



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ,
ПАТЕНТАМ И ТОВАРНЫМ ЗНАКАМ

(12) **ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ**(21), (22) Заявка: **2005119173/04**, **19.12.2003**(30) Приоритет: **20.12.2002 US 60/434,962**(43) Дата публикации заявки: **27.02.2006 Бюл. № 6**(85) Дата перевода заявки РСТ на национальную фазу: **20050617**(86) Заявка РСТ:
US 03/40932 (19.12.2003)(87) Публикация РСТ:
WO 2004/058176 (15.07.2004)

Адрес для переписки:
**129010, Москва, ул. Б.Спасская, 25, стр.3,
ООО "Юридическая фирма Городисский и
Партнеры", пат.пов. Г.Б. Егоровой**

(71) Заявитель(и):
ФАРМАЦИЯ КОРПОРЕЙШН (US)

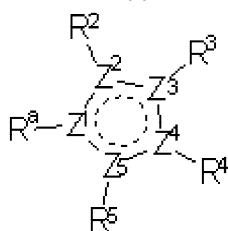
(72) Автор(ы):
**ХАНАУ Кэтлин Э. (US),
МЕРШОН Серена Мари (US),
ГРАНЕТО Мэттью Дж. (US),
МЕЙЕРЗ Марвин Дж. (US),
ХЕДЖД Шридхар Дж. (US),
БАХЛЕР Ингрид П. (US),
ВУ Кун К. (US),
ЛЮ Шуан (US),
НАКРО Кассум (US)**

(74) Патентный поверенный:
Егорова Галина Борисовна

(54) **АЦИКЛИЧЕСКИЕ ПИРАЗОЛЬНЫЕ СОЕДИНЕНИЯ**

(57) Формула изобретения

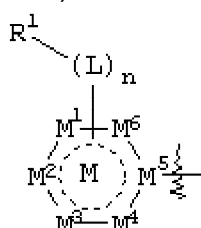
1. Соединение, имеющее структуру

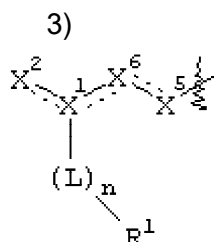
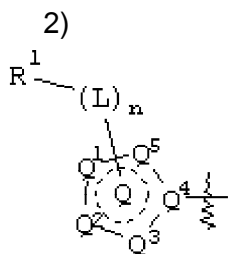


в которой Z^2 и Z^3 представляют азот, Z^1 , Z^4 и Z^5 представляют углерод и совместно с Z^2 и Z^3 образуют пиразольное кольцо, или, необязательно, Z^4 и Z^5 представляют азот, Z^1 , Z^2 и Z^3 представляют углерод и совместно с Z^4 и Z^5 образуют пиразольное кольцо;

 R^a выбран из

1)





в которых пунктирные линии указывают на необязательную одинарную или двойную связи;

когда R^a представляет кольцо М и кольцо М является ароматическим, M^1 представляет углерод и является замещенным заместителем $(L)_nR^1$, M^5 представляет углерод, и каждый из M^2 , M^3 , M^4 и M^6 независимо выбран из углерода и азота и является незамещенным или замещен заместителем $(L)_nR^1$;

когда кольцо М является частично насыщенным, M^1 представляет углерод и является моно- или дизамещенным заместителем $(L)_nR^1$, M^5 представляет углерод, и каждый из M^2 , M^3 , M^4 и M^6 независимо выбран из углерода, азота, кислорода и серы, и, когда M^2 , M^3 , M^4 или M^6 представляет кислород или серу, он является незамещенным, а когда M^2 , M^3 , M^4 или M^6 представляет углерод или азот, он является необязательно незамещенным или моно- или дизамещенным заместителем $(L)_nR^1$;

когда R^a представляет кольцо Q и кольцо Q является ароматическим, Q^1 выбран из углерода и азота, и, когда Q^1 представляет углерод, он замещен заместителем $(L)_nR^1$, а когда Q^1 представляет азот, он является незамещенным, Q^4 выбран из азота и углерода, и каждый из Q^2 , Q^3 и Q^5 независимо выбран из азота и углерода, и, в случае углерода, он замещен заместителем $(L)_nR^1$;

необязательно, когда кольцо Q является ароматическим, Q^1 представляет углерод и замещен заместителем $(L)_nR^1$, Q^4 является углеродом, и один из Q^2 , Q^3 и Q^5 необязательно представляет кислород или серу, а остальные из Q^2 , Q^3 и Q^5 независимо выбраны из азота и углерода, и, в случае углерода, замещены заместителем $(L)_nR^1$;

когда кольцо Q является частично насыщенным, Q^1 выбран из углерода и азота, и, в случае углерода, он является моно- или дизамещенным заместителем $(L)_nR^1$, а в случае азота он является незамещенным или замещенным заместителем $(L)_nR^1$, Q^4 выбран из углерода и азота, но только один из Q^1 и Q^4 может быть азотом, каждый из Q^2 , Q^3 и Q^5 независимо выбран из углерода, азота, кислорода и серы, и в случае кислорода или серы он является незамещенным, а в случае углерода он является моно- или ди-замещенным заместителем $(L)_nR^1$, и в случае азота он является незамещенным или замещенным заместителем $(L)_nR^1$;

когда R^a представляет структуру 3, она является полностью сопряженной, X^2 выбран из кислорода или азота, замещенного заместителем $(L)_nR^1$, X^1 представляет углерод и замещен заместителем $(L)_nR^1$, и каждый из X^5 и X^6 независимо выбран из азота и углерода, и, в случае углерода, он является замещенным заместителем $(L)_nR^1$;

R^1 выбран

из -H, C_1 - C_6 алкила, C_2 - C_6 алкенила, C_2 - C_6 алкинила, C_1 - C_6 алкил- R^{11} , C_2 - C_6 алкенил- R^{11} , C_2 - C

6алкинил- R^{11} , C_1 - C_6 алкил- $(R^{11})_2$, C_2 - C_6 алкенил- $(R^{11})_2$, CSR^{11} , amino, $CONHR^{11}$, NHR^7 , NR^8R^9 , $N(R^7)-N(R^8)(R^9)$, $C(R^{11})=N-N(R^8)(R^9)$, $N=N(R^7)$, $N(R^7)-N=C(R^8)$, $C(R^{11})=N-O(R^{10})$, $ON=C(R^{11})$, C_1 - C_6 алкил- NHR^7 , C_1 - C_6 алкил- NR^8R^9 , (C_1-C_4) алкил- $NH(R^7)-N(R^8)(R^9)$, (C_1-C_4) алкил- $C(R^{11})=N-N(R^8)(R^9)$, (C_1-C_4) алкил- $N=N(R^7)$, (C_1-C_4) алкил- $N(R^7)-N=C(R^8)$, нитро, циано, CO_2R^{11} , $O-R^{10}$, C_1 - C_4 алкил- OR^{10} , COR^{11} , SR^{10} , SSR^{10} , SOR^{11} , SO_2R^{11} , C_1 - C_6 алкил- COR^{11} , C_1 - C_6 алкил- SR^{10} , C_1 - C_6 алкил- SOR^{11} , C_1 - C_6 алкил- SO_2R^{11} , галогена, $Si(R^{11})_3$, галоген- C_1 - C_4 алкила, арила, гетероарила, гетероциклила, алкиларила, алкилгетероциклила, алкилгетероарила, арилалкила, гетероарилалкила, гетероциклилалкила и C_3 - C_{10} моно- и бициклического циклоалкила, где арил, гетероарил, гетероциклил, алкиларил, алкилгетероциклил, алкилгетероарил, арилалкил, гетероарилалкил, гетероциклилалкил и C_3 - C_{10} моно- и бициклический циклоалкил необязательно замещены одной или более из групп, определенных символом R^{12} ;

R^7, R^8 и R^9 , каждый, независимо, выбран

из -H, C₁-C₆алкила, C₂-C₆алкенила, C₂-C₆алкинила, C₁-C₄алкил-R¹¹, C₁-C₆алкил-NHR¹³, C₁-C₆алкил-NR¹³R¹⁴, O-R¹⁵, C₁-C₄алкил-OR¹⁵, CO₂R¹⁵, C(S)OR¹⁵, C(O)SR¹⁵, C(O)R¹⁷, C(S)R¹⁷, CONHR¹⁶, C(S)NHR¹⁶, CON(R¹⁶)₂, C(S)N(R¹⁶)₂, SR¹⁵, SOR¹⁷, SO₂R¹⁷, C₁-C₆алкил-CO₂R¹⁵, C₁-C₆алкил-C(S)OR¹⁵, C₁-C₆алкил-C(O)SR¹⁵, C₁-C₆алкил-COR¹⁷, C₁-C₆алкил-C(S)R¹⁷, C₁-C₆алкил-CONHR¹⁶, C₁-C₆алкил-C(S)NHR¹⁶, C₁-C₆алкил-CON(R¹⁶)₂, C₁-C₆алкил-C(S)N(R¹⁶)₂, C₁-C₆алкил-SR¹⁵, C₁-C₆алкил-SOR¹⁷, C₁-C₆алкил-SO₂R¹⁷, галоген-C₁-C₄алкила, арила, гетероарила, гетероциклила, алкиларила, алкилгетероциклила, алкилгетероарила, арилалкила, гетероарилалкила, гетероциклилалкила и C₃-C₁₀ моно- и бициклического циклоалкила, где арил, гетероарил, гетероциклил, алкиларил, алкилгетероциклил, алкилгетероарил, арилалкил, гетероарилалкил, гетероциклилалкил и C₃-C₁₀ моно- и бициклический циклоалкил необязательно замещены одной или более из групп, определенных символом R¹⁸;

R^{10} выбран из -H, C_1 - C_{10} алкила, C_2 - C_6 алкенила, C_2 - C_6 алкинила, C_1 - C_6 алкил-NHR¹³, C_1 - C_6 алкил-NR¹³R¹⁴, C_1 - C_4 алкил-OR¹⁵, CSR¹¹, CO₂R¹⁵, C(S)OR¹⁵, C(O)SR¹⁵, COR¹⁷, C(S)R¹⁷, CONHR¹⁶, C_1 - C_4 алкил-R¹¹, C_1 - C_4 алкил-NH₂R¹³, C(S)NHR¹⁶, O-R¹⁵, CON(R¹⁶)₂, C(S)N(R¹⁶)₂, SOR¹⁷, SO₂R¹⁷, C_1 - C_6 алкил-CO₂R¹⁵, C_1 - C_6 алкил-C(S)OR¹⁵, C_1 - C_6 алкил-C(O)SR¹⁵, C_1 - C_6 алкил-COR¹⁷, C_1 - C_6 алкил-C(S)R¹⁷, C_1 - C_6 алкил-CONHR¹⁶, C_1 - C_6 алкил-C(S)NHR¹⁶, C_1 - C_6 алкил-CON(R¹⁶)₂, Si(R¹³)₂R¹⁷, C_1 - C_6 алкил-C(S)N(R¹⁶)₂, C_1 - C_6 алкил-SR¹⁵, C_1 - C_6 алкил-SOR¹⁷, C_1 - C_6 алкил-SO₂R¹⁷, галоген- C_1 - C_4 алкила, арила, гетероарила, гетероциклила, алкиларила, алкилгетероциклила, алкилгетероарила, арилалкила, гетероарилалкила, гетероциклилалкила и C_3 - C_{10} моно- и бициклического циклоалкила, где арил, гетероарил, гетероциклил, алкиларил, алкилгетероциклил, алкилгетероарил, арилалкил, гетероарилалкил, гетероциклилалкил и C_3 - C_{10} моно- и бициклический циклоалкил необязательно замещены одной или более из групп, определенных символом R¹⁸.

R¹¹ выбран из -H, C₁-C₆алкила, C₁-C₆алкокси, C₂-C₆алкенила, C₂-C₆алкинила, amino, NHR¹³, NR¹³R¹⁴, N=NR¹³, C₁-C₆алкил-NHR¹³, C₁-C₆алкил-NR¹³R¹⁴, O-R¹⁵, C₁-C₄алкил-OR¹⁵, SR¹⁵, COR¹³, CO₂R¹⁷, C₁-C₆алкил-CO₂R¹⁵, C₁-C₆алкил-C(S)OR¹⁵, C₁-C₆алкил-C(O)SR¹⁵, C₁-C₆алкил-COR¹⁷, C₁-C₆алкил-C(S)R¹⁷, C₁-C₆алкил-CONHR¹⁶, C₁-C₆алкил-C(S)NHR¹⁶, C₁-C₆алкил-CON(R¹⁶)₂, C₁-C₆алкил-C(S)N(R¹⁶)₂, C₁-C₆алкил-SR¹⁵, C₁-C₆алкил-SOR¹⁷, C₁-C₆алкил-SO₂R¹⁷, галогена, галоген-C₁-C₄алкила, арила, гетероарила, гетероциклила, алкиларила, алкилгетероциклила, алкилгетероарила, арилалкила, гетероарилалкила, гетероциклилалкила и C₃-C₁₀ моно- и бициклического циклоалкила, где арил, гетероарил, гетероциклил, алкиларил, алкилгетероциклил, алкилгетероарил, арилалкил, гетероарилалкил, гетероциклилалкил и C₃-C₁₀ моно- и бициклический циклоалкил необязательно замещены одной или более из групп, определенных символом R¹⁸.

R^{12} выбран из -H, OH, оксо, C_1 - C_{10} алкила, C_2 - C_{10} алкенила, C_2 - C_{10} алкинила, C_1 - C_{10} алкил- R^{11} , C_2 - C_{10} алкенил- R^{11} , C_2 - C_{10} алкинил- R^{11} , C_1 - C_{10} алкил- $(R^{11})_2$, C_2 - C_{10} алкенил- $(R^{11})_2$, CSR^{11} , гидроксил- C_1 - C_6 алкил- R^{11} , амино- C_1 - C_4 алкил- R^7 , амино, NHR^7 , NR^8R^9 , $N(R^7)$ - $N(R^8)(R^9)$, $C(R^{11})=N-N(R^8)(R^9)$, $N=N(R^7)$, $N(R^7)-N=C(R^8)$, $C(R^{11})=N-O(R^{10})$, $ON=C(R^{11})$, C_1 - C_{10} алкил- NHR^7 , C_1 - C_{10} алкил- NR^8R^9 , (C_1-C_{10}) алкил- $N(R^7)-N(R^8)(R^9)$, (C_1-C_{10}) алкил- $C(R^{11})=N-N(R^8)(R^9)$, (C_1-C_{10}) алкил- $N=N(R^7)$, (C_1-C_{10}) алкил- $N(R^7)-N=C(R^8)$, SCN , NCS , (C_1-C_{10}) алкил SCN , (C_1-C_{10}) алкил NCS , нитро, циано, $O-R^{10}$, C_1 - C_{10} алкил- OR^{10} , COR^{11} , CO_2R^{11} , SR^{10} , SSR^{10} , SOR^{11} , SO_2R^{11} , C_1 - C_{10} алкил- COR^{11} , C_1 - C_{10} алкил- SR^{10} , C_1 - C_{10} алкил- SOR^{11} , C_1 - C_{10} алкил- SO_2R^{11} , галогена, $Si(R^{11})_3$, галоген- C_1 - C_{10} алкила, арила, гетероарила, гетероциклила, алкиларила, алкилгетероциклила, алкилгетероарила, арилалкила, гетероарилалкила, гетероциклилалкила и C_3 - C_{10} моно- и бициклического циклоалкила, где арил, гетероарил, гетероциклил, алкиларил, алкилгетероциклил, алкилгетероарил, арилалкил, гетероарилалкил, гетероциклилалкил и C_3 - C_{10} моно- и бициклический циклоалкил необязательно замещены одной или более из групп, определенных символом R^{18} ;

R^{13} и R^{14} , каждый, независимо, выбран из -H, оксо, C_1 - C_6 алкила, C_2 - C_6 алкенила, C_2 - C_6 алкинила, C_1 - C_4 алкил- R^{23} , C_1 - C_6 алкил- NHR^{19} , C_1 - C_6 алкил- $NR^{19}R^{20}$, $O-R^{21}$, C_1 - C_4 алкил- OR^{21} , CO_2R^{21} , COR^{21} , $C(S)OR^{21}$, $C(O)SR^{21}$, $C(O)R^{23}$, $C(S)R^{23}$, $CONHR^{22}$, $C(S)NHR^{22}$, $CON(R^{22})_2$, $C(S)N(R^{22})_2$, SR^{21} , SOR^{23} , SO_2R^{23} , C_1 - C_6 алкил- CO_2R^{21} , C_1 - C_6 алкил- $C(S)OR^{21}$, C_1 - C_6 алкил- $C(O)SR^{21}$, C_1 - C_6 алкил- COR^{23} , C_1 - C_6 алкил- $C(S)R^{23}$, C_1 - C_6 алкил- $CONHR^{22}$, C_1 - C_6 алкил- $C(S)NHR^{22}$, C_1 - C_6 алкил- $CON(R^{22})_2$, C_1 - C_6 алкил- $C(S)N(R^{22})_2$, C_1 - C_6 алкил- SR^{21} , C_1 - C_6 алкил- SOR^{23} , C_1 - C_6 алкил- SO_2R^{23} , галоген- C_1 - C_4 алкила, арила, гетероарила, гетероциклила, алкиларила, алкилгетероциклила, алкилгетероарила, арилалкила, гетероарилалкила, гетероциклилалкила и C_3 - C_{10} моно- и бициклического циклоалкила, где арил, гетероарил, гетероциклил, алкиларил, алкилгетероциклил, алкилгетероарил, арилалкил, гетероарилалкил, гетероциклилалкил и C_3 - C_{10} моно- и бициклический циклоалкил необязательно замещены одной или более из групп, определенных символом R^{24} ;

R^{15} и R^{16} , каждый, независимо, выбран из -H, C_1 - C_6 алкила, C_2 - C_6 алкенила, C_2 - C_6 алкинила, C_1 - C_6 алкил- NHR^{19} , C_1 - C_6 алкил- $NR^{19}R^{20}$, C_1 - C_4 алкил- OR^{21} , CSR^{11} , CO_2R^{22} , COR^{23} , $CONHR^{22}$, $CON(R^{22})_2$, SOR^{23} , SO_2R^{23} , C_1 - C_6 алкил- CO_2R^{22} , C_1 - C_6 алкил- COR^{23} , C_1 - C_6 алкил- $CONHR^{22}$, C_1 - C_6 алкил- $CON(R^{22})_2$, C_1 - C_6 алкил- SR^{21} , C_1 - C_6 алкил- SOR^{23} , C_1 - C_6 алкил- SO_2R^{23} , галоген- C_1 - C_4 алкила, арила, гетероарила, гетероциклила, алкиларила, алкилгетероциклила, алкилгетероарила, арилалкила, гетероарилалкила, гетероциклилалкила и C_3 - C_{10} моно- и бициклического циклоалкила, где арил, гетероарил, гетероциклил, алкиларил, алкилгетероциклил, алкилгетероарил, арилалкил, гетероарилалкил, гетероциклилалкил и C_3 - C_{10} моно- и бициклический циклоалкил необязательно замещены одной или более из групп, определенных символом R^{24} ;

R^{17} выбран из -H, C_1 - C_6 алкила, C_2 - C_6 алкенила, C_2 - C_6 алкенил- R^{19} , C_1 - C_6 алкил- R^{19} , C_2 - C_6 алкинила, амино, NHR^{19} , $NR^{19}R^{20}$, C_1 - C_6 алкил- NHR^{19} , C_1 - C_6 алкил- $NR^{19}R^{20}$, $O-R^{21}$, C_1 - C_4 алкил- OR^{21} , SR^{21} , C_1 - C_6 алкил- CO_2R^{21} , C_1 - C_6 алкил- $C(S)OR^{21}$, C_1 - C_6 алкил- $C(O)_3R^{21}$, C_1 - C_6 алкил- COR^{23} , C_1 - C_6 алкил- $C(S)R^{23}$, C_1 - C_6 алкил- $CONHR^{22}$, C_1 - C_6 алкил- $C(S)NHR^{22}$, C_1 - C_6 алкил- $CON(R^{22})_2$, C_1 - C_6 алкил- $C(S)N(R^{22})_2$, C_1 - C_6 алкил- SR^{21} , C_1 - C_6 алкил- SOR^{23} , C_1 - C_6 алкил- SO_2R^{23} , галоген- C_1 - C_4 алкила, арила, гетероарила, гетероциклила, алкиларила, алкилгетероциклила, алкилгетероарила, арилалкила, гетероарилалкила, гетероциклилалкила и C_3 - C_{10} моно- и бициклического циклоалкила, где арил, гетероарил, гетероциклил, алкиларил, алкилгетероциклил, алкилгетероарил, арилалкил, гетероарилалкил, гетероциклилалкил и C_3 - C_{10} моно- и бициклический циклоалкил

необязательно замещены одной или более из групп, определенных символом R^{24} ;

R^{18} выбран из -H, оксо, OH, C_1 - C_{10} алкила, C_2 - C_{10} алкенила, C_2 - C_{10} алкинила, C_1 - C_{10} алкил- R^{23} , C_3 - C_{10} алкенил- R^{23} , C_2 - C_{10} алкинил- R^{23} , C_1 - C_{10} алкил- $(R^{23})_2$, C_2 - C_{10} алкенил- $(R^{23})_2$, CSR²³, amino, NHR¹⁹, NR²⁰R²⁰, N(R¹⁹)-N(R²⁰)(R²⁰), C(R²³)=N-N(R²⁰)(R²⁰), N=N(R¹⁹), N(R¹⁹)-N=C(R²⁰), C(R²³)=N-O(R²¹), ON=C(R²³), C_1 - C_{10} алкил-NHR¹⁹, C_1 - C_{10} алкил-NR²⁰R²⁰, (C_1 - C_{10})алкил-N(R¹⁹)-N(R²⁰)(R²⁰), (C_1 - C_{10})алкилC(R²³)=N-N(R²⁰)(R²⁰), (C_1 - C_{10})алкил-N=N(R¹⁹), (C_1 - C_{10})алкил-N(R¹⁹)-N=C(R²⁰), SCN, NCS, (C_1 - C_{10})алкил SCN, (C_1 - C_{10})алкил NCS, нитро, циано, O-R²¹, C_1 - C_{10} алкил-OR²¹, COR²³, CO₂R²³, SR²¹, SR²¹, SOR²³, SO₂R²³, C_1 - C_{10} алкил-COR²³, C_1 - C_{10} алкил-SR²¹, C_1 - C_{10} алкил-SOR²³, C_1 - C_{10} алкил-SO₂R²³, галогена, Si(R²³)₃, галоген- C_1 - C_{10} алкила, арила, гетероарила, гетероциклила, алкиларила, алкилгетероциклила, алкилгетероарила, арилалкила, гетероариалалкила, гетероциклилалкила и C_3 - C_{10} моно- и бициклического циклоалкила, где арил, гетероарил, гетероциклил, алкиларил, алкилгетероциклил, алкилгетероарил, арилалкил, гетероариалалкил, гетероциклилалкил и C_3 - C_{10} моно- и бициклический циклоалкил обязательно замещены одной или более из групп, определенных символом R^{24} ;

R^{19} и R^{20} , каждый, независимо, выбран

из -H, C_1 - C_6 алкила, C_2 - C_6 алкенила, C_2 - C_6 алкинила, C_1 - C_4 алкил- R^{29} , C_1 - C_6 алкил-NHR²⁵, C_1 - C_6 алкил-NR²⁵R²⁶, O-R²⁷, C_1 - C_4 алкил-OR²⁷, CO₂R²⁷, C(S)OR²⁷, C(O)SR²⁷, C(O)R²⁹, C(S)R²⁹, CONHR²⁸, C(S)NHR²⁸, CON(R²⁸), C(S)N(R²⁸)₂, SR²⁷, SOR²⁹, SO₂R²⁹, C_1 - C_6 алкил-CO₂R²⁷, C_1 - C_6 алкил-C(S)OR²⁷, C_1 - C_6 алкил-C(O)SR²⁷, C_1 - C_6 алкил-COR²⁹, C_1 - C_6 алкил-C(S)R²⁹, C_1 - C_6 алкил-CONHR²⁸, C_1 - C_6 алкил-C(S)NHR²⁸, C_1 - C_6 алкил-CON(R²⁸)₂, C_1 - C_6 алкил-C(S)N(R²⁸)₂, C_1 - C_6 алкил-SR²⁷, C_1 - C_6 алкил-SOR²⁹, C_1 - C_6 алкил-SO₂R²⁹, галоген- C_1 - C_4 алкила, арила, гетероарила, гетероциклила, алкиларила, алкилгетероциклила, алкилгетероарила, арилалкила, гетероариалалкила, гетероциклилалкила и C_3 - C_{10} моно- и бициклического циклоалкила, где арил, гетероарил, гетероциклил, алкиларил, алкилгетероциклил, алкилгетероарил, арилалкил, гетероариалалкил, гетероциклилалкил и C_3 - C_{10} моно- и бициклический циклоалкил обязательно замещены одной или более из групп, определенных символом R^{30} ;

R^{21} и R^{22} , каждый, независимо, выбран

из -H, C_1 - C_{10} алкила, C_2 - C_6 алкенила, C_2 - C_6 алкинила, C_1 - C_6 алкил-NHR²⁵, C_1 - C_6 алкил-NR²⁵R²⁶, C_1 - C_4 алкил-OR²⁷, CSR¹¹, CO₂R²⁸, COR²⁹, CONHR²⁸, CO(R²⁸)₂, SOR²⁹, SO₂R²⁹, C_1 - C_6 алкил-CO₂R²⁸, C_1 - C_6 алкил-COR²⁹, C_1 - C_6 алкил-CONHR²⁸, C_1 - C_6 алкил-CON(R²⁸)₂, C_1 - C_6 алкил-SR²⁷, C_1 - C_6 алкил-SOR²⁹, C_1 - C_6 алкил-SO₂R²⁹, галоген- C_1 - C_4 алкила, арила, гетероарила, гетероциклила, алкиларила, алкилгетероциклила, алкилгетероарила, арилалкила, гетероариалалкила, гетероциклилалкила и C_3 - C_{10} моно- и бициклического циклоалкила, где арил, гетероарил, гетероциклил, алкиларил, алкилгетероциклил, алкилгетероарил, арилалкил, гетероариалалкил, гетероциклилалкил и C_3 - C_{10} моно- и бициклический циклоалкил обязательно замещены одной или более из групп, определенных символом R^{30} ;

R^{23} выбран

из -H, C_1 - C_6 алкила, C_2 - C_6 алкенила, C_2 - C_6 алкенил- R^{25} , C_1 - C_6 алкил- R^{25} , C_2 - C_6 алкинила, amino, NHR²⁵, NR²⁵R²⁶, C_1 - C_6 алкил-NHR²⁵, C_1 - C_6 алкил-NR²⁵R²⁶, O-R²⁷, C_1 - C_4 алкил-OR²⁷, SR²⁷, C_1 - C_6 алкил-CO₂R²⁷, C_1 - C_6 алкил-C(S)OR²⁷, C_1 - C_6 алкил-C(O)SR²⁷, C_1 - C_6 алкил-COR²⁹, C_1 - C_6 алкил-C(S)R²⁹, C_1 - C_6 алкил-CONHR²⁸, C_1 - C_6 алкил-C(S)NHR²⁸, C_1 - C_6 алкил-CON(R²⁸)₂, C_1 - C_6 алкил-C(S)N(R²⁸)₂, C_1 - C_6 алкил-SR²⁷, C_1 - C_6 алкил-SOR²⁹, C_1 - C_6 алкил-SO₂R²⁹, галоген- C_1 - C_4 алкила, арила, гетероарила, гетероциклила, алкиларила, алкилгетероциклила, алкилгетероарила, арилалкила, гетероариалалкила, гетероциклилалкила и C_3 - C_{10} моно- и бициклического циклоалкила, где арил, гетероарил, гетероциклил, алкиларил, алкилгетероциклил, алкилгетероарил, арилалкил, гетероариалалкил, гетероциклилалкил и C_3 - C_{10} моно- и бициклический циклоалкил

необязательно замещены одной или более из групп, определенных символом R^{30} ;

R^{24} выбран из -H,

ОН, C_1 - C_{10} алкила, C_2 - C_{10} алкенила, C_2 - C_{10} алкинила, C_1 - C_{10} алкил- R^{29} , C_2 - C_{10} алкенил- R^{29} , C_2 - C_{10} алкинил- R^{29} , C_1 - C_{10} алкил- $(R^{29})_2$, C_2 - C_{10} алкенил- $(R^{29})_2$, CSR^{29} , amino, NHR^{25} , $NR^{26}R^{26}$, $N(R^{25})-N(R^{26})(R^{26})$, $C(R^{29})=N-N(R^{26})(R^{26})$, $N=N(R^{25})$, $N(R^{25})-N=C(R^{26})$, $C(R^{29})=N-O(R^{27})$, $ON=C(R^{29})$, C_1 - C_{10} алкил- NHR^{25} , C_1 - C_{10} алкил- $NR^{26}R^{26}$, (C_1-C_{10}) алкил- $N(R^{25})-N(R^{26})(R^{26})$, (C_1-C_{10}) алкил- $C(R^{29})=N-N(R^{26})(R^{26})$, (C_1-C_{10}) алкил- $N=N(R^{25})$, (C_1-C_{10}) алкил- $N(R^{25})-N=C(R^{26})$, SCN , NCS , (C_1-C_{10}) алкил SCN , (C_1-C_{10}) алкил NCS , нитро, циано, $O-R^{27}$, C_1 - C_{10} алкил- OR^{27} , COR^{29} , CO_2R^{29} , SR^{27} , SSR^{27} , SOR^{29} , SO_2R^{29} , C_1 - C_{10} алкил- COR^{29} , C_1 - C_{10} алкил- SR^{27} , C_1 - C_{10} алкил- SOR^{29} , C_1 - C_{10} алкил- SO_2R^{29} , галогена, $Si(R^{29})_3$, галоген- C_1 - C_{10} алкила, арила, гетероарила, гетероциклила, алкиларила, алкилгетероциклила, алкилгетероарила, арилалкила, гетероарилалкила, гетероциклилалкила и C_3 - C_{10} моно- и бициклического циклоалкила, где арил, гетероарил, гетероциклил, алкиларил, алкилгетероциклил, алкилгетероарил, арилалкил, гетероарилалкил, гетероциклилалкил и C_3 - C_{10} моно- и бициклический циклоалкил

необязательно замещены одной или более из групп, определенных символом R^{30} ;

R^{25} и R^{26} , каждый, независимо, выбран

из -H, C_1 - C_6 алкила, C_2 - C_6 алкенила, C_2 - C_6 алкинила, C_1 - C_4 алкил- R^{35} , C_1 - C_6 алкил- NHR^{31} , C_1 - C_6 алкил- $NR^{31}R^{32}$, $O-R^{33}$, C_1 - C_4 алкил- OR^{33} , CO_2R^{33} , $C(S)OR^{33}$, $C(O)SR^{33}$, $C(O)R^{35}$, $C(S)R^{35}$, $CONHR^{34}$, $C(S)NHR^{34}$, $CON(R^{34})_2$, $C(S)N(R^{34})_2$, SR^{33} , SOR^{35} , SO_2R^{35} , C_1 - C_6 алкил- CO_2R^{33} , C_1 - C_6 алкил- $C(S)OR^{33}$, C_1 - C_6 алкил- $C(O)SR^{33}$, C_1 - C_6 алкил- COR^{35} , C_1 - C_6 алкил- $C(S)R^{35}$, C_1 - C_6 алкил- $CONHR^{34}$, C_1 - C_6 алкил- $C(S)NHR^{34}$, C_1 - C_6 алкил- $CON(R^{34})_2$, C_1 - C_6 алкил- $C(S)N(R^{34})_2$, C_1 - C_6 алкил- SR^{33} , C_1 - C_6 алкил- SOR^{35} , C_1 - C_6 алкил- SO_2R^{35} , галоген- C_1 - C_4 алкила, арила, гетероарила, гетероциклила, алкиларила, алкилгетероциклила, алкилгетероарила, арилалкила, гетероарилалкила, гетероциклилалкила и C_3 - C_{10} моно- и бициклического циклоалкила, где арил, гетероарил, гетероциклил, алкиларил, алкилгетероциклил, алкилгетероарил, арилалкил, гетероарилалкил, гетероциклилалкил и C_3 - C_{10} моно- и бициклический циклоалкил

необязательно замещены одной или более из групп, определенных символом R^{36} ;

R^{27} и R^{28} , каждый, независимо, выбран

из -H, C_1 - C_6 алкила, C_2 - C_6 алкенила, C_2 - C_6 алкинила, C_1 - C_6 алкил- NHR^{31} , C_1 - C_6 алкил- $NR^{31}R^{32}$, C_1 - C_6 алкил- OR^{33} , CSR^{11} , CO_2R^{34} , COR^{35} , $CONHR^{34}$, $CON(R^{34})_2$, SOR^{35} , SO_2R^{35} , C_1 - C_6 алкил- CO_2R^{34} , C_1 - C_6 алкил- COR^{35} , C_1 - C_6 алкил- $CONHR^{34}$, C_1 - C_6 алкил- $CON(R^{34})_2$, C_1 - C_6 алкил- SR^{33} , C_1 - C_6 алкил- SOR^{35} , C_1 - C_6 алкил- SO_2R^{35} , галоген- C_1 - C_4 алкила, арила, гетероарила, гетероциклила, алкиларила, алкилгетероциклила, алкилгетероарила, арилалкила, гетероарилалкила, гетероциклилалкила и C_3 - C_{10} моно- и бициклического циклоалкила, где арил, гетероарил, гетероциклил, алкиларил, алкилгетероциклил, алкилгетероарил, арилалкил, гетероарилалкил, гетероциклилалкил и C_3 - C_{10} моно- и бициклический циклоалкил

необязательно замещены одной или более из групп, определенных символом R^{36} ;

R^{29} выбран

из -H, C_1 - C_6 алкила, C_2 - C_6 алкенила, C_2 - C_6 алкенил- R^{31} , C_1 - C_6 алкил- R^{31} , C_2 - C_6 алкинила, amino, NHR^{31} , $NR^{31}R^{32}$, C_1 - C_6 алкил- NHR^{31} , C_1 - C_6 алкил- $NR^{31}R^{32}$, $O-R^{33}$, C_1 - C_4 алкил- OR^{33} , SR^{33} , C_1 - C_6 алкил- CO_2R^{33} , C_1 - C_6 алкил- $C(S)OR^{33}$, C_1 - C_6 алкил- $C(O)SR^{33}$, C_1 - C_6 алкил- COR^{35} , C_1 - C_6 алкил- $C(S)R^{35}$, C_1 - C_6 алкил- $CONHR^{34}$, C_1 - C_6 алкил- $C(S)NHR^{34}$, C_1 - C_6 алкил- $CON(R^{34})_2$, C_1 - C_6 алкил- $C(S)N(R^{34})_2$, C_1 - C_6 алкил- SR^{33} , C_1 - C_6 алкил- SOR^{35} , C_1 - C_6 алкил- SO_2R^{35} , галоген- C_1 - C_4 алкила, арила, гетероарила, гетероциклила, алкиларила, алкилгетероциклила, алкилгетероарила, арилалкила, гетероарилалкила, гетероциклилалкила и C_3 - C_{10} моно- и бициклического циклоалкила, где арил, гетероарил, гетероциклил, алкиларил, алкилгетероциклил, алкилгетероарил, арилалкил, гетероарилалкил, гетероциклилалкил и C_3 - C_{10} моно- и бициклический циклоалкил

гетероарилалкил, гетероциклилалкил и C_3 - C_{10} моно- и бициклический циклоалкил необязательно замещены одной или более из групп, определенных символом R^{36} ;

R^{30} выбран из -H,

ОН, C_1 - C_{10} алкила, C_2 - C_{10} алкенила, C_2 - C_{10} алкинила, C_1 - C_{10} алкил- R^{35} , C_2 - C_{10} алкенил- R^{35} , C_2 - C_{10} алкинил- R^{35} , C_1 - C_{10} алкил- $(R^{35})_2$, C_2 - C_{10} алкенил- $(R^{35})_2$, CSR^{35} , $N=NR^{31}$, amino, NHR^{31} , $NR^{32}R^{32}$, $N(R^{31})-N(R^{32})(R^{32})$, $C(R^{35})=N-N(R^{32})(R^{32})$, $N=N(R^{31})$, $N(R^{31})-N=C(R^{32})$, $C(R^{35})=N-O(R^{33})$, $ON=C(R^{35})$, C_1 - C_{10} алкил- NHR^{31} , C_1 - C_{10} алкил- $NR^{32}R^{32}$, (C_1-C_{10}) алкил- $N(R^{31})-N(R^{32})(R^{32})$, (C_1-C_{10}) алкил- $C(R^{35})=N-N(R^{32})(R^{32})$, (C_1-C_{10}) алкил- $N=N(R^{31})$, (C_1-C_{10}) алкил- $N(R^{31})-N=C(R^{32})$, SCN , NCS , (C_1-C_{10}) алкил SCN , C_1 - C_{10} алкил NCS , нитро, циано, $O-R^{33}$, C_1 - C_{10} алкил- OR^{33} , COR^{35} , SR^{33} , SSR^{33} , SOR^{35} , SO_2R^{35} , C_1 - C_{10} алкил- COR^{35} , C_1 - C_{10} алкил- SR^{33} , C_1 - C_{10} алкил- SOR^{35} , C_1 - C_{10} алкил- SO_2R^{35} , галогена, $Si(R^{35})_3$, галоген- C_3 - C_{10} алкила, арила, гетероарила, гетероциклила, алкиларила, алкилгетероциклила, алкилгетероарила, арилалкила, гетероарилалкила, гетероциклилалкила и C_3 - C_{10} моно- и бициклического циклоалкила, где арил, гетероарил, гетероциклил, алкиларил, алкилгетероциклил, алкилгетероарил, арилалкил, гетероарилалкил, гетероциклилалкил и C_3 - C_{10} моно- и бициклический циклоалкил необязательно замещены одной или более из групп, определенных символом R^{36} ;

R^{31} , R^{32} , R^{33} и R^{34} , каждый, независимо, выбран из -H, алкила, алкенила, алкинила, аминоалкила, гидроксиалкила, алкиламиноалкила, диалкиламиноалкила, алкоксиалкила, арила, гетероарила, гетероциклила, алкиларила, алкилгетероциклила, алкилгетероарила, арилалкила, гетероарилалкила, гетероциклилалкила и C_3 - C_{10} моно- и бициклического циклоалкила, где арил, гетероарил, гетероциклил, алкиларил, алкилгетероциклил, алкилгетероарил, арилалкил, гетероарилалкил, гетероциклилалкил и C_3 - C_{10} моно- и бициклический циклоалкил необязательно замещены одной или более из групп, определенных символом R^{36} ;

R^{35} выбран из -H, алкила, алкенила, алкинила, аминоалкила, ОН, алкокси, amino, алкиламино, диалкиламино, гидроксиалкила, алкиламиноалкила, диалкиламиноалкила, алкоксиалкила, арила, гетероарила, гетероциклила, алкиларила, алкилгетероциклила, алкилгетероарила, арилалкила, гетероарилалкила, гетероциклилалкила и C_3 - C_{10} моно- и бициклического циклоалкила, где арил, гетероарил, гетероциклил, алкиларил, алкилгетероциклил, алкилгетероарил, арилалкил, гетероарилалкил, гетероциклилалкил и C_3 - C_{10} моно- и бициклический циклоалкил необязательно замещены одной или более из групп, определенных символом R^{36} ;

R^{36} выбран из -H, алкила, алкенила, алкинила, аминоалкила, ОН, алкокси, amino, нитро, циано, галогена, алкиламино, диалкиламино, гидроксиалкила, алкиламиноалкила, диалкиламиноалкила, алкоксиалкила, арила, гетероарила, гетероциклила, циклоалкила, алкиларила, алкилгетероциклила, алкилгетероарила, арилалкила, гетероарилалкила и гетероарилалкила;

R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^{37} и R^{38} , каждый, независимо, отсутствует или выбран из групп R^1 ;

n представляет 0; и

R^3 и R^4 , необязательно, совместно образуют кольцо из 5, 6, 7 или 8 атомов, в котором атомы в кольце выбраны независимо из Z^3 , Z^4 , O, S, C=O, C=S, S=O, SO_2 , C, который является моно- или дизамещенным R^1 -группой, и N, который является незамещенным или замещенным R^1 -группой.

2. Соединение по п.1, в котором, когда Z^2 и Z^3 оба представляют азот, R^4 является иным, чем пиррол, или, необязательно, когда Z^4 и Z^5 оба представляют азот и R^a является кольцом Q, Q^2 является отличным от азота.

3. Соединение по п.1, в котором R^a выбран из M-кольца и Q-кольца.

4. Соединение по п.1, в котором R^a представляет M-кольцо.

5. Соединение по п.4, в котором кольцо M является ароматическим пиридиновым или пиримидиновым кольцом, в котором M^1 , M^3 и M^4 представляют углерод и замещены

заместителем $(L)_nR^1$, M^5 представляет углерод, M^2 и M^6 независимо выбраны из углерода и азота, и в случае углерода данный углерод замещен заместителем $(L)_nR^1$.

6. Соединение по п.1, в котором R^a представляет кольцо М, которое является ароматическим пиридиновым или пиримидиновым кольцом, в котором M^1 , M^3 и M^4 представляют углерод и замещены заместителем $(L)_nR^1$, M^5 представляет углерод, M^2 и M^6 независимо выбраны из углерода и азота, и в случае углерода данный углерод замещен заместителем $(L)_nR^1$.

7. Соединение по п.1, в котором R^a представляет кольцо М, которое представляет ароматическое пиридиновое или пиримидиновое кольцо;

M^1 , M^3 и M^4 представляют углерод и замещены заместителем $(L)_nR^1$;

M^5 представляет углерод;

M^2 и M^6 , независимо, выбраны из углерода и азота, и в случае углерода данный углерод замещен заместителем $(L)_nR^1$; и

R^3 и R^4 , необязательно, совместно образуют кольцо из 5, 6, 7 или 8 атомов, в котором атомы в кольце выбраны независимо из Z^3 , Z^4 , O, S, C=O, C=S, S=O, SO₂, C, который является моно- или дизамещенным R^1 -группой, и N, который является незамещенным или замещенным R^1 -группой.

8. Соединение по п.1,

в котором R^a представляет кольцо М, которое представляет ароматический пиридин или пиримидин;

M^1 , M^3 и M^4 представляют углерод и замещены заместителем $(L)_nR^1$;

M^5 представляет углерод;

M^2 и M^6 , независимо, выбраны из углерода и азота, и в случае углерода данный углерод замещен заместителем $(L)_nR^1$; и

R^3 и R^4 , необязательно, совместно образуют кольцо из 6 или 7 атомов, в котором атомы в кольце выбраны независимо из Z^3 , Z^4 , C=O, C, который является моно- или ди-замещенным R^1 -группой, и N, который является незамещенным или замещенным R^1 -группой.

9. Соединение по п.1,

в котором R^a представляет кольцо М, которое представляет ароматический пиридин или пиримидин;

M^1 , M^3 и M^4 представляют углерод и замещены заместителем $(L)_nR^1$;

M^5 представляет углерод;

M^2 и M^6 , независимо, выбраны из углерода и азота, и в случае углерода данный углерод замещен заместителем $(L)_nR^1$; и

R^3 и R^4 , необязательно, совместно образуют кольцо из 6 атомов, в котором атомы в кольце выбраны независимо из Z^3 , Z^4 , C=O, C, который является моно- или ди-замещенным R^1 -группой, и N, который является незамещенным или замещенным R^1 -группой.

10. Соединение по п.1,

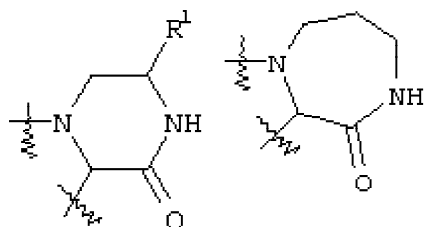
в котором R^a представляет кольцо М, которое представляет ароматическое пиридиновое или пиримидиновое кольцо;

M^1 , M^3 и M^4 представляют углерод и замещены заместителем $(L)_nR^1$;

M^5 представляет углерод;

M^2 и M^6 , независимо, выбраны из углерода и азота, и в случае углерода данный углерод замещен заместителем $(L)_nR^1$; и

R^3 и R^4 , необязательно, совместно образуют кольцо, которое выбрано из



11. Соединение по п.1,

в котором R^a представляет кольцо М, которое представляет ароматический пиридин;

M^1 , M^3 , M^4 и M^6 представляют углерод и замещены заместителем $(L)_nR^1$;

M^5 представляет углерод; и

M^2 представляет азот.

12. Соединение по п.1,

в котором R^a представляет кольцо М, которое представляет ароматический пиримидин;

M^1 , M^3 и M^4 представляют углерод и замещены заместителем $(L)_nR^1$;

M^5 представляет углерод; и

M^2 и M^6 представляют азот.

13. Соединение по п.1,

в котором R^a представляет кольцо М, которое представляет ароматический пиридин;

M^1 , M^3 , M^4 и M^6 представляют углерод и замещены заместителем $(L)_nR^1$;

M^5 представляет углерод; и

M^2 представляет азот;

R^1 выбран из -H, C_1 - C_6 алкила, C_2 - C_6 алкенила, C_2 - C_6 алкинила,

гидроксила, C_1 - C_6 алкокси, C_2 - C_6 алкенил- R^{11} , C_1 - C_6 алкокси- R^{11} , COR^{17} , CO_2R^7 , $CONHR^7$,

$N(R^8)_2$, амино- C_1 - C_4 алкила, гидрокси- C_1 - C_4 алкила, амино, амино- C_1 - C_4 алкил- R^7 ,

галоген- C_1 - C_4 алкила, C_1 - C_6 алкил- NHR^7 , карбонитрила, SR^{10} , галогена, NHR^7 , NR^8R^9 ,

NHR^7C_1 - C_6 алкила, NR^8R^9 - C_1 - C_6 алкила, нитро, циано, $O-R^{10}$, C_1 - C_4 алкил- OR^{10} , C_1 - C_6 алкил-

COR^{11} , галоген- C_1 - C_4 алкила, арила, гетероарила, гетероциклила, алкиларила,

алкилгетероциклила, алкилгетероарила, арилалкила, гетероариалкила,

гетероциклилалкила или C_3 - C_{10} моно- и бициклического циклоалкила, где арил,

гетероарил, гетероциклил, моно- и бициклический циклоалкил необязательно замещены одной или более из групп, определенных символом R^{12} ;

R^7 и R^8 , каждый, независимо, выбран из -H, C_1 - C_6 алкила, C_1 - C_4 алкил- R^{11} , C_1 - C_6 алкил- $N(R^{13})_2$, CO_2R^{16} , COR^{17} , арила и арилалкила, где арил и арилалкил необязательно замещены одной или более из групп, определенных символом R^{18} ;

R^9 и R^{10} , каждый, независимо, выбран из -H,

гидроксила, C_1 - C_6 алкила, C_1 - C_6 алкил- R^{17} , C_1 - C_6 алкил- NH_2R^{13} , CO_2R^{16} , COR^{17} , C_1 - C_6 алкил-

CO_2R^{16} , C_1 - C_6 алкил- $CONH-R^{16}$, C_1 - C_6 алкил- $CON(R^{16})_2$, гидрокси- C_1 - C_4 алкила,

галоген- C_1 - C_4 алкокси, галоген- C_1 - C_4 алкила, $Si(R^{13})_2R^{17}$, арила, гетероарила,

гетероциклила, алкиларила и C_3 - C_{10} моно- и бициклического циклоалкила, где арил,

гетероарил, гетероциклил и арилалкил необязательно замещены одной или более из групп, определенных символом R^{18} ;

R^{11} выбран из -H, C_1 - C_6 алкила, C_1 - C_6 алкокси, гидроксила, галогена, амино, NHR^{13} ,

$N(R^{13})_2$, COR^{13} , CO_2R^{17} , галоген- C_1 - C_4 алкила, арила, гетероарила, гетероциклила,

гетероариалалкила и гетероциклилалкила, где гетероциклил, гетероариалалкил и

гетероциклилалкил необязательно замещены одной или более из групп, определенных символом R^{18} ;

R^{12} выбран из -H, гидроксила, оксо, C_1 - C_6 алкила,

гидрокси- C_1 - C_6 алкил- R^{11} , C_1 - C_{10} алкокси, амино, амино- C_1 - C_4 алкил- R^7 , NHR^7 ,

$N(R^7)_2$, C_1 - C_6 алкил- NHR^7 , C_1 - C_6 алкил- NHR^8R^9 , C_1 - C_6 алкил-

$N(R^8)_2$, C_1-C_6 алкил- R^{11} , C_1-C_6 алкил- CO_2R^7 , C_1-C_6 алкокси- R^{11} , нитро, $O-R^{10}$, $C=O$, COR^{11} , CO_2R^{11} , SR^{10} , SOR^{11} , SO_2R^{11} , $NHSO_2R^{11}$, C_1-C_6 алкил- SR^{10} , галогена, галоген- C_1-C_4 алкила, галоген- C_1-C_4 алкокси, гидрокси- C_1-C_4 алкила, гидрокси- C_1-C_4 алкокси, арила, гетероарила, гетероциклила, арилалкила, гетероарилалкила, гетероциклилалкила и C_3-C_{10} моно- и бициклического циклоалкила, где арил, гетероарил, гетероциклил, арилалкил, гетероарилалкил, гетероциклилалкил и C_3-C_{10} моно- и бициклический циклоалкил необязательно замещены одной или более из групп, определенных символом R^{18} ;

R^{13} и R^{14} , каждый, независимо, выбран из -H, оксо, C_1-C_6 алкила, COR^{23} и арила;

R^{15} и R^{16} , каждый, независимо, выбран из -H, арила, арилалкила, где арил, арилалкил необязательно замещены одной или более из групп, определенных символом R^{24} ;

R^{17} выбран из -H, C_1-C_6 алкила, C_1-C_6 алкил- R^{19} , NHR^{19} , арила, гетероарилалкила и гетероциклилалкила, где арил необязательно замещен одной или более из групп, определенных символом R^{24} ;

R^{18} выбран из -H, оксо, гидроксила, C_1-C_{10} алкила, C_1-C_{10} алкокси, amino, amino- C_1-C_6 алкила, $N(R^{19})_2$, C_1-C_6 алкил- $N(R^{19})_2$, CO_2R^{23} , SR^{21} , галогена, галоген- C_1-C_4 алкила, арила, гетероарила и гетероциклила, где арил, гетероарил и гетероциклил необязательно замещены одной или более из групп, определенных символом R^{24} ;

R^{19} и R^{20} , каждый, независимо, выбран из -H, C_1-C_6 алкила, арила, гетероарила и гетероциклила, где арил, гетероарил и гетероциклил необязательно замещены одной или более из групп, определенных символом R^{30} ;

R^{21} и R^{22} , каждый, независимо, выбран из -H и C_1-C_6 алкила;

R^{23} выбран из -H и C_1-C_6 алкила;

R^{24} выбран из -H, C_1-C_6 алкила, C_1-C_6 алкокси, CO_2R^{29} , галогена и галоген- C_1-C_4 алкила;

R^{29} выбран из -H и C_1-C_6 алкила;

R^{30} выбран из -H, арила, гетероарила, гетероциклила, алкиларила, арилалкила, где арил, гетероарил, гетероциклил, алкиларил и арилалкил необязательно замещены одной или более из групп, определенных символом R^{36} ;

R^{36} выбран из -H и галогена; и

R^2 , R^3 , R^4 , R^{37} и R^{38} , каждый, независимо, выбран из групп R^1 .

14. Соединение по п.1,

в котором R^a представляет кольцо М, которое представляет ароматический пиримидин;

M^1 , M^3 и M^4 представляют углерод и замещены заместителем $(L)_nR^1$;

M^5 представляет углерод; и

M^2 и M^6 представляют азот;

R^1 выбран из -H, C_1-C_6 алкила, C_2-C_6 алкенила, C_2-C_6 алкинила, гидроксила, C_1-C_6 алкокси, C_2-C_6 алкенил- R^{11} , C_1-C_6 алкокси- R^{11} , COR^{17} , CO_2R^7 , $CONHR^7$, $N(R^8)_2$, amino- C_1-C_4 алкила, гидрокси- C_1-C_4 алкила, amino, amino- C_1-C_4 алкил- R^7 , галоген- C_1-C_4 алкила, C_1-C_6 алкил- NHR^7 , карбонитрила, SR^{10} , галогена, NHR^7 , NR^8R^9 , NHR^7 - C_1-C_6 алкила, NR^8R^9 - C_1-C_6 алкила, нитро, циано, $O-R^{10}$, C_1-C_4 алкил- OR^{10} , C_1-C_6 алкил- COR^{11} , галоген- C_1-C_4 алкила, арила, гетероарила, гетероциклила, алкиларила, алкилгетероциклила, алкилгетероарила, арилалкила, гетероарилалкила, гетероциклилалкила или C_3-C_{10} моно- и бициклического циклоалкила, где арил, гетероарил, гетероциклил, моно- и бициклический циклоалкил необязательно замещены одной или более из групп, определенных символом R^{12} ;

R^7 и R^8 , каждый, независимо, выбран из -H, C_1-C_6 алкила, C_1-C_4 алкил- R^{11} , C_1-C_6 алкил- $N(R^{13})_2$, CO_2R^{16} , COR^{17} , арила и арилалкила, где арил и арилалкил необязательно замещены одной или более из групп, определенных символом R^{18} ;

R^9 и R^{10} , каждый, независимо, выбран из -H,

гидроксила, C_1 - C_6 алкила, C_1 - C_6 алкил- R^{17} , C_1 - C_6 алкил- NH_2R^{13} , CO_2R^{16} , COR^{17} , C_1 - C_6 алкил- CO_2R^{16} , C_1 - C_6 алкил- $CONH-R^{16}$, C_1 - C_6 алкил- $CON(R^{16})_2$, гидрокси- C_1 - C_4 алкила, галоген- C_1 - C_4 алкокси, галоген- C_1 - C_4 алкила, $Si(R^{13})_2R^{17}$, арила, гетероарила, гетероциклила, арилалкила и C_3 - C_{10} моно- и бициклического циклоалкила, где арил, гетероарил, гетероциклил и арилалкил необязательно замещены одной или более из групп, определенных символом R^{18} ;

R^{11} выбран из -H, C_1 - C_6 алкила, C_1 - C_6 алкокси, гидроксила, галогена, amino, NHR^{13} , $N(R^{13})_2$, COR^{13} , CO_2R^{17} , галоген- C_1 - C_4 алкила, арила, гетероарила, гетероциклила, гетероарилалкила и гетероциклилалкила, где гетероциклил, гетероарилалкил и гетероциклилалкил необязательно замещены одной или более из групп, определенных символом R^{18} ;

R^{12} выбран из -H, гидроксила, оксо, C_1 - C_6 алкила, гидроксил- C_1 - C_6 алкил- R^{11} , C_1 - C_{10} алкокси, amino, amino- C_1 - C_4 алкил- R^7 , NHR^7 , $N(R^7)_2$, C_1 - C_6 алкил- NHR^7 , C_1 - C_6 алкил- NHR^8R^9 , C_1 - C_6 алкил- $N(R^8)_2$, C_1 - C_6 алкил- R^{11} , C_1 - C_6 алкил- $CO_2R^7R^{11}$, C_1 - C_6 алкокси- R^{11} , нитро, $O-R^{10}$, $C=O$, COR^{11} , CO_2R^{11} , SR^{10} , SOR^{11} , SO_2R^{11} , $NHSO_2R^{11}$, C_1 - C_6 алкил- SR^{10} , галогена, галоген- C_1 - C_4 алкила, галоген- C_1 - C_4 алкокси, гидрокси- C_1 - C_4 алкила, гидрокси- C_1 - C_4 алкокси, арила, гетероарила, гетероциклила, арилалкила, гетероарилалкила, гетероциклилалкила и C_3 - C_{10} моно- и бициклического циклоалкила, где арил, гетероарил, гетероциклил, арилалкил, гетероарилалкил, гетероциклилалкил и C_3 - C_{10} моно- и бициклический циклоалкил необязательно замещены одной или более из групп, определенных символом R^{18} ;

R^{13} и R^{14} , каждый, независимо, выбран из -H, оксо, C_1 - C_6 алкила, COR^{23} и арила;

R^{15} и R^{16} , каждый, независимо, выбран из -H, арила, арилалкила, где арил, арилалкил необязательно замещены одной или более из групп, определенных символом R^{24} ;

R^{17} выбран из -H, C_1 - C_6 алкила, C_1 - C_6 алкил- R^{19} , NHR^{19} , арила, гетероарилалкила и гетероциклилалкила, где арил необязательно замещен одной или более из групп, определенных символом R^{24} ;

R^{18} выбран из -H, оксо, гидроксила, C_1 - C_{10} алкила, C_1 - C_{10} алкокси, amino, amino- C_1 - C_6 алкила, $N(R^{19})_2$, C_1 - C_6 алкил- $N(R^{19})_2$, CO_2R^{23} , SR^{21} , галогена, галоген- C_1 - C_4 алкила, арила, гетероарила и гетероциклила, где арил, гетероарил и гетероциклил необязательно замещены одной или более из групп, определенных символом R^{24} ;

R^{19} и R^{20} , каждый, независимо, выбран из -H, C_1 - C_6 алкила, арила, гетероарила и гетероциклила, где арил, гетероарил и гетероциклил необязательно замещены одной или более из групп, определенных символом R^{30} ;

R^{21} и R^{22} , каждый, независимо, выбран из -H и C_1 - C_6 алкила;

R^{23} выбран из -H и C_1 - C_6 алкила;

R^{24} выбран из -H, C_1 - C_6 алкила, C_1 - C_6 алкокси, CO_2R^{29} , галогена и галоген- C_1 - C_4 алкила;

R^{29} выбран из -H и C_1 - C_6 алкила;

R^{30} выбран из -H, арила, гетероарила, гетероциклила, алкиларила, арилалкила, где арил, гетероарил, гетероциклил, алкиларил и арилалкил необязательно замещены одной или более из групп, определенных символом R^{36} ;

R^{36} выбран из -H и галогена; и

R^2 , R^3 , R^4 , R^{37} и R^{38} , каждый, независимо, выбран из групп R^1 .

15. Соединение, ингибирующее МК-2, которое приведено в таблице 1 или таблице 2.

16. Соединение по п.15, выбранное из группы, состоящей из трифторацетата 1-(2-аминоэтил)-3-(2-хинолин-3-илпиридин-4-ил)-1Н-пиразол-5-карбоновой кислоты, дигидрохлорида 1-(3-аминопропил)-3-[2-(3-нитрофенил)пиридин-4-ил]-1Н-пиразол-5-

карбоновой кислоты,

6-(аминометил)-2-(2-хиолин-3-илпиридин-4-ил)-6,7-дигидропиразоло[1,5-а]пиразин-4(5H)-она,

трифторацетата 1-(2-аминоэтил)-3-{2-[(E)-2-фенилэтенил]пиридин-4-ил}-1H-пиразол-5-карбоновой кислоты,

дигидрохлорида 1-(2-аминоэтил)-3-{2-[4-(гидроксиметил)фенил]пиридин-4-ил}-1H-пиразол-5-карбоновой кислоты,

6-(гидроксиметил)-2-(2-хиолин-3-илпиридин-4-ил)-6,7-дигидропиразоло[1,5-а]пиразин-4(5H)-она, и

дигидрохлорида 1-(3-аминопропил)-3-(2-хиолин-3-илпиридин-4-ил)-1H-пиразол-5-карбоновой кислоты, и их смесей.

17. Способ ингибирования МК-2, включающий контактирование МК-2 с, по крайней мере, одним соединением, имеющим структуру, описанную в п.1.

18. Способ ингибирования МК-2, включающий контактирование МК-2 с, по крайней мере, одним соединением, выбранным из соединений, описанных в п.15.

19. Способ предотвращения или лечения заболеваний или расстройств, опосредуемых $TNF\alpha$, у пациента, включающий введение пациенту эффективного количества ингибирующего МК-2 соединения, имеющего структуру, описанную в п.1.

20. Способ по п.19, отличающийся тем, что указанный пациент нуждается в таком предотвращении или лечении.

21. Способ по п.19, отличающийся тем, что пациентом является млекопитающее.

22. Способ по п.19, отличающийся тем, что пациентом является человек.

23. Способ по п.19, отличающийся тем, что заболевание или расстройство, опосредуемое $TNF\alpha$, выбрано из группы, состоящей из расстройств соединительной ткани и суставов, неопластических расстройств, сердечнососудистых нарушений, заболеваний ушей, заболеваний глаз, дыхательных расстройств, желудочнокишечных расстройств, нарушений, связанных с ангиогенезом, иммунологических расстройств, аллергических расстройств, нарушений питания, инфекционных заболеваний и расстройств, эндокринных расстройств, метаболических, неврологических и нейродегенеративных расстройств, психиатрических расстройств, расстройств печени и желчного пузыря, мышечноскелетных расстройств, мочеполовых расстройств, гинекологических и акушерских расстройств, нарушений, связанных с повреждениями и травмами, хирургических расстройств, заболеваний зубов и полости рта, расстройств сексуальной дисфункции, дерматологических, гематологических расстройств, и связанных с отравлением нарушений.

24. Способ по п.19, отличающийся тем, что заболевание или расстройство, опосредуемое $TNF\alpha$, выбрано из группы, состоящей из артрита, ревматоидного артрита, спондилоартропатий, подагрического артрита, остеоартрита, системной красной волчанки, юношеского артрита, астмы, бронхита, менструальных болезненных спазмов, тендинита, бурсита, повреждений или расстройств соединительной ткани, кожных заболеваний, псориаза, экземы, ожогов, дерматита, желудочнокишечных расстройств, воспалительного заболевания пищеварительного тракта, язвы желудка, желудочных варикозных расширений, болезни Крона, гастрита, синдрома раздраженного кишечника, язвенного колита, рака, колоректального рака, герпесных инфекций, ВИЧ, отека легких, почечных камней, незначительных повреждений, заживления ран, вагинита, кандидоза, поясничного спондилартроза, сосудистых заболеваний, мигреневых головных болей, синусных головных болей, напряженных головных болей, зубной боли, нодозного периартериита, тиреоидита, апластической анемии, болезни Ходжкина, склеродомы, ревматической лихорадки, диабета типа I, миастении гравис, рассеянного склероза, саркоидоза, нефротического синдрома, синдрома Бехчета, полимиозита, гингивита, гиперчувствительности, опухания, происходящего после повреждения, миокардиальной ишемии, глазных болезней, ретинита, ретинопатий, конъюнктивита, увеита, окулярной фотофобии, острого повреждения глазной ткани, воспаления легких, вирусных инфекций, кистозного фиброза, расстройств центральной нервной системы, корковой деменции и болезни Альцгеймера.

25. Способ предотвращения или лечения заболеваний или расстройств, опосредуемых

TNF α , у пациента, включающий введение пациенту, по крайней мере, одного ингибирующего МК-2 соединения, которое выбрано из группы, состоящей из соединений, описанных в п.15.

26. Терапевтическая композиция, включающая соединение, имеющее структуру, описанную в п.1.

27. Терапевтическая композиция, включающая, по крайней мере, одно ингибирующее МК-2 соединение, которое описано в п.15.

28. Фармацевтическая композиция, включающая фармацевтически приемлемый носитель и, по крайней мере, одно ингибирующее МК-2 соединение, имеющее структуру, описанную в п.1.

29. Фармацевтическая композиция по п.28, отличающаяся тем, что соединение, ингибирующее МК-2, имеет показатель IC₅₀ Для МК-2 не выше 0,1 мМ.

30. Набор, включающий дозированную форму, которая включает терапевтически эффективное количество, по крайней мере, одного ингибирующего МК-2 соединения, имеющего структуру, описанную в п.1.