую 1-3 гетероатомов, выбранных из группы, состоящей из N, O и S, где указанная бициклическая гетероциклическая кольцевая система выбрана из индолила, индолинила, индазолила, бензимидазолила, бензимидазолинила, бензтриазолила, бензоксазолила, бензоксазолинила, бензтиазолила, хинолинила, тетрагидрохинолинила, изохинолинила, тетрагидроизохинолинила, где указанная бициклическая гетероциклическая кольцевая система является замещенной 0-1 R^{16};

R^{15} представляет собой H, метил, этил, пропил или бутил;

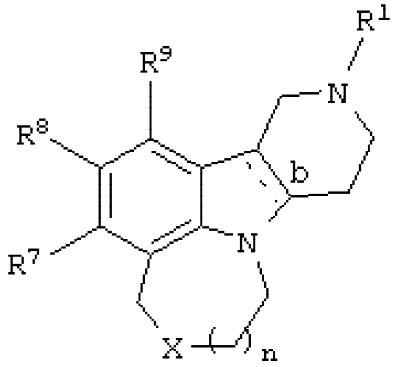
R^{16}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, OH, F, Cl, CN, NO_2, метила, этила, метокси, этокси, трифторметила и трифторметокси;

R^{33}, при каждом возникновении, является независимым, выбранным из H, F, Cl, $-CH_3$, $-OCH_3$, $-SCH_3$, $-CF_3$, $-OCF_3$, -CN, и $-NO_2$;

k имеет значение 1; и

n имеет значение 1 или 2.

10. Соединение по пункту 2 формулы (I-b)



(I-b)

в которой b представляет собой простую или двойную связь;

X представляет собой -S- или -O-;

R^1 выбран из

водорода, метила, этила, н-пропила, н-бутила, втор-бутила, трет-бутила, н-пентила, н-гексила, 2-пропила, 2-бутила, 2-пентила, 2-гексила, 2-метилпропила, 2-метилбутила, 2-метилпентила, 2-этилбутила, 3-метилпентила, 3-метилбутила, 4-метилпентила, 2-фторэтила, 2,2-дифторэтила, 2,2,2-трифторэтила, 2-пропенила, 2-метил-2-пропенила, транс-2-бутенила, 3-метил-2-бутенила, 3-бутенила, транс-2-пентенила, цис-2-пентенила, 4-пентенила, 4-метил-3-пентенила, 3,3-дихлор-2-пропенила, транс-3-фенил-2-пропенила,

RU 2003121304 A

RU 2003121304 A

циклопропила, циклобутила, диклопентила, циклогексила, циклопропилметила, циклобутилметила, циклопентилметила, циклогексилметила, бензила, 2-метилбензила, 3-метилбензила, 4-метилбензила, 2,5-диметилбензила, 2,4-диметилбензила, 3,5-диметилбензила, 2,4,6-триметилбензила, 3-метоксибензила, 3,5-диметоксибензила, пентафторбензила, 2-фенилэтила, 1-фенил-2-пропила, 4-фенилбутила, 4-фенилбензила, 2-фенилбензила, 2,6-диметоксибензила, 2,4-диметоксибензила, 2,4,6-триметоксибензила, 2,3-диметоксибензила, 2,4,5-триметоксибензила, 2,3,4-триметоксибензила, 3,4-диметоксибензила, 3,4,5-триметоксибензила, (4-фторфенил) этила,

$-CH=CH_2$, $-CH_2-CH=CH_2$, $-CH=CH-CH_3$, $-C\equiv CH$, $-C\equiv C-CH_3$, и

$-CH_2-C\equiv CH$;

R^7, R^8 и R^9, в случае присутствия, независимо являются выбранными из водорода, фтора, хлора, брома, циано, метила, этила, пропил изопропила, бутила, трет-бутила, нитро, трифторметила, метокси, этокси изопропокси, трифторметокси, фенила;

2-Cl-фенила; 2-F-фенила; 2-Br-фенила; 2-CN-фенила; 2-Me-фенила; 2-CF_3-фенила;

2-MeO-фенила; 2-CF_3O-фенила;

2-NO_2-фенила; 2-MeS-фенила; 2-CHO-фенила; 2-$HOCH_2$-фенила;

3-Cl-фенила; 3-F-фенила; 3-Br-фенила; 3-CH-фенила; 3-Me-фенила; 3-Et-фенила; 3-н-Pr-фенила; 3-изоPr-фенила; 3-н-Bu-фенила; 3-CF_3-фенила; 3-MeO-фенила; 3-MeS-фенила; 3-изопропоксифенила; 3-CF_3O-фенила; 3-NO_2-фенила; 3-CHO-фенила; 3-$HOCH_2$-фенила; 3-$MeOCH_2$-фенила;

3-Me_2MCH_2-фенила;

4-Cl-фенила; 4-F-фенила; 4-Br-фенила; 4-CN-фенила; 4-Me-фенила; 4-Et-фенила; 4-н-Pr-фенила; 4-изо-Pr-фенила; 4-н-Bu-фенила; 4-CF_3-фенила; 4-MeO-фенила; 4-изопропоксифенила; 4-CF_3O-фенила; 4-MeS-фенила;

4-ацетилфенила; 3-ацетамидофенила; 4-пиридила; 2-фуранила; 2-тиофенила; 2-нафтила; 1-пирролидинила,

2,3-диCl-фенила; 2,3-диF-фенила; 2,3-диMe-фенила;

2,3-ДиCF_3-фенила; 2,3-диMeO-фенила; 2,3-ДиCF_3O-фенила;

2,4-диCl-фенила; 2,4-диF-фенила; 2,4-диMe-фенила;

2,4-диCF_3-фенила; 2,4-диMeO-фенила; 2,4-диCF_3O-фенила;

2,5-диCl-фенила; 2,5-диF-фенила; 2,5-диMe-фенила;

2,5-диCF_3-фенила; 2,5-диMeO-фенила; 2,5-диCF_3O-фенила;

2,6-диCl-фенила; 2,6-диF-фенила; 2,6-диMe-фенила;

2,6-диCF_3-фенила; 2,6-диMeO-фенила; 2,6-диCF3O-фенила;

3,4-диCl-фенила; 3,4-диF-фенила; 3,4-диMe-фенила;

3,4-диCF_3-фенила; 3,4-диMeO-фенила; 3,4-диCF_3O-фенила;

2,4,6-триCl-фенила; 2,4,6-триF-фенила; 2,4,6-триMe-фенила; 2,4,6-триCF_3-фенила; 2,4,6-триMeO-фенила; 2,4,6-триCF_3O-фенила; 2,4,5-триMe-фенила; 2,3,4-триF-фенила; 2-Me-4-MeO-5-F-фенила; 2,6-диCl-4-MeO-фенила; 2,4-диMeO-6-F-фенила;

2,6-диF-4-Cl-фенила; 2,3,4,6-тетраF-фенила; 2,3,4,5,6-пентаF-фенила; 2-Cl-4-F-фенила; 2-Cl-6-F-фенила; 2-Cl-3-Me-фенила; 2-Cl-4-MeO-фенила; 2-Cl-4-EtO-фенила; 2-Cl-4-изоPrO-фенила; 2-Cl-4-CF_3-фенила; 2-Cl-4-CF_3O-фенила; 2-C_{1-4}-(CHF2)O-фенила; 2-F-3-Cl-фенила; 2-F-4-MeO-фенила; 2-F-5-Me-фенила;

2-Me-3-Cl-фенила; 2-Me-3-CH-фенила; 2-Me-4-Cl-фенила; 2-Me-4-F-фенила; 2-Me-4-CN-фенила; 2-Me-4-MeO-фенила; 2-Me-4-EtO-фенила; 2-Me-4-MeS-фенила; 2-Me-4-H_2NCO-фенила; 2-Me-4-MeOC(=O)-фенила; 2-Me-4-$CH_3C(=O)$-фенила; 2-Me-5-F-фенила;

2-Et-4-MeO-фенила; 2-MeO-5-F-фенила; 2-MeO-4-изопропил-фенила; 2-CF_3-4-Cl-фенила; 2-CF_3-4-F-фенила; 2-CF_3-4-MeO-фенила; 2-CF_3-4-EtO-фенила; 2-CF_3-4-iPrO-фенила; 2-CF_3-4-CN-фенила; 2-CF_3-6-F-фенила;

2-CHO-4-MeO-фенила; 2-MeOC(=O)-3-MeO-фенила; 2-$CH_3CH(OH)$-4-MeO-фенила; 2-$CH_3CH(OH)$-4-F-фенила; 2-$CH_3CH(OH)$-4-Cl-фенила; 2-$CH_3CH(OH)$-4-Me-фенила; 2-$CH_3CH(OMe)$-4-MeO-фенила; 2-$CH_3C(=O)$-4-MeO-фенила; 2-$CH_3C(=O)$-4-F-фенила; 2-$CH_3C(=O)$-4-Cl-фенила; 2-$CH_3C(=O)$-4-Me-фенила; 2-$H_2C(OH)$-4-MeO-фенила;

RU 2003121304 A

RU 2003121304 A

2-H $_2$C(OMe)-4-MeO-фенила; 2-H_3CCH_2CH(OH)-4-MeO-фенила;
2-H $_3CCH_2C$(=O)-4-MeO-фенила; 2-$CH_3CO_2CH_2CH_2$-4-MeO-фенила;
{Z)-2-HOCH $_2$CH=CH-4-MeO-фенила;
(E)-2-$HOCH_2CH$=CH-4-MeO-фенила; (Z)-2-CH_3CO_2CH=CH-4-MeO-фенила;
(E)-2-CH $_3CO_2CH$=CH-4-MeO-фенила; 2-$CH_3OCH_2CH_2$-4-MeO-фенила;
3-CN-4-F-фенила; 3-H_2NCO-4-F-фенила; {2-Cl-фенил)-CH=CH-; (3-Cl-фенил)-CH=CH-;
{2,6-диF-фенил)-CH=CH-; фенил-CH=CH-; (2-Me-4-MeO-фенил}-CH-CH-;
циклогексила; циклопентила; циклогексилметила; бензила;
2-F-бензила; 3-F-бензила; 4-F-бензила; 3-MeO-бензила;
3-OH-бензила; 2-MeO-бензила; 2-OH-бензила;
тетрагидрохинолин-1-ила;
тетрагидроиндолин-1-ила;
тетрагидроизоиндолин-1-ила;
фенил-S-; фенил-NH-; пирид-3-ил-NH-; (4-Me-пирид-3-ил)-NH-;
(1-нафтил)-NH-; (2-нафтил)-NH-; (2-Me-нафт-1-ил)-NH-;
(3-хинолинил)-NH-;
(2-[1,1'-бифенил])-NH-; (3-[1,1'-бифенил])-NH-;
(4-[1,1'-бифенил])-NH-; (2-F-фенил)-NH-;
(2-Cl-фенил)-NH-; (2-CF_3~фенил)-NH-;
(2-CH_3-фенил)-NH-; (2-OMe-фенил)-NH-;
(2-CN-фенил)-NH-; (2-OCF_3-фенил)-NH-;
(2-SMe-фенил)-NH-; (3-F-фенил)-NH-;
(3-Cl-фенил)-NH-; (3-CF3-фенил)-NH-;
(3-CH_3-фенил)-NH-; (3-OMe-фенил)-NH-;
(3-CN-фенил)-NH-; (3-OCF3-фенил)-NH-;
(3-SMe-фенил)-NH-; (4-F-фенил)-NH-;
(4-Cl-фенил)-NH-; (4-CF3-фенил)-NH-;
(4-CH_3-фенил)-NH-; (4-OMe-фенил)-NH-;
(4-CN-фенил)-NH-; (4-OCF3-фенил)-NH-;
(4-SMe-фенил)-NH-; (2,3-диCl-фенил)-NH-;
(2,4-диCl-фенил)-NH-; (2,5-диCl-фенил)-NH-;
(2,6-диCl-фенил)-NH-; (3,4-диCl-фенил)-NH-;
(3,5-диCl-фенил)-NH-; (2,3-диF-фенил)-NH-;
(2,4-диF-фенил)-NH-; (2,5-диF-фенил)-NH-;
(2,6-диF-фенил)-NH-; (3,4-диF-фенил)-NH-;
(3,5-диF-фенил)-NH-; (2,3-ДиCH_3-фенил)-NH-;
(2,4-диCH_3-фенил)-NH-; (2,5-диCH_3-фенил)-NH-
(2,6-диCH_3-фенил)-NH-; (3,4-диCH_3-фенил)-NH-
(3,5-диCH_3-фенил)-NH-; (2,3-диCF_3-фенил)-NH-
(2,4-даCF_3-фенил)-NH-(2,5-диCF_3-фенил)-NH-
(2,6-диCF_3-фенил)-NH-; (3,4-диCF_3-фенил)-NH-
(3,5-диCF_3-фенил)-NH-; (2,3-диOMe-фенил)-NH-
(2,4-диOMe-фенил)-NH-; (2,5-диOMe-фенил)-NH-
(2,6-диOMe-фенил)-NH-; (3,'4-диOMe-фенил)-NH-
(3,5-диOMe-фенил)-NH-; (2-F-3-Cl-фенил)-NH-
(2-F-4-Cl-фенил)-NH-; (2-F-5-Cl-фенил)-NH-;
(2-F-6-Cl-фенил)-NH-; (2-F-3-CH_3-фенил)-NH-;
(2-F-4-CH_3-фенил)-NH-; (2-F-5-CH_3-фенил)-NH-;
(2-F-6-CH_3-фенил)-NH-; (2-F-3-CF_3-фенил)-NH-;
(2-F-4-CF_3-фенил)-NH-; (2-F-5-CF_3-фенил)-NH-,
(2-F-4-OMe-фенил)-NH-; (2-F-6-OMe-фенил)-NH-;
(2-F-6-CF_3-фенил)-NH-; (2-F-3-OMe-фенил)-NH-;
(2-F-6-OMe-фенил)-NH-; {2-Cl-3-F-фенил)-NH-;
(2-C1-4-F-фенил)-NH-; (2-Cl-5-F-фенил)-NH-;

RU 2003121304 A
RU 2003121304 A

(2-C1-6-F-фенил)-NH-; (2-Cl-3-CH_3-фенил)-NH-;
(2-Cl-4-CH_3-фенил)-NH-; (2-Cl-5-CH_3-фенил)-NH-;
(2-Cl-6-CH_3-фенил)-NH-; (2-Cl-3-CF_3-фенил)-NH-;
(2-C1-4-CF_3-фенил)-NH-; (2-Cl-5-CF_3-фенил)-NH-;
(2-C1-6-CF_3-фенил)-NH-(2-Cl-3-OMe-фенил)-NH-;
(2-C1-4-OMe-фенил)-NH-; (2-Cl-5-OMe-фенил)-NH-;
(2-C1-6-OMe-фенил)-NH-; (2-CH_3-3-F-фенил)-NH-;
(2-CH_3-4-F-фенил)-NH-; (2-CH_3-5-фенил)-NH-;
(2-CH_{3-6}F-фенил)-NH-; (2-CH_3-3-Cl-фенил)-NH-;
(2-CH_3-4-Cl-фенил)-NH-; (2-CH_3-5-Cl-фенил)-NH-;
(2-CH_{3-6-}Cl-фенил)-NH-; (2-CH_3-3-CF_3-фенил)-NH-;
(2-CH_2-4-CF_3-фенил)-NH-; (2-CH_3-5-CF_3-фенил)-NH-;
(2-CH_{3-}6-CF_3-фенил)-NH-; (2-CH_3-3-OMe-фенил)-NH-;
(2-CH_3-4-OMe-фенил)-NH-(2-CH_3-5-OMe-фенил)-NH-;
(2-CH_{3-}6-OMe-фенил)-NH-; (2-CF_3-3-F-фенил)-NH-;
(2-CF_3-4-F-фенил)-NH-; (2-CF_3-5-F-фенил)-NH-;
(2-CF_3-6-F-фенил)-NH-; (2-CF_3-3-Cl-фенил)-NH-;
(2-CF_3-4-Cl-фенил)-NH-; (2-CF_3-5-Cl-фенил)-NH-;
{2-CF_{3-}6-Cl-фенил)-NH-; (2-CF_3-3-CH_3-фенил)-NH-;
(2-CF_3-4-CH_3-фенил)-NH-; (2-CH_3-5-CF_3-фенил)-NH-;
(2-CF_3-6-CH_3-фенил)-NH-; (2-CF_3-3-OMe-фенил)-NH-;
(2-CF_3-4-OMe-фенил)-NH-; (2-CF_3-5-OMe-фенил)-NH-;
(2-CF_3-6-OMe-фенил)-NH-; (2-OMe-3-F-фенил)-NH-;
(2-OMe-4-F-фенил)-NH-; (2-OMe-5-F-фенил)-NH-;
(2-OMe-6-F-фенил)-NH-; (2-OMe-3-Cl-фенил)-NH-;
(2-OMe-4-Cl-фенил)-NH-(2-OMe-5-Cl-фенил)-NH-;
(2-OMe-6-Cl-фенил)-NH-; (2-OMe-4-CN-фенил)-NH-;
(2-OMe-4-CHO-фенил)-NH-; (2-OMe-3-CH_3-фенил)-NH-;
(2-OMe-4-CH_3-фенил)-NH-; (2-OMe-5-CH_3-фенил)-NH-;
(2-OMe-6-CH_3-фенил)-NH-; (2-OMe-3-CF_3-фенил)-NH-;
(2-OMe-4-CF_3-фенил)-NH-; (2-OMe-5-CF_3-фенил)-NH-;
(2-OMe-6-CF_3-фенил)-NH-; (2-ацетил-4-Cl-фенил)-NH-;
(2-ацетил-4-Me-фенил)-NH-; (2-ацетил-4-MeO-фенил)-NH-;
(2-CH_3CH(OH)-4-Cl-фенил)-NH-; (2-CH_3CH(OH)-4-Me-фенил)-NH-;
(2-CH_3CH(OH)-4-MeO-фенил)-NH-;
(3-CF_3-4-Cl-фенил)-NH-; (3-F-4-CHO-фенил)-NH-;
(3-CH_3-4-CN-фенил)-NH-; (3-CH_3-4-MeO-фенил)-NH-;
(3-CH_3-4-Cl-фенил)-NH-; (3-CH_3-4-F-фенил)-NH-;
(3-CH_3-4-CO_2Me-фенил)-NH-; (3-CF_3-4-C(O)CH_3-фенил)NH-;
(3-CHO-4-OMe-фенил)-NH-; (4-F-3-CF_3-фенил)-NH-;
(2,3,5-триCl-фенил)-NH-; (2,4,5-триF-фенил)-NH-;
(2,6-диCl-3-Me-фенил)-NH-; (3,5-диMe-4-MeO-фенил)-NH-;
(2-F-3-Cl-6-CF_3-фенил)-NH-, бензил-NH-; (3-хинолинил)CH_2NH-; (2-F-фенил)CH_2NH-; (2-Cl-фенил)CH_2NH-;
(2-CF_3-фенил)CH_2NH-; (2-CH_3-фенил)CH_2NH-(2-OMe-фенил)CH_2NH-;
(2-CN-фенил)CH_2NH-; (2-OCF_3-фенил)CH_2NH-;
(2-SMe-фенил)CH_2NH-; (3-F-фенил)CH_2NH-;
(3-Cl-фенил)CH_2NH-; (3-CF_3-фенил)CH_2NH-;
(3-CH_3-фенил)CH_2NH-(3-OMe-фенил)CH_2NH-;
(3-CN-фенил)CH_2NH-; (3-OCF_3-фенил)CH_2NH-;
(3-SMe-фенил)CH_2NH-; (4-F-фенил)CH_2NH-;
(4-Cl-фенил)CH_2NH-; (4-CF_3-фенил)CH_2NH-;
(4-CH_3-фенил)CH_2NH-; (4-OMe-фенил)CH_2NH-;
(4-CN-фенил)CH_2NH-; (4-OCF_3-фенил)CH_2NH-;

RU 2003121304 A
RU 2003121304 A

(4-SMe-фенил)CH_2NH-; (2,3-ДиCl-фенил)CH_2NH-;
(2,4-диCl-фенил)CH_2NH-; (2,5-дид-фенил)CH_2NH-;
(2,6-диCl-фенил)CH_2NH-; (3,4-диCl-фенил)CH_2NH-;
(3,5-диCl-фенил)CH_2NH-; (2,3-диF-фенил)CH_2NH-;
(2,4-диF-фенил)CH_2NH-; (2,5-диF-фенил)CH_2NH-;
(2,6-диF-фенил) CH_2NH-; (3,4-диF-фенил) CH_2NH-;
(3,5-диF-фенил)CH_2NH-; {2,3-диCH_3-фенил)CH_2NH-,
(2,4-диCH_3-фенил)CH_2NH-; (2,5-даCH_3-фенил)CH_2NH-;
(2,6-диCH_3-фенил)CH_2NH-; (3,4-диCF_3-фенил)CH_2NH-;
(3,5-диCF_3-фенил)CH_2NH-; (2,5-диCF_3-фенил)CH_2NH-;
(2,4-диCH_3-фенил)CH_2H-; (2,5-диCH_3-фенил)CH_2HH-;
(2,6-диCH3-фенил)CH_2NH-; (3,4-диCF_3-фенил)CH_2NH-;
(3,5-диCF_3-фенил)CH_2NH-; (2,3-диCF_3-фенил)CH_2NH-;
(2,4-диOMe-фенил)CH_2NH-; (2,5-диOMe-фенил)CH_2NH-;
(2,6-диOMe-фенил)CH_2NH-; (3,4-диOMe-фенил)CH_2NH-;
(3,5-ди OMe-фенил)CH_2NH-; (2-F-3-Cl-фенил)CH_2NH-,
(2-F-4-Cl-фенил)CH_2NH-; (2-F-5-Cl-фенил)CH_2NH-;
(2-F-6-Cl-фенил)CH_2NH-; (2-F-3-CH_3-фенил}CH_2NH-;
(2-F-4-CH_3-фенил)CH_2NH-; (2-F-5-CH_3-фенил)CH_2NH-;
(2-F-6-CF_3-фенил)CH_2NH-; (2-F-4-CF_3-фенил)CH_2NH-;
(2-F-6-CH_3-фенил)CH_2NH-; (2-F-3-CF_3-фенил)CH_2NH-;
(2-F-4-CF_3-фенил)CH_2NH-; (2-F-5-CF_3-фенил)CH_2NH-;
(2-F-6-CF_3-фенил)CH_2NH-; (2-F-3-OMe-фенил)CH_2NH-;
(2-F-4-OMe-фенил)CH_2NH-; (2-F-5-OMe-фенил)CH_2NH-;
(2-F-6-OMe-фенил)CH_2NH-; (2-Cl-3-F-фенил)CH_2NH-;
(2-Cl-4-F-фенил)CH_2NH-; (2-Cl-5-F-фенил)CH_2NH-;
(2-Cl-6-F-фенил)CH_2NH-; (2-Cl-3-CH_3-фенил)CH_2NH-;
(2-Cl-4-CH_3-фенил)CH_2NH-; (2-Cl-5-CH_3-фенил)CH_2NH-;
(2-Cl-6-CH_3-фенил)CH_2NH-; (2-Cl-3-CF_3-фенил)CH_2NH-;
(2-Cl-4-CF_3-фенил)CH_2NH-; (2-Cl-5-CF_3-фенил)CH_2NH-;
(2-Cl-6-CF_3-фенил)CH_2NH-; (2-Cl-3-OMe-фенил)CH_2NH-;
{2-Cl-4-OMe-фенил)CH_2NH-; (2-Cl-5-OMe-фенил)CH_2NH-;
(2-C1-6-OMe-фенил)CH_2NH-; (2-CH_3-3-F-фенил)CH_2NH-;
(2-CH_3-4-F-фенил)CH_2NH-; (2-CH_3-5-F-фенил)CH_2NH-;
{2-CH_3-$_6$-F-фенил)CH_2NH-; (2-CH_3-3-Cl-фенил)CH_2NH-;
(2-CH_3-4-Cl-фенил)CH_2NH-; (2-CH_3-5-Cl-фенил)CH_2NH-;
(2-CH_3-6-Cl-фенил)CH_2NH-; (2-CH_3-3-CF_3-фенил)CH_2NH-;
(2-CH_3-4-CF_3-фенил)CH_2NH-; (2-CH_3-5-CF_3-фенил)CH_2NH-;
(2-CH_3-$_6$-CF_3-фенил)CH_2NH-; (2-CH_3-3-OMe-фенил)CH_2NH-;
(2-CH_3-4-OMe-фенил)CH_2NH-; (2-CH_3-5-OMe-фенил)CH_2NH-;
(2-CH_3-6-OMe-фенил)CH_2NH-; (2-CF_3-3-F-фенил)CH_2NH-;
(2-CF_3-4-F-фенил)CH_2NH-; (2-CF_3~5-F-фенил)CH_2NH-;
(2-CF_3-6-F-фенил)CH_2NH-; (2-CF_3-3-Cl-фенил)CH_2NH-;
(2-CF_3-4-C1-фенил)CH_2NH-; (2-CF_3-5-Cl-фенил)CH_2NH-;
(2-CF_3-6-Cl-фенил)CH_2NH-; (2-CF_3-3-CH_3-фенил)CH_2NH-;
(2-CF_3-4-CH_3-фенил)CH_2NH-; (2-CH_3-5-CF_3-фенил)CH_2NH-;
(2-CF_3-6-CH_3-фенил)CH_2NH-; (2-CF_3-3-OMe-фенил)CH_2NH-;
(2-CF_3-4-OMe-фенил)CH_2NH-; (2-CF_3-5-OMe-фенил)CH_2NH-;
(2-CF_3-6-OMe-фенил)CH_2NH-; (2-OMe3-F-фенил)CH_2NH-;
(2-OMe-4-F-фенил)CH_2NH-; (2-OMe-5-F-фенил)CH_2NH-;
(2-OMe-6-F-фенил)CH_2NH-; (2-OMe-3-Cl-фенил)CH_2NH-;
(2-OMe-4-Cl-фенил)CH_2NH-; (2-OMe-5-Cl-фенил)CH_2NH-;
(2-OMe6-Cl-фенил)CH_2NH-; (2-OMe-4-CN-фенил)CH_2NH-;

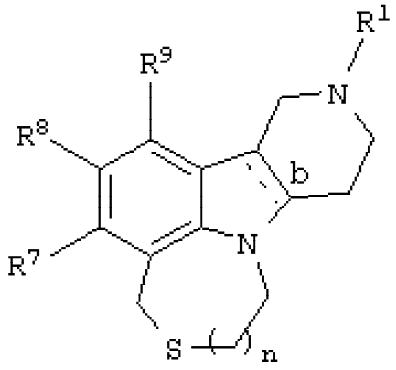
RU 2003121304 A

(2-OMe-4-CHO-фенил)CH_2NH-; (2-OMe-3-CH_3-фенил)CH_2NH-;
(2-OMe4-CH_3-фенил)CH_2NH-; (2-Оме-5-CH_3-фенил)CH_2NH-;
(2-OMe-6-CH_3-фенил)CH_2NH-; (2-OMe-3-CF_3-фенил)CH_2NH-;
(2-OMe-4-CF_3-фенил)CH_2NH-; (2-OMe-5-CF_3-фенил)CH_2NH-;
(2-OMe-6-CF_3-фенил)CH_2NH-; {2-ацетил-4-Cl-фенил)CH_2NH-;
(2-ацетил-4-Me-фенил)CH_2NH-;
(2-ацетил-4-MeO-фенил)CH_2NH-;
(2-CH_3CH(OH)-4-Cl-фенил)CH_2NH-;
(2-CH_3CH(OH)-4-Me-фенил)CH_2NH-;
(2-CH_3CH(OH)-4-MeO-фенил)CH_2NH-;
(3-CF_3-4-Cl-фенил)CH2NH-; (3-F-4-CHO-фенил)CH_2NH-;
(3-CH_3-4-CN-фенил)CH_2NH-; (3-CH_3-4-MeO-фенил)CH_2NH-;
(3-CH_3-4-Cl-фенил)CH_2NH-; (3-CH_3-4-F-фенил)CH_2NH-;
(4-F-3-CF_3-фенил)CH_2NH-; (3-CH_3-4-CO_2Me-фенил)CH_2NH
3-CF_3-4-C(O)CH_3-фенил)CH_2NH-; (3-CHO-4-OMe-фенил)CH_2NH-;
(2,3,5-триCl-фенил)CH_2NH-;
(2,4,5-триF-фенил)CH_2NH-;
(2,6-диCl-3-Me-фенил)CH_2NH-;
(3,5-диMe-4-MeO-фенил)CH_2NH-; и
(2-F-3-Cl-6-CF_3-фенил)CH_2NH-;

при условии, что два из R^7, R^8 и R^9, являются независимо выбранными из водорода, фтора, хлора, брома, циано, метила, этила, пропил изопропила, бутила, трет-бутила, нитро, трифторметила, метокси, этокси, изопропокси и трифторметокси; и

n имеет значение 1 или 2.

11. Соединение по п.10 формулы (II):



(II)

в которой b представляет собой простую связь, в которой мостиковые водороды находятся в цис положении;

R^1 выбран из

водорода, метила, этила, н-пропила, н-бутила, втор-бутила, трет-бутила, н-пентила, н-гексила, 2-пропила, 2-бутила, 2-пентила, 2-гексила, 2-метилпропила, 2-метилбутила, 2-метилпентила, 2-этилбутил, 3-метилпентила, 3-метилбутила, 4-метилпентила, 2-фторэтила, 2,2-дифторэтила, 2,2,2-трифторэтила, 2-пропенила, 2-метил-2-пропенила, транс-2-бутенила, 3-метил-2-бутенила, 3-бутенила, транс-2-пентенила, цис-2-пентенила, 4-пентенила, 4-метил-3-пентенила, 3,3-дихлор-2-пропенила, транс-3-фенил-2-пропенила, циклопропила, циклобутила, циклопентила, циклогексила, циклопропилметила, циклобутилметила, циклопентилметила, циклогексилметила,

-$CH=CH_2$, -CH_2-$CH=CH_2$, -CH=CH-CH_3, -$C\equiv CH$, -$C\equiv C$-CH_3, и -CH_2-$C\equiv CH$;

R^7 и R^9, в случае присутствия, независимо являются выбранными из водорода, фтора, метила, трифторметила и метокси;

R^8 выбран из

RU 2003121304 A
RU 2003121304 A

водорода, фтора, хлора, брома, циано, метила, этила, пропила изопропила, бутила, трет-бутила, нитро, трифторметила, метокси, этокси, изопропокси, трифторметокси, фенила;

2-Cl-фенила; 2-F-фенила; 2-Br-фенила; 2-CN-фенила; 2-Me-фенила; 2-CF_3-фенила; 2-MeO-фенила; 2-CF_3O-фенила;

2-NO_2-фенила; 2-MeS-фенила; 2-CHO-фенила; 2-$HOCH_2$-фенила;

3-Cl-фенила; 3-F-фенила; 3-Br-фенила; 3-CN-фенила; 3-Me-фенила; 3-Et-фенила; 3-н-Pr-фенила; 3-изоPr-фенила;

3-н-Bu-фенила; 3-CF_3-фенила; 3-MeO-фенила; 3-MeS-фенила;

3-изопропоксифенила; 3-CF_3 O-фенила; 3-NO_3-фенила; 3-CHO-фенила;

3-$HOCH_2$-фенила; 3-$MeOCH_2$-фенила; 3-Me2NCH_2-фенила;

4-Cl-фенила; 4-F-фенила; 4-Br-фенила; 4-CN-фенила; 4-Me-фенила;

4-Et-фенила; 4-н-Pr-фенила; 4-изо-Pr-фенила;4-н-Bu-фенила;

4-CF_3-фенила; 4-MeO-фенила; 4-изопропоксифенила; 4-CF_3O-фенила;

4-MeS-фенила; 4-ацетилфенила; 3-ацетамидофенила; 4-пиридила;

2-фуранила; 2-тиофенила; 2-нафтила; 1-пирролидинила, 2,3-диCl-фенила; 2,3-диF-фенила; 2,3-диMe-фенила;

2,3-диCF_3-фенила; 2,3-диMeO-фенила; 2,3-диCF_3O-фенила;

2,4-диCl-фенила; 2,4-диF-фенила; 2,4-диMe-фенила;

2,4-диCF_3-фенила; 2,4-диMeO-фенила; 2,4-диCF_3O-фенила;

2,5-диCl-фенила; 2,5-диF-фенила; 2,5-диMe-фенила;

2,5-диCF_3-фенила; 2,5-диMeO-фенила; 2,5-диCFзO-фенила;

2,6-диCl-фенила; 2,6-диF-фенила; 2,6-диMe-фенила;

2,6-диCF_3-фенила; 2,6-диMeO-фенила; 2,6-диCFзO-фенила;

3,4-диCl-фенила; 3,4-диF-фенила; 3,4-диMe-фенила;

3,4-диCF_3-фенила; 3,4-диMeO-фенила; 3,4-диCF_3O-фенила;

2,4,6-триCl-фенила; 2,4,6-триF-фенила; 2,4,6-триMe-фенила;

2,4,6-триCF_3-фенила; 2,4,6-триMeO-фенила; 2,4,6-триCF_3O-фенила;

2,4,5-триMe-фенила; 2,3,4-триF-фенила; 2-Me-4-MeO-5-P-фенила;

2,6-диC1-4-MeO-фенила; 2,4-диMeO-6-F-фенила,2,6-диF-4-C1-фенила;

2,3,4,6-тетраF-фенила; 2,3,4,5,6-пентаF-фенила;

2-Cl-4-F-фенила; 2-Cl-6-F-фенила; 2-Cl-3-Me-фенила; 2-Cl-4-MeO-фенила;

2-Cl-4-EtO-фенила; 2-Cl-4-iPrO-фенила; 2-Cl-4-CF_3-фенила; 2-Cl-4-CF_3O-фенила;

2-Cl-4-(CHF2)O-фенила; 2-F-3-Cl-фенила; 2-F-4-MeO-фенила; 2-F-5-Me-фенила;

2-Me-3-Cl-фенила; 2-Me-3-CN-фенила; 2-Me-4-Cl-фенила; 2-Me-4-F-фенила;

2-Me-4-CN-фенила; 2-Me-4-MeO-фенила; 2-Me-4-EtO-фенила; 2-Me-4-MeS-фенила;

2-Me-4-H_2NCO-фенила; 2-Me-4-MeOC(=O)-фенила;

2-Me-4-$CH_3C(=O)$-фенила; 2-Me-5-F-фенила;

2-Et-4-MeO-фенила; 2-MeO-5-F-фенила;

2-MeO-4-изопропил-фенила; 2-CF_3-4-Cl-фенила;

2-CF_3-4-F-фенила; 2-CF_3-4-MeO-фенила;

2-CF_3-4-EtO-фенила; 2-CF_3-4-изоPrO-фенила;

2-CF3-4-CN-фенила; 2-CF3-6-F-фенила;

2-CHO-4-MeO-фенила; 2-MeOC(=O)-3-MeO-фенила;

2-$CH_3CH(OH)$-4-MeO-фенила; 2-$CH_3CH(OH)$-4-F-фенила;

2-$CH_3CH(OH)$-4-Cl-фенила; 2-$CH_3CH(OH)$-4-Me-фенила;

2-$CH_3CH(OMe)$-4-MeO-фенила; 2-$CH_3C(=O)$-4-MeO-фенила;

2-$CH_3C(=O)$-4-F-фенила; 2-$CH_3C(=O)$-4-C1-фенила;

2-$CH_3C(=O)$-4-Me-фенила; 2-$H_2C(OH)$-4-MeO-фенила;

2-$H_2C(OMe)$-4-MeO-фенила; 2-$H_3CCH_2CH(OH)$-4-MeO-фенила;

2-$H_3CCH_2C(=O)$-4-MeO-фенила; 2-$CH_3CO_2CH_2CH_3$-4-MeO-фенила;

(Z)-2-$HOCH_2CH$=CH-4-MeO-фенила; (E)-2-$HOCH_2CH$=CH-4-MeO-фенила;

(Z)-2-CH_3CO_2CH=CH-4-MeO-фенила;

(E)-2-CH_3CO_2CH=CH-4-MeO-фенила;

RU 2003121304 A

RU 2003121304 A

2-$CH_3OCH_2CH_2$-4-MeO-фенила;
3-CN-4-F-фенил; 3-H_2NCO-4-F-фенил;
(2-Cl-фенил)-CH=CH-; (3-Cl-фенил)-CH=CH-;
(2,6-диF-фенил)-CH=CH-; фенил-CH=CH-;
(2-Me-4-MeO-фенил)-CH=CH-;
циклогексила; циклопентила; циклогексилметила; бензила; 2-F-бензила; 3-F-бензила; 4-F-бензила; 3-MeO-бензила;
3-OH-бензила; 2-MeO-бензила; 2-OH-бензила; тетрагидрохинолин-1-ила; тетрагидроиндолин-1-ила; тетрагидроизоиндолин-1-ила;
фенил-S-; фенил-NH-; пирид-3-ил-NH-; (4-Me-пирид-3-ил)-NH-;
(1-нафтил)-NH-; (2-нафтил)-NH-; (2-Me-нафт-1-ил)-NH-;
(3-хинолинил)-NH-;
(2-[1,1'-бифенил])-NH-; (3-[1,1'-бифенил])-NH-;
(4-[1,1'-бифенил])-HH-; (2-F-фенил)-NH-;
(2-Cl-фенил)-NH-; (2-CF_3-фенил)-NH-;
(2-CH_3-фенил)-NH-; (2-OMe-фенил)-NH-;
(2-CN-фенил)-NH-; (2-OCF_3-фенил)-NH-;
(2-SMe-фенил)-NH-; (3-F-фенил)-NH-;
(3-Cl-фенил)-NH-; (3-CFз-фенил)-NH-;
(3-CH_3-фенил)-NH-; (3-OMe-фенил)-NH-;
(3-CN-фенил)-NH-; (3-OCF_3-феню1)-NH-;
(3-SMe-фенил)-NH-; (4-F-фенил)-NH-;
(4-Cl-фенил)-NH-; {4-CF_3-фенил)-NH-;
(4-CH_3-фенил)-NH-; (4-OMe-фенил)-NH-;
(4-CN-фенил)-NH-; (4-OCF_3-фенил)-NH-;
(4-SMe-фенил)-NH-; (2,3-диCl-фенил)-NH-;
(2,4-диCl-фенил)-NH-; (2,5-диCl-фенил)-NH-;
(2,6-диCl-фенил)-NH-; (3,4-диCl-фенил)-NH-;
(3,5-диCl-фенил)-NH-; {2,3-диF-фенил)-NH-;
(2,4-диF-фенил)-NH-; (2,5-диF-фенил)-NH-;
(2,6-диF-фенил)-NH-; (3,4-диF-фенил)-NH-;
(3,5-диF-фенил)-NH-; (2,3-диCH_3-фенил)-NH-;
(2,4-диCH_3-фенил)-NH-; (2,5-диCH_3-фенил)-NH-;
(2,6-диCH_3-фенил)-NH-; (3,4-диCH_3-фенил)-NH-;
(3,5-диCH_3-фенил)-NH-; (2,3-диCF_3-фенил)-NH-;
(2,4-диCF_3-фенил)-NH-; (2,5-диCF_3-фенил)-NH-;
(2,6-диCF_3-фенил)-NH-; (3,4-диCF_3-фенил)-NH-;
(3,5-диCF_3-фенил)-NH-; (2,3-диOMe-фенил)-NH-;
(2,4-диOMe-фенил)-NH[1]; (2,5-диOMe-фенил)-NH-;
(2,6-диOMe-фенил)-NH-; (3,4-диOMe-фенил)-NH-;
(3,5-диOMe-фенил)-NH-; (2-F-3-Cl-фенил)-NH-;
(2-F-4-Cl-фенил)-NH-; (2-F-5-Cl-фенил)-NH-;
(2-F-6-Cl-фенил)-NH-; (2-F-3-CH_3-фенил)-NH-;
(2-F-4-CH_3-фенил)-NH-; (2-F-5-CH_3-фенил)-NH-;
(2-F-6-CH_3-фенил)-NH-; (2-F-3-CF_3-фенил)-NH-;
(2-F-4-CF_3-фенил)-NH-; (2-F-5-CF_3-фенил)-NH-;
(2-F-6-CF_3-фенил)-NH-; (2-F-3-OMe-фенил)-NH-;
(2-F-OMe-фенил)-NH-; (2-F-5-OMe-фенил)-NH-;
(2-F-6-OMe-фенил)-NH-; (2-C1-3-F-фенил)-NH-;
(2-Cl-4-F-фенил)-NH-; (2-Cl-5-F-фенил)-NH-;
(2-Cl-6-CH_3-фенил)-NH-; (2-Cl-3-CH_3-фенил)-NH-;
(2-Cl-4-CH_3-фенил)-NH-; {2-Cl-5-CH_3-фенил)-NH-;
(2-Cl-6-F-фенил)-NH-; (2-Cl-3-CF_3-фенил)-NH-;
(2-Cl-4-CF_3-фенил)-NH-; (2-Cl-5-CF_3-фенил)-NH-;

RU 2003121304 A
RU 2003121304 A

(2-Cl-6-CF_3-фенил)-NH-; {2-Cl-3-OMe-фенил)-NH-;
(2-Cl-4-OMe-фенил)-NH-; (2-Cl-5-OMe-фенил)-NH-;
(2-Cl-6-OMe-фенил)-NH-; (2-CH_3-3-F-фенил)-NH-;
(2-CH_3-4-F-фенил)-NH-; (2-CH_3-5-F-фенил)-NH-;
(2-CH_3-6-F-фенил)-NH-; (2-CH_3-3-Cl-фенил)-NH-;
(2-CH_3-4-Cl-фенил)-NH-; (2-CH_3-5-Cl-фенил)-NH-;
(2-CH_3-6-Cl-фенил)-NH-; (2-CH_3-3-CF_3-фенил)-NH-;
(2-CH_3-4-CF_3-фенил)-NH-; (2-CH_3-5-CF_3-фенил)-NH-;
(2-CH_3-6-CF_3-фенил)-NH-; (2-CH_3-3-OMe-фенил)-NH-;
(2-CH_3-4-OMe-фенил)-NH-; (2-CH_3-5-OMe-фенил)-NH-,
(2-CH_3-6-OMe-фенил)-NH-; (2-CF_3-3-F-фенил)-NH-;
(2-CF_3-4-F-фенил)-HH-; (2-CF_3-5-F-фенил)-NH-;
(2-CF_3-6-F-фенил)-NH-; (2-CF_3-3-Cl-фенил)-NH-;
(2-CF_3-4-Cl-фенил)-NH-; (2-CF_3-5-C1-фенил)-NH-;
(2-CF_3-6-Cl-фенил)-NH-; (2-CF_3-3-CH_3-фенил)-NH-;
(2-CF_3-4-CH_3-фенил)-NH-; (2-CH_3-5-CH_3-фенил)-NH-;
(2-CF_3-6-CH_3-фенил)-NH-; (2-CF_3-3-OMe-фенил)-NH-;
(2-CF_3-4-OMe-фенил)-NH-; (2-CF_3-5-OMe-фенил)-NH-;
(2-CF_3-6-OMe-фенил)-NH-; (2-OMe-3-F-фенил)-NH-;
(2-OMe-4-F-фенил)-NH-; (2-OMe-5-F-фенил)-NH-;
(2-OMe-6-F-фенил)-NH-; (2-OMe-3-Cl-фенил)-NH-;
(2-OMe-4-Cl-фенил)-NH-; (2-OMe-5-Cl-фенил)-NH-;
(2-OMe-6-Cl-фенил)-NH-; (2-OMe-4-CN-фенил)-NH-;
(2-OMe-4-CHO-фенил)-NH-; (2-OMe-3-CH_3-фенил)-NH-;
(2-OMe-4-CH_3-фенил)-NH-; (2-OMe-5-CH_3-фенил)-NH-;
(2-OMe-6-CH_3-фенил)-NH-; (2-OMe-3-CF_3-фенил)-NH-;
(2-OMe-4-CF_3-фенил)-NH-; (2-OMe-5-CF_3-фенил)-NH-;
(2-OMe-6-CF_3-фенил)-NH-; (2-ацетил-4-Cl-фенил)-NH-;
(2-ацетил-4-Me-фенил)-NH-; (2-ацетил-4-MeO-фенил)-NH-;
(2-CH_3CH(OH)-4-Cl-фенил)-NH-;
(2-CH_3CH(OH)-4-Me-фенил)-NH-;
(2-CH_3CH(OH)-4-MeO-фенил)-NH-;
(3-CF_3-4-Cl-фенил)-NH-; (3-F-4-CHO-фенил)-NH-;
(3-CH_3-4-CN-фенил)-NH-; (3-CH_3-4-MeO-фенил)-NH-;
(3-CH_3-4-Cl-фенил)-NH-; (3-CH_3-4-F-фенил)-NH-;
(3-CH_3-4-CO_2Me-фенил)NH-; (3-CF_3-4-C(O)CH_3-фенил)-NH-;
(3-CHO-4-OMe-фенил)-NH-; (4-F-3-CF_3-фенил)-NH-;
(2,3,5-триCl-фенил)-NH-; (2,4,5-триF-фенил)-NH-;
(2,6-диCl-3-Me-фенил)-NH-; (3,5-диMe-4-MeO-фенил)-NH-;
(2-F-3-C1-6-CF_3-фенил)-NH-;
бензил-NH-; (3-хинолинил)CH_2NH-; (2-F-фенил)CH_2NH-;
(2-Cl-фенил)CH_2NH-; (2-CF_3-фенил)CH_2NH-;
(2-CH_3-фенил)CH_2NH-; (2-OMe-фенил)CH_2NH-;
(2-CN-фенил)CH_2NH-; (2-OCF_3-фенил)CH_2NH-;
(2-SMe-фенил)CH_2NH-; (3-F-фенил)CH_2NH-;
(3-Cl-фенил)CH_2NH-; (3-CF_3-фенил)CH_2NH-;
(3-CH_3-фенил)CH_2NH-; (3-OMe-фенил)CH_2NH-;
(3-CN-фенил)CH_2NH-; (3-OCF_3-фенил)CH_2NH-;
(3-SMe-фенил)CH_2NH-; (4-F-фенил)CH_2NH-;
(4-Cl-фенил)CH_2NH-; (4-CF_3-фенил)CH_2NH-;
(4-CH_3-фенил)CH_2NH-; (4-OMe-фенил)CH_2NH-;
(4-CN-фенил)CH_2NH-; (4-OCF_3-фенил)CH_2NH-;
(4-SMe-фенил)CH_2NH-; (2,3-диCl-фенил)CH_2NH-;
(2,4-диCl-фенил)CH_2NH-; (2,5-диCl-фенил)CH_2NH-;

RU 2003121304 A

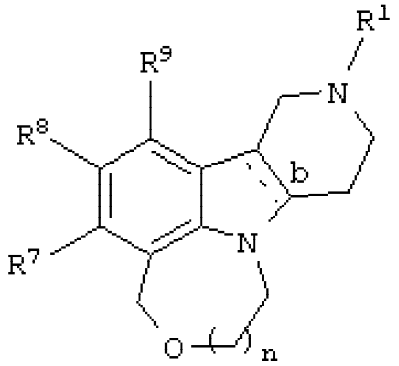
RU 2003121304 A

(2,6-диCl-фенил)CH_2NH-; (3,4-диCl-фенил)CH_2NH-;
(3,5-диCl-фенил)CH_2NH-; (2,3-диF-фенил)CH_2NH-;
(2,4-диF-фенил)CH_2NH-; (2,5-диF-фенил)CH_2NH-;
(2,6-диF-фенил)CH_2NH-; (3,4-диF-фенил)CH_2NH-;
(3,5-диF-фенил)CH_2NH-; (2,3-диCHз-фенил)CH_2NH-;
(2,4-диCH_3-фенил)CH_2NH-; (2,5-диCH_3-фенил)CH_2NH-;
(2,6-диCH_3-фенил)CH_2NH-; (3,4-диCH_3-фенил)CH_2NH-;
(3,5-диCHB-фенил)CH_2NH-; (2,3-диCF_3-фенил)CH_2NH-;
(2,4-диCF_3-фенил)CH_2NH-; (2,5-диCF_3-фенил)CH_2NH-;
(2,6-диCF_3-фенил)CH_2NH-; (3,4-диCF_3-фенил)CH_2NH-;
(3,5-диCF_3-фенил)CH_2NH-; (2,3-ДиOMe-фенил)CH_2NH-;
(2,4-диOMe-фенил)CH_2NH-;(2,5-диOMe-фенил)CH_2NH-;
(2,6-диOMe-фенил)CH_2NH-; (3,4-ДиOMe-фенил)CH_2NH-;
(3,5-диOMe-фенил)CH_2NH-; (2-F-3-C1-фенил)CH_2NH-;
(2-F-4-C1-фенил)CH_2NH-; (2-F-5-C1-фенил)CH_2NH-;
(2-F-6-Cl-фенил)CH_2NH-; (2-F-3-CH_3-фенил)CH_2NH-;
(2-F-4-CH_3-фенил)CH_2NH-; (2-F-5-CH_3-фенил)CH_2NH-;
(2-F-6-CH_3-фенил)CH_2NH-; (2-F-3-CF_3-фенил)CH_2NH-;
(2-F-4-CF_3-фенил)CH_2NH-; (2-F-5-CF_3-фенил)CH_2NH-;
(2-F-6-CF_3-фенил)CH_2NH-; (2-F-3-OMe-фенил)CH_2NH-;
(2-F-4-OMe-фенил)CH_2NH-; (2-F-5-OMe-фенил)CH_2NH-;
(2-F-6-OMe-фенил)CH_2NH-; (2-Cl-3-F-фенил)CH_2NH-;
(2-C1-4-F-фенил)CH_2NH-; (2-C1-5-F-фенил)CH_2NH-;
(2-Cl-6-F-фенил)CH_2NH-; (2-C1-3-CHз-фенил)CH_2NH-;
(2-Cl-4-CH_3-фенил)CH_2NH-(2-C1-5-CHз-фенил)CH_2NH-;
(2-Cl-6-CH_3-фенил)CH_2NH-(2-C1-3-CF_3-фенил)CH_2NH-;
(2-Cl-4-CF_3-фенил)CH_2NH-(2-Cl-5-CF_3-фенил)CH_2NH-;
(2-C1-6-CF_3-фенил)CH_2NH-(2-Cl-3-OMe-фенил)CH_2NH-;
(2-Cl-4-OMe-фенил)CH_2NH-(2-C1-5-OMe-фенил)CH_2NH-;
(2-Cl-6-OMe-фенил)CH_2NH-(2-CH_3-3-F-фенил)CH_2NH-;
(2-CH_3-4-F-фенил)CH_2NH-; (2-CH_3-5-F-фенил)CH_2NH-;
(2-CH_3-6-F-фенил)CH_2NH-; (2-CH_3-3-Cl-фенил)CH_2NH-;
(2-CH_3-4-Cl-фенил)CH_2NH-; (2-CH_3-5-Cl-фенил)CH_2NH-;
(2-CH_3-6-Cl-фенил)CH_2NH-; (2-CH_3-3-CF_3-фенил)CH_2NH-;
(2-CH_3-4-CF_3-фенил)CH_2NH-; (2-CH_3-5-CF_3-фенил)CH_2NH-;
(2-CH_3-6-CF_3-фенил)CH_2NH-; (2-CH_3-3-OMe-фенил)CH_2NH-;
(2-CH_3-4-OMe-фенил)CH_2NH-; (2-CH_3-5-OMe-фенил)CH_2NH-;
(2-CH_3-6-OMe-фенил)CH_2NH-; (2-CF_3-3-F-фенил)CH_2NH-;
(2-CF_3-4-F-фенил)CH_2NH-; (2-CF_3-5-F-фенил)CH_2NH-;
(2-CF_3-6-F-фенил)CH_2NH-; (2-CF_3-3-Cl-фенил)CH_2NH-;
(2-CF_3-4-Cl-фенил)CH_2NH-; (2-CF_3-5-Cl-фенил)CH_2NH-;
(2-CF_3-6-Cl-фенил)CH_2NH-; (2-CF_3-5-CH_3-фенил)CH_2NH-;
(2-CF_3-4-CH_3-фенил)CH_2NH-; (2-CH_3-5-CF_3-фенил)CH_2NH-;
(2-CF_3-6-CH_3-фенил)CH_2NH-; (2-CF_3-3-OMe-фенил)CH_2NH-;
(2-CF_3-4-OMe-фенил)CH_2NH-; (2-CF_3-5-OMe-фенил)CH_2NH-;
(2-CF_3-6-OMe-фенил)CH_2NH-; (2-OMe-3-F-фенил)CH_2NH-;
(2-OMe-4-F-фенил)CH_2MH-; (2-OMe-5-F-фенил)CH_2NH-;
(2-OMe-6-F-фенил)CH_2NH-; (2-OMe-3-Cl-фенил)CH_2NH-;
(2-OMe-4-Cl-фенил)CH_2NH-; (2-OMe-5-Cl-фенил)CH_2NH-;
(2-OMe-6-Cl-фенил)CH_2NH-;(2-OMe-4-CN-фенил)CH_2NH-;
(2-OMe-4-CHO-фенил)CH_2NH-; (2-OMe-3-CH_3-фенил)CH_2NH-;
(2-OMe-4-CH_3-фенил)CH_2NH-; (2-OMe-5-CH_3-фенил)CH_2NH-;
(2-OMe-6-CH_3-фенил)CH_2NH-; (2-OMe-3-CF_3-фенил)CH_2NH-;

RU 2003121304 A
RU 2003121304 A

(2-OMe-4-CF_3-фенил)CH_2NH-; (2-OMe-5-CF_3-фенил)CH_2NH-;
(2-OMe-6-CF_3-фенил)CH_2NH-; (2-ацетил-4-Cl-фенил)CH_2NH-;
(2-ацетил-4-Me-фенил)CH_2NH-; (2-ацетил-4-MeO-фенил)CH_2NH-;
(2-CH_3CH(OH)-4-Cl-фенил)CH_2NH-;
(2-CH_3CH(OH)-4-Me-фенил)CH_2NH-;
(2-CH_3CH(OH)-4-MeO-фенил)CH_2NH-;
(3-CF_3-4-Cl-фенил)CH_2NH-; (3-F-4-CHO-фенил)CH_2NH-;
(3-CH_3-4-CN-фенил)CH_2NH-; (3-CH_3-4-MeO-фенил)CH_2NH-;
(3-CH_3-4-Cl-фенил)CH_2NH-; (3-CH_3-4-F-фенил)CH_2NH-;
(4-F-3-CF_3-фенил)CH_2NH-; (3-CH_3-4-CO_2Me-фенил)CH_2NH-;
(3-CF_3-4-C(O)CH_3-фенил)CH_2NH-; (3-CHO-4-OMe-фенил)CH_2NH-;
(2,3,5-триCl-фенил)CH_2NH-;
(2,4,5-триF-фенил)CH_2NH-;
(2,6-диCl-3-Me-фенил)CH_2NH-;
(3,5-диMe-4-MeO-фенил)CH_2NH-; и
(2-F-3-Cl-6-CF_3-фенил)CH_2NH-;
n имеет значение 1 или 2.

12. Соединение по пункту 10 формулы (III)



(III)

в которой b представляет собой простую связь, в которой мостиковые водороды находятся в цис положении;

R^1 выбран из

водорода, метила, этила, н-пропила, н-бутила, втор-бутила, трет-бутила, н-пентила, н-гексила, 2-пропила, 2-бутила, 2-пентила, 2-гексила, 2-метилпропила, 2-метилбутила, 2-метилпентила, 2-этилбутила, 3-метилпентила, 3-метилбутила, 4-метилпентила, 2-фторэтила, 2,2-дифторэтила, 2,2,2-трифторэтила,2-пропенила, 2-метил-2-пропенила, транс-2-бутенила, 3-метил-2-бутенила, 3-бутенила, транс-2-пентенил, цис-2-пентенила, 4-пентенила, 4-метил-3-пентенила, 3,3-дихлор-2-пропенила, транс-3-фенил-2-пропенила, циклопропила, циклобутила, циклопентила, циклогексила, циклопропилметила, циклобутилметила, циклопентилметила, пиклогексилметила, -CH=CH_2, -CH_2-CH=CH_2, -CH=CH-CH_3, -C≡CH, -C≡C-CH_3 и -CH_2-C≡CH;

R^7 и R^9, в случае присутствия, независимо являются выбранными из водорода, фтора, метила, трифторметила и метокси; и

R^8 выбран из

водорода, фтора, хлора, брома, циано, метила, этила, пропила изопропила, бутила, трет-бутила, нитро, трифторметила, метокси, этокси, изопропокси, трифторметокси, фенила;

2-Cl-фенила; 2-F-фенила; 2-Br-фенила; 2-CN-фенила;

2-Me-фенила; 2-CF_3-фенила; 2-MeO-фенила; 2-CF_3O-фенила;

2-NO_2-фенила; 2-MeS-фенила; 2-CHO-фенила; 2-$HOCH_2$-фенила;

3-Cl-фенила; 3-F-фенила; 3-Br-фенила; 3-CN-фенила;

RU 2003121304 A

RU 2003121304 A

3-Me-фенила; 3-Et-фенила; 3-н-Pr-фенила; 3-изоPr-фенила;
3-н-Bu-фенила; 3-CF_3-фенила; 3-MeO-фенила; 3-MeS-фенила;
3-изопропоксифенила; 3-CF_3O-фенила; 3-NO_2-фенил-;
3-CHO-фенила; 3-$HOCH_2$-фенила; 3-$MeOCH_2$-фенила;
3-Me2NCH_2-фенил;
4-Cl-фенила; 4-F-фенила; 4-Br-фенила; 4-CN-фенила;
4-Me-фенила; 4-Et-фенила; 4-н-Pr-фенила;
4-изо-Pr-фенила;
4-н-Bu-фенила; 4-CF_3-фенила; 4-MeO-фенила;
4-изопропоксифенила; 4-CF_3O-фенила; 4-MeS-фенила;
4-ацетилфенила; 3-ацетамидофенила; 4-пиридила; 2-фуранила; 2-тиофенила;
2-нафтила; 1-пирролидинила, 2,3-диCl-фенила; 2,3-диF-фенила; 2,3-диMe-фенила;
2,3-диCF_3-фенила; 2,3-диMeO-фенила; 2,3-диCF_3O-фенила;
2,4-диCl-фенила; 2,4-диF-фенила; 2,4-диMe-фенила;
2,4-диCF_3-фенила; 2,4-диMeO-фенила; 2,4-диCF_3O-фенила;
2,5-диCl-фенила; 2,5-диF-фенила; 2,5-диMe-фенила;
2,5-диCF_3-фенила; 2,5-диMeO-фенила; 2,5-диCF_3O-фенила;
2,6-диCl-фенила; 2,6-диF-фенила; 2,6-диMe-фенила;
2,6-диCF_3-фенила; 2,6-диMeO-фенила; 2,6-диCF_3O-фенила;
3,4-диCl-фенила; 3,4-диF-фенила; 3,4-диMe-фенила; 3,4-диCF_3-фенила;
3,4-диMeO-фенила; 3,4-диCF_3O-фенила;
2,4,6-триCl-фенила; 2,4,6-триF-фенила; 2,4,6-триMe-фенила; 2,4,6-триCF_3-фенила;
2,4,6-триMeO-фенила; 2,4,6-триCF_3O-фенила; 2,4,5 -триMe-фенила; 2,3,4-триF-фенила;
2-Me-4-MeO-5-F-фенила; 2,6-диCl-4-MeO-фенила; 2,4-диMeO-6-F-фенила;
2,6-диF-4-Cl-фенила; 2,3,4,6-тетраF-фенила; 2,3,4,5,6-пентаF-фенила;
2-Cl-4-F-фенила; 2-Cl-6-F-фенила; 2-Cl-3-Me-фенила; 2-Cl-4-MeO-фенила;
2-Cl-4-EtO-фенила; 2-Cl-4-изоPrO-фенила; 2-Cl-4-CF_3-фенила; 2-Cl-4-CF_3O-фенила;
2-Cl-4-$(CHF_2)O$-фенила; 2-F-3-Cl-фенила; 2-F-4-MeO-фенила; 2-F-5-Me-фенила;
2-Me-3-Cl-фенила; 2-Me-3-CN-фенила; 2-Me-4-Cl-фенила;
2-Me-4-F-фенила; 2-Me-4-CN-фенила; 2-Me-4-MeO-фенила;
2-Me-4-EtO-фенила; 2-Me-4-MeS-фенила; 2-Me-4-H_2NCO-фенила;
2-Me-4-MeOC(=O)-фенила; 2-Me-4-$CH_3C(=O)$-фенила; 2-Me-5-F-фенила;
2-Et-4-MeO-фенила; 2-MeO-5-F-фенила; 2-MeO-4-изопропил-фенила;
2-CF_3-4-Cl-фенила; 2-CF_3-4-F-фенила; 2-CF_3-4-MeO-фенила;
2-CF_3-4-EtO-фенила; 2-CF_3-4-iPrO-фенила; 2-CF_3-4-CH-фенила;
2-CF_3-6-F-фенила; 2-CHO-4-MeO-фенила; 2-MeOC(=O)-3-MeO-фенила;
2-$CH_3CH(OH)$-4-MeO-фенила; 2-$CH_3CH(OH)$-4-F-фенила; 2-$CH_3CH(OH)$-4-Cl-фенила;
2-$CH_3CH(OH)$-4-Me-фенила; 2-$CH_3CH(OMe)$-4-MeO-фенила; 2-$CH_3C(=O)$-4-MeO-фенила;
2-$CH_3C(=O)$-4-F-фенила; 2-$CH_3C(=O)$-4-Cl-фенила; 2-$CH_3C(=O)$-4-Me-фенила;
2-H $_2C(OH)$-4-MeO-фенила; 2-$H_2C(OMe)$-4-MeO-фенила;
2-$H_3CCH_2CH(OH)$-4-MeO-фенила;
2-$H_3CCH_2C(=O)$-4-MeO-фенила;
2-$CH_3CO_2CH_2CH_2$-4-MeO-фенила;
(Z)-2-$HOCH_2CH$=CH-4-MeO-фенила;
(E)-2-$HOCH_2CH$=CH-4-MeO-фенила;
(Z)-2-CH_3CO_2CH=CH-4-MeO-фенила;
(E)-2-CH_3CO_2CH=CH-4-MeO-фенила;
2-$CH_3OCH_2CH_3$-4-MeO-фенила;
3-CN-4-F-фенила; 3-H_2NCO-4-F-фенила;
(2-Cl-фенил)-CH=CH-; (3-Cl-фенил)-CH=CH-;
(2,6-диF-фенил)-CH=CH-; фенил-CH=CH-;
(2-Me-4-MeO-фенил)-CH=CH-;
циклогексила; циклопентила; циклогексилметила; бензила;
2-F-бензила; 3-F-бензила; 4-F-бензила; 3-MeO-бензила;

RU 2003121304 A

RU 2003121304 A

3-OH-бензила; 2-MeO-бензила; 2-OH-бензила;
тетрагидрохинолин-1-ила; тетрагидроиндолин-1-ила;
тетрагидроизоиндолин-1-ила;
фенила-S-; фенила-NH-.; пирида-3-ил-NH-;
(4-Me-пирид-3-ил)-NH-; (1-нафтил)-NH-;
(2-нафтил)-NH-; (2-Me-нафт-1-ил)-NH-;
(3-хинолинил)-NH-;
(2-[1,1'-бифенил])-NH-; (3-[1,1'-бифенил])-NH-;
(4-[1,1'-бифенил])-NH-; (2-F-фенил)-NH-;
(2-C1-фенил)-NH-;(2-CF_3-фенил)-NH-;
(2-CH_3-фенил)-NH-; (2-OMe-фенил)NH-;
(2-CN-фенил)-NH-; (2-OCF_3-фенил)-NH-;
(2-SMe-фенил)-NH-; (3-F-фенил)-NH-;
(3-C1-фенил)-NH-; (3-CF_3-фенил)-NH-;
(3-CH_3-фенил)-NH-; (3-OMe-фенил)-NH-,
(3-CN-фенил)-NH-; (3-OCF_3-фенил)-NH-;
(3-SMe-фенил)-NH-; (4-F-фенил)-NH-;
(4-Cl-фенил)-NH-; (4-CF_3-фенил)-NH-;
(4-CH_3-фенил)-NH-; (4-OMe-фенил)-NH-;
(4-CN-фенил)-NH-; (4-OCF_3-фенил)-NH-;
(4-SMe-фенил)-NH-; (2,3-диCl-фенил)-NH-;
(2,4-диCl-фенил)-NH-; (2,5-диCl-фенил)-NH-;
(2,6-диCl-фенил)-NH-; (3,4-диCl-фенил)-NH-;
(3,5-диCl-фенил)-NH-; (2,3-диF-фенил)-NH-;
(2,4-диF-фенил)-NH-; (2,5-диF-фенил)-NH-;
(2,6-диF-фенил)-NH-; (3,4-диF-фенил)-NH-;
(3,5-диF-фенил)-NH-; (2,3-диCH_3-фенил)-NH-;
(2,4-диCH_3-фенил)-NH-; (2,5-диCH_3-фенил)-NH-;
(2,6-диCH_3-фенил)-NH-; (3,4-диCH_3-фенил)-NH-;
(3,5-диCH_3-фенил)-NH-; (2,3-диCF_3-фенил)-NH-;
(2,4-диCF_3-фенил)-NH-; (2,5-диCF_3-фенил)-NH-;
(2,6-диCF_3-фенил)-NH-; (3,4-диCFз-фенил)-NH-;
(3,5-диCF_3-фенил)-NH-; (2,3-диOMe-фенил)-NH-;
(2,4-диOMe-фенил)-NH-; (2,5-диOMe-фенил)-NH-;
(2,6-диOMe-фенил)-NH-; (3,4-диOMe-фенил)-NH-;
(3,5-диOMe-фенил)-NH-; (2-F-3-Cl-фенил)-NH-;
(2-F-4-Cl-фенил)-NH-; (2-F-5-Cl-фенил)-NH-;
(2-F-6-Cl-фенил)-NH-; (2-F-3-CH_3-фенил)-NH-;
(2-F-4-CH_3-фенил)-NH-; (2-F-5-CH_3-фенил)-NH-;
(2-F-6-CH_3-фенил)-NH-; (2-F-3-CF_3-фенил)-NH-;
(2-F-4-CF_3-фенил)-NH-; (2-F-5-CF_3-фенил)-NH-;
(2-F-6-CF_3-фенил)-NH-; (2-F-3-OMe-фенил)-NH-;
(2-F-4-OMe-фенил)-NH-; (2-F-5-OMe-фенил)-NH-;
(2-F-6-OMe-фенил)-NH-; (2-C1-3-F-фенил)-NH-;
(2-Cl-4-F-фенил)-NH-; (2-C1-5-F-фенил)-NH-;
(2-C1-6-F-фенил)-NH-; (2-C1-3-CH_3-фенил)-NH-;
(2-C1-4-CH_3-фенил)-NH-; (2-Cl-5-CH_3-фенил)-NH-;
(2-C1-6-CH_3-фенил)-NH-; (2-Cl-3-CF_3-фенил)-NH-;
(2-C1-4-CF_3-фенил)-NH-; (2-C1-5-CF_3-фенил)-NH-;
(2-Cl-6-CF_3-фенил)-NH-; (2-Cl-3-OMe-фенил)-NH-;
(2-C1-4-OMe-фенил)-NH-; (2-Cl-5-OMe-фенил)-NH-;
(2-C1-6-OMe-фенил)-NH-; (2-CH_3-3-F-фенил)-NH-;
(2-CH_3-4-F-фенил)-NH-; (2-CH_3-5-F-фенил)-NH-;
(2-CH_3-6-F-фенил)-NH-; (2-CH_3-3-C1-фенил)-NH-;

RU 2003121304 A
RU 2003121304 A

(2-CH_3-4-Cl-фенил)-NH-; (2-CH_3-5-C1-фенил)-NH-;
(2-CH_3-6-Cl-фенил)-NH-; (2-CH_3-3-CF_3-фенил)-NH-;
(2-CH_3-4-CF_3-фенил)-NH-; (2-CH_3-5-CF_3-фенил)-NH-;
(2-CH_3-6-CF_3-фенил)-NH-; (2-CH_3-3-OMe-фенил)-NH-;
(2-CH_3-4-OMe-фенил)-NH-; (2-CH_3-5-OMe-фенил)-NH-;
(2-CH_3-6-OMe-фенил)-NH-; (2-CF_3-3-F-фенил)-NH-;
(2-CF_3-4-F-фенил)-NH-; (2-CF_3-5-F-фенил)-NH-;
(2-CF_3-6-F-фенил)-NH-; (2-CF_3-3-C1-фенил)-NH-;
(2-CF_3-4-C1-фенил)-NH-; (2-CF_3-5-C1-фенил)-NH-;
(2-CF_3-6-Cl-фенил)-NH-; (2-CF_3-3-CH_3-фенил)-NH-;
(2-CF_3-4-CH_3-фенил)-NH-; (2-CH_3-5-CF_3-фенил)-NH-;
(2-CF_3-6-CH_3-фенил)-NH-; (2-CF_3-3-OMe-фенил)-NH-;
(2-CF_3-4-OMe-фенил)-NH-; (2-CF_3-5-OMe-фенил)-NH;
(2-CF_3-6-OMe-фенил)-NH-; (2-OMe-3-F-фенил)-NH-;
(2-OMe-4-F-фенил)-NH-; (2-OMe-5-F-фенил)-NH-;
(2-OMe-6-F-фенил)-NH-; (2-OMe-3-C1-фенил)-NH-;
(2-OMe-4-Cl-фенил)-NH-; (2-OMe-5-C1-фенил)-NH-;
(2-OMe-6-Cl-фенил)-NH-; (2-OMe-4-CN-фенил)-NH-;
(2-OMe-4-CHO-фенил)-NH-; (2-OMe-3-CH_3-фенил)-NH-;
(2-OMe-4-CH_3-фенил)-NH-; (2-OMe-5-CH_3-фенил)-NH-;
(2-OMe-6-CH_3-фенил)-NH-; (2-OMe-3-CF_3-фенил)-NH-;
(2-OMe-4-CF_3-фенил)-NH-; (2-OMe-5-CF_3-фенил)-NH-;
(2-OMe-6-CF_3-фенил)-NH-; (2-ацетил-4-Cl-фенил)-NH-;
(2-ацетил-4-Me-фенил)-NH-; (2-ацетил-4-MeO-фенил)-NH-;
(2-CH_3CH(OH)-4-C1-фенил)-NH-;
(2-CH_3CH(OH)-4-Me-фенил)-NH-;
(2-CH_3CH(OH)-4-MeO-фенил)-NH-;
(3-CF_3-4-C1-фенил)-NH-; (3-F-4-CHO-фенил)-NH-;
(3-CH_3-4-CN-фенил)-NH-; (3-CH_3-4-MeO-фенил)-NH-;
(3-CH_3-4-Cl-фенил)-NH-; (3-CH_3-4-F-фенил)-NH-;
(3-CH_3-4-CO_2Me-фенил)NH-; (3-CF_3-4-C(O)CH_3-фенил)NH-;
(3-CHO-4-OMe-фенил)-NH-; (4-F-3-CF_3-фенил)-NH-;
(2,3,5-триCl-фенил)-NH-; (2,4,5-триF-фенил)-NH-;
(2,6-диCl-3-Me-фенил)-NH-; (3,5-диMe-4-MeO-фенил)-NH-;
(2-F-3-Cl-6-CF_3-фенил)-NH-;
бензила-NH-; (3-хинолинил)CH_2NH-; (2-F-фенил)CH_2NH-;
(2-Cl-фенил)CH_2NH-; (2-CF_3-фенил)CH_2NH-;
(2-CH_3-фенил)CH_2NH-; (2-OMe-фенил)CH_2NH-;
(2-CN-фенил)CH_2NH-; (2-OCF_3-фенил)CH_2NH-;
(2-SMe-фенил)CH_2NH-; (3-F-фенил)CH_2NH-;
(3-Cl-фенил)CH_2NH-; (3-CF_3-фенил)CH_2NH-;
(3-CH_3-фенил)CH_2NH-; (3-OMe-фенил)CH_2NH-;
(3-CN-фенил)CH_2NH-; (3-OCF_3-фенил)CH_2NH-;
(3-SMe-фенил)CH_2NH-; (4-F-фенил)CH_2NH-;
(4-Cl-фенил)CH_2NH-; (4-CF_3-фенил)CH_2NH-;
(4-CH_3-фенил)CH_2NH-; (4-OMe-фенил)CH_2NH-;
(4-CN-фенил)CH_2NH-; (4-OCF_3-фенил)CH_2NH-;
(4-SMe-фенил)CH_2NH-; (2,3-диCl-фенил)CH_2NH-;
(2,4-диCl-фенил)CH_2NH-; (2,5-диC1-фенил)CH_2NH-;
(2,6-диCl-фенил)CH_2NH-; (3,4-диCl-фенил)CH_2NH-;
(3,5-диCl-фенил)CH_2NH-; (2,3-диF-фенил)CH_2NH-;
(2,4-диF-фенил)CH_2NH-; (2,5-диF-фенил)CH_2NH-;
(2,6-диF-фенил)CH_2NH-; (3,4-диF-фенил)CH_2NH-;
(3,5-диF-фенил)CH_2NH-; (2,3-диCH_3-фенил)CH_2NH-;

RU 2003121304 A

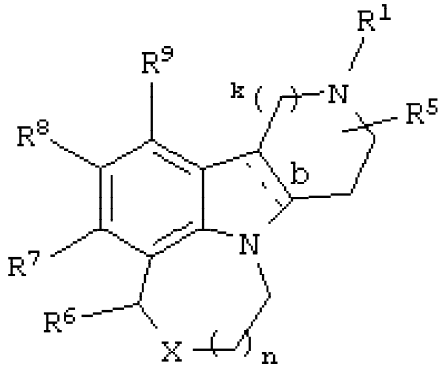
RU 2003121304 A

(2,4-диCH_3-фенил)CH_2NH-;(2,5-диCH_3-фенил)CH_2NH-;
(2,6-диCH_3-фенил)CH_2NH-; (3,4-диCH_3-фенил)CH_2NH-;
(3,5-диCH_3-фенил}CH_2NH-; (2,3-диCF_3-фенил)CH_2NH-;
(2,4-диCF_3-фенил)CH_2NH-; (2,5-диCF_3-фенил)CH_2NH-;
(2,6-диCF_3-фенил)CH_2NH-; (3,4-диCF_3-фенил)CH_2NH-;
(3,5-диCF_3-фенил)CH_2NH-; (2,3-диOMe-фенил)CH_2NH-;
(2,4-диOMe-фенил)CH_2NH-; (2,5-диOMe-фенил)CH_2NH-;
(2,6-диOMe-фенил)CH_2NH-; (3,4-диOMe-фенил)CH_2NH-;
(3,5-диOMe-фенил)CH_2NH-; (2-F-3-Cl-фенил)CH_2NH-;
(2-F-4-Cl-фенил)CH_2NH-; (2-F-5-Cl-фенил)CH_2NH-;
(2-F-6-Cl-фенил)CH_2NH-; (2-F-3-CH_3-фенил)CH_2NH-;
(2-F-4-CH_3-фенил)CH_2NH-; (2-F-5-CH_3-фенил)CH_2NH-;
(2-F-6-CH_3-фенил)CH_2NH-; (2-F-3-CF_3-фенил)CH_2NH-;
(2-F-4-CF_3-фенил)CH_2NH-; (2-F-5-CF_3-фенил)CH_2NH-;
(2-F-6-CF_3-фенил)CH_2NH-; (2-F-3-OMe-фенил)CH_2NH-;
(2-F-4-OMe-фенил)CH_2NH-; (2-F-5-OMe-фенил)CH_2NH-;
(2-F-6-OMe-фенил)CH_2NH-; (2-Cl-3-F-фенил) CH_2NH-;
(2-Cl-4-F-фенил)CH_2NH-; (2-Cl-5-F-фенил)CH_2NH-;
(2-Cl-6-F-фенил)CH_2NH-; (2-Cl-3-CH_3-фенил)CH_2NH-;
(2-Cl-4-CH_3-фенил)CH_2NH-; (2-Cl-5-CH_3-фенил)CH_2NH-;
(2-Cl-6-CH_3-фенил)CH_2NH-; (2-Cl-3-CF_3-фенил)CH_2NH-;
(2-Cl-4-CF_3-фенил)CH_2NH-; (2-Cl-5-CF_3-фенил)CH_2NH-;
(2-Cl-6-CF_3-фенил)CH_2NH-; (2-Cl-3-OMe-фенил)CH_2NH-;
(2-Cl-4-OMe-фенил)CH_2NH-; (2-Cl-5-OMe-фенил)CH_2NH-;
(2-Cl-6-OMe-фенил)CH_2NH-; (2-CH_3-3-F-фенил)CH_2NH-;
(2-CH_3-4-F-фенил)CH_2NH-; (2-CH_3-5-F-фенил)CH_2NH-;
(2-CH_3-6-F-фенил)CH_2NH-; (2-CH_3-3-Cl-фенил)CH_2NH-;
(2-CH_3-4-Cl-фенил)CH_2NH-; (2-CH_3-5-Cl-фенил)CH_2NH-;
(2-CH_3-6-Cl-фенил)CH_2NH-; (2-CH_3-3-CF_3-фенил)CH_2NH-;
(2-CH_3-4-CF_3-фенил)CH_2NH-; (2-CH_3-5-CF_3-фенил)CH_2NH-;
(2-CH_3-6-CF_3-фенил)CH_2NH-; (2-CH_3-3-OMe-фенил)CH_2NH-;
(2-CH_3-4-OMe-фенил)CH_2NH-; (2-CH_3-5-OMe-фенил)CH_2NH-;
(2-CH_3-6-OMe-фенил)CH_2NH-; (2-CF_3-3-F-фенил)CH_2NH-;
(2-CF_3-4-F-фенил)CH_2NH-; (2-CF_3-5-F-фенил)CH_2NH-;
(2-CF_3-6-F-фенил)CH_2NH-; (2-CF_3-3-Cl-фенил)CH_2NH-;
(2-CF_3-4-Cl-фенил}CH_2NH-; (2-CF_3-5-Cl-фенил)CH_2NH-;
(2-CF_3-6-Cl-фенил}CH_2NH-; (2-CF_3-3-CH_3-фенил)CH_2NH-;
(2-CF_3-4-CH_3-фенил)CH_2NH-; (2-CH_3-5-CF_3-фенил)CH_2NH-;
(2-CF_3-6-CH_3-фенил)CH_2NH-; (2-CF_3-3-OMe-фенил)CH_2NH-;
(2-CF_3-4-OMe-фенил)CH_2NH-; (2-CF_3-5-OMe-фенил)CH_2NH-;
(2-CF_3-6-OMe-фенил)CH_2NH-; (2-OMe-3-F-фенил)CH_2NH-;
(2-OMe-4-F-фенил)CH_2NH-; (2-OMe-5-F-фенил)CH_2NH-;
(2-OMe-6-F-фенил)CH_2NH-; (2-OMe-3-Cl-фенил)CH_2NH-;
(2-OMe-4-Cl-фенил)CH_2NH-; (2-OMe-5-Cl-фенил)CH_2NH-;
(2-OMe-6-Cl-фенил)CH_2NH-; (2-OMe-4-CN-фенил)CH_2NH-;
(2-OMe-4-CHO-фенил)CH_2NH-; (2-OMe-3-CH_3-фенил)CH_2NH-;
(2-OMe-4-CH_3-фенил)CH_2NH-; (2-OMe-5-CH_3-фенил)CH_2NH-;
(2-OMe-6-CH_3-фенил)CH_2NH-;(2-OMe-3-CF_3-фенил)CH_2NH-;
(2-OMe-4-CF_3-фенил)CH_2NH-; (2-OMe-5-CF_3-фенил)CH_2NH-;
(2-OMe-6-CF_3-фенил)CH_2NH-; (2-ацетил-4-Cl-фенил)CH_2NH-;
(2-ацетил-4-Me-фенил)CH_2NH-; (2-ацетил-4-MeO-фенил)CH_2NH-;
(2-CH_3CH(OH)-4-Cl-фенил)CH_2NH-; (2-CH_3CH(OH)-4-Me-фенил)CH_2NH-;
(2-CH_3CH(OH)-4-MeO-фенил)CH_2NH-;

RU 2003121304 A
RU 2003121304 A

(3-CF_3-4-Cl-фенил)CH_2NH-; (3-F-4-CHO-фенил)CH_2NH-;
(3-CH_3-4-CN-фенил)CH_2NH-; (3-CH_3-4-MeO-фенил)CH_2NH-;
(3-CH_3-4-Cl-фенил)CH_2NH-; (3-CH_3-4-F-фенил)CH_2NH-;
(4-F-3-CF_3-фенил)CH_2NH-; (3-CH_3-4-CO_2Me-фенил)CH_2NH-;
(3-CF_3-4-C(O)CH_3-фенил)CH_2NH-; (3-CHO-4-OMe-фенил)CH_2NH-;
(2,3,5-триCl-фенил)CH_2NH-;
(2,4,5-триF-фенил)CH_2NH-;
(2,6-диCl-3-Me-фенил)CH_2NH-;
(3,5-диMe-4-MeO-фенил)CH_2NH-; и
(2-F-3-Cl-6-CF_3-фенил)CH_2NH-;
n имеет значение 1 или 2.

13. Соединение по пункту 1 формулы (I-a)



(I-a)

в которой X представляет собой -O-, -S-, -S(=O)-, -$S(=O)_2$- или -NR^{10}-;

R^1 выбран из

C_{1-6} алкила, замещенного Z,

C_{2-6} алкенила, замещенного Z,

C_{2-6} алкинила, замещенного Z, C_{3-6} циклоалкила, замещенного Z,

арила, замещенного Z,

5-6-членной гетероциклической кольцевой системы, содержащей, по крайней мере, один гетероатом, выбранный из группы, состоящей из N, O и S, указанная гетероциклическая кольцевая система замещена Z;

C_{1-6} алкила, замещенного 0-2 R^2,

C_{2-6} алкенила, замещенного 0-2 R^2,

C_{2-6} алкинила, замещенного 0-2 R^2,

арила, замещенного 0-2 R^2 и

5-6-членной гетероциклической кольцевой системы, содержащей по крайней мере один гетероатом, выбранный из группы, состоящей из N, O и S, указанная гетероциклическая кольцевая система замещена 0-2 R^2;

Z выбран из H,

-$CH(OH)R^2$,

-C(этилендиокси)R^2,

-OR^2,

-SR^2,

-NR^2R^3,

-$C(O)R^2$,

-$C(O)NR^2R^3$,

-$NR^3C(O)R^2$,

-$C(O)OR^2$,

-$OC(O)R^2$,

RU 2003121304 A

RU 2003121304 A

-CH(=NR^4)NR^2R^3,
-NHC(=NR^4)NR^2R^3,
-S(O)R^2,
-$S(O)_2R^2$,
-$S(O)_2NR^2R^3$ и -$NR^3S(O)_2R^2$;
R^2, в случае присутствия, независимо является выбранным из
C_{1-4} алкила,
C_{2-4} алкенила,
C_{2-4} алкинила,
C_{3-6} циклоалкила,
арила, замещенного 0-5 R^{42};
C_{3-10} карбоциклического остатка, замещенного 0-3 R^{41} и
5-10-членной гетероциклической кольцевой системы, содержащей 1-4 гетероатомов, выбранных из группы, состоящей из N, O и S, замещенной 0-3 R^{41}
R^3, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, C_{1-4} алкила, C_{3-10} алкенила, C_{2-4} алкинила и C_{1-4} алкокси;
альтернативно, R^2 и R^3 объединяются, чтобы образовать 5- или 6-членное кольцо, необязательно замещенное -O- или -N(R^4)-;
R^4, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, метила, этила, пропила и бутила;
R^5 представляет собой H, метил, этил, пропил или бутил;
R^6 представляет собой H, метил, этил, пропил или бутил;
R^7, R^8 и R^9, в случае присутствия, независимо являются выбранными из H, галогена, -CF_3, -OCF_3, -OH, -CN, -NO_2, -$NR^{46}R^{47}$,
C_{1-8} алкила, C_{2-8} алкенила, C_{2-8} алкинила, C_{1-4} галогеналкила,
C_{1-8} алкокси, (C_{1-4} галогеналкил)окси,
C_{1-4} алкила, замещенного 0-2 R^{11},
C_{3-10} карбоциклического остатка, замещенного 0-3 R^{33},
арила, замещенного 0-5 R^{33},
5-10-членной гетероциклической кольцевой системы, содержащей 1-4 гетероатомов, выбранных из группы, состоящей из N, O и S, замещенной 0-3 R^{31};
OR^{12}, SR^{12}, $NR^{12}R^{13}$, C(O)H, C(O)R^{12}, C(O)$NR^{12}R^{13}$, $NR^{14}C(O)R^{12}$, C(O)OR^{12}, OC(O)R^{12}, OC(O)OR^{12}, CH(=NR^{14})$NR^{12}R^{13}$, NHC(=NR^{14})$NR^{12}R^{13}$, S(O)R^{12}, $S(O)_2R^{12}$, S(O)$NR^{12}R^{13}$, $S(O)_2NR^{12}R^{13}$, $NR^{14}S(O)R^{12}$, $NR^{14}S(O)NR^{12}C(O)R^{15}$, $NR^{12}C(O)ORI^5$, $NR^{12}S(O)_2R^{15}$ и HR ^{12}C(O)NHR^{15};
R^{10} выбран из H, C_{1-4} алкила, C_{3-10} алкенила, C_{3-10} алкинила и C_{1-4} алкокси;
R^{11} выбран из
H, галогена, -CF_3, -CN, -NO_2,
C_{1-8} алкила, C_{2-8} алкенила, C_{2-8} алкинила, C_{1-4} галогеналкила,
C_{1-8} алкокси, C_{3-10} циклоалкила,
C_{3-10} карбоциклического остатка, замещенного 0-3 R^{33},
арила, замещенного 0-5 R^{33},
5-10-членной гетероциклической кольцевой системы, содержащей 1-4 гетероатомов, выбранных из группы, состоящей из N, O и S, замещенной 0-3 R^{31};
OR^{12}, SR^{12}, $NR^{12}R^{13}$, C(O)H, C(O)R^{12}, C(O)$NR^{12}R^{13}$, $NR^{14}C(O)R^{12}$, C(O)OR^{12}, OC(O)R^{12}, OC(O)OR^{12}, CH(=NR^{14})$NR^{12}R^{13}$, NHC(=NR^{14})$NR^{12}R^{13}$, S(O)R^{12}, $S(O)_2R^{12}$, S(O)$NR^{12}R^3$, $S(O)_2NR^{12}R^{13}$, $NR^{14}S(O)R^{12}$ и $NR^{14}S(O)_2R^{12}$;
R^{12}, в случае присутствия, независимо является выбранным из
C_{1-4} алкила,

RU 2003121304 A
RU 2003121304 A

C_{2-4} алкенила,

C_{2-4} алкинила,

C_{3-6} циклоалкила,

фенила, замещенного 0-5 R^{33};

C_{3-10} карбоциклического остатка, замещенного 0-3 R^{33} и

5-10-членной гетероциклической кольцевой системы, содержащей 1-4 гетероатомов, выбранных из группы, состоящей из N, O и S, замещенной 0-3 R^{31};

R^{13}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, C_{1-4} алкила, C_{2-4} алкенила и C_{2-4} алкинила;

альтернативно, R^{12} и R^{13} объединяются, чтобы образовать 5- или 6-членное кольцо, необязательно замещенное -O- или -N(R^{14})-;

R^{14}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H и C_{1-4} алкила;

R^{31}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, OH, галогена, CF_3, SC^R^{45}, $NR^{46}R^{47}$, метила, этила и пропила;

R^{33}, в случае присутствия, независимо является выбранным из

H, OH, галогена, CN, NO_2, CF_3, SO_2R^{45}, $NR^{46}R^{47}$, C_{1-3} алкила, C_{2-6} алкенила, C_{2-3} алкинила, C_{3-5} циклоалкила, C_{1-3} галогеналкила, C_{1-3} галогеналкила-окси-, C_{1-3} алкилокси-, C_{1-3} алкилтио-, C_{1-3} алкила-C(=O)- и C_{1-3} алкила-C(=O)NH-;

R^{41}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, CF_3, галогена, OH, CO_2H, SO_2R^{45}, $NR^{46}R^{47}$, NO_2, CN, =O, C_{2-8} алкенила, C_{2-8} алкинила, C_{1-4} алкокси, C_{1-4} галогеналкила,

C_{1-4} алкила, замещенного 0-1 R^{43},

арила, замещенного 0-3 R^{42} и

5-10-членной гетероциклической кольцевой системы, содержащей 1-4 гетероатомов, выбранных из группы, состоящей из N, O и S, замещенной 0-3 R^{44};

R^{42}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, CF_3, галогена, OH, CO_2H, SO_2R^{45}, SR^{45}, $NR^{46}R^{47}$, OR^{48}, NO_2, CN, $CH(=NH)NH_2$, $NHC(=NH)NH_2$, C_{2-6} алкенила, C_{2-6} алкинила, C_{1-4} алкокси, C_{1-4} галогеналкила,

C_{3-6} циклоалкила,

C_{1-4} алкила, замещенного 0-1 R^{43},

арила, замещенного 0-3 R^{44} и

5-10-членной гетероциклической кольцевой системы, содержащей 1-4 гетероатомов, выбранных из группы, состоящей из N, O и S, замещенной 0-3 R^{44};

R^{43} представляет собой C_{3-6} циклоалкил или арил, замещенный 0-3 R^{44};

R^{44}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, галогена, -OH, $NR^{46}R^{47}$, COaH, SO_2R^{45}, $-CF_3$, $-OCF_3$, -CN, $-NO_2$, C_{1-4} алкила и C_{1-4} алкокси;

R^{45} представляет собой C_{1-4} алкил;

R^{46}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H и C_{1-4} алкила;

R^{47}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, C_{1-4} алкила, -C(=O)NH(C_{1-4} алкил), -SO_2(C_{1-4} алкил}, -SO_2(фенил), -C(=O)O(C_{1-4} алкил), -C(=O)(C_{1-4} алкил) и -C(=O)H;

R^{48}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, C_{1-4} алкила, -C(=O)NH(C_{1-4} алкил), -C(=O)O(C_{1-4} алкил), -C(=O)(C_{1-4} алкил) и -C(=O)H;

k имеет значение 1 или 2; и

n имеет значение 1 или 2.

14. Соединение по пункту 13, у которого:

X представляет собой -O-, -S- или -NH-;

R^1 выбран из

C_{2-5} алкила, замещенного Z,

C_{2-5} алкенила, замещенного Z,

RU 2003121304 A

RU 2003121304 A

C_{2-5} алкинила, замещенного Z, C_{3-6} циклоалкила, замещенного Z,

арила, замещенного Z,

5-6-членной гетероциклической кольцевой системы, содержащей, по крайней мере, один гетероатом, выбранный из группы, состоящей из N, O и S, указанная гетероциклическая кольцевая система замещена Z;

C_{1-5} алкила, замещенного 0-2 R^2,

C_{2-5} алкенила, замещенного 0-2 R^2 и

C_{2-5} алкинила, замещенного 0-2 R^2;

Z выбран из H,

$-CH(OH)R^2$,

-C(этилендиокси) R^2,

$-OR^2$,

$-SR^2$,

$-NR^2R^3$,

$-C(O)R^2$,

$-C(O)NR^2R^3$,

$-NR^3C(O)R^2$,

$-C(OKCOR^2$,

$-OC(O)R^2$,

$-CH(=NR^4)NR^2R^3$,

$-NHC(=NR^4)NR^2R^3$,

$-S(O)R^2$,

$-S(O)_2R^2$,

$-S(O)_2NR^2R^3$ и $-NR^3S(O)_2R^2$;

R^2, в случае присутствия, независимо является выбранным из

C_{1-4} алкила,

C_{2-4} алкенила,

C_{2-4} алкинила,

C_{3-6} циклоалкила,

арила, замещенного 0-5 R^{42};

C_{3-10} карбоциклического остатка, замещенного 0-3 R^{41} и

5-10-членной гетероциклической кольцевой системы, содержащей 1-4 гетероатомов, выбранных из группы, состоящей из N, O и S, замещенной 0-3 R^{41}

R^3, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, C_{1-4} алкила, C_{2-4} алкенила, C_{3-10} алкинила и C_{1-4} алкокси;

альтернативно, R^2 и R^3 объединяются, чтобы образовать 5- или 6-членное кольцо, необязательно замещенное -O- или $-N(R^4)-$;

R^4, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, метила, этила, пропила и бутила;

R^5 представляет собой H, метил или этил;

R^6 представляет собой H, метил, этил, пропил или бутил;

R^7, R^8 и R^9, в случае присутствия, независимо являются выбранными из H, галогена, $-CF_3$, $-OCF_3$, -OH, $-OCH_3$, -CN, $-NO_2$, $-NR^{46}R^{47}$,

C_{1-6} алкила, C_{2-6} алкенила, C_{2-6} алкинила, C_{1-4} галогеналкила, C_{1-6} алкокси, (C_{1-4} галогеналкил)окси,

C_{1-4} алкила, замещенного 0-2 R^{11},

C_{3-10} карбоциклического остатка, замещенного 0-3 R^{33},

арила, замещенного 0-5 R^{33},

5-10-членной гетероциклической кольцевой системы, содержащей 1-4 гетероатомов, выбранных из группы, состоящей из N, O и S, замещенной 0-3 R^{31};

RU 2003121304 A

RU 2003121304 A

OR^{12}, SR^{12}, $NR^{12}R^{13}$, C(O)H, $C(O)R^{12}$, $C(O)NR^{12}R^{13}$, $NR^{14}C(O)R^{12}$, $C(O)OR^{12}$, $OC(O)R^{12}$, $CH(=NR^{14})NR^{12}R^{13}$, $NHC(=NR^{14})NR^{12}R^{13}$, $S(O)R^{12}$, $S(O)_2R^{12}$, $S(O)_2NR^{12}R^{13}$, $NR^{14}S(O)_2R^{12}$, $NR^{14}S(O)R^{12}$, $NR^{14}S(O)_2R^{12}$, $NR^{12}C(O)R^{15}$, $NR^{12}C(O)OR^{15}$, $NR^{12}S(O)_2R^{15}$ и $NR^{12}C(O)NHR^{15}$;

R^{11} выбран из

H, галогена, $-CF_3$, $-OCF_3$, -OH, $-OCH_3$, -CN, $-NO_2$, $-NR^{46}R^{47}$,

C_{1-6} алкила, C_{2-6} алкенила, C_{2-6} алкинила, C_{1-4} галогеналкила,

C_{1-6} алкокси, (C_{1-4} галогеналкил)окси,

C_{3-10} карбоциклического остатка, замещенного 0-3 R^{33},

арила, замещенного 0-5 R^{33},

5-10-членной гетероциклической кольцевой системы, содержащей 1-4 гетероатомов, выбранных из группы, состоящей из N, O и S, замещенной 0-3 R^{31};

OR^{12}, SR^{12}, $NR^{12}R^{13}$, C(O)H, $C(O)R^{12}$, $C(O)NR^{12}R^{13}$, $NR^{14}C(O)R^{12}$, $C(O)OR^{12}$, $OC(O)R^{12}$, $CH(=NR^{14})NR^{12}R^{13}$, $NHC(=NR^{14})NR^{12}R^{13}$, $S(O)R^{12}$, $S(O)_2R^{12}$, $S(O)_2NR^{12}R^{13}$ и $NR^{14}S(O)_2R^{12}$;

R^{12}, в случае присутствия, независимо является выбранным из

C_{1-4} алкила,

C_{2-4} алкенила,

C_{2-4} алкинила,

C_{3-6} циклоалкила,

фенила, замещенного 0-5 R^{33};

C_{3-10} карбоциклического остатка, замещенного 0-3 R^{33} и

5-10-членной гетероциклической кольцевой системы, содержащей 1-4 гетероатомов, выбранных из группы, состоящей из N, O и S, замещенной 0-3 R^{31};

R^{13}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, C_{1-4} алкила, C_{2-4} алкенила и C_{2-4} алкинила;

альтернативно, R^{12} и R^{13} объединяются, чтобы образовать 5- или 6-членное кольцо, необязательно замещенное -O- или $-N(R^{14})-$;

R^{14}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H и C_{1-4} алкила;

R^{31}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, OH, галогена, CF_3, метила и этила;

R^{33}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, OH, галогена, CN, NO_2, CF_3, метила и этила;

R^{41}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, CF_3, галогена, OH, CO_2H, SO_2R^{45}, $NR^{46}R^{47}$, NO_2, CN, =O, C_{2-8} алкенила, C_{2-8} алкинила, C_{1-4} алкокси, C_{1-4} галогеналкила, C_{1-4} алкила, замещенного 0-1 R^{43}, арила, замещенного 0-3 R^{42} и

5-10-членной гетероциклической кольцевой системы, содержащей 1-4 гетероатомов, выбранных из группы, состоящей из N, O и S, замещенной 0-3 R^{44};

R^{42}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, CF_3, галогена, OH, CO_2H, SO_2R^{45}, SR^{45}, $NR^{46}R^{47}$, OR^{48}, NO_2, CN, $CH(=NH)NH_2$, $NHC(=NH)NH_2$, C_{2-8} алкенила, C_{2-6} алкинила, C_{1-4} алкокси,

C_{1-4} галогеналкила,

C_{3-6} циклоалкила,

C_{1-4} алкила, замещенного 0-1 R^{43},

арила, замещенного 0-3 R^{44} и

5-10-членной гетероциклической кольцевой системы, содержащей 1-4 гетероатомов, выбранных из группы, состоящей из N, O и S, замещенной 0-3 R^{44};

R^{43} представляет собой C_{3-6} циклоалкила или арила, замещенного 0-3 R^{44};

R^{44}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, галогена, -OH, $NR^{46}R^{47}$, CO_2H, SO_2R^{45}, $-CF_3$, $-OCF_3$, -CN, $-NO_2$, C_{1-4} алкила и C_{1-4} алкокси;

R^{45} представляет собой C_{1-4} алкил;

RU 2003121304 A

RU 2003121304 A

R^{46}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H и C_{1-3} алкила;

R^{47}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, C_{1-4} алкила, $-C(=O)NH(C_{1-4}$ алкил), $-SO_2(C_{1-4}$ алкил), $-SO_2$(фенил), $-C(=O)O(C_{1-4}$ алкил), $-C(=O)(C_{1-4}$ алкил) и -C(=O)H;

R^{48}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, C_{1-4} алкила, $-C(=O)NH(C_{1-4}$ алкил}, $-C(=O)O(C_{1-4}$ алкил), $-C(=O)(C_{1-4}$ алкил) и -C(=O)H;

k имеет значение 1 или 2; и

n имеет значение 1 или 2.

15. Соединение по пункту 13, у которого:

X представляет собой -O- или -S-;

R^1 выбран из

C_{2-4} алкила, замещенного Z,

C_{2-4} алкенила, замещенного Z,

C_{2-4} алкинила, замещенного Z,

C_{3-6} циклоалкила, замещенного Z,

арила, замещенного Z,

5-6-членной гетероциклической кольцевой системы, содержащей, по крайней мере, один гетероатом, выбранный из группы, состоящей из N, O и S, указанной гетероциклической кольцевой системы, замещенной Z;

C_{2-4} алкила, замещенного 0-2 R^2 и

C_{2-4} алкенила, замещенного 0-2 R^2;

Z выбран из H,

$-CH(OH)R^2$,

$-C$(этилендиокси)R^2,

$-OR^2$,

$-SR^2$,

$-NR^2R^3$,

$-C(O)R^2$,

$-C(O)NR^2R^3$,

$-NR^3C(O)R^2$,

$-C(O)OR^2$,

$-S(O)R^2$,

$-S(O)_2R^2$,

$-S(O)_2NR^2R^3$ и $-NR^3S(O)_2R^2$;

R^2, в случае присутствия, независимо является выбранным из фенила, замещенного 0-5 R^{42};

C_{3-10} карбоциклического остатка, замещенного 0-3 R^{41} и

5-10-членной гетероциклической кольцевой системы, содержащей 1-4 гетероатомов, выбранных из группы, состоящей из N, O и S, замещенной 0-3 R^{41}

R^3, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, C_{1-4} алкила, C_{2-4} алкенила, C_{2-4} алкинила и C_{1-4} алкокси;

альтернативно, R^2 и R^3 объединяются, чтобы образовать 5- или 6-членное кольцо, необязательно замещенное -O- или $-N(R^4)-$;

R^4, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, метила, этила, пропила и бутила;

R^5 представляет собой H;

R^6 представляет собой H;

R^7, R^8 и R^9, в случае присутствия, независимо являются выбранными из H, галогена, $-CF_3$, $-OCF_3$, -OH, $-OCH_3$, -CN, $-NO_2$, C_{1-4} алкила, C_{1-4} галогеналкила, C_{1-4} алкокси, (C_{1-3} галогеналкил) окси, и C_{1-4} алкила, замещенного 0-2 R^{11};

RU 2003121304 A

RU 2003121304 A

R^{11} выбран из

H, галогена, $-CF_3$, $-OCF_3$, -OH, $-OCH_3$, -CN, $-NO_2$, C_{1-4} алкила, C_{1-4} галогеналкила, C_{1-4} алкокси и (C_{1-3} галогеналкил)окси;

R^{33}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, OH, галогена, CF_3 и метила;

R^{41}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, CF_3, галогена, OH, CO_2H, SO_2R^{45}, $NR^{46}R^{47}$, NO_2, CN, =O, C_{2-8} алкенила, C_{2-8} алкинила, C_{1-4} алкокси, C_{1-4} галогеналкила, C_{1-4} алкила, замещенного 0-1 R^{43}, арила, замещенного 0-3 R^{42} и

5-10-членной гетероциклической кольцевой системы, содержащей 1-4 гетероатомов, выбранных из группы, состоящей из N, O и S, замещенной 0-3 R^{44}.

R^{42}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, CF_3, галогена, OH, CO_2H, SO_2R^{45}, SR^{45}, $NR^{46}R^{47}$, OR^{48}, NO_2, CN, $CH(=NH)NH_2$, $NHC(=NH)NH_2$,

C_{2-6} алкенила, C_{2-6} алкинила, C_{1-4} алкокси, C_{1-4} галогеналкила,

C_{3-6} циклоалкила,

C_{1-4} алкила, замещенного 0-1 R^{43},

арила, замещенного 0-3 R^{44} и

5-10-членной гетероциклической кольцевой системы, содержащей 1-4 гетероатомов, выбранных из группы, состоящей из N, O и S, замещенной 0-3 R^{44};

R^{43} представляет собой циклопропил, циклобутил, циклопентил, циклогексил, фенил или пиридил, каждый замещен 0-3 R^{44};

R^{44}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, галогена, -OH, $NR^{46}R^{47}$, CO_2H, SO_2R^{45}, $-CF_3$, $-OCF_3$, -CN, $-NO_2$, метила, этила, пропила, бутила, метокси, этокси, пропокси и бутокси;

R^{45} представляет собой метил, этил, пропил или бутил;

R^{46}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, метила, этила, пропила и бутила;

R^{47}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, метила, этила, н-пропила, изо-пропила, н-бутила, i-бутила, -C(=O)NH(метил), -C(=O)NH(этил), $-SO_2$(метил), $-SO_2$(этил), $-SO_2$(фенил), -C(=O)0(метил),-C(=O)0(этил), -C(=O)(метил),

-C(=O)(этил) и -C(=O)H;

R^{48}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, метила, этила, н-пропила, i-пропила, -C(=O)NH(метил), -C(=O)NH(этил), -C(=O)O(метил), -C(=O)O(этил), -C(=O)(метил), -C(=O)(этил) и -C(=O)H;

k имеет значение 1; и

n имеет значение 1 или 2.

16. Соединение по пункту 13, у которого:

X представляет собой -O- или -S-;

R^1 выбран из

этила, замещенного Z,

пропила, замещенного Z,

бутила, замещенного Z,

пропенила, замещенного Z,

бутенила, замещенного Z,

этила, замещенного R^2,

пропила, замещенного R^2,

бутила, замещенного R^2,

пропенила, замещенного R^2 и

бутенила, замещенного R^2;

Z выбран из H,

$-CH(OH)R^2$,

$-OR^2$,

RU 2003121304 A

RU 2003121304 A

-SR^2,
-NR^2R^3,
-$C(O)R^2$,
-$C(O)NR^2R^3$,
-$NR^3C(O)R^2$.
-$C(O)OR^2$,
-$S(O)R^2$,
-$S(O)_2R^2$,
-$S(O)_2NR^2R^3$ и -$NR^3S(O)_2R^2$;

R^2, в случае присутствия, независимо является выбранным из фенила, замещенного 0-3 R^{42}; нафтила, замещенного 0-3 R^{42};

циклопропила, замещенного 0-3 R^{41}; циклобутила, замещенного 0-3 R^{41};

циклопентила, замещенного 0-3 R^{41};

циклогексила, замещенного 0-3 R^{41};

пиридила, замещенного 0-3 R^{41};

индолила, замещенного 0-3 R^{41};

индолинила, замещенного 0-3 R^{41};

бензимидазолила, замещенного 0-3 R^{41};

бензотриазолила, замещенного 0-3 R^{41};

бензотиенила, замещенного 0-3 R^{41};

бензофуранила, замещенного 0-3 R^{41};

фталимид-1-ила, замещенного 0-3 R^{41};

инден-2-ила, замещенного 0-3 R^{41};

2,3-дигидро-1H-инден-2-ила, замещенного 0-3 R^{41};

индазолила, замещенного 0-3 R^{41};

тетрагидрохинолинила, замещенного 0-3 R^{41}; и

тетрагидроизохинолинила, замещенного 0-3 R^{41};

R^3, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, метила и этила;

R^5 представляет собой H;

R^6 представляет собой H;

R^7, R^8 и R^9, в случае присутствия,независимо являются выбранными из H, F, Cl, метила, этила, метокси, CF_3 и -OCF_3;

R^{41}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, F, Cl, Br, OH, CF_3, NO_2, CN, =O, метила, этила, пропила, бутила, метокси и этокси;

R^{42}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, F, Cl, Br, OH, CF_3, SO_2R^{45}, SR^{45}, $NR^{46}R^{47}$, OR^{48}, NO_2, CN, =O, метила, этила, пропила, бутила, метокси и этокси;

R^{45} представляет собой метил, этил, пропил или бутил;

R^{46}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, метила, этила, пропила и бутила;

R^{47}, в случае присутствия, независимо является выбранным из

H, метила, этила, н-пропила, i-пропила, н-бутила, изо-бутила, -C(=O)NH(метил), C(=O)NH(этил), -SO_2(метил), -SO_2(этил), -SO_2(фенил), -C(=O)O(метил), -C(=O)O(этил), -C(=O)(метил), -C(-O)(этил), и -C(=O)H;

R^{48}, в случае присутствия, независимо является выбранным из H, метила, этила, н-пропила, изо-пропила, -C(=O)NH(метил), -C(=O)NH(этил), C(=O)O(метил), -C(=O)O(этил), -C(=O)(метил), -C(=O)(этил), и -C(=O)H;

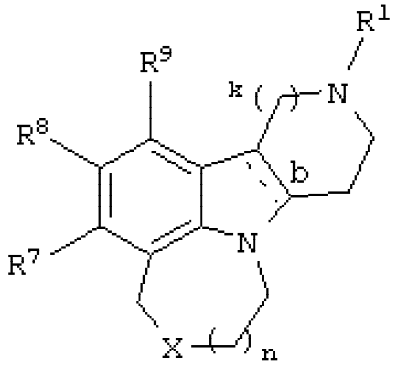
k имеет значение 1; и

n имеет значение 1 или 2.

RU 2003121304 A

RU 2003121304 A

17. Соединение по пункту 13 формулы (I-c),



(I-c)

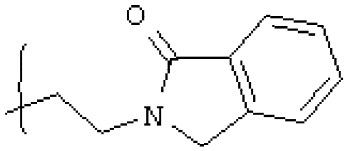
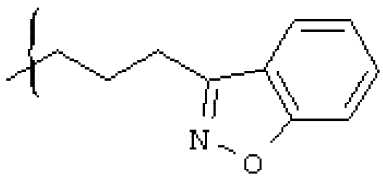
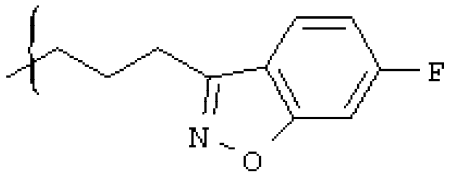
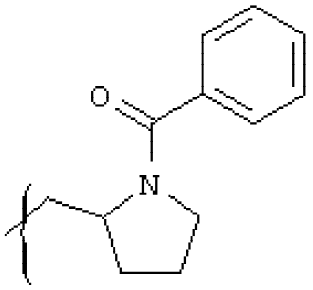
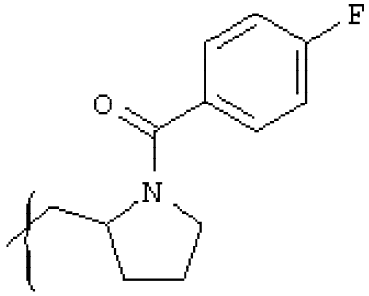
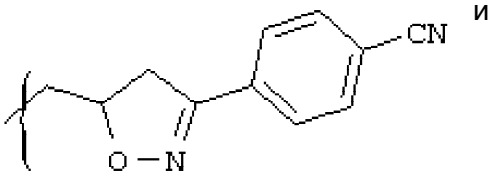
в которой b представляет собой простую или двойную связь;
X представляет собой -S- или -O-;
R^1 выбран из
$-(CH_2)_3C(=O)$(4-фторфенила),
$-(CH_2)_3C(=O)$(4-бромфенила),
$-(CH_2)_3C(=O)$(4-метилфенила),
$-(CH_2)_3C(=O)$(4-метоксифенила),
$-(CH_2)_3C(=O)$(4-(3,4-дихлорфенил)фенила)
$-(CH_2)_3C(=O)$(3-метил-4-фторфенила),
$-(CH_2)_3C(=O)$(2,3-диметоксифенила),
$-(CH_2)_3C(=O)$(фенила),
$-(CH_2)_3C(=O)$(4-хлорфенила),
$-(CH_2)_3C(=O)$(3-метилфенила),
$-(CH_2)_3C(=O)$(4-трет-бутилфенила),
$-(CH_2)_3C(=O)$(3,4-дифторфенила),
$-(CH_2)_3C(=O)$(2-метокси-5-фторфенила),
$-(CH_2)_3C(=O)$(4-фтор-1-нафтила),
$-(CH_2)_3C(=O)$(бензила),
$-(CH_2)_3C(=O)$(4-пиридила),
$-(CH_2)_3C(=O)$(3-пиридила),
$-(CH_2)_3CH(OH)$(4-фторфенила),
$-(CH_2)_3CH(OH)$(4-пиридила),
$-(CH_2)_3CH(OH)$(2,3-диметоксифенила),
$-(CH_2)_3S$(3-фторфенила),
$-(CH_2)_3S$(4-фторфенила),
$-(CH_2)_3S(=O)$(4-фторфенила),
$-(CH_2)_3SO_2$(3-фторфенила),
$-(CH_2)_3SO_2$(4-фторфенила),
$-(CH_2)_3O$(4-фторфенила),
$-(CH_2)_3O$(фенила),
$-(CH_2)_3O$(3-пиридила),
$-(CH_2)_3O$(4-пиридила),
$-(CH_2)_3O$(2-NH_2-фенила),
$-(CH_2)_3O$(2-NH_2-5-F-фенила),
$-(CH_2)_3O$(2-NH_2-4-F-фенила),
$-(CH_2)_3O$(2-NO_2-4-F-фенила),
$-(CH_2)_3O$(2-NH_2-3-F-фенила),
$-(CH_2)_3O$(2-NH_2-4-Cl-фенила),
$-(CH_2)_3O$(2-NH_2-4-OH-фенила),

RU 2003121304 A
RU 2003121304 A

-$(CH_2)_3$O(2-NH_2-4-Br-фенила),
-$(CH_2)_3$O(2-NHC(=O)Me-4-F-фенила),
-$(CH_2)_3$O(2-NHC(=O)Me-фенила),
-$(CH_2)_3$NH(4-фторфенила),
-$(CH_2)_3$N(метил)(4-фторфенила),
$(CH_2)_3CO_2$(этила),
$(CH_2)_3$C(=O)N(метил)(метокси),
$(CH_2)_3$C(=O)NH(4-фторфенила),
-$(CH_2)_2$NHC(=O)(фенила),
$(CH_2)_2$NMeC(=O)(фенила),
$(CH_2)_2$NHC(=O)(2-фторфенила),
$(CH_2)_2$NMeC(=O)(2-фторфенила),
$(CH_2)_2$NHC(=O)(4-фторфенила),
$(CH_2)_2$NMeC(=O)(4-фторфенила),
$(CH_2)_2$NHC(=O)(2,4-дифторфенила),
$(CH_2)_2$NMeC(=O)(2,4-дифторфенила),
$(CH_2)_3$(3-индолила),
$(CH_2)_3$(1-метил-3-индолила),
$(CH_2)_3$(1-индолила),
$(CH_2)_3$(1-индолинила),
$(CH_2)_3$(1-бензимидазолила),
(1H-1,2,3-бензотриазол-1-ила),
-$(CH_2)_3$(1H-1,2,3-бензотриазол-2-ила),
-$(CH_2)_2$(1H-1,2,3-бензотриазол-1-ила),
-$(CH_2)_2$(1H-1,2,3-бензотриазол-2-ила),
-$(CH_2)_3$(3,4 дигидро-1(2H)-хинолинила),
-(CH_2)2C(=O)(4-фторфенила),
-(CH_2)2C(=O)NH(4-фторфенила),
-CH_2CH_2(3-индолила),
-CH_2CH_2(1-фталимидила),
-$(CH_2)_4$C(=O)N(метил)(метокси),
-$(CH_2)_4CO_2$(этила),
-$(CH_2)_4$C(=O)(фенила),
-$(CH_2)_4$(циклогексил)а,
-$(CH_2)_3$CH(фенила)$_2$,
-CH_2CH_2CH=C(фенила)$_2$,
-CH_2CH_2CH=CMe(4-F-фенила),
-$(CH_2)_3$CH(4-фторфенила)$_2$,
-CH_2CH_2CH=C(4-фторфенила)$_2$,
-$(CH_2)_2$(2,3-дигидро-1H-инден-2-ила),
-$(CH_2)_3$C(=O)(2-NH_2-фенила),
-$(CH_2)_3$C(=O)(2-NH_2-5-F-фенила),
-$(CH_2)_3$C(=O)(2-NH_2-4-F-фенила),
-$(CH_2)_3$C(=O)(2-NH_2-3-F-фенила),
-$(CH_2)_3$C(=O)(2-NH_2-4-Cl-фенила),
-$(CH_2)_3$C(=O)(2-NH_2-4-OH-фенила),
-$(CH_2)_3$C(=O)(2-NH_2-4-Br-фенила),
-$(CH_2)_3$(1H-индазол-3-ила),
-$(CH_2)_3$(5-F-1H-индазол-3-ила),
-$(CH_2)_3$(7-F-1H-индазол-3-ила),
-$(CH_2)_3$(6-Cl-1H-индазол-3-ила),
-$(CH_2)_3$(6-Br-1H-индазол-3-ила),
-$(CH_2)_3$C(=O)(2-NHMe-фенила),

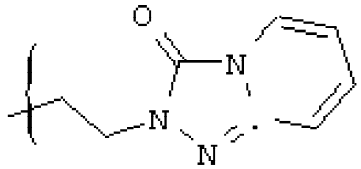
RU 2003121304 A
RU 2003121304 A

-$(CH_2)_3$(1-бензотиен-3-ила),
-$(CH_2)_3$(6-F-1H-индол-1-ила),
-$(CH_2)_3$(5-F-1H-индол-1-ила),
-$(CH_2)_3$(6-F-2,3-дигидро-1H-индол-1-ила),
-$(CH_2)_3$(5-F-2,3-дигидро-1H-индол-1-ила),
-$(CH_2)_3$(6-F-1H-индол-3-ила),
-$(CH_2)_3$(5-F-1H-индол-3-ила),
$(CH_2)_3$(5-F-1H-индол-3-ила),
-$(CH_2)_3$(9H-пурин-9-ила),
-$(CH_2)_3$(7H-пурин-7-ила),
-$(CH_2)_3$(6-F-1H-индазол-3-ила),
$(CH_2)_3C(=O)$(2-$NHSO_2Me$-4-F-фенила),
$(CH_2)_3C(=O)$(2-NHC(=O)Me-4-F-фенила),
$(CH_2)_3C(=O)$(2-NHC(=O)Me-фенила),
$(CH_2)_3C(=O)$(2-$NHCO_2Et$-4-F-фенила),
$(CH_2)_3C(=O)$(2-NHC(=O)NHEt-4-F-фенила)
$(CH_2)_3C(=O)$(2-NHCHO-4-F-фенила),
$(CH_2)_3C(=O)$(2-OH-4-F-фенила),
$(CH_2)_3C(=O)$(2-MeS-4-F-фенила),
$(CH_2)_3C(=O)$(2-$NHSO_2Me$-4-F-фенила),
$(CH_2)_2C(Me)CO_2Me$,
$(CH_2)_2C(Me)CH(OH)$(4-F-фенила)$_2$,
$(CH_2)_2C(Me)CH(OH)$(4-Cl-фенила)$_2$,
$(CH_2)_2C(Me)C(=O)$(4-F-фенила),
$(CH_2)_2C(Me)C(=O)$(2-MeO-4-F-фенила),
$(CH_2)_2C(Me)C(=O)$(3-Me-4-F-фенила),
$(CH_2)_2C(Me)C(=O)$(2-Me-фенила),
$(CH_2)_2C(Me)C(=O)$фенила,

и

RU 2003121304 A



R^7, R^8 и R^9, в случае присутствия, независимо являются выбранными из водорода, фтора, хлора, брома, циано, метила, этила, пропила изопропила, бутила, трет-бутила, нитро, трифторметила, метокси, этокси, изопропокси, трифторметокси, фенила, бензила, HC(=O)-, метилаC(=O)-, этилаC(=O)-, пропилаC(=O)-изопропилаC(=O)-, н-бутилаC(=O)-изобутилаC(=O)-, секбутилаC(=O)-, третбутилаC(=O)-, фенилаC(=O)-метилаC(=O)NH-, этилаC(=O)NH-, пропилаC(=O)NH-изопропилаC(=O)NH-, н-бутилаC(=O)NH-, изобутилаC(=O)NH-, втор-бутилаC(=O)NH-, третбутилаC(=O)NH-, фенилаC(=O)NH-, метиламино-, этиламино-, пропиламино- изопропиламино-, н-бутиламино-изобутиламино-, секбутиламино-, третбутиламино-, фениламино-, при условии, что два заместителя R^7, R^8 и R^9 независимо являются выбранными из водорода, фтора, хлора, брома, циано, метила, этила, пропила, изопропила, бутила, трет-бутила, нитро, трифторметила, метокси, этокси, изопропокси и трифторметокси;

k имеет значение 1 или 2; и

n имеет значение 1 или 2.

18. Соединение по пунктам 1-10 или 13-17, где b представляет собой простую связь.

19. Соединение, выбранное из группы, состоящей из соединений, раскрытых в таблице 1.

20. Фармацевтическая композиция, содержащая фармацевтически приемлемый носитель и терапевтически эффективное количество соединения по пунктам 1-19 или его фармацевтически приемлемую соль.

21. Способ лечения человека, страдающего от нарушения, связанного с модулированием 5HT2C рецептора, включающий введение пациенту, нуждающемуся в этом, терапевтически эффективного количества соединения по пунктам 1-19 или его фармацевтически приемлемой соли.

22. Способ по пункту 21 лечения человека, страдающего от нарушения, связанного с модулированием 5HT2C рецептора, в котором соединение представляет собой 5HT2C агонист.

23. Способ лечения человека, страдающего от нарушения, связанного с модулированием 5HT2A рецептора, включающий введение пациенту, нуждающемуся в этом, терапевтически эффективного количества соединения по пунктам 1-19 или его фармацевтически приемлемой соли.

24. Способ по пункту 23 лечения человека, страдающего от нарушения, связанного с модулированием 5HT2A рецептора, в котором соединение представляет собой 5HT2A антагонист.

25. Способ лечения ожирения, включающий введение пациенту, нуждающемуся в этом, терапевтически эффективного количества соединения по пунктам 1-19 или его фармацевтически приемлемой соли.

26. Способ лечения шизофрении, включающий введение пациенту, нуждающемуся в этом, терапевтически эффективного количества соединения по пунктам 1-19 или его фармацевтически приемлемой соли.

27. Способ лечения депрессии, включающий введение пациенту, нуждающемуся в этом, терапевтически эффективного количества соединения по пунктам 1-9 или его фармацевтически приемлемой соли.

RU 2003121304 A

RU 2003121304 A