

ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА  
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ(12) **ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ**

(21)(22) Заявка: 2013141528/04, 10.02.2012

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:  
11.02.2011 EP 11154188.4

(43) Дата публикации заявки: 20.03.2015 Бюл. № 8

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на  
национальной фазе: 11.09.2013(86) Заявка РСТ:  
CN 2012/071017 (10.02.2012)(87) Публикация заявки РСТ:  
WO 2012/106995 (16.08.2012)

Адрес для переписки:

129090, Москва, ул. Б. Спасская, 25, строение 3,  
ООО "Юридическая фирма Городисский и  
Партнеры"

(71) Заявитель(и):

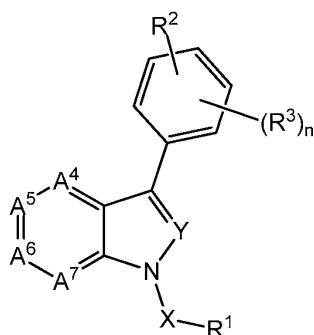
**МЕРК ШАРП И ДОУМ КОРП. (US),  
МЕРК ШАРП И ДОУМ Б.В. (NL)**

(72) Автор(ы):

**КАРСТЕНС Виллем Фредерик Йохан (NL),  
СТЕЛТ Марио Ван Дер (NL),  
КАЛС Йос (NL),  
АСЕВЕДО Рита Корте Реал Гонкалвес (NL),  
БАПП Кеннет Джей (US),  
ЧЖАН Хунцзюнь (US),  
БЕРЕЗИС Ричард Томас (CN),  
ЧЖАН Дуншань (CN),  
ДУАНЬ Сяобан (CN)**(54) **ИНГИБИТОРЫ РЕЦЕПТОРОВ ROR $\gamma$  гаммаТ**

(57) Формула изобретения

1. Соединение формулы I:



I

или его фармацевтически приемлемая соль или сольват, где  
X означает C(O), SO или SO<sub>2</sub>;

Y означает CH или N;

n = 0, 1, 2, 3 или 4;

A<sup>4</sup>-A<sup>7</sup> независимо означают соответственно N или CR<sup>4</sup>, CR<sup>5</sup>, CR<sup>6</sup> или CR<sup>7</sup>, при условии,

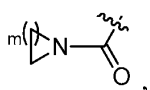
что N может одновременно находиться не более чем в двух из четырех положений A<sup>4</sup>-A<sup>7</sup>;

R<sup>1</sup> означает (i) (C<sub>3-7</sub>)циклоалкил или (C<sub>3-5</sub>)гетероциклоалкил, которые необязательно замещены одной или несколькими группами, выбранными из галогена, amino, циано, нитро, гидроксид, H<sub>2</sub>NC(O)-, (C<sub>1-3</sub>)алкоксикарбонил, (ди)(C<sub>1-6</sub>)алкиламинокарбонил, (C<sub>1-4</sub>)алкила или (C<sub>1-3</sub>)алкокси, где (C<sub>1-3</sub>)алкоксикарбонил, (ди)(C<sub>1-6</sub>)алкиламинокарбонил, (C<sub>1-4</sub>)алкил и (C<sub>1-3</sub>)алкокси необязательно замещены одним или несколькими атомами галогена; (ii) (C<sub>2-9</sub>)гетероарил, необязательно замещенный одной или несколькими группами, выбранными из галогена, amino, циано, нитро, гидроксид, H<sub>2</sub>NC(O)-, (C<sub>1-3</sub>)алкоксикарбонил, (ди)(C<sub>1-6</sub>)алкиламинокарбонил, (C<sub>1-4</sub>)алкила или (C<sub>1-3</sub>)алкокси, где (C<sub>1-3</sub>)алкоксикарбонил, (ди)(C<sub>1-6</sub>)алкиламинокарбонил, (C<sub>1-4</sub>)алкил и (C<sub>1-3</sub>)алкокси необязательно замещены одним или несколькими атомами галогена; или (iii) (C<sub>6-14</sub>)арил, необязательно замещенный одной или несколькими группами, выбранными из галогена, amino, циано, нитро, гидроксид, H<sub>2</sub>NC(O)-, (C<sub>1-3</sub>)алкоксикарбонил, (ди)(C<sub>1-6</sub>)алкиламинокарбонил, (C<sub>1-4</sub>)алкила или (C<sub>1-3</sub>)алкокси, где (C<sub>1-3</sub>)алкоксикарбонил, (ди)(C<sub>1-6</sub>)алкиламинокарбонил, (C<sub>1-4</sub>)алкил и (C<sub>1-3</sub>)алкокси необязательно замещены одним или несколькими атомами галогена;

R<sup>2</sup> означает C(O)OH, 5-тетразолил, HOC(CF<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, C(O)OH(C<sub>1-10</sub>)алкил, (C<sub>1-10</sub>)алкилсульфоксиаминокарбонил или карбамоил;

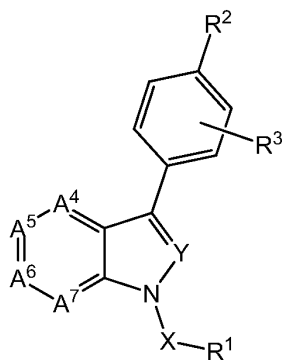
R<sup>3</sup> означает водород, галоген, циано, нитро, гидроксид, (C<sub>1-3</sub>)алкилC(O)O-, (C<sub>1-4</sub>)алкил или (C<sub>1-4</sub>)алкокси, где (C<sub>1-4</sub>)алкил и (C<sub>1-4</sub>)алкокси необязательно замещены одним или несколькими атомами галогена;

R<sup>4</sup>-R<sup>7</sup> независимо означают H, галоген, amino, циано, гидроксид, (C<sub>1-3</sub>)алкокси, (C<sub>1-4</sub>)алкил, (C<sub>0-10</sub>)алкиламинокарбонил, (ди)(C<sub>1-6</sub>)алкиламинокарбонил или amino(C<sub>1-4</sub>)алкил, где (C<sub>1-3</sub>)алкокси, (C<sub>1-4</sub>)алкил, (C<sub>0-10</sub>)алкиламинокарбонил, (ди)(C<sub>1-6</sub>)алкиламинокарбонил и amino(C<sub>1-4</sub>)алкил необязательно замещены одним или несколькими атомами галогена, гидроксидом или (C<sub>1-3</sub>)алкокси; или группу формулы



, необязательно замещенную одним или несколькими следующими группами: (C<sub>1-10</sub>)алкилом, галогеном, amino, циано, гидроксид, (C<sub>1-3</sub>)алкокси, и где m означает 1, 2, 3 или 4.

2. Соединение формулы Ia:



Ia

или его фармацевтически приемлемая соль или сольват, где

X означает C(O), SO или SO<sub>2</sub>;

Y означает CH или N;

A<sup>4</sup>-A<sup>7</sup> независимо означают соответственно N или CR<sup>4</sup>, CR<sup>5</sup>, CR<sup>6</sup> или CR<sup>7</sup>, при условии, что N может одновременно находиться не более чем в двух из четырех положений A<sup>4</sup>-A<sup>7</sup>;

R<sup>1</sup> означает (C<sub>3-7</sub>)циклоалкил или (C<sub>3-5</sub>)гетероциклоалкил, которые необязательно замещены одной или несколькими группами, выбранными из галогена, amino, циано, гидроксид, H<sub>2</sub>NC(O)- или (C<sub>1-3</sub>)алкоксикарбонила, (ди)(C<sub>1-6</sub>)алкиламинокарбонила, (C<sub>1-4</sub>)алкила или (C<sub>1-3</sub>)алкокси, которые необязательно замещены одним или несколькими атомами галогена; или

R<sup>1</sup> означает (C<sub>2-9</sub>)гетероарил, необязательно замещенный одной или несколькими группами, выбранными из галогена, amino, циано, нитро, гидроксид, H<sub>2</sub>NC(O)- или (C<sub>1-3</sub>)алкоксикарбонила, (ди)(C<sub>1-6</sub>)алкиламинокарбонила, (C<sub>1-4</sub>)алкила или (C<sub>1-3</sub>)алкокси, которые необязательно замещены одним или несколькими атомами галогена; или

R<sup>1</sup> означает (C<sub>6-14</sub>)арил, необязательно замещенный одной или несколькими группами, выбранными из галогена, amino, циано, нитро, гидроксид, H<sub>2</sub>NC(O)- или (C<sub>1-3</sub>)алкоксикарбонила, (ди)(C<sub>1-6</sub>)алкиламинокарбонила, (C<sub>1-4</sub>)алкила или (C<sub>1-3</sub>)алкокси, которые необязательно замещены одним или несколькими атомами галогена;

R<sup>2</sup> означает C(O)OH, 5-тетразоилил или HOC(CF<sub>3</sub>)<sub>2</sub>;

R<sup>3</sup> независимо выбирают из водорода, галогена, циано, нитро или (C<sub>1-4</sub>)алкила, необязательно замещенного одним или несколькими атомами галогена; и

R<sup>4</sup>-R<sup>7</sup> независимо означают H, галоген, amino, циано, гидроксид, (C<sub>1-3</sub>)алкокси, (C<sub>1-4</sub>)алкил, необязательно замещенные одним или несколькими атомами галогена.

3. Соединение по п.1, в котором A<sup>4</sup>, A<sup>5</sup>, A<sup>6</sup>, A<sup>7</sup> выбирают из группы, состоящей из: (i) CR<sup>4</sup>, CR<sup>5</sup>, CR<sup>6</sup>, CR<sup>7</sup>; (ii) N, CR<sup>5</sup>, CR<sup>6</sup>, CR<sup>7</sup>; и (iii) CR<sup>4</sup>, N, CR<sup>6</sup>, CR<sup>7</sup>.

4. Соединение по п.3, в котором A<sup>4</sup>, A<sup>5</sup>, A<sup>6</sup>, A<sup>7</sup> означают (i) CR<sup>4</sup>, CR<sup>5</sup>, CR<sup>6</sup>, CR<sup>7</sup>, или (ii) N, CR<sup>5</sup>, CR<sup>6</sup>, CR<sup>7</sup>; и Y означает N.

5. Соединение по п.4, в котором

X означает C(O) или SO<sub>2</sub>;

$R^1$  означает (i) ( $C_{3-7}$ )циклоалкил или ( $C_{3-5}$ )гетероциклоалкил, обязательно замещенные одной или несколькими группами, выбранными из ( $C_{1-4}$ )алкила или галогена; (ii) ( $C_{2-9}$ )гетероарил, обязательно замещенный одной или несколькими группами, выбранными из галогена, amino или ( $C_{1-4}$ )алкила; или (iii) ( $C_{6-14}$ )арил, обязательно замещенный одной или несколькими группами, выбранными из галогена, amino, циано, нитро, гидрокси, ( $C_{1-3}$ )алкоксикарбонила, ( $C_{1-4}$ )алкила, ( $C_{1-3}$ )алкокси, где ( $C_{1-3}$ )алкоксикарбонил, ( $C_{1-4}$ )алкил и ( $C_{1-3}$ )алкокси обязательно замещены одним или несколькими атомами галогена.

6. Соединение по п.5, в котором

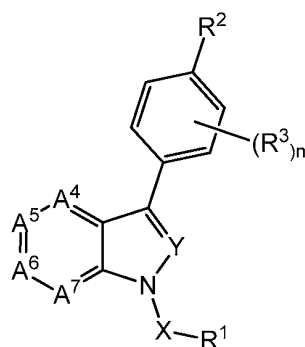
$R^1$  означает ( $C_{2-9}$ )гетероарил или ( $C_{6-14}$ )арил, обязательно замещенные одной или несколькими группами, выбранными из галогена, amino, циано, нитро, гидрокси, ( $C_{1-3}$ )алкоксикарбонила, ( $C_{1-4}$ )алкила или ( $C_{1-3}$ )алкокси, где ( $C_{1-3}$ )алкоксикарбонил, ( $C_{1-4}$ )алкил и ( $C_{1-3}$ )алкокси обязательно замещены одним или несколькими атомами галогена.

7. Соединение по п.6, в котором  $R^1$  означает фенил, нафтил, пиридинил, хиолинил, бензооксадиазолил, тиофенил или изоксазолил, которые обязательно замещены одной или несколькими группами, выбранными из галогена, amino, циано, нитро, гидрокси, ( $C_{1-3}$ )алкоксикарбонила, ( $C_{1-4}$ )алкила или ( $C_{1-3}$ )алкокси, где ( $C_{1-3}$ )алкоксикарбонил, ( $C_{1-4}$ )алкил и ( $C_{1-3}$ )алкокси обязательно замещены одним или несколькими атомами галогена.

8. Соединение по п.7, в котором  $R^1$  означает фенил, обязательно замещенный одной или несколькими группами, выбранными из галогена, amino, циано, нитро, гидрокси, ( $C_{1-3}$ )алкоксикарбонила, ( $C_{1-4}$ )алкила или ( $C_{1-3}$ )алкокси, где ( $C_{1-3}$ )алкоксикарбонил, ( $C_{1-4}$ )алкил и ( $C_{1-3}$ )алкокси обязательно замещены одним или несколькими атомами галогена.

9. Соединение по п.8, в котором  $R^2$  означает  $C(O)OH$ .

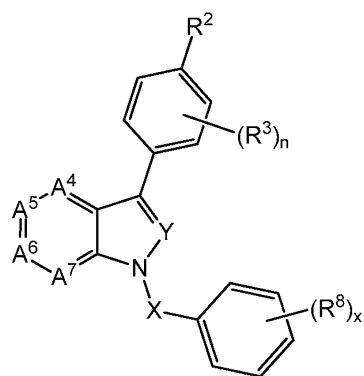
10. Соединение по п.3, имеющее формулу Ib:



Ib

и его фармацевтически приемлемая соль или сольват.

11. Соединение по п.10, имеющее формулу Ic:

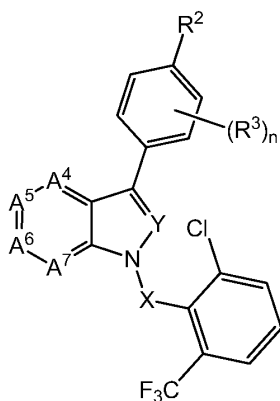


Ic

или его фармацевтически приемлемая соль или сольват, где  
X означает C(O) или SO<sub>2</sub>;

R<sup>8</sup> выбирают из галогена, amino, циано, нитро, гидроксид, H<sub>2</sub>NC(O)-, (C<sub>1-3</sub>)алкоксикарбонил, (ди)(C<sub>1-6</sub>)алкиламинокарбонил, (C<sub>1-4</sub>)алкил или (C<sub>1-3</sub>)алкоксид, где (C<sub>1-3</sub>)алкоксикарбонил, (ди)(C<sub>1-6</sub>)алкиламинокарбонил, (C<sub>1-4</sub>)алкил или (C<sub>1-3</sub>)алкоксид необязательно замещены одним или несколькими атомами галогена; и  
x означает 0, 1, 2, 3, 4 или 5.

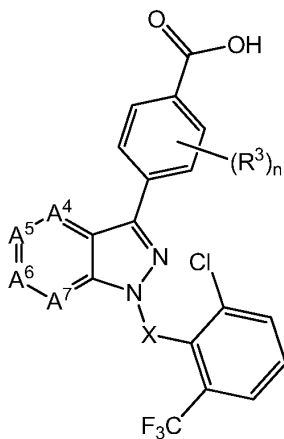
12. Соединение по п.11, имеющее формулу Id:



Id

и его фармацевтически приемлемая соль или сольват.

13. Соединение по п.12, имеющее формулу Ie:



Ie

и его фармацевтически приемлемая соль или сольват.

14. Соединение по п.1, выбранное из следующих соединений:

- 4-(1-(2,6-дихлорбензоил)-1Н-индазол-3-ил)бензойная кислота;
- 4-(1-(2,6-дихлорбензоил)-5-фтор-1Н-индазол-3-ил)бензойная кислота;
- 4-(1-(2,6-дихлорбензоил)-7-фтор-1Н-индазол-3-ил)бензойная кислота;
- 4-(1-(2,6-дихлорбензоил)-4-фтор-1Н-индазол-3-ил)бензойная кислота;
- 4-(1-(2,6-дихлорбензоил)-6-фтор-1Н-индазол-3-ил)бензойная кислота;
- 4-(1-(2,6-дихлорбензоил)-1Н-пиразоло[4,3-*b*]пиридин-3-ил)бензойная кислота;
- 4-(1-(2-(трифторметил)бензоил)-1Н-пиразоло[4,3-*b*]пиридин-3-ил)бензойная кислота;
- 4-(1-(2,6-дихлорбензоил)-1Н-пирроло[3,2-*b*]пиридин-3-ил)бензойная кислота;
- 4-(1-(2,6-дихлорбензоил)-1Н-пиразоло[4,3-*c*]пиридин-3-ил)бензойная кислота;
- 1,1,1,3,3,3-гексафтор-2-(4-(1-(2-(трифторметил)фенилсульфонил)-1Н-индазол-3-ил)

фенил)пропан-2-ол;

- 4-(1-(2-трифторметил)бензоил)-1Н-индазол-3-ил)бензойная кислота;
- 4-(1-(3,5-дихлоризоникотиноил)-1Н-индазол-3-ил)бензойная кислота;
- 4-(1-(2-бромбензоил)-1Н-индазол-3-ил)бензойная кислота;
- 4-(1-(2-(метоксикарбонил)бензоил)-1Н-индазол-3-ил)бензойная кислота;
- 4-(1-(циклогексанкарбонил)-1Н-индазол-3-ил)бензойная кислота;
- 4-(1-(2-бром-6-хлорбензоил)-1Н-индазол-3-ил)бензойная кислота;
- 4-(1-(2-фтор-6-(трифторметил)бензоил)-1Н-индазол-3-ил)бензойная кислота;
- 4-(1-(2-фтор-6-метоксибензоил)-1Н-индазол-3-ил)бензойная кислота;
- 4-(1-(2,4,6-трихлорбензоил)-1Н-индазол-3-ил)бензойная кислота;
- 4-(1-(2,6-диметилбензоил)-1Н-индазол-3-ил)бензойная кислота;
- 4-(1-(2-этоксibenзоил)-1Н-индазол-3-ил)бензойная кислота;
- 4-(1-(2,3-дихлорбензоил)-(1Н-индазол-3-ил)бензойная кислота;
- 4-(1-(2-хлорбензоил)-1Н-индазол-3-ил)бензойная кислота;
- 4-(1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-1Н-индазол-3-ил)бензойная кислота;
- 4-(1-(2-метил-6-нитробензоил)-1Н-индазол-3-ил)бензойная кислота;
- 4-(1-(2-(трифторметил)фенилсульфонил)-1Н-индазол-3-ил)бензойная кислота;
- 4-(1-хиолин-8-илсульфонил)-1Н-индазол-3-ил)бензойная кислота;
- 4-(1-(2-бромфенилсульфонил)-1Н-индазол-3-ил)бензойная кислота;
- 4-(1-(2,5-дихлорфенилсульфонил)-1Н-индазол-3-ил)бензойная кислота;
- 4-(1-(3-хлор-2-метилфенилсульфонил)-1Н-индазол-3-ил)бензойная кислота;
- 4-(1-(2,3-дихлорфенилсульфонил)-1Н-индазол-3-ил)бензойная кислота;
- 4-(1-(2,3,4-трихлорфенилсульфонил)-1Н-индазол-3-ил)бензойная кислота;
- 4-(1-(2-цианофенилсульфонил)-1Н-индазол-3-ил)бензойная кислота;
- 4-(1-(2-(трифторметокси)фенилсульфонил)-1Н-индазол-3-ил)бензойная кислота;
- 4-(1-(нафталин-1-илсульфонил)-1Н-индазол-3-ил)бензойная кислота;
- 4-(1-(2,6-дихлорфенилсульфонил)-1Н-индазол-3-ил)бензойная кислота;
- 4-(1-(бензо[*c*][1,2,5]оксадиазол-4-илсульфонил)-1Н-индазол-3-ил)бензойная кислота;
- 4-(1-(2-циано-5-метилфенилсульфонил)-1Н-индазол-3-ил)бензойная кислота;
- 4-(1-(3,5-диметилфенилсульфонил)-1Н-индазол-3-ил)-3-фторбензойная кислота;
- 4-(1-(3,5-диметилфенилсульфонил)-1Н-индазол-3-ил)-2-(трифторметил)бензойная

кислота;

- 4-(1-(2-хлорфенилсульфонил)-1Н-пиразоло[4,3-*c*]пиридин-3-ил)бензойная кислота;
- 3-(4-(1Н-тетразол-5-ил)фенил)-1-(3-хлорфенилсульфонил)-1Н-индазол;
- метил-3-(3-(4-(1Н-тетразол-5-ил)фенил)-1Н-индазол-1-илсульфонил)тиофен-2-

карбоксилат;

- 3-(4-(1Н-тетразол-5-ил)фенил)-1-(2-бром-4-фторфенилсульфонил)-1Н-индазол;
- 3-(4-(1Н-тетразол-5-ил)фенил)-1-(3-бром-5-хлортиофен-2-илсульфонил)-1Н-индазол;

4-(3-(4-(1H-тетразол-5-ил)фенил)-1H-индазол-1-илсульфонил)-3,5-диметилизоксазол;  
 (3-(4-(1H-тетразол-5-ил)фенил)-1H-индазол-1-ил)(2,6-дихлорфенил)метанон;  
 (3-(4-(1H-тетразол-5-ил)фенил)-1H-индазол-1-ил)(2,3-дихлорфенил)метанон;  
 метил-4-(1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-4-фтор-1H-индазол-3-ил)-3-фторбензоат;  
 4-(1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-4-фтор-1H-индазол-3-ил)-3-фторбензойная кислота;  
 4-(1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-4-фтор-1H-индазол-3-ил)-3-фторбензоат натрия;  
 метил-4-(1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-1H-индазол-3-ил)бензоат;  
 4-(1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-1H-индазол-3-ил)бензойная кислота;  
 4-(1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-1H-индазол-3-ил)бензоат натрия;  
 метил-4-(1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-1H-пиразоло[4,3-b]пиридин-3-ил)-3-фторбензоат;  
 4-(1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-1H-пиразоло[4,3-b]пиридин-3-ил)-3-фторбензоат натрия;  
 (2-хлор-6-(трифторметил)фенил)(4-фтор-3-(4-(1,1,1,3,3,3-гексафтор-2-гидроксипропан-2-ил)фенил)-1H-индазол-1-ил)метанон;  
 3-(1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-4-фтор-1H-индазол-3-ил)бензойная кислота;  
 2-(3-(1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-4-фтор-1H-индазол-3-ил)фенил)уксусная кислота;  
 2-(4-(1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-4-фтор-1H-индазол-3-ил)фенил)уксусная кислота;  
 2-хлор-4-(1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-4-фтор-1H-индазол-3-ил)бензойная кислота;  
 3-хлор-4-(1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-4-фтор-1H-индазол-3-ил)бензоат натрия;  
 4-(1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-4-фтор-1H-индазол-3-ил)бензамид;  
 4-(1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-4-фтор-1H-индазол-3-ил)-2-фтор-5-метилбензойная кислота;  
 4-(1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-4-фтор-1H-индазол-3-ил)-3-метилбензойная кислота;  
 4-(1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-4-фтор-1H-индазол-3-ил)-2-метоксибензойная кислота;  
 4-(1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-4-фтор-1H-индазол-3-ил)-2-фторбензойная кислота;  
 4-(1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-4-фтор-1H-индазол-3-ил)-2-фторбензоат натрия;  
 4-(1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-4-фтор-1H-индазол-3-ил)-2-метилбензойная кислота;  
 4-(1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-4-фтор-1H-индазол-3-ил)-3-метоксибензойная кислота;  
 4-(1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-4-фтор-1H-индазол-3-ил)-2,6-дифторбензойная кислота;  
 4-(1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-4-фтор-1H-индазол-3-ил)-2-изопропилбензойная кислота;  
 4-(1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-4-фтор-1H-индазол-3-ил)-3,5-диметоксибензойная кислота;  
 4-(1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-4-фтор-1H-индазол-3-ил)-2-цианобензойная кислота;

4-(1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-4-фтор-1Н-индазол-3-ил)-2,3-дифторбензойная кислота;

4-(1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-4-фтор-1Н-индазол-3-ил)-2,5-дифторбензойная кислота;

2-хлор-4-(1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-4-фтор-1Н-индазол-3-ил)-5-фторбензойная кислота;

4-(1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-4-фтор-1Н-индазол-3-ил)-5-фтор-2-метоксибензойная кислота;

5-(1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-4-фтор-1Н-индазол-3-ил)-2-гидроксибензойная кислота;

3-фтор-4-(4-фтор-1-(2-фтор-6-метоксибензоил)-1Н-индазол-3-ил)бензойная кислота;

4-(4-фтор-1-(2-фтор-6-метоксибензоил)-1Н-индазол-3-ил)бензойная кислота;

3-(1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-1Н-пиразоло[4,3-*b*]пиридин-3-ил)бензойная кислота;

2-(4-(1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-1Н-пиразоло[4,3-*b*]пиридин-3-ил)фенил)уксусная кислота;

(2-хлор-6-(трифторметил)фенил)(3-(4-(1,1,1,3,3,3-гексафтор-2-гидроксипропан-2-ил)фенил)-1Н-пиразоло[4,3-*b*]пиридин-1-ил)метанон;

4-(1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-1Н-пиразоло[4,3-*b*]пиридин-3-ил)-3-метилбензойная кислота;

3-хлор-4-(1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-1Н-пиразоло[4,3-*b*]пиридин-3-ил)бензойная кислота;

4-(1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-1Н-пиразоло[4,3-*b*]пиридин-3-ил)-2-фторбензойная кислота;

4-(1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-1Н-пиразоло[4,3-*b*]пиридин-3-ил)-2-метоксибензойная кислота;

2-хлор-4-(1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-1Н-пиразоло[4,3-*b*]пиридин-3-ил)-5-фторбензойная кислота;

4-(1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-1Н-пиразоло[4,3-*b*]пиридин-3-ил)-2,5-дифторбензойная кислота;

5-(1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-1Н-пиразоло[4,3-*b*]пиридин-3-ил)-2-гидроксибензойная кислота;

4-(1-(2-фтор-6-метоксибензоил)-1Н-пиразоло[4,3-*b*]пиридин-3-ил)бензойная кислота;

3-фтор-4-(1-(2-фтор-6-метоксибензоил)-1Н-пиразоло[4,3-*b*]пиридин-3-ил)бензойная кислота;

4-(1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-4-(трифторметил)-1Н-индазол-3-ил)бензойная кислота;

4-(1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-1Н-индазол-3-ил)-2-изопропилбензойная кислота;

4-(1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-1Н-индазол-3-ил)-2-фторбензоат натрия;

4-(1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-1Н-индазол-3-ил)-3-фторбензоат натрия;

3-хлор-4-(1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-1Н-индазол-3-ил)бензойная кислота;

3-фтор-4-(1-(2-фтор-6-метоксибензоил)-1Н-индазол-3-ил)бензойная кислота;

3-фтор-4-(1-(2-фтор-6-метоксибензоил)-1Н-индазол-3-ил)бензоат натрия;

4-(7-фтор-1-(2-фтор-6-метоксибензоил)-1Н-индазол-3-ил)бензойная кислота;

3-фтор-4-(7-фтор-1-(2-фтор-6-метоксибензоил)-1Н-индазол-3-ил)бензойная кислота;

4-(6-бром-1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-4-фтор-1Н-индазол-3-ил)бензойная кислота;

4-(6-бром-1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-1Н-индазол-3-ил)бензойная кислота;

4-(1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-4-фтор-6-метокси-1Н-индазол-3-ил)бензойная



**RU 2013141528 A**

**RU 2013141528 A**

4-(1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-4-фтор-6-гидрокси-1H-индазол-3-ил)-3-фторбензойная кислота;

4-(1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-6-(гидроксиметил)-1H-индазол-3-ил)-3-фторбензойная кислота;

1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-3-(4-(метоксикарбонил)фенил)-1H-индазол-6-карбоновая кислота;

4-(1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-6-(2-гидроксиэтилкарбамоил)-1H-индазол-3-ил)бензойная кислота;

4-(1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-6-(диметилкарбамоил)-1H-индазол-3-ил)бензойная кислота;

4-(1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-6-(2-гидроксиэтилкарбамоил)-1H-индазол-3-ил)бензоат натрия;

4-(1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-6-(диметилкарбамоил)-1Н-индазол-3-ил)-3-фторбензоат натрия;

4-(1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-6-(2-гидроксиэтилкарбамоил)-1H-индазол-3-ил)-3-фторбензойная кислота;

3-хлор-4-(1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-6-(диметилкарбамоил)-1H-индазол-3-ил)бензойная кислота;

4-(1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-6-(3-гидроксипропилкарбамоил)-1Н-индазол-3-ил)бензойная кислота;

4-(1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-6-(3-метоксипропилкарбамоил)-1Н-индазол-3-ил)-3-фторбензойная кислота;

- 4-(1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-6-(2-гидроксипропилкарбамоил)-1Н-индазол-3-ил)бензойная кислота;
- 4-(1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-6-(4-гидроксипропилкарбамоил)-1Н-индазол-3-ил)бензойная кислота;
- 4-(1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-6-((2-гидроксиэтил)(метил)карбамоил)-1Н-индазол-3-ил)бензойная кислота;
- 4-(1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-6-((2-гидроксиэтил)(метил)карбамоил)-1Н-индазол-3-ил)-3-фторбензойная кислота;
- 4-(1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-6-((2-метоксиэтил)(метил)карбамоил)-1Н-индазол-3-ил)-3-фторбензойная кислота;
- 4-(1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-6-(3-фторазетидин-1-карбонил)-1Н-индазол-3-ил)бензойная кислота;
- 4-(1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-6-(3,3-дифторазетидин-1-карбонил)-1Н-индазол-3-ил)бензойная кислота;
- 4-(1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-6-(пирролидин-1-карбонил)-1Н-индазол-3-ил)бензойная кислота;
- 4-(6-(азетидин-1-карбонил)-1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-1Н-индазол-3-ил)бензойная кислота;
- 4-(1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-4-фтор-1Н-индазол-3-ил)-2-гидроксibenзойная кислота;
- 2-ацетокси-4-(1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-4-фтор-1Н-индазол-3-ил)бензойная кислота;
- 4-(1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-4-фтор-1Н-индазол-3-ил)-2-гидроксibenзоат натрия;
- 4-(1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-4-фтор-1Н-индазол-3-ил)-2-фтор-6-гидроксibenзойная кислота;
- 4-(1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-4-фтор-1Н-индазол-3-ил)-3-гидроксibenзойная кислота;
- 4-(1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-4-фтор-1Н-индазол-3-ил)-5-фтор-2-гидроксibenзойная кислота;
- 4-(1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-4-фтор-1Н-индазол-3-ил)-3,6-дифтор-2-гидроксibenзойная кислота;
- 4-(1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-1Н-пиразоло[4,3-*b*]пиридин-3-ил)-2-гидроксibenзойная кислота;
- 2-ацетокси-4-(1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-1Н-пиразоло[4,3-*b*]пиридин-3-ил)бензойная кислота;
- 4-(1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-6-(диметилкарбамоил)-1Н-индазол-3-ил)-2-гидроксibenзойная кислота;
- 4-(6-(аминометил)-1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-1Н-индазол-3-ил)бензойная кислота;
- 4-(6-(аминометил)-1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-1Н-индазол-3-ил)-3-фторбензойная кислота;
- 4-(1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-1Н-индазол-3-ил)-2-(дифторметил)бензойная кислота; и
- 4-(1-(2-хлор-6-(трифторметил)бензоил)-6-циано-1Н-индазол-3-ил)бензойная кислота.

15. Фармацевтическая композиция, содержащая соединение по п.1 или его фармацевтически приемлемую соль или сольват и один или несколько фармацевтически приемлемых наполнителей.

16. Фармацевтическая композиция по п.15, которая кроме того содержит по меньшей мере один дополнительный терапевтически активный агент.

17. Применение соединения по п.1 или его фармацевтически приемлемой соли или сольвата при приготовлении лекарственного средства, предназначенного для лечения заболевания или состояния, опосредованного сиротским рецептором гамма t, родственным рецептору ретиноевой кислоты (RORгаммаТ).

18. Способ лечения у субъекта заболевания или состояния, опосредованного рецептором RORгаммаТ, который включает введение указанному субъекту соединения по п.1, его фармацевтически приемлемой соли или сольвата в количестве, эффективном для лечения у субъекта заболевания или состояния, опосредованного рецептором RORгаммаТ.

19. Способ по п.18, в котором заболевание или состояние является аутоиммунным или воспалительным заболеванием.

20. Способ по п.19, в котором заболевание или состояние является рассеянным склерозом, воспалительным заболеванием кишечника, болезнью Крона, псориазом, ревматоидным артритом, астмой, остеоартритом, болезнью Кавасаки, тиреоидитом Хашимото или лейшманиозом слизистой оболочки.

RU 2013141528 A

RU 2013141528 A