

ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ

(12) ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ

(21)(22) Заявка: 2020124138, 21.12.2018

Приоритет(ы):

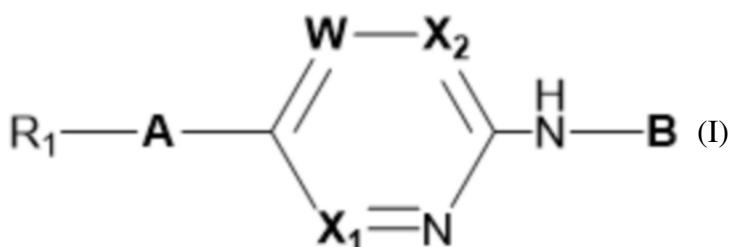
(30) Конвенционный приоритет:
22.12.2017 US 62/609,568

(43) Дата публикации заявки: 24.01.2022 Бюл. № 3

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на
национальной фазе: 22.07.2020(86) Заявка РСТ:
US 2018/067264 (21.12.2018)(87) Публикация заявки РСТ:
WO 2019/126731 (27.06.2019)Адрес для переписки:
129090, Москва, ул. Б.Спасская, 25, строение 3,
ООО "Юридическая фирма Городисский и
Партнеры"(71) Заявитель(и):
ХИБЕРСЕЛЛ, ИНК. (US)(72) Автор(ы):
ЛИНДСТРЁМ, Йохан (SE),
ПЕРССОН, Ларс Бухарта (SE),
ВИКЛУНД, Дженни (SE),
КЕСИКИ, Эдвард А. (US),
ХИКИ, Юджин Р. (US),
ДАЛЬГРЕН, Маркус К. (US),
ГЕРАСИОТО, Алексей И. (US)(54) ПРОИЗВОДНЫЕ АМИНОПИРИДИНА В КАЧЕСТВЕ ИНГИБИТОРОВ
ФОСФАТИДИЛИНОЗИТОЛФОСФАТИНАЗЫ

(57) Формула изобретения

1. Соединение формулы (I):

или его фармацевтически приемлемая соль, пролекарство, сольват, гидрат, изомер
или таутомер,

где:

А представляет собой C₃₋₈ циклоалкил, C₄₋₈ циклоалкенил, C₂₋₆ алкинил, арил,
спирогетероциклик, гетероциклик или 6-членный гетероарил, где циклоалкил,
гетероциклик, арил, спирогетероциклик или гетероарил необязательно замещены одним
или более R₅;В представляет собой гетероциклик или гетероарил, где гетероциклическая группа
необязательно замещена одним или более R₇, а гетероарил необязательно замещен

A 2020124138 A

R U 2020124138 A

одним или более R₈, при условии, что когда В представляет собой гетероарил, В не связан через свой гетероатом;

X₁ представляет собой C(R₅);

X₂ представляет собой C(R₅) или N;

W представляет собой C(R₆) или N; при условии, что только один из X₁, X₂ или W может быть N;

R₁ представляет собой -N(R₂)C(O)R₃, -C(O)N(R₂)(R₃), -S(O)₂N(R₂)(R₃), -N(R₂)S(O)₂R₃, -R₂C(O)N(R₂)(R₃) или гетероарил, где гетероарил необязательно замещен одним или более R₇;

R₂ в каждом случае независимо представляет собой C₁₋₆ алкил, C₂₋₆ алкенил или C₂₋₆ алкинил, где алкил, алкенил или алкинил необязательно замещены одним или более R₄;

R₃ в каждом случае независимо представляет собой -H, C₁₋₆ алкил, C₂₋₆ алкенил или C₂₋₆ алкинил, где алкил, алкенил или алкинил необязательно замещены одним или более R₄; или

R₂ и R₃ вместе с атомом, к которому присоединен каждый из них, образуют гетероцикл, необязательно замещенный одним или более R₄;

R₄ независимо представляет собой -H, галоген, -OH, -NH₂, -NO₂, -CN, C₁₋₆ алкил, C₁₋₆ алcoxси, C₃₋₈ циклоалкил, гетероциклик, арил или гетероарил, где алкил, алcoxси, циклоалкил, гетероциклик, арил или гетероарил необязательно замещены одним или более R₇;

R₅ независимо представляет собой -H, галоген, -OH, -CN, C₁₋₆ алкил, метокси, -OC_{3-C}₆ алкил, C₃₋₈ циклоалкил, гетероциклик, арил или гетероарил;

R₆ представляет собой -H, галоген, -OH, -NH₂, -NO₂, -CN, -CO₂H, -C(O)NH₂, C₁₋₆ алcoxси, C₃₋₈ циклоалкил, гетероциклик, -O-C₃₋₈ циклоалкил или C₁₋₆ алкил, где алкил, алcoxси, гетероциклик или циклоалкил необязательно замещены -OH, C₁₋₆ алкилом, C₁₋₆ алcoxси, C₃₋₈ циклоалкилом, -NH₂, -NH(C₁₋₆ алкилом) или -N(C₁₋₆ алкилом)₂; или

R₅ и R₆, находящиеся на смежных атомах углерода и взятые вместе с атомом углерода, к которому присоединен каждый из них, образуют 5-6-членное гетероарильное кольцо;

R₇ представляет собой -H, галоген, -OH, оксо, C₁₋₆ алкил, C₁₋₆ алcoxси, C₃₋₈ циклоалкил, гетероциклик, арил или гетероарил, где алкил, алcoxси, циклоалкил, гетероциклик, арил или гетероарил необязательно замещены одним или более R₁₄;

R₈ представляет собой -H, -CN, оксо, C₁₋₆ алкил, гетероциклик, арил, гетероарил -N(R₉)C(O)R₁₀, -N(R₉)C(O)OR₁₀, -N(R₉)C(O)N(R₉)(R₁₀), -N(R₉)S(O)₂R₁₀, -S(O)₂R₁₀, -C(O)R₉, -N(R₉)(R₁₀), -OR₁₀, -C(O)R₉-NR₁₀, -N(R₉)C(O)R₁₃ или -C(O)N(R₉)(R₁₀), где алкил, гетероциклик, арил, гетероарил необязательно замещены одним или более R₁₅; или

две группы R₈ вместе с атомами, к которым они присоединены, образуют C₃₋₆ циклоалкил, C₅₋₆ спироциклоалкил, спирогетероциклоалкил, гетероциклик, арил или гетероарил, где циклоалкил, спироциклоалкил, спирогетероциклоалкил или гетероциклик необязательно замещены одним или более R₁₅ или арил или гетероарил необязательно замещены одним или более R₂₄;

каждый из R₉ или R₁₀ в каждом случае независимо представляет собой -H, C₁₋₆ алкил,

R U 2020124138 A

С₂₋₆ алкенил, С₂₋₆ алкинил, С₃₋₈ циклоалкил, арил, гетероарил или гетероциклик, где алкил, циклоалкил или циклоалкил необязательно замещены одним или более R₁₁; или R₉ и R₁₀ вместе с атомом, к которому присоединен каждый из них, образуют гетероциклическое кольцо, необязательно замещенное одним или более R₁₂;

R₁₁ представляет собой -H, галоген, -CN, оксо, -OH, -N(R₂₃)(R₂₅), -OR₂₃, С₁₋₆ алкил, С₁₋₆ алcoxи, С₃₋₈ циклоалкил, гетероциклик, гетероарил, арил, -C(O)R₁₇, -C(O)R₁₇, -C(O)OR₁₇, -OC(O)R₁₇ или -C(O)N(R₂₃)(R₂₅), где алкил, алcoxи, арил, гетероарил, гетероциклик или циклоалкил необязательно замещены одним или более R₁₇;

R₁₂ независимо представляет собой -C(O)OR₂₁, -C(O)R₁₃; оксо, -OH, С₁₋₆ алкил, гетероцикл, -(С₁₋₆ алкил)-гетероарил, -(С₁₋₆ алкил)-гетероцикл, -(С₁₋₆ алкил)-С₃₋₆ циклоалкил, -(С₁₋₆ алкил)-арил, где любой алкил, гетероарил, гетероцикл, циклоалкил или арил необязательно замещены одним или более R₁₈; или

два R₁₂ вместе с атомами, к которым они присоединены, образуют арильное кольцо, необязательно замещенное одним или более R₁₈;

каждый R₁₃ представляет собой арил, гетероциклик, циклоалкил или гетероарил, где арильная или гетероарильная группа необязательно замещена одним или более R₁₉, а гетероциклик или циклоалкил необязательно замещены одним или более R₂₀;

R₁₄ независимо представляет собой -H, галоген, -CN, -NO₂, -OH, -NH₂, С₁₋₆ алкил, С₃₋₈ циклоалкил, гетероциклик, арил или гетероарил;

R₁₅ представляет собой -H, галоген, оксо, -OH, -NH₂, -NO₂, С₁₋₆ алкил, С₁₋₆ алcoxи, С₃₋₈ циклоалкил, гетероциклик, арил, гетероарил, -C(O)N(R₂₁)(R₂₃), -(CH₂)_o-C(O)R₂₃, -OC(O)R₂₃, -C(O)OR₂₃, -SO₂R₂₃, -N(R₂₃)C(O)-Ar-N(R₂₃)-G или -N(R₂₃)C(O)-Ar-N(R₂₃)C(O)-G, где алкил, алcoxи, циклоалкил, гетероциклик, гетероарил или арил необязательно замещены одним или более R₂₃; или

две группы R₁₅ вместе с атомами, к которым они присоединены, образуют гетероциклик, С₃₋₆ циклоалкил, С₅₋₆ спироциклоалкил, арил или гетероарил, где циклоалкил, гетероциклик, спироциклоалкил, гетероарил или арил необязательно замещены одним или более R₂₀;

Ar представляет собой арил;

G представляет собой -H, С₁₋₆ алкил, С₁₋₆ алcoxи, С₂₋₆ алкенил, С₂₋₆ алкинил, С₃₋₈ циклоалкил, гетероциклик, арил, гетероарил, -C(O)OR₂₃, -C(O)CH=CHCH₂N(R₂₃)(R₂₃) или -C(O)N(R₂₁)(R₂₃); или

два R₁₅, находящиеся на смежных атомах и взятые вместе с атомами, к которым присоединен каждый из них, образуют гетероцикл, необязательно замещенный одним или более R₁₆;

R₁₆ независимо представляет собой С₁₋₆ алкил, С₃₋₆ циклоалкил, -C(O)R₂₃, -C(O)R₂₃, -C(O)OR₂₃, -S(O)₂R₂₃ или оксо;

R₁₇ представляет собой -H, -CN, С₁₋₆ алкил, С₁₋₆ алcoxи, гетероарил, арил, -N(R₂₃)(R₂₃), -N(R₂₃)C(O)OR₂₃, -C(O)N(R₂₃)(R₂₃), -N(R₂₃)C(O)R₂₃, -N(R₂₃)C(O)-U-Z или -N(R₂₃)C(O)-U-N(R₂₃)-Z;

Z представляет собой -H, С₁₋₆ алкил, С₁₋₆ алcoxи, С₂₋₆ алкенил, С₂₋₆ алкинил, С₃₋₈ циклоалкил, гетероциклик, арил, гетероарил или -C(O)-U-N(R₂₃)(R₂₃);

R U 2020124138 A

U представляет собой $-(CH_2)_p$, $-(CH_2)_p-Ar$, $-CH=CH(CH_2)_p$ или гетероциклик; R₁₈ независимо представляет собой C₁₋₆ алкил, гетероарил, гетероциклик, циклоалкил, арил, -OR₂₃, -N(R₂₃)(R₂₃) или -N(R₂₃)C(O)-V-N(R₂₃)-E, где гетероарил, гетероциклик, циклоалкил или арил необязательно замещены одним или более R₁₉;

V представляет собой $-(CH_2)_n$, $-(CH_2)_n-Ar$ или $-CH=CH(CH_2)_n$,

E представляет собой -H, C₁₋₆ алкил или -C(O)-V-N(R₂₃)(R₂₃);

R₁₉ представляет собой галоген, C₁₋₆ алкил, C₃₋₆ циклоалкил, -OR₂₁, -N(R₂₁)(R₂₂), -C(O)R₂₁, -N(R₂₃)C(O)OR₂₃, -N(R₂₃)C(O)-Q-N(R₂₃)-F или -N(R₂₃)-Q-N(R₂₃)-F;

Q представляет собой $-CH=CH(CH_2)_m$, $-(CH_2)_m$, $-(CH_2O)_m$, $-(CH_2)_m-Ar$ или $(CH_2CH_2O)_o-(CH_2)_m$,

F представляет собой -H, C₁₋₆ алкил, арил, гетероарил, -C(O)-Q-R₂₃ или -C(O)-Q-N(R₂₃)(R₂₃), где алкил, арил или гетероарил необязательно замещены одним или более R₂₃; или

R₂₀ независимо представляет собой -H, галоген, -OH, -NH₂, оксо, -C(O)R₂₁, -OR₂₃, C₃₋₆ циклоалкил или C₁₋₆ алкил; или

R₂₁ представляет собой -H, C₁₋₆ алкил, C₂₋₆ алкенил, C₂₋₆ алкинил, C₃₋₈ циклоалкил, гетероциклик, арил или гетероарил, где алкил, алкенил, алкинил, циклоалкил, гетероарил или арил необязательно замещены одним или более -H, галогеном, -CN, -OH, C₁₋₆ алкилом, C₁₋₆ алcoxси, C₃₋₈ циклоалкилом, гетероцикликом, гетероарилом или арилом;

R₂₂ представляет собой -H, C₁₋₆ алкил или -C(O)R₂₃; и

каждый R₂₃ независимо представляет собой -H, C₁₋₆ алкил, C₁₋₆ алcoxси, C₂₋₆ алкенил, C₂₋₆ алкинил, C₃₋₈ циклоалкил, гетероциклик, арил или гетероарил, где алкил, алкенил, алкинил, циклоалкил, гетероциклик, гетероарил или арил необязательно замещены одним или более -H, галогеном, -CN, -OH, -NH₂, C₁₋₆ алкилом, C₁₋₆ алcoxси, C₃₋₈ циклоалкилом, гетероцикликом, гетероарилом, арилом или R₂₄;

R₂₄ представляет собой -H, C₁₋₆ алкил, C₂₋₆ алкенил, C₂₋₆ алкинил, C₃₋₈ циклоалкил, гетероциклик, арил или гетероарил, C(O)N(C₁₋₆ алкил)(C₁₋₆ алкил), -C(O)-C₁₋₆ алкил, -C(O)-C₂₋₆ алкенил, -C(O)O-C₁₋₆ алкил, где алкил, алкенил, алкинил, циклоалкил, гетероциклик, гетероарил или арил необязательно замещены одним или более -H, галогеном, -CN, -OH, -NH₂, C₁₋₆ алкилом, C₁₋₆ алcoxси, C₃₋₈ циклоалкилом, гетероцикликом, гетероарилом или арилом;

R₂₅ независимо представляет собой C₁₋₆ алкил, C₁₋₆ алcoxси, C₂₋₆ алкенил, C₂₋₆ алкинил, C₃₋₈ циклоалкил, гетероциклик, арил или гетероарил, где алкил, алкенил, алкинил, циклоалкил, гетероциклик, гетероарил или арил необязательно замещены одним или более -H, галогеном, -CN, -OH, -NH₂, C₁₋₆ алкилом, C₁₋₆ алcoxси, C₃₋₈ циклоалкилом, гетероцикликом, гетероарилом, арилом или R₂₄;

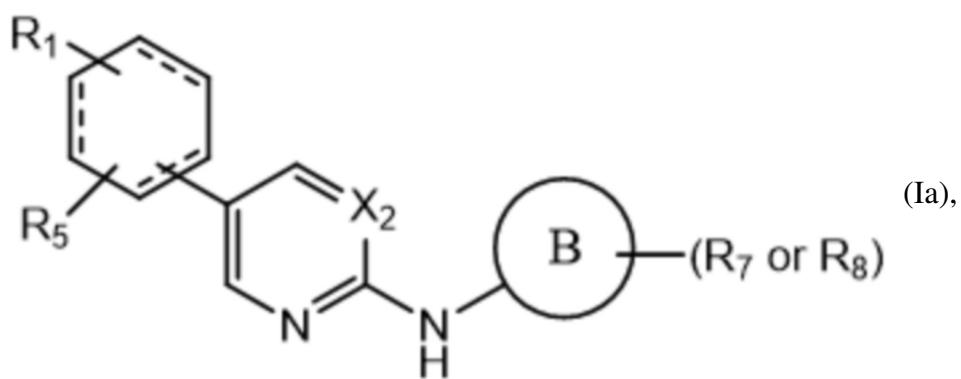
каждый p независимо равен 1-4;

каждый n независимо равен 1-4;

каждый m независимо равен 1-4; и

каждый o независимо равен 0-4.

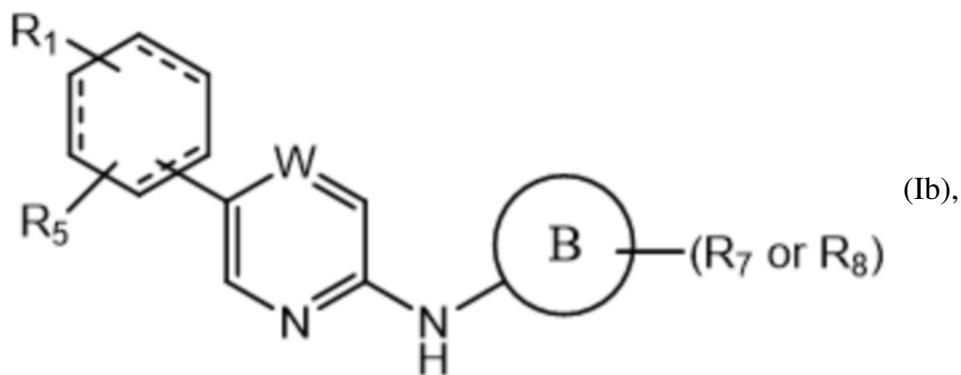
2. Соединение по п. 1, имеющее формулу Ia:



где:

— предстает необязательную двойную связь.

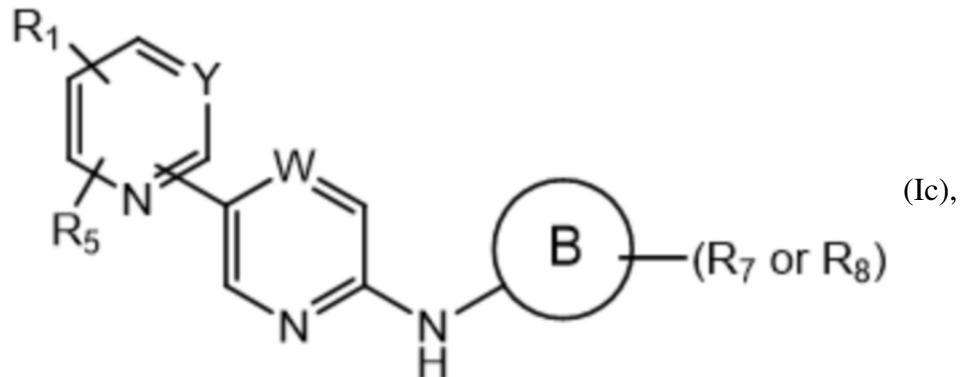
3. Соединение по п. 1, имеющее формулу Ib:



где:

— предстает необязательную двойную связь, обеспечивающую кольцу частичную ненасыщенность или ароматичность.

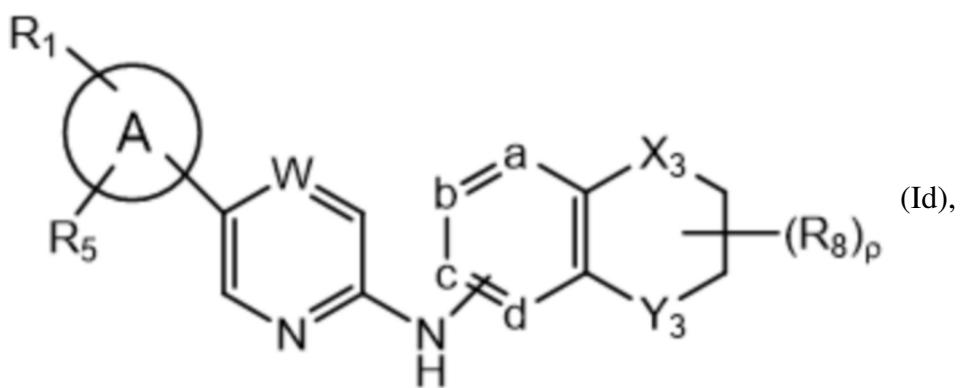
4. Соединение по п. 1, имеющее формулу Ic:



где:

Y предстает собой C(R5) или N.

5. Соединение по п. 1, имеющее формулу Id:



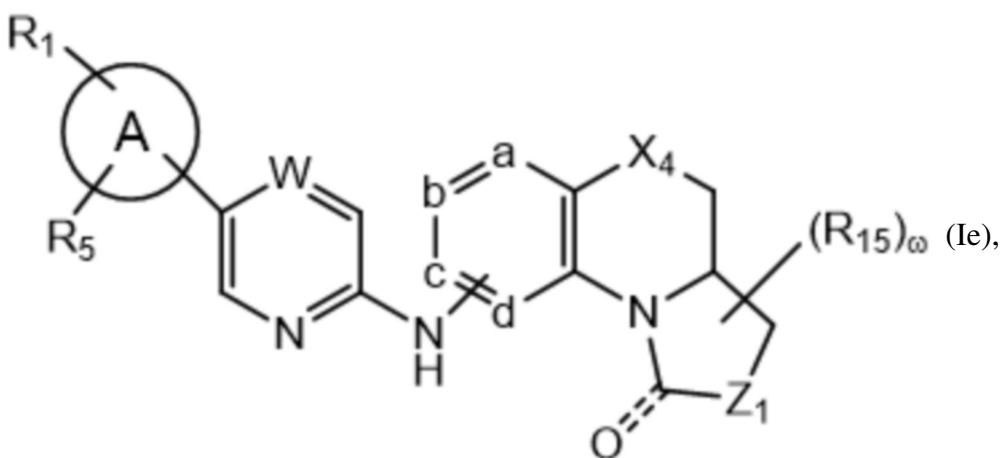
где:

а, б, с и д, каждый, независимо представляют собой С или N, где по меньшей мере один из а, б, с и д представляет собой N, и не более двух из а, б, с и д представляют собой N;

Х₃ и Y₃, каждый, независимо представляют собой -O-, -CH₂- или -N(R₈)-;

ρ равен 1, 2 или 3.

6. Соединение по п. 1, имеющее формулу Ie:



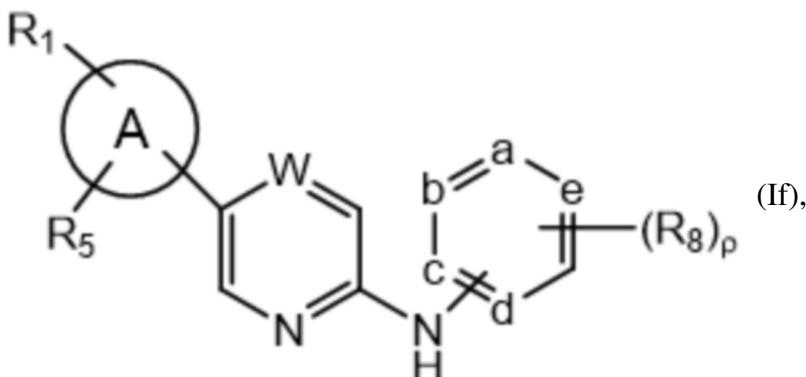
где:

— предстает необязательную двойную связь;

а, б, с и д, каждый, независимо представляют собой С или N, где по меньшей мере один из а, б, с и д представляет собой N, и не более двух из а, б, с, д и е представляют собой N;

Х₄ и Z₁, каждый, независимо представляют собой -O-, -N(R₁₅)- или -C(R₁₅)(R₁₅)-; и ω равен 1, 2 или 3.

7. Соединение по п. 1, имеющее формулу If:



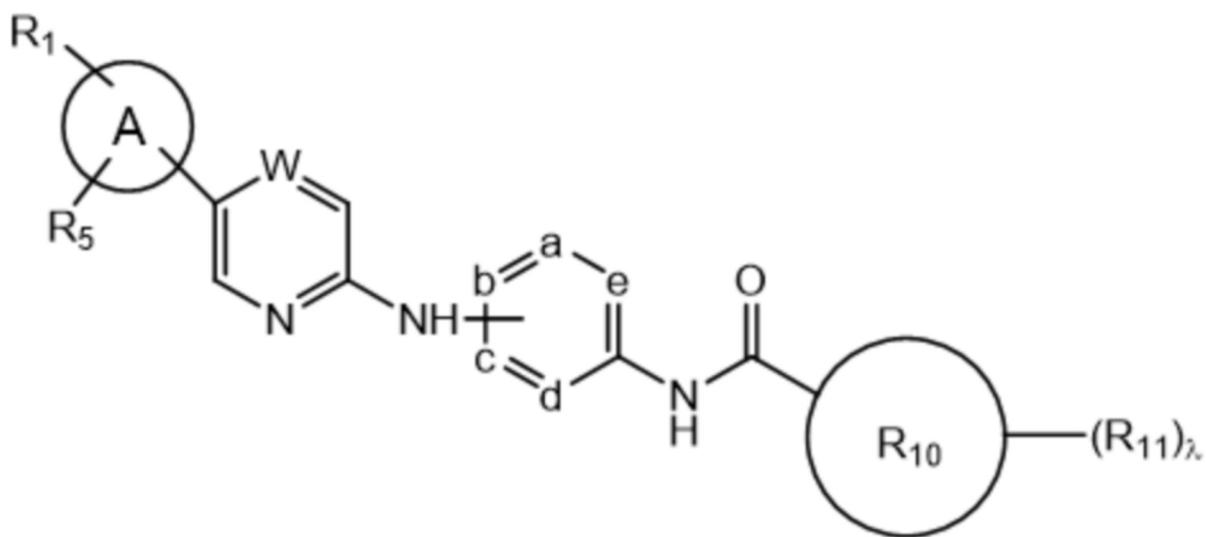
где:

а, б, с, д и е, каждый, независимо представляют собой С или N, где по меньшей мере

один из a, b, c, d и e представляет собой N, и не более двух из a, b, c, d и e представляют собой N; и

ρ равен 1, 2 или 3.

8. Соединение по п. 1, имеющее формулу Ig:



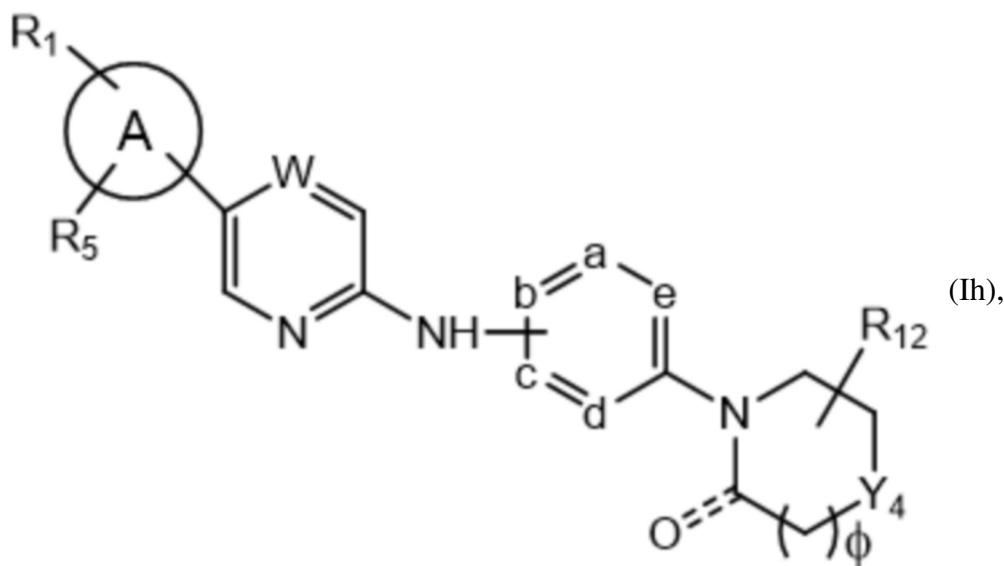
(Ig),

где:

a, b, c, d и e, каждый, независимо представляют собой C или N, где по меньшей мере один из a, b, c, d и e представляет собой N, и не более двух из a, b, c, d и e представляют собой N; и

λ равен 1, 2 или 3.

9. Соединение по п. 1, имеющее формулу Ih:



где:

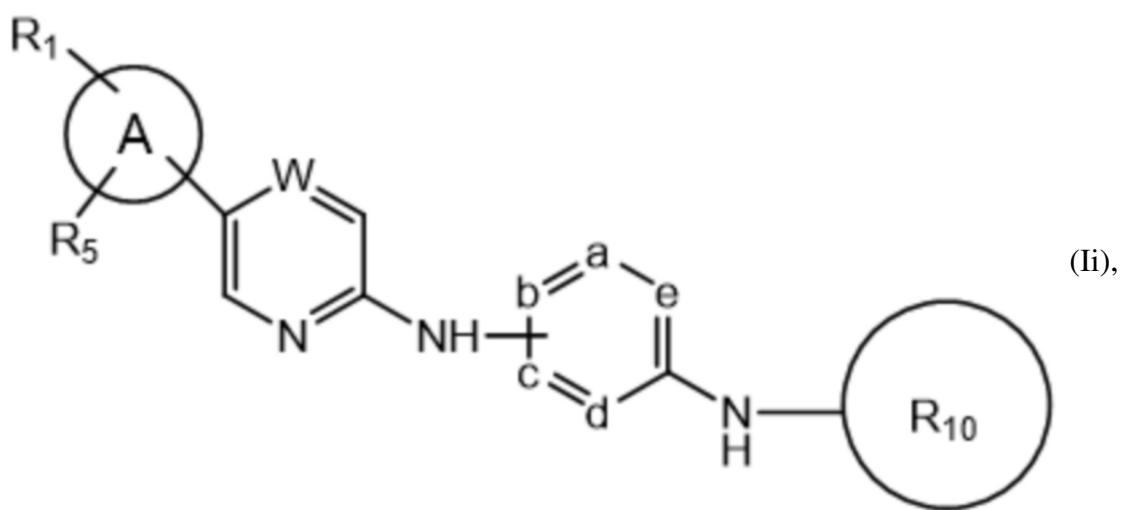
— — — — — представляет необязательную двойную связь;

a, b, c, d и e, каждый, независимо представляют собой C или N, где по меньшей мере один из a, b, c, d и e представляет собой N, и не более двух из a, b, c, d и e представляют собой N;

Y4 представляет собой -O-, -N(R12)- или -C(R12)(R12)-; и

Φ равен 0, 1 или 2.

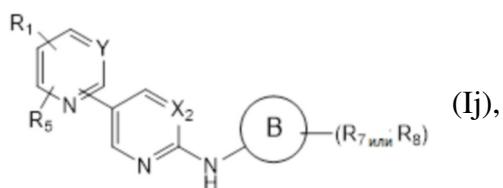
10. Соединение по п. 1, имеющее формулу Ii:



где:

a, b, c, d и e, каждый, независимо представляют собой С или N, где по меньшей мере один из a, b, c, d и e представляет собой N, и не более двух из a, b, c, d и e представляют собой N.

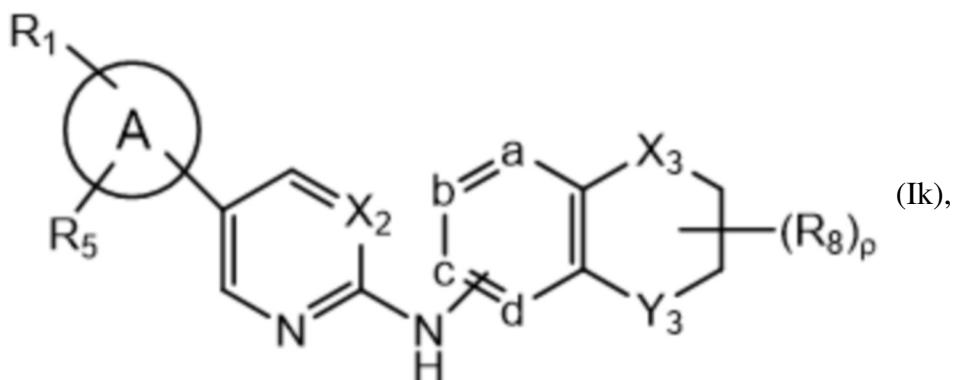
11. Соединение по п. 1, имеющее формулу Ij:



где:

Y представляет собой C(R₅) или N.

12. Соединение по п. 1, имеющее формулу Ik:



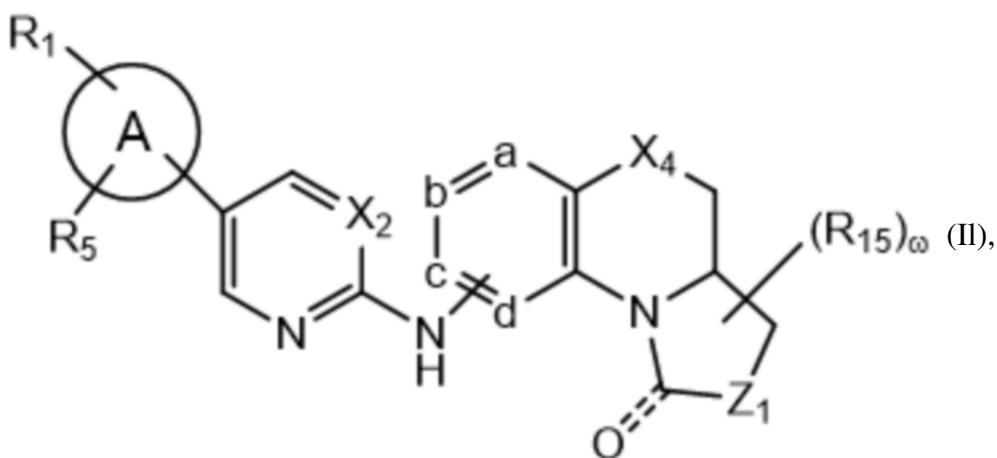
где:

a, b, c и d, каждый, независимо представляют собой С или N, где по меньшей мере один из a, b, c и d представляет собой N, и не более двух из a, b, c и d представляют собой N;

X₃ и Y₃, каждый, независимо представляют собой -O-, -CH₂- или -N(R₈)-;

ρ равен 1, 2 или 3.

13. Соединение по п. 1, имеющее формулу II:



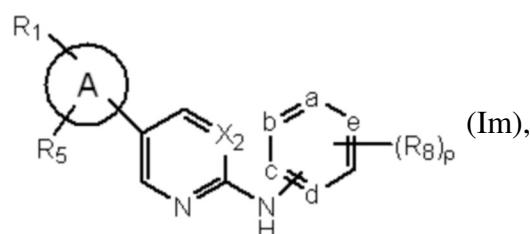
где:

— предстает необязательную двойную связь;

а, б, с и д, каждый, независимо представляют собой С или N, где по меньшей мере один из а, б, с и д представляет собой N, и не более двух из а, б, с, д и е представляют собой N;

Х₄ и Z₁, каждый, независимо представляют собой -O-, -N(R₁₅)- или -C(R₁₅)(R₁₅)-; и ω равен 1, 2 или 3.

14. Соединение по п. 1, имеющее формулу Im:

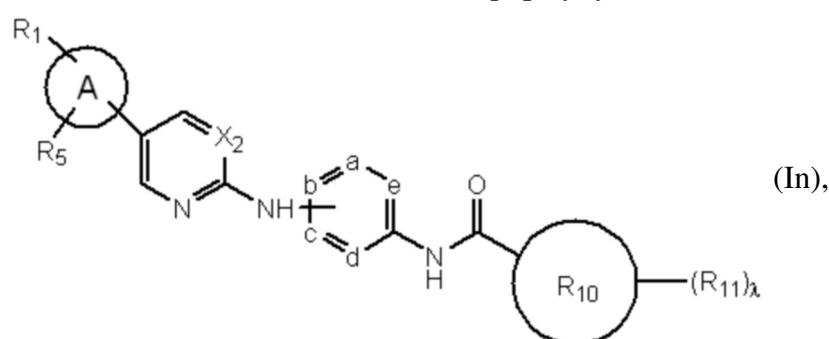


где:

а, б, с, д и е, каждый, независимо представляют собой С или N, где по меньшей мере один из а, б, с, д и е представляет собой N, и не более двух из а, б, с, д и е представляют собой N; и

ρ равен 1, 2 или 3.

15. Соединение по п. 1, имеющее формулу In:

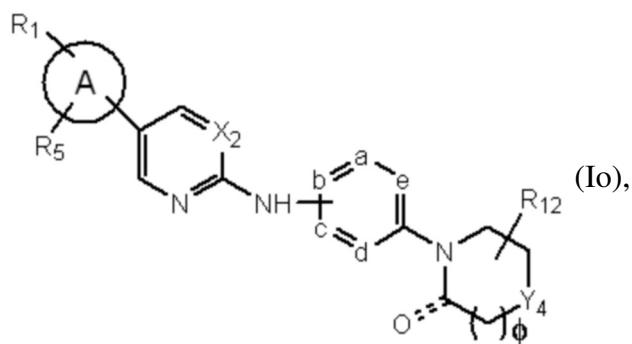


где:

а, б, с, д и е, каждый, независимо представляют собой С или N, где по меньшей мере один из а, б, с, д и е представляет собой N, и не более двух из а, б, с, д и е представляют собой N; и

λ равен 1, 2 или 3.

16. Соединение по п. 1, имеющее формулу Io:



где:

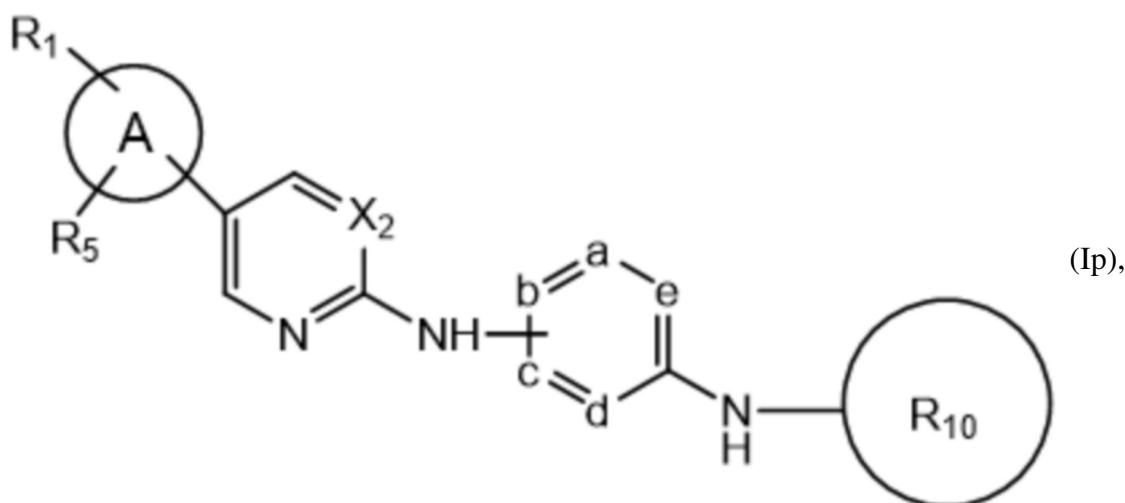
— предстает необязательную двойную связь;

а, б, с, д и е, каждый, независимо представляют собой С или N, где по меньшей мере один из а, б, с, д и е представляет собой N, и не более двух из а, б, с, д и е представляют собой N;

Y₄ представляет собой -O-, -N(R₁₂)- или -C(R₁₂)(R₁₂)-; и

Ф равен 0, 1 или 2.

17. Соединение по п. 1, имеющее формулу Ip:



где:

а, б, с, д и е, каждый, независимо представляют собой С или N, где по меньшей мере один из а, б, с, д и е представляет собой N, и не более двух из а, б, с, д и е представляют собой N.

18. Соединение по п. 1, выбранное из группы, состоящей из таких соединений:

N, N-диметил-4-(6-(пиридин-3-иламино)пиридин-3-ил)бензамид,

4-(6-((5-(3-бензил-2-оксоимидазолидин-1-ил)пиридин-3-ил)амино)пиридин-3-ил)-N,

N-диметилбензамид,

1-(4-(6-(пиридин-3-иламино)пиридин-3-ил)фенил)пирролидин-2-он,

N, N-диметил-4-(6-((5-(2-оксопирролидин-1-ил)пиридин-3-ил)амино)пиридин-3-ил)бензамид,

N, N-диметил-4-(6-((5-(N-метилметилсульфонамило)пиридин-3-ил)амино)пиридин-3-ил)бензамид,

4-(6-((5-(1-цианоциклогексил)пиридин-3-ил)амино)пиридин-3-ил)-N, N-диметилбензамид,

N, N-диметил-4-(6-((1-(метилсульфонил)-1H-пирроло[3,2-b]пиридин-6-ил)амино)пиридин-3-ил)бензамид,

N, N-диметил-4-(6-((1-(метилсульфонил)-2,3-дигидро-1H-пиридо[2,3-b][1,4]оксазин-7-ил)амино)пиридин-3-ил)бензамид,

N, N-диметил-4-((5-оксо-3-(пиридин-3-илметил)имидазолидин-1-ил)пиридин-3-ил)амино)пиридин-3-ил)бензамид,

4-((5-оксоимидазолидин-1-ил)пиридин-3-ил)амино)пиразин-2-ил)-N, N-диметилбензамид,

N, N-диметил-4-((5-оксопирролидин-1-ил)пиридин-3-ил)амино)пиразин-2-ил)бензамид

азетидин-1-ил(4-(6-(пиридин-3-иламино)пиридин-3-ил)фенил)метанон,

4-((5-(N-циклогексилметилсульфонамида)пиридин-3-ил)амино)пиридин-3-ил)-N, N-диметилбензамид,

N, N-диметил-4-((5-оксо-3-(тиазол-4-илметил)имидазолидин-1-ил)пиридин-3-ил)амино)пиридин-3-ил)бензамид,

4-((1-ацетил-2,3-дигидро-1Н-пиридо[2,3-*b*][1,4]оксазин-7-ил)амино)пиридин-3-ил)-N, N-диметилбензамид,

4-((5-(4-метоксибензил)-2-оксоимидазолидин-1-ил)пиридин-3-ил)амино)пиридин-3-ил)-N, N-диметилбензамид,

N, N-диметил-4-((5-оксо-3-((тетрагидрофуран-2-ил)метил)имидазолидин-1-ил)пиридин-3-ил)амино)пиридин-3-ил)бензамид,

N, N-диметил-4-((5-(N-метил-2-фенилциклогексан-1-карбоксамида)пиридин-3-ил)амино)пиридин-3-ил)бензамид,

N, N-диметил-4-((5-оксоимидазолидин-1-ил)пиридин-3-ил)амино)пиридин-3-ил)бензамид,

N, N-диметил-4-((5-(N-метилпропан-2-илсульфонамида)пиридин-3-ил)амино)пиридин-3-ил)бензамид,

N, N-диметил-4-((5-(N-метилциклогексансульфонамида)пиридин-3-ил)амино)пиридин-3-ил)бензамид,

4-((5-ацетамида)пиридин-3-ил)амино)пиридин-3-ил)-N, N-диметилбензамид,

2-фтор-N, N-диметил-4-((5-оксопирролидин-1-ил)пиридин-3-ил)амино)пиридин-3-ил)бензамид,

N, N-диметил-4-((5-(3-метил-2-оксоимидазолидин-1-ил)пиридин-3-ил)амино)пиридин-3-ил)бензамид,

3-фтор-N, N-диметил-4-((5-(2-оксопирролидин-1-ил)пиридин-3-ил)амино)пиридин-3-ил)бензамид,

N, N-диметил-4-((5-(2-оксо-2-((пиридин-3-илметил)амино)этил)пиридин-3-ил)амино)пиридин-3-ил)бензамид,

(S)-4-((5-(4-изопропил-2,5-диоксоимидазолидин-1-ил)пиридин-3-ил)амино)пиридин-3-ил)-N, N-диметилбензамид,

2,5-дифтор-N, N-диметил-4-((5-(2-оксопирролидин-1-ил)пиридин-3-ил)амино)пиридин-3-ил)бензамид,

N-(фуран-2-илметил)-N-метил-4-((пиридин-3-иламино)пиридин-3-ил)бензамид,

N, N-диметил-4-((5-(3-оксоморфолино)пиридин-3-ил)амино)пиридин-3-ил)бензамид,

4-((5-(диметиламино)-2-оксоэтил)пиридин-3-ил)амино)пиридин-3-ил)-N, N-диметилбензамид,

4-((2-метоксипирамидин-5-ил)амино)пиридин-3-ил)-N, N-диметилбензамид,

N, N-диметил-4-((4-метил-6-(пиридин-3-иламино)пиридин-3-ил)бензамид,

4-((5-(N-изопропилметилсульфонамида)пиридин-3-ил)амино)пиридин-3-ил)-N, N-диметилбензамид,

4-((5-(1-карбамоилциклогексил)пиридин-3-ил)амино)пиридин-3-ил)-N, N-диметилбензамид,

4-((5-метоксипиридин-3-ил)амино)пиридин-3-ил)-N, N-диметилбензамид,

N-этил-N-метил-4-((6-(пиридин-3-иламино)пиридин-3-ил)бензамид,

A
2020124138
RU

5-(4-(4-метил-4Н-1,2,4-триазол-3-ил)фенил)-N-(пиридин-3-ил)пиридин-2-амин,
N, N-диметил-4-(6-(пиrimидин-5-иламино)пиридин-3-ил)бензамид,
4-((5-цианопиридин-3-ил)амино)пиридин-3-ил)-N, N-диметилбензамид,
N-бензил-N-метил-4-(6-(пиридин-3-иламино)пиридин-3-ил)бензамид,
N, N-диметил-4-(6-(пиридин-3-иламино)пиридин-3-ил)бензенсульфонамид,
N, N,2-триметил-4-(6-(пиридин-3-иламино)пиридин-3-ил)бензамид,
(4-(6-(пиридин-3-иламино)пиридин-3-ил)фенил)(пирролидин-1-ил)метанон,
N, N-диметил-4-(6-((2-метилпиrimидин-5-ил)амино)пиридин-3-ил)бензамид,
N, N-диметил-6'-(пиридин-3-иламино)-[3,3'-бипиридин]-6-карбоксамид,
4-((1-бензил-6-оксо-1,6-дигидропиридин-3-ил)амино)пиридин-3-ил)-N, N-
диметилбензамид,
N, N-диметил-4-(6-((2-метилпиридин-3-ил)амино)пиридин-3-ил)бензамид,
N, N-диметил-6'-(пиридин-3-иламино)-[2,3'-бипиридин]-5-карбоксамид,
5-((5-(4-(диметилкарбамоил)фенил)пиридин-2-ил)амино)-N, N-диметилникотинамид,
N, N-диметил-4-(6-(пиридин-3-иламино)пиридин-3-ил)циклогекс-3-ен-1-карбоксамид,
N, N-диметил-4-(6-(пиразин-2-иламино)пиридин-3-ил)бензамид,
N-метил-4-(6-((5-(2-оксопирролидин-1-ил)пиридин-3-ил)амино)пиридин-3-ил)бензамид,
(1r,4r)-N, N-диметил-4-(6-(пиридин-3-иламино)пиридин-3-ил)циклогексан-1-
карбоксамид,
N, N,3-триметил-4-(6-(пиридин-3-иламино)пиридин-3-ил)бензамид,
N-метил-N-(4-(6-(пиридин-3-иламино)пиридин-3-ил)фенил)ацетамид,
N-метил-4-(6-(пиридин-3-иламино)пиридин-3-ил)-N-(пиридин-3-илметил)бензамид,
N, N-диметил-3-(6-(пиридин-3-иламино)пиридин-3-ил)пропиоламид,
(1s,4s)-N, N-диметил-4-(6-(пиридин-3-иламино)пиридин-3-ил)циклогексан-1-
карбоксамид,
N, N-диметил-4-(6-((2-оксо-1,2-дигидропиридин-4-ил)амино)пиридин-3-ил)бензамид,
2-фтор-N, N-диметил-4-(5-((5-(2-оксопирролидин-1-ил)пиридин-3-ил)амино)пиразин-
2-ил)бензамид,
3-фтор-N, N-диметил-4-(5-((5-(2-оксопирролидин-1-ил)пиридин-3-ил)амино)пиразин-
2-ил)бензамид,
N, N-диметил-4-(5-(пиридин-3-иламино)пиразин-2-ил)бензамид,
2,5-дифтор-N, N-диметил-4-(5-((5-(2-оксопирролидин-1-ил)пиридин-3-ил)амино)
пиразин-2-ил)бензамид,
N, N-диметил-4-(6-((6-морфолинопиридин-3-ил)амино)пиридин-3-ил)бензамид,
4-(6-((1-ацетил-4-метил-1,2,3,4-тетрагидропиридо[2,3-b]пиразин-7-ил)амино)пиридин-
3-ил)-N, N-диметилбензамид,
4-((2,3-дигидро-1Н-пиридо[2,3-b][1,4]оксазин-7-ил)амино)пиридин-3-ил)-N, N-
диметилбензамид,
трет-бутил 7-((5-(4-(диметилкарбамоил)фенил)пиридин-2-ил)амино)-2,3-дигидро-1Н-
пиридо[2,3-b][1,4]оксазин-1-карбоксилат,
N, N-диметил-4-(6-((5-(1-оксоизоиндолин-2-ил)пиридин-3-ил)амино)пиридин-3-ил)
бензамид,
(R)-N, N-диметил-4-(6-((5-(2-оксо-3-(1-фенилэтил)имидазолидин-1-ил)пиридин-3-ил)
амино)пиридин-3-ил)бензамид,
(S)-N, N-диметил-4-(6-((5-(2-оксо-3-(1-фенилэтил)имидазолидин-1-ил)пиридин-3-ил)
амино)пиридин-3-ил)бензамид,
4-(4-этил-6-(пиридин-3-иламино)пиридин-3-ил)-N, N-диметилбензамид,
4-((5-(3-(циклогексан-1-ил)амино)пиридин-3-ил)амино)пиридин-3-ил)-N, N-диметилбензамид,
4-((1-бензоил-2,3-дигидро-1Н-пиридо[2,3-b][1,4]оксазин-7-ил)амино)пиридин-3-

R
U
2020124138
A

ил)-N, N-диметилбензамид,
(E)-4-((5-(3-(4-(диметиламино)бут-2-енамидо)бензамидо)пиридин-3-ил)амино)пиридин-3-ил)-N, N-диметилбензамид,
4-((5-(3-аминобензамидо)пиридин-3-ил)амино)пиридин-3-ил)-N, N-диметилбензамид,
трет-бутил (3-((5-((4-(диметилкарбамоил)фенил)пиридин-2-ил)амино)пиридин-3-ил)амино)-3-оксопропил)фенил)карбамат,
4-((5-(3-аминофенил)пропанамидо)пиридин-3-ил)амино)пиридин-3-ил)-N, N-диметилбензамид,
(E)-4-((5-(3-(4-(диметиламино)бут-2-енамидо)фенил)пропанамидо)пиридин-3-ил)амино)пиридин-3-ил)-N, N-диметилбензамид,
трет-бутил (3-((5-((4-(диметилкарбамоил)фенил)пиридин-2-ил)амино)пиридин-3-ил)карбамоил)фенил)карбамат,
N, N-диметил-4-((1-пиколиноил-2,3-дигидро-1H-пиридо[2,3-b][1,4]оксазин-7-ил)амино)пиридин-3-ил)бензамид,
трет-бутил (3-((5-((5-(4-(диметилкарбамоил)фенил)пиридин-2-ил)амино)пиридин-2-ил)метил)карбамоил)фенил)карбамат,
(E)-4-((6-((3-(4-(диметиламино)бут-2-енамидо)бензамидо)метил)пиридин-3-ил)амино)пиридин-3-ил)-N, N-диметилбензамид,
N, N-диметил-4-((1-пивалоил-2,3-дигидро-1H-пиридо[2,3-b][1,4]оксазин-7-ил)амино)пиридин-3-ил)бензамид,
4-((1-(циклогексанкарбонил)-2,3-дигидро-1H-пиридо[2,3-b][1,4]оксазин-7-ил)амино)пиридин-3-ил)-N, N-диметилбензамид,
метил 7-((5-(4-(диметилкарбамоил)фенил)пиридин-2-ил)амино)-2,3-дигидро-1H-пиридо[2,3-b][1,4]оксазин-1-карбоксилат,
N-метил-4-((6-(пиридин-3-иламино)пиридин-3-ил)амино)-N-(тиазол-5-илметил)бензамид,
1-((4-((2,3-дигидро-[1,4]диоксино[2,3-b]пиридин-7-ил)амино)пиридин-3-ил)фенил)пирролидин-2-он,
(R)-2-((5-(4-(2-оксопирролидин-1-ил)фенил)пиридин-2-ил)амино)-6,6a,7,8-тетрагидро-9H-пиридо[2,3-b]пирроло[1,2-d][1,4]оксазин-9-он,
4-((3,4-дигидро-2H-пирано[2,3-b]пиридин-6-ил)амино)пиридин-3-ил)-N, N-диметилбензамид,
N, N-диметил-4-((6-(2-морфолиноэтил)пиридин-3-ил)амино)пиридин-3-ил)бензамид,
4-((2,3-дигидро-[1,4]диоксино[2,3-b]пиридин-7-ил)амино)пиридин-3-ил)-N, N-диметилбензамид,
4-((5-(диформетокси)пиридин-3-ил)амино)пиридин-3-ил)-N, N-диметилбензамид,
1-((4-((1-ацетил-2,3-дигидро-1H-пиридо[2,3-b][1,4]оксазин-7-ил)амино)пиридин-3-ил)фенил)пирролидин-2-он,
N, N-диметил-4-((5-(2-морфолиноэтил)пиридин-3-ил)амино)пиридин-3-ил)бензамид,
4-((1-(2-гидроксиацетил)-2,3-дигидро-1H-пиридо[2,3-b][1,4]оксазин-7-ил)амино)пиридин-3-ил)-N, N-диметилбензамид,
N, N-диметил-4-((2-оксо-2,3-дигидро-1H-пиридо[2,3-b][1,4]оксазин-7-ил)амино)пиридин-3-ил)бензамид,
4-((5-аминопиридин-3-ил)амино)пиридин-3-ил)-N, N-диметилбензамид,
4-((1-(2-гидроксипропаноил)-2,3-дигидро-1H-пиридо[2,3-b][1,4]оксазин-7-ил)амино)пиридин-3-ил)-N, N-диметилбензамид,
1-((5-(4-(диметилкарбамоил)фенил)пиридин-2-ил)амино)-2,3-дигидро-1H-пиридо[2,3-b][1,4]оксазин-1-ил)-1-оксопропан-2-ил ацетат,
4-((1-(3-гидрокси-2,2-диметилпропаноил)-2,3-дигидро-1H-пиридо[2,3-b][1,4]оксазин-7-ил)амино)пиридин-3-ил)-N, N-диметилбензамид,
4-((5-(3-(4-аминобензил)-2-оксомидазолидин-1-ил)амино)пиридин-3-ил)амино)пиридин-

R U 2020124138 A

3-ил)-N, N-диметилбензамид,
4-((5-(3-аминобензил)-2-оксоимидазолидин-1-ил)пиридин-3-ил)амино)пиридин-3-ил)-N, N-диметилбензамид,
4-((5-(3-(3-аминофенил)пропанамидо)бензил)-2-оксоимидазолидин-1-ил)пиридин-3-ил)амино)пиридин-3-ил)-N, N-диметилбензамид,
(E)-4-((5-(3-(3-(4-(диметиламино)бут-2-енамидо)фенил)пропанамидо)бензил)-2-оксоимидазолидин-1-ил)пиридин-3-ил)-N, N-диметилбензамид,
4-((5-(3-(2-аминоацетамидо)бензил)-2-оксоимидазолидин-1-ил)пиридин-3-ил)амино)пиридин-3-ил)-N, N-диметилбензамид,
4-((5-(3-(2-(2-аминоэтокси)этокси)пропанамидо)бензамидо)пиридин-3-ил)амино)пиридин-3-ил)-N, N-диметилбензамид,
(E)-N, N-диметил-4-((5-(3-(2-метил-6-оксо-10,13-диокса-2,7-диазагексадек-4-ен-16-амида)бензамидо)пиридин-3-ил)амино)пиридин-3-ил)-N, N-диметилбензамид,
(E)-4-((5-(3-(2-(4-(диметиламино)бут-2-енамидо)ацетамидо)бензил)-2-оксоимидазолидин-1-ил)пиридин-3-ил)амино)пиридин-3-ил)-N, N-диметилбензамид,
N, N-диметил-4-((2-метилоксазоло[4,5-b]пиридин-6-ил)амино)пиридин-3-ил)-N, N-диметилбензамид,
4-((5-([1,3]диоксоло[4,5-b]пиридин-6-иламино)пиридин-3-ил)-N, N-диметилбензамид,
4-((5-(4-аминобензамида)пиридин-3-ил)амино)пиридин-3-ил)-N, N-диметилбензамид,
(E)-4-((5-(4-(4-(диметиламино)бут-2-енамида)бензамида)пиридин-3-ил)амино)пиридин-3-ил)-N, N-диметилбензамид,
4-((5-(3-(4-аминофенил)пропанамида)пиридин-3-ил)амино)пиридин-3-ил)-N, N-диметилбензамид,
(E)-4-((5-(3-(4-(4-(диметиламино)бут-2-енамида)фенил)пропанамида)пиридин-3-ил)амино)пиридин-3-ил)-N, N-диметилбензамид,
4-((5-(3-(4-(2-аминоацетамида)бензил)-2-оксоимидазолидин-1-ил)пиридин-3-ил)амино)пиридин-3-ил)-N, N-диметилбензамид,
(E)-4-((5-(3-(4-(2-(4-(диметиламино)бут-2-енамида)ацетамида)бензил)-2-оксоимидазолидин-1-ил)пиридин-3-ил)амино)пиридин-3-ил)-N, N-диметилбензамид,
N-(3-(3-((5-(4-(диметилкарбамоил)фенил)пиридин-2-ил)амино)пиридин-3-ил)амино)-3-оксопропил)фенил)пиперидин-4-карбоксамид,
4-((5-(3-(3-(6-аминогексанамида)фенил)пропанамида)пиридин-3-ил)амино)пиридин-3-ил)-N, N-диметилбензамид,
4-((5-(3-(4-(3-аминофенил)пропанамида)бензил)-2-оксоимидазолидин-1-ил)пиридин-3-ил)-N, N-диметилбензамид,
(E)-4-((5-(3-(4-(3-(4-(диметиламино)бут-2-енамида)фенил)пропанамида)бензил)-2-оксоимидазолидин-1-ил)пиридин-3-ил)-N, N-диметилбензамид,
4-((5-(4-фторбензамида)пиридин-3-ил)амино)пиридин-3-ил)-N, N-диметилбензамид,
4-((5-(3-фторбензамида)пиридин-3-ил)амино)пиридин-3-ил)-N, N-диметилбензамид,
4-((5-(3-(2-аминоацетамида)фенил)пропанамида)пиридин-3-ил)амино)пиридин-3-ил)-N, N-диметилбензамид,
4-((5-бензамида)пиридин-3-ил)амино)пиридин-3-ил)-N, N-диметилбензамид,
4-((5-(2-цианоацетамида)пиридин-3-ил)амино)пиридин-3-ил)-N, N-диметилбензамид,
N, N-диметил-4-((5-(2-фенилацетамида)пиридин-3-ил)амино)пиридин-3-ил)-N, N-диметилбензамид,
4-((5-(2-(диметиламино)ацетамида)пиридин-3-ил)амино)пиридин-3-ил)-N, N-диметилбензамид,
N-(5-(4-(диметилкарбамоил)фенил)пиридин-2-ил)амино)пиридин-3-ил)-N, N-диметилбензамид,
пиколинамид,
N-(5-(4-(диметилкарбамоил)фенил)пиридин-2-ил)амино)пиридин-3-ил)-N, N-диметилбензамид,
изоникотинамид,

RU 2020124138 A

N-(5-((5-(4-(диметилкарбамоил)фенил)пиридин-2-ил)амино)пиридин-3-ил)-1Н-индол-6-карбоксамид,
N-(5-((5-(4-(диметилкарбамоил)фенил)пиридин-2-ил)амино)пиридин-3-ил)бензо[d]оксазол-6-карбоксамид,
N, N-диметил-4-((6-((5-(3-фенилпропанамидо)пиридин-3-ил)амино)пиридин-3-ил)бензамид,
N, N-диметил-4-((6-((5-(2-фенилциклогексан-1-карбоксамило)пиридин-3-ил)амино)пиридин-3-ил)бензамид,
4-((6-((5-(3-метоксибензамило)пиридин-3-ил)амино)пиридин-3-ил)-N, N-диметилбензамид,
4-((6-((5-(4-метоксибензамило)пиридин-3-ил)амино)пиридин-3-ил)-N, N-диметилбензамид,
N-(5-((5-(4-(диметилкарбамоил)фенил)пиридин-2-ил)амино)пиридин-3-ил)-1Н-индол-4-карбоксамид,
N-(5-((5-(4-(диметилкарбамоил)фенил)пиридин-2-ил)амино)пиридин-3-ил)тетрагидро-2Н-пиран-4-карбоксамид,
метил (5-((5-(4-(диметилкарбамоил)фенил)пиридин-2-ил)амино)пиридин-3-ил)карбамат,
N-(5-((5-(4-(диметилкарбамоил)фенил)пиридин-2-ил)амино)пиридин-3-ил)никотинамид,
N-(5-((5-(4-(диметилкарбамоил)фенил)пиридин-2-ил)амино)пиридин-3-ил)-1Н-бензо[d]имидаэол-7-карбоксамид,
(E)-4-((6-((5-(3-(3-(4-(диметиламино)бут-2-енамило)гексанамило)фенил)пропанамило)пиридин-3-ил)амино)пиридин-3-ил)-N, N-диметилбензамид,
N, N-диметил-4-((6-((5-(3-метилуреидо)пиридин-3-ил)амино)пиридин-3-ил)бензамид,
2-амино-N-(5-((5-(4-(диметилкарбамоил)фенил)пиридин-2-ил)амино)пиридин-3-ил)изоникотинамид,
(E)-4-((6-((5-(3-(2-(4-(диметиламино)бут-2-енамило)ацетамило)фенил)пропанамило)пиридин-3-ил)амино)пиридин-3-ил)-N, N-диметилбензамид,
(E)-1-(4-(диметиламино)бут-2-еноил)-N-(3-((5-((5-(4-(диметилкарбамоил)фенил)пиридин-2-ил)амино)пиридин-3-ил)амино)-3-оксопропил)фенил)пиперидин-4-карбоксамид,
N, N-диметил-3-((5-(4-(2-оксопирролидин-1-ил)фенил)пиридин-2-ил)амино)хинолин-5-карбоксамид,
1-(4-((1-пивалоил-2,3-дигидро-1Н-пиридо[2,3-b][1,4]оксазин-7-ил)амино)пиридин-3-ил)фенил)пирролидин-2-он,
N-метил-N-(5-((5-(4-(2-оксопирролидин-1-ил)фенил)пиридин-2-ил)амино)пиридин-3-ил)метансульфонамид,
N-(5-((5-(4-(диметилкарбамоил)фенил)пиридин-2-ил)амино)пиридин-3-ил)-1-гидрокси-1,3-дигидробензо[c][1,2]оксаборол-6-карбоксамид,
N-метил-3-((5-(4-(2-оксопирролидин-1-ил)фенил)пиридин-2-ил)амино)хинолин-5-карбоксамид,
1-(4-((5-(пирролидин-1-карбонил)хинолин-3-ил)амино)пиридин-3-ил)фенил)пирролидин-2-он
1-(4-((5-(3-гидроксипирролидин-1-карбонил)хинолин-3-ил)амино)пиридин-3-ил)фенил)пирролидин-2-он,
N, N-диметил-2-((5-(4-(2-оксопирролидин-1-ил)фенил)пиридин-3-ил)амино)пиридин-5-карбоксамид,
1-(4-((1-(1-гидроксициклогексан-1-карбонил)-2,3-дигидро-1Н-пиридо[2,3-b][1,4]оксазин-7-ил)амино)пиридин-3-ил)фенил)пирролидин-2-он,
N, N-диметил-4-((5-(метилсульфонамило)пиридин-3-ил)амино)пиридин-3-ил)

R U 2020124138 A

RU 2020124138 A

бензамид,
N-(5-((5-(4-(диметилкарбамоил)фенил)пиридин-2-ил)амино)пиридин-3-ил)-1-гидрокси-1,3-дигидробензо[с][1,2]оксаборол-5-карбоксамид,
4-((5-(3-аминобензил)-2-оксопирролидин-1-ил)амино)пиридин-3-ил)-N, N-диметилбензамид,
1-((4-((1-изобутирил-2,3-дигидро-1Н-пиридо[2,3-*b*][1,4]оксазин-7-ил)амино)пиридин-3-ил)фенил)пирролидин-2-он,
1-((4-((1-(метилсульфонил)-2,3-дигидро-1Н-пиридо[2,3-*b*][1,4]оксазин-7-ил)амино)пиридин-3-ил)фенил)пирролидин-2-он,
N-(2-метокси-5-((5-(4-(2-оксопирролидин-1-ил)фенил)пиридин-2-ил)амино)пиридин-3-ил)ацетамид,
N-(2-метокси-5-((5-(4-(2-оксопирролидин-1-ил)фенил)пиридин-2-ил)амино)пиридин-3-ил)-N-метилметансульфонамид,
1-((5-((5-(4-(2-оксопирролидин-1-ил)фенил)пиридин-2-ил)амино)пиридин-3-ил)-3-(тиазол-4-илметил)имидализолидин-2-он,
метил 7-((5-(4-(2-оксопирролидин-1-ил)фенил)пиридин-2-ил)амино)-2,3-дигидро-1Н-пиридо[2,3-*b*][1,4]оксазин-1-карбоксилат,
1-((4-((1-(циклогексилсульфонил)-2,3-дигидро-1Н-пиридо[2,3-*b*][1,4]оксазин-7-ил)амино)пиридин-3-ил)фенил)пирролидин-2-он,
N-(2-метокси-5-((5-(4-(2-оксопирролидин-1-ил)фенил)пиридин-2-ил)амино)пиридин-3-ил)метансульфонамид,
N-(2-метокси-5-((5-(4-(2-оксопирролидин-1-ил)фенил)пиридин-2-ил)амино)пиридин-3-ил)-N-метилацетамид,
1-((4-((1-(2-гидроксипропаноил)-2,3-дигидро-1Н-пиридо[2,3-*b*][1,4]оксазин-7-ил)амино)пиридин-3-ил)фенил)пирролидин-2-он,
1-((4-((1-(2-гидроксиацетил)-2,3-дигидро-1Н-пиридо[2,3-*b*][1,4]оксазин-7-ил)амино)пиридин-3-ил)фенил)пирролидин-2-он,
1-((4-((1-(циклогексанкарбонил)-2,3-дигидро-1Н-пиридо[2,3-*b*][1,4]оксазин-7-ил)амино)пиридин-3-ил)фенил)пирролидин-2-он,
1-((оксазол-4-илметил)-3-((5-(4-(2-оксопирролидин-1-ил)фенил)пиридин-2-ил)амино)пиридин-3-ил)имидализолидин-2-он,
(S)-2-((5-(4-((R)-4-гидрокси-2-оксопирролидин-1-ил)фенил)пиридин-2-ил)амино)-6,6а,7,8-тетрагидро-9Н-пиридо[2,3-*b*]пирроло[1,2-*d*][1,4]оксазин-9-он,
(S)-2-((5-(4-((S)-4-гидрокси-2-оксопирролидин-1-ил)фенил)пиридин-2-ил)амино)-6,6а,7,8-тетрагидро-9Н-пиридо[2,3-*b*]пирроло[1,2-*d*][1,4]оксазин-9-он,
1-((4-((1-(2-гидрокси-2-метилпропаноил)-2,3-дигидро-1Н-пиридо[2,3-*b*][1,4]оксазин-7-ил)амино)пиридин-3-ил)фенил)пирролидин-2-он,
1-((оксазол-5-илметил)-3-((5-(4-(2-оксопирролидин-1-ил)фенил)пиридин-2-ил)амино)пиридин-3-ил)имидализолидин-2-он,
(S)-2-((5-(4-(2-оксопирролидин-1-ил)фенил)пиразин-2-ил)амино)-6,6а,7,8-тетрагидро-9Н-пиридо[2,3-*b*]пирроло[1,2-*d*][1,4]оксазин-9-он,
5-метокси-N-((5-(4-(2-оксопирролидин-1-ил)фенил)пиридин-2-ил)амино)пиридин-3-ил)никотинамид,
6-оксо-N-((5-(4-(2-оксопирролидин-1-ил)фенил)пиридин-2-ил)амино)пиридин-3-ил)-1,6-дигидропиридин-3-карбоксамид,
1-((4-((5-(4-(3-метоксипропаноил)пиперазин-1-ил)пиридин-3-ил)амино)пиридин-3-ил)фенил)пирролидин-2-он,
1-((4-((1-(изопропилсульфонил)-2,3-дигидро-1Н-пиридо[2,3-*b*][1,4]оксазин-7-ил)

RU 2020124138 A

амино)пиридин-3-ил)фенил)пиуролидин-2-он,
(S)-N, N-диметил-4-((9-оксо-6a,7,8,9-тетрагидро-6Н-пиридо[2,3-b]пиуроло[1,2-d]
[1,4]оксазин-2-ил)амино)пиридин-3-ил)бензамид,
2,3-дифтор-N-((5-(4-(2-оксопиуролидин-1-ил)фенил)пиридин-2-ил)амино)пиридин-
3-ил)бензамид,
(R)-1-((4-((5-(4-(тетрагидрофуран-3-карбонил)пiperазин-1-ил)пиридин-3-ил)амино)
пиридин-3-ил)фенил)пиуролидин-2-он,
(S)-1-((4-((5-(4-(тетрагидрофуран-3-карбонил)пiperазин-1-ил)пиридин-3-ил)амино)
пиридин-3-ил)фенил)пиуролидин-2-он,
(S)-2-((5-(3-фтор-4-(2-оксопиуролидин-1-ил)фенил)пиридин-2-ил)амино)-6,6a,7,8-
тетрагидро-9Н-пиридо[2,3-b]пиуроло[1,2-d][1,4]оксазин-9-он,
N-((5-(4-(2-оксопиуролидин-1-ил)фенил)пиридин-2-ил)амино)пиридин-3-ил)-2-
фенилциклогексан-1-карбоксамид,
1-этил-6-оксо-N-((5-(4-(2-оксопиуролидин-1-ил)фенил)пиридин-2-ил)амино)пиридин-
3-ил)-1,6-дигидропиридин-3-карбоксамид,
6-этокси-N-((5-(4-(2-оксопиуролидин-1-ил)фенил)пиридин-2-ил)амино)пиридин-
3-ил)никотинамид,
1-((5-(3-фтор-4-(2-оксопиуролидин-1-ил)фенил)пиридин-2-ил)амино)пиридин-3-
ил)имидазолидин-2-он,
2-метил-N-((5-(4-(2-оксопиуролидин-1-ил)фенил)пиридин-2-ил)амино)пиридин-3-
ил)морфолин-4-карбоксамид,
N-((5-(4-(2-оксопиуролидин-1-ил)фенил)пиридин-2-ил)амино)пиридин-3-ил)
морфолин-4-карбоксамид,
(1S,2S)-2-этокси-N-((5-(4-(2-оксопиуролидин-1-ил)фенил)пиридин-2-ил)амино)
пиридин-3-ил)циклогексан-1-карбоксамид,
5-метокси-N-((5-(4-(2-оксопиуролидин-1-ил)фенил)пиридин-2-ил)амино)пиридин-
3-ил)-1Н-бензо[d]имидазол-7-карбоксамид,
N-((5-(4-(2-оксопиуролидин-1-ил)фенил)пиридин-2-ил)амино)пиридин-3-ил)-2Н-
тетразол-5-карбоксамид,
(S)-8,8-диметил-2-((5-(4-(2-оксопиуролидин-1-ил)фенил)пиридин-2-ил)амино)-6,6a,7,8-
тетрагидро-9Н-пиридо[2,3-b]пиуроло[1,2-d][1,4]оксазин-9-он,
3-метил-N-((5-(4-(2-оксопиуролидин-1-ил)фенил)пиридин-2-ил)амино)пиридин-3-
ил)пiperазин-1-карбоксамид,
3-циклогексан-1-карбоксамид-N-((5-(4-(2-оксопиуролидин-1-ил)фенил)пиридин-2-ил)амино)
пиридин-3-ил)пiperазин-1-карбоксамид,
(S)-2-((5-(3-фтор-4-(2-оксопиуролидин-1-ил)фенил)пиридин-2-ил)амино)-8,8-диметил-
6,6a,7,8-тетрагидро-9Н-пиридо[2,3-b]пиуроло[1,2-d][1,4]оксазин-9-он,
(E)-4-(диметиламино)-N-((3-(3-оксо-3-((5-(4-(2-оксопиуролидин-1-ил)фенил)пиридин-
2-ил)амино)пиридин-3-ил)амино)пропил)фенил)бут-2-енамид,
4-(диметиламино)-N-((3-(3-оксо-3-((5-(4-(2-оксопиуролидин-1-ил)фенил)пиридин-
2-ил)амино)пиридин-3-ил)амино)пропил)фенил)бутанамид,
4-(4-(диметиламино)бутанамидо)-N-((5-(4-(2-оксопиуролидин-1-ил)фенил)пиридин-
2-ил)амино)пиридин-3-ил)бензамид,
(6aS)-8-метил-2-((5-(4-(2-оксопиуролидин-1-ил)фенил)пиридин-2-ил)амино)-6,6a,7,8-
тетрагидро-9Н-пиридо[2,3-b]пиуроло[1,2-d][1,4]оксазин-9-он,
(R)-2-((5-(3-фтор-4-(2-оксопиуролидин-1-ил)фенил)пиридин-2-ил)амино)-6,6a,7,8-
тетрагидро-9Н-пиридо[2,3-b]пиуроло[1,2-d][1,4]оксазин-9-он,
(S)-2'-((5-(4-(2-оксопиуролидин-1-ил)фенил)пиридин-2-ил)амино)-6a',7'-дигидро-
6'Н,9'Н-спиро[циклогексан-1,8'-пиридо[2,3-b]пиуроло[1,2-d][1,4]оксазин]-9'-он,
(6aS)-2-((5-(3-фтор-4-(2-оксопиуролидин-1-ил)фенил)пиридин-2-ил)амино)-8-метил-

6,6a,7,8-тетрагидро-9Н-пиридо[2,3-*b*]пирроло[1,2-*d*][1,4]оксазин-9-он,
(E)-4-(4-(диметиламино)бут-2-енамидо)-N-(5-((5-(4-(2-оксопирролидин-1-ил)фенил)пиридин-2-ил)амино)пиридин-3-ил)бензамид,
2-циклогексил-N-(5-((5-(4-(2-оксопирролидин-1-ил)фенил)пиридин-2-ил)амино)пиридин-3-ил)морфолин-4-карбоксамид,
(S)-2-((5-(3-фтор-4-(2-оксопирролидин-1-ил)фенил)-4-метоксиридиин-2-ил)амино)-6,6a,7,8-тетрагидро-9Н-пиридо[2,3-*b*]пирроло[1,2-*d*][1,4]оксазин-9-он,
(S)-2-((4'-(дифторметил)-5-(2-оксопирролидин-1-ил)-[2,3'-бипиридин]-6'-ил)амино)-6,6a,7,8-тетрагидро-9Н-пиридо[2,3-*b*]пирроло[1,2-*d*][1,4]оксазин-9-он,
(S)-2-((5-(3-фтор-4-(2-оксопирролидин-1-ил)фенил)-4-метилридиин-2-ил)амино)-6,6a,7,8-тетрагидро-9Н-пиридо[2,3-*b*]пирроло[1,2-*d*][1,4]оксазин-9-он,
(E)-4-(диметиламино)-N-(2-оксо-2-((3-((2-оксо-3-(5-((4-(2-оксопирролидин-1-ил)фенил)амино)этил)бут-2-енамид),
(S)-2-((5-(3,5-дифтор-4-(2-оксопирролидин-1-ил)фенил)пиридин-2-ил)амино)-6,6a,7,8-тетрагидро-9Н-пиридо[2,3-*b*]пирроло[1,2-*d*][1,4]оксазин-9-он,
(S)-2-((5-(2,5-дифтор-4-(2-оксопирролидин-1-ил)фенил)пиридин-2-ил)амино)-6,6a,7,8-тетрагидро-9Н-пиридо[2,3-*b*]пирроло[1,2-*d*][1,4]оксазин-9-он,
(S)-2-((5-(4-(2-оксопирролидин-1-ил)фенил)пиридин-2-ил)амино)-6,6a,7,8-тетрагидро-9Н-пиридо[2,3-*b*]пирроло[1,2-*d*][1,4]оксазин-9-он,
(S)-2-((6-метил-5-(4-(2-оксопирролидин-1-ил)фенил)пиридин-2-ил)амино)-6,6a,7,8-тетрагидро-9Н-пиридо[2,3-*b*]пирроло[1,2-*d*][1,4]оксазин-9-он,
N, N-диметил-4-(2-(пиридин-3-иламино)пиридин-5-ил)бензамид,
(S)-2'-(4-циклогексил-5-(4-(2-оксопирролидин-1-ил)фенил)пиридин-2-ил)амино)-6a',7'-дигидро-6'Н,9'Н-спиро[циклогексан-1,8'-пиридо[2,3-*b*]пирроло[1,2-*d*][1,4]оксазин]-9'-он,
(S)-2-((4-циклогексил-5-(4-(2-оксопирролидин-1-ил)фенил)пиридин-2-ил)амино)-6,6a,7,8-тетрагидро-9Н-пиридо[2,3-*b*]пирроло[1,2-*d*][1,4]оксазин-9-он,
(R)-8-((5-(4-(2-оксопирролидин-1-ил)фенил)пиридин-2-ил)амино)-3а,4-дигидро-1Н,3Н-оксазоло[3,4-*d*]пиридо[2,3-*b*][1,4]оксазин-1-он,
(S)-2'-(4-изопропил-5-(4-(2-оксопирролидин-1-ил)фенил)пиридин-2-ил)амино)-6a',7'-дигидро-6'Н,9'Н-спиро[циклогексан-1,8'-пиридо[2,3-*b*]пирроло[1,2-*d*][1,4]оксазин]-9'-он,
(S)-2-((4-(2-аминогексан-2-ил)-5-(2-фтор-4-(2-оксопирролидин-1-ил)фенил)пиридин-2-ил)амино)-6,6a,7,8-тетрагидро-9Н-пиридо[2,3-*b*]пирроло[1,2-*d*][1,4]оксазин-9-он,
(S)-2'-(4-циклогексил-5-(4-(2-оксопирролидин-1-ил)фенил)пиридин-2-ил)амино)-6a',7'-дигидро-6'Н,9'Н-спиро[циклогексан-1,8'-пиридо[2,3-*b*]пирроло[1,2-*d*][1,4]оксазин]-9'-он,
(S)-2'-(5-(2-метил-4-(2-оксопирролидин-1-ил)фенил)пиридин-2-ил)амино)-6a',7'-дигидро-6'Н,9'Н-спиро[циклогексан-1,8'-пиридо[2,3-*b*]пирроло[1,2-*d*][1,4]оксазин]-9'-он,
(S)-2'-(4-метокси-5-(4-(2-оксопирролидин-1-ил)фенил)пиридин-2-ил)амино)-6a',7'-дигидро-6'Н,9'Н-спиро[циклогексан-1,8'-пиридо[2,3-*b*]пирроло[1,2-*d*][1,4]оксазин]-9'-он,
(S)-2'-(5-(2-метил-4-(2-оксопирролидин-1-ил)фенил)пиридин-2-ил)амино)-6a',7'-дигидро-6'Н,9'Н-спиро[циклогексан-1,8'-пиридо[2,3-*b*]пирроло[1,2-*d*][1,4]оксазин]-9'-он,
(S)-2'-(4-метил-5-(4-(2-оксопирролидин-1-ил)фенил)пиридин-2-ил)амино)-6a',7'-дигидро-6'Н,9'Н-спиро[циклогексан-1,8'-пиридо[2,3-*b*]пирроло[1,2-*d*][1,4]оксазин]-9'-он,

дигидро-6'Н,9'Н-спиро[циклопропан-1,8'-пиридо[2,3-б]пирроло[1,2-д][1,4]оксазин]-9'-он,

(S)-2-((5-(2-метил-4-(2-оксопирролидин-1-ил)фенил)пиридин-2-ил)амино)-6,6а,7,8-тетрагидро-9Н-пиридо[2,3-б]пирроло[1,2-д][1,4]оксазин-9-он,

(S)-2'-(4-амино-5-(4-(2-оксопирролидин-1-ил)фенил)пиридин-2-ил)амино)-6а',7'-дигидро-6'Н,9'Н-спиро[циклопропан-1,8'-пиридо[2,3-б]пирроло[1,2-д][1,4]оксазин]-9'-он,

(S)-2'-(4-метил-5-(4-(2-оксопирролидин-1-ил)фенил)пиридин-2-ил)амино)-6а',7'-дигидро-6'Н,9'Н-спиро[циклопропан-1,8'-пиридо[2,3-б]пирроло[1,2-д][1,4]оксазин]-9'-он,

(S)-2-((4-амино-5-(4-(2-оксопирролидин-1-ил)фенил)пиридин-2-ил)амино)-6,6а,7,8-тетрагидро-9Н-пиридо[2,3-б]пирроло[1,2-д][1,4]оксазин-9-он,

(S)-2-((4-метил-5-(4-(2-оксопирролидин-1-ил)фенил)пиридин-2-ил)амино)-6,6а,7,8-тетрагидро-9Н-пиридо[2,3-б]пирроло[1,2-д][1,4]оксазин-9-он,

(S)-2-((4-метокси-5-(4-(2-оксопирролидин-1-ил)фенил)пиридин-2-ил)амино)-6,6а,7,8-тетрагидро-9Н-пиридо[2,3-б]пирроло[1,2-д][1,4]оксазин-9-он,

(S)-2-((4-(метоксиметил)-5-(4-(2-оксопирролидин-1-ил)фенил)пиридин-2-ил)амино)-6а',7'-дигидро-6'Н,9'Н-спиро[циклопропан-1,8'-пиридо[2,3-б]пирроло[1,2-д][1,4]оксазин]-9'-он,

(S)-2'-(5-(4-(2-оксопирролидин-1-ил)фенил)пиридин-2-ил)амино)-6а',7'-дигидро-6'Н,9'Н-спиро[циклопропан-1,8'-пиридо[2,3-б]пирроло[1,2-д][1,4]оксазин]-9'-он,

(S)-2-((3-метил-5-(4-(2-оксопирролидин-1-ил)фенил)пиридин-2-ил)амино)-6,6а,7,8-тетрагидро-9Н-пиридо[2,3-б]пирроло[1,2-д][1,4]оксазин-9-он,

(S)-2-((5-(2-метил-4-(2-оксопирролидин-1-ил)фенил)пиридин-2-ил)амино)-6,6а,7,8-тетрагидро-9Н-пиридо[2,3-б]пирроло[1,2-д][1,4]оксазин-9-он,

(S)-2-((4-циклопропил-5-(3-фтор-4-(2-оксопирролидин-1-ил)фенил)пиридин-2-ил)амино)-6,6а,7,8-тетрагидро-9Н-пиридо[2,3-б]пирроло[1,2-д][1,4]оксазин-9-он,

(S)-2-((4-циклопропил-5-(4-(2-оксопирролидин-1-ил)фенил)пиридин-2-ил)амино)-6,6а,7,8-тетрагидро-9Н-пиридо[2,3-б]пирроло[1,2-д][1,4]оксазин-9-он,

(S)-2-((5-(3-фтор-4-(2-оксопирролидин-1-ил)фенил)пиридин-2-ил)амино)-6,6а,7,8-тетрагидро-9Н-пиридо[2,3-б]пирроло[1,2-д][1,4]оксазин-9-он,

(S)-2-((5-(3-фтор-4-(2-оксопирролидин-1-ил)фенил)-4-изопропилпиридин-2-ил)амино)-6,6а,7,8-тетрагидро-9Н-пиридо[2,3-б]пирроло[1,2-д][1,4]оксазин-9-он,

(S)-2-((4-изопропил-5-(4-(2-оксопирролидин-1-ил)фенил)пиридин-2-ил)амино)-6,6а,7,8-тетрагидро-9Н-пиридо[2,3-б]пирроло[1,2-д][1,4]оксазин-9-он,

(S)-2-((5-(2-фтор-4-(2-оксопирролидин-1-ил)фенил)пиридин-2-ил)амино)-6,6а,7,8-тетрагидро-9Н-пиридо[2,3-б]пирроло[1,2-д][1,4]оксазин-9-он,

1-(4-((5-(5-метил-1,1-диокси-1,2,5-тиадиазолидин-2-ил)пиридин-3-ил)амино)пиридин-3-ил)фенил)пиридин-2-он,

(E)-4-(диметиламино)-N-(2-оксо-2-((4-((2-оксо-3-(5-(4-(2-оксопирролидин-1-ил)фенил)пиридин-2-ил)амино)пиридин-3-ил)имида-1-ил)метил)фенил)амино)этил)бут-2-енамид,

(6aS)-2-((5-(3-фтор-4-(2-оксопирролидин-1-ил)фенил)пиридин-2-ил)амино)-8-гидрокси-6,6а,7,8-тетрагидро-9Н-пиридо[2,3-б]пирроло[1,2-д][1,4]оксазин-9-он,

(6aS)-8-гидрокси-2-((5-(4-(2-оксопирролидин-1-ил)фенил)пиридин-2-ил)амино)-6,6а,7,8-тетрагидро-9Н-пиридо[2,3-б]пирроло[1,2-д][1,4]оксазин-9-он,

(S)-2-((4-метокси-5-(4-(2-оксопирролидин-1-ил)фенил)пиридин-2-ил)амино)-6,6а,7,8-

A
2020124138
RU

R U
2020124138
A

тетрагидро-9Н-пиридо[2,3-*b*]пирроло[1,2-*d*][1,4]оксазин-9-он,
(S)-2-((4-метил-5-(4-(2-оксопирролидин-1-ил)фенил)пиридин-2-ил)амино)-6,6а,7,8-тетрагидро-9Н-пиридо[2,3-*b*]пирроло[1,2-*d*][1,4]оксазин-9-он,
(6aR)-2-((5-(4-(1-метил-2-оксопирролидин-3-ил)фенил)пиридин-2-ил)амино)-6,6а,7,8-тетрагидро-9Н-пиридо[2,3-*b*]пирроло[1,2-*d*][1,4]оксазин-9-он,
(6aS,8R)-2-((5-(3-фтор-4-(2-оксопирролидин-1-ил)фенил)пиридин-2-ил)амино)-8-гидрокси-8-метил-6,6а,7,8-тетрагидро-9Н-пиридо[2,3-*b*]пирроло[1,2-*d*][1,4]оксазин-9-он,
(6aS,8R)-8-гидрокси-8-метил-2-((5-(4-(2-оксопирролидин-1-ил)фенил)пиридин-2-ил)амино)-6,6а,7,8-тетрагидро-9Н-пиридо[2,3-*b*]пирроло[1,2-*d*][1,4]оксазин-9-он,
N-метил-4-[6-[[5-(2-оксопирролидин-1-ил)-3-пиридил]амино]-3-пиридил]бензамид,
N, N-диметил-4-(6-((1-(метилсульфонил)-2,3-дигидро-1Н-пиридо[2,3-*b*][1,4]оксазин-7-ил)амино)пиридин-3-ил)бензамид,
4'-((5-(2-(диметиламино)-2-оксоэтил)пиридин-3-ил)амино)-N, N-диметил-[1,1'-бифенил]-4-карбоксамид,
1-(4-(6-((6-метоксиридин-3-ил)амино)пиридин-3-ил)фенил)пирролидин-2-он,
4-(6-((3-аминобензамидо)метил)пиридин-3-ил)амино)пиридин-3-ил)-N, N-диметилбензамид,
N-(5-((5-(4-(диметилкарбамоил)фенил)пиридин-2-ил)амино)пиридин-3-ил)-1Н-бензо[d]имида-4-карбоксамид,
3-((5-(4-(2-оксопирролидин-1-ил)фенил)пиридин-2-ил)амино)хинолин-5-карбоксамид,
(S)-1-(4-(6-((2-метил-1,1-диокси-2,3,3а,4-тетрагидропиридо[2,3-*b*][1,2,5]тиадиазоло[2,3-*d*][1,4]оксазин-8-ил)амино)пиридин-3-ил)фенил)пирролидин-2-он,
(S)-2-((4-(метоксиметил)-5-(4-(2-оксопирролидин-1-ил)фенил)пиридин-2-ил)амино)-6,6а,7,8-тетрагидро-9Н-пиридо[2,3-*b*]пирроло[1,2-*d*][1,4]оксазин-9-он,
(S)-2-((4-(метоксиметил)-5-(4-(2-оксопирролидин-1-ил)фенил)пиримидин-2-ил)амино)-6,6а,7,8-тетрагидро-9Н-пиридо[2,3-*b*]пирроло[1,2-*d*][1,4]оксазин-9-он,
(S)-2'-(4-(метоксиметил)-5-(4-(2-оксопирролидин-1-ил)фенил)пиримидин-2-ил)амино)-6а',7'-дигидро-6Н,9'Н-спиро[циклогексан-1,8'-пиридо[2,3-*b*]пирроло[1,2-*d*][1,4]оксазин]-9'-он,
(3S,6R)-N, N-диметил-6-((S)-9-оксо-6а,7,8,9-тетрагидро-6Н-пиридо[2,3-*b*]пирроло[1,2-*d*][1,4]оксазин-2-ил)амино)пиридин-3-ил)тетрагидро-2Н-пиран-3-карбоксамид,
(S)-2-((4-изопропил-5-(4-(2-оксопирролидин-1-ил)фенил)пиримидин-2-ил)амино)-6,6а,7,8-тетрагидро-9Н-пиридо[2,3-*b*]пирроло[1,2-*d*][1,4]оксазин-9-он,
(S)-2'-(4-изопропил-5-(4-(2-оксопирролидин-1-ил)фенил)пиримидин-2-ил)амино)-6а',7'-дигидро-6Н,9'Н-спиро[циклогексан-1,8'-пиридо[2,3-*b*]пирроло[1,2-*d*][1,4]оксазин]-9'-он,
(S)-2-((4-(3-метоксицикло-*b*утил)-5-(4-(2-оксопирролидин-1-ил)фенил)пиримидин-2-ил)амино)-6,6а,7,8-тетрагидро-9Н-пиридо[2,3-*b*]пирроло[1,2-*d*][1,4]оксазин-9-он,
(S)-2-((1'-(4-метил-4Н-1,2,4-триазол-3-ил)-1',2',3',6'-тетрагидро-[3,4'-бипиридин]-6-ил)амино)-6,6а,7,8-тетрагидро-9Н-пиридо[2,3-*b*]пирроло[1,2-*d*][1,4]оксазин-9-он,
(S)-2-((5-(4-(4-метил-4Н-1,2,4-триазол-3-ил)пиперазин-1-ил)пиридин-2-ил)амино)-6,6а,7,8-тетрагидро-9Н-пиридо[2,3-*b*]пирроло[1,2-*d*][1,4]оксазин-9-он,
(S)-2-((5-(4-(4-метилпиридин-3-ил)фенил)пиридин-2-ил)амино)-6,6а,7,8-тетрагидро-9Н-пиридо[2,3-*b*]пирроло[1,2-*d*][1,4]оксазин-9-он,
(S)-2-((5-(4-(4-метилизоксазол-5-ил)фенил)пиридин-2-ил)амино)-6,6а,7,8-тетрагидро-9Н-пиридо[2,3-*b*]пирроло[1,2-*d*][1,4]оксазин-9-он,
(S)-2-((4-изопропил-5-(4-(5-метил-1Н-1,2,3-триазол-1-ил)фенил)пиримидин-2-ил)амино)-6,6а,7,8-тетрагидро-9Н-пиридо[2,3-*b*]пирроло[1,2-*d*][1,4]оксазин-9-он,
(S)-2-((5-(3-метил-2-оксо-1-окса-3,8-диазаспиро[4.5]декан-8-ил)пиридин-2-ил)амино)

**A
2020124138**

-6,6a,7,8-тетрагидро-9Н-пиридо[2,3-*b*]пирроло[1,2-*d*][1,4]оксазин-9-он,
(S)-2-((4-морфолино-5-(4-(2-оксопирролидин-1-ил)фенил)пиrimидин-2-ил)амино)-
6,6a,7,8-тетрагидро-9Н-пиридо[2,3-*b*]пирроло[1,2-*d*][1,4]оксазин-9-он,
(S)-2-((4-(4-метилпиперазин-1-ил)-5-(4-(2-оксопирролидин-1-ил)фенил)пиrimидин-2-
ил)амино)-6,6a,7,8-тетрагидро-9Н-пиридо[2,3-*b*]пирроло[1,2-*d*][1,4]оксазин-9-он,
(S)-2-((4-(метоксиметил)-5-(4-(4-метилизоксазол-3-ил)фенил)пиridин-2-ил)амино)-
6,6a,7,8-тетрагидро-9Н-пиридо[2,3-*b*]пирроло[1,2-*d*][1,4]оксазин-9-он,
(S)-2-((5-(4-(4-метилизоксазол-3-ил)фенил)пиridин-2-ил)амино)-6,6a,7,8-тетрагидро-
9Н-пиридо[2,3-*b*]пирроло[1,2-*d*][1,4]оксазин-9-он,
(S)-2-((4-цикlobутокси-5-(4-(2-оксопирролидин-1-ил)фенил)пиridин-2-ил)амино)-
6,6a,7,8-тетрагидро-9Н-пиридо[2,3-*b*]пирроло[1,2-*d*][1,4]оксазин-9-он,
(S)-2-((4-цикlopропил-5-(4-(4-метил-4Н-1,2,4-триазол-3-ил)фенил)пиridин-2-ил)амино)-
6,6a,7,8-тетрагидро-9Н-пиридо[2,3-*b*]пирроло[1,2-*d*][1,4]оксазин-9-он,
(S)-2-((4-(3-метоксиазетидин-1-ил)-5-(4-(2-оксопирролидин-1-ил)фенил)пиrimидин-
2-ил)амино)-6,6a,7,8-тетрагидро-9Н-пиридо[2,3-*b*]пирроло[1,2-*d*][1,4]оксазин-9-он,
(S)-2-((4-метокси-5-(4-(4-метил-4Н-1,2,4-триазол-3-ил)фенил)пиrimидин-2-ил)амино)-
6,6a,7,8-тетрагидро-9Н-пиридо[2,3-*b*]пирроло[1,2-*d*][1,4]оксазин-9-он,
(S)-2-((4-метокси-5-(4-(5-метил-1Н-1,2,3-триазол-1-ил)фенил)пиrimидин-2-ил)амино)-
6,6a,7,8-тетрагидро-9Н-пиридо[2,3-*b*]пирроло[1,2-*d*][1,4]оксазин-9-он,
(S)-2-((5-(4-(5-метил-1Н-1,2,3-триазол-1-ил)фенил)пиridин-2-ил)амино)-6,6a,7,8-
тетрагидро-9Н-пиридо[2,3-*b*]пирроло[1,2-*d*][1,4]оксазин-9-он,
(S)-2-((4-метокси-5-(4-(4-метил-4Н-1,2,4-триазол-3-ил)фенил)пиridин-2-ил)амино)-
6,6a,7,8-тетрагидро-9Н-пиридо[2,3-*b*]пирроло[1,2-*d*][1,4]оксазин-9-он,
(S)-2-((5-(4-(4-метил-4Н-1,2,4-триазол-3-ил)фенил)пиridин-2-ил)амино)-6,6a,7,8-
тетрагидро-9Н-пиридо[2,3-*b*]пирроло[1,2-*d*][1,4]оксазин-9-он,
4-(4-(2-((2-2,6-диоксопиперидин-3-ил)-1,3-диоксоиндолин-4-ил)окси)ацетамидо)
бутанамидо)-N-(5-((5-(4-(2-оксопирролидин-1-ил)фенил)пиridин-2-ил)амино)пиridин-
3-ил)бензамид,
(S)-4-(4-(метоксиметил)-2-((9-оксо-6a,7,8,9-тетрагидро-6Н-пиридо[2,3-*b*]пирроло[1,2-
d][1,4]оксазин-2-ил)амино)пиrimидин-5-ил)-N, N-диметилбензамид,
(S)-4-(4-метокси-2-((9-оксо-6a,7,8,9-тетрагидро-6Н-пиридо[2,3-*b*]пирроло[1,2-*d*][1,4]
оксазин-2-ил)амино)пиrimидин-5-ил)-N, N-диметилбензамид,
(R)-8-((5-(3-фтор-4-(2-оксопирролидин-1-ил)фенил)пиridин-2-ил)амино)-3a,4-дигидро-
1Н,3Н-оксазоло[3,4-*d*]пиридо[2,3-*b*][1,4]оксазин-1-он,
4-(2-(2-(2-((2-2,6-диоксопиперидин-3-ил)-1,3-диоксоиндолин-4-ил)амино)этокси)
этокси)ацетамидо)-N-(5-((5-(4-(2-оксопирролидин-1-ил)фенил)пиridин-2-ил)
амино)пиridин-3-ил)бензамид,
(S)-2-((5-(4-(4-изобутил-4Н-1,2,4-триазол-3-ил)фенил)пиridин-2-ил)амино)-6,6a,7,8-
тетрагидро-9Н-пиридо[2,3-*b*]пирроло[1,2-*d*][1,4]оксазин-9-он,
(S)-N, N-диметил-4-(2-((9'-оксо-6a',7'-дигидро-6Н,9'Н-спиро[цикlopропан-1,8'-пиридо
[2,3-*b*]пирроло[1,2-*d*][1,4]оксазин]-2'-ил)амино)пиrimидин-5-ил)бензамид,
(S)-2-фтор-N, N-диметил-4-(2-((9-оксо-6a,7,8,9-тетрагидро-6Н-пиридо[2,3-*b*]пирроло
[1,2-*d*][1,4]оксазин-2-ил)амино)пиrimидин-5-ил)бензамид,
(S)-2-((5-(4-((R)-2-метил-5-оксопирролидин-1-ил)фенил)пиridин-2-ил)амино)-6,6a,7,8-
тетрагидро-9Н-пиридо[2,3-*b*]пирроло[1,2-*d*][1,4]оксазин-9-он,
(S)-2-((5-(4-(пиrrолидин-1-карбонил)фенил)пиrimидин-2-ил)амино)-6,6a,7,8-
тетрагидро-9Н-пиридо[2,3-*b*]пирроло[1,2-*d*][1,4]оксазин-9-он,
(S)-2-((5-(4-(азетидин-1-карбонил)фенил)пиrimидин-2-ил)амино)-6,6a,7,8-тетрагидро-
9Н-пиридо[2,3-*b*]пирроло[1,2-*d*][1,4]оксазин-9-он,
(S)-N, N-диметил-4-(2-((9-оксо-6a,7,8,9-тетрагидро-6Н-пиридо[2,3-*b*]пирроло[1,2-*d*]

**R U
2020124138**

[1,4]оксазин-2-ил)амино)пиrimидин-5-ил)бензамид,

(S)-2-((9-фтор-5,5-диметил-8-(2-оксопирролидин-1-ил)-5Н-хромено[3,4-d]пиrimидин-3-ил)амино)-6,6а,7,8-тетрагидро-9Н-пиридо[2,3-b]пирроло[1,2-d][1,4]оксазин-9-он и

(S)-2-((5-(4-(2-оксопирролидин-1-ил-4,4,5,5-d4)фенил)пиридин-2-ил)амино)-6,6а,7,8-тетрагидро-9Н-пиридо[2,3-b]пирроло[1,2-d][1,4]оксазин-9-он.

19. Фармацевтическая композиция, содержащая соединение по любому из пп. 1-18 и фармацевтически приемлемый носитель.

20. Способ лечения заболевания или расстройства, связанного с модуляцией фосфатидилинозитол-5-фосфат-4-киназы (PI5P4K), включающий введение нуждающемуся в этом пациенту эффективного количества соединения по любому из пп. 1-18.

21. Способ по п. 20, отличающийся тем, что заболевание или расстройство, связанные с модуляцией (PI5P4K), представляют собой рак или клеточно-пролиферативное расстройство, метаболическое расстройство, нейродегенеративное заболевание и воспалительное заболевание.

22. Способ ингибиования PI5P4K, включающий введение нуждающемуся в этом пациенту эффективного количества соединения по любому из пп. 1-18.

23. Способ лечения рака или клеточно-пролиферативного расстройства, включающий введение нуждающемуся в этом пациенту эффективного количества соединения по любому из пп. 1-18.

24. Способ по п. 23, отличающийся тем, что рак или клеточно-пролиферативное расстройство представляет собой лейкозы (например, острый лейкоз, острый лимфоцитарный лейкоз, острый миелоцитарный лейкоз, острый миелобластный лейкоз, острый промиелоцитарный лейкоз, острый миеломоноцитарный лейкоз, острый моноцитарный лейкоз, острый эритролейкоз, хронический лейкоз, хронический миелоцитарный лейкоз, хронический лимфоцитарный лейкоз), истинную полицитемию, лимфому (ходжкинская лимфома, неходжкинская лимфома), макроглобулинемию Вальденстрема, болезнь тяжелых цепей и солидные опухоли, такие как саркомы и карциномы (например, фибросаркома, миксосаркома, липосаркома, хондросаркома, остеогенная саркома, хордома, ангиосаркома, эндотелиосаркома, лимфангиосаркома, лимфангиоэндотелиосаркома, синовиома, мезотелиома, саркома Юинга, лейомиосаркома, рабдомиосаркома, карцинома толстой кишки, рак поджелудочной железы, рак молочной железы, рак яичника, рак предстательной железы, плоскоклеточная карцинома, базальноклеточная карцинома, адено-карцинома, карцинома потовых желез, карцинома сальных желез, папиллярная карцинома, папиллярная адено-карцинома, цистаденокарцинома, медуллярная карцинома, бронхогенная карцинома, почечно-клеточная карцинома, гепатома, карцинома желчного протока, хориокарцинома, семинома, эмбриональная карцинома, опухоль Вильмса, рак шейки матки, рак матки, рак яичка, карцинома легкого, мелкоклеточная карцинома легкого, карцинома мочевого пузыря, эпителиальная карцинома, глиома, астроцитома, медуллобластома, краинофарингиома, эпендимома, пинеалома, гемангиобластома, акустическая невринома, олигодендроглиома, шваннома, менингиома, меланома, нейробластома и ретинобластома).

25. Способ лечения рака или нейродегенеративного заболевания, включающий введение нуждающемуся в этом пациенту эффективного количества соединения по любому из пп. 1-18.

26. Способ по п. 26, отличающийся тем, что нейродегенеративное заболевание представляет собой травму головного мозга, травму спинного мозга, травму периферической нервной системы, болезнь Альцгеймера, болезнь Пика, болезнь диффузных телес Леви, прогрессирующий надъядерный паралич (синдром Стила - Ричардсона), мультисистемную дегенерацию (синдром Шая - Дрейджа), болезнь

двигательного нейрона, включая амиотрофический латеральный склероз, дегенеративную атаксию, кортико-базальную дегенерацию, комплекс АЛС - болезнь Паркинсона - деменция Гуама, подострый склерозирующий панэнцефалит, болезнь Хантингтона, болезнь Паркинсона, синуклеопатии, первичную прогрессирующую афазию, стрионигральную дегенерацию, болезнь Мачадо - Джозефа/спиноцеребеллярную атаксию типа 3 и оливопонтоцеребеллярные дегенерации, болезнь Жилля де ла Туретта, бульбарный и псевдобульбарный паралич, спинальную и спинобульбарную мышечную атрофию (болезнь Кеннеди), первичный латеральный склероз, семейную спастическую параплегию, болезнь Верднига - Гоффманна, болезнь Кугельберга - Веландер, болезнь Тея - Сакса, болезнь Сандхоффа, семейную спастическую болезнь, болезнь Вольфарта - Кугельберга - Веландер, спастический парапарез, прогрессирующую многоочаговую лейкоэнцефалопатию и прионные болезни (включая болезнь Крейтцфельда - Якоба, болезнь Герстманна - Штреусслера - Шейнкера, куру и фатальную семейную бессонницу, старческую деменцию, сосудистую деменцию, диффузную болезнь белого вещества (болезнь Бинсвангера), деменцию эндокринного или метаболического происхождения, деменцию вследствие травмы головы и диффузного повреждения головного мозга, деменцию боксеров или деменцию лобных долей, нейродегенеративные расстройства в результате ишемии головного мозга или инфаркта, включая эмболическую окклюзию и тромботическую окклюзию, а также внутричерепное кровотечение любого типа, внутричерепные и межпозвоночные поражения, наследственную церебральную ангиопатию, не невропатический наследственный амилоидоз, синдром Дауна, макроглобулинемию, вторичную семейную средиземноморскую лихорадку, синдром Макла - Уэльса, множественную миелому, панкреатический и сердечный амилоидоз, артропатию при хроническом гемодиализе и финский и айовский амилоидоз.

27. Способ лечения воспалительного заболевания, включающий введение нуждающемуся в этом пациенту эффективного количества соединения по любому из пп. 1-18.

28. Способ по п. 27, отличающийся тем, что воспалительное заболевание связано с метаболическим расстройством.

29. Способ по п. 28, отличающийся тем, что метаболическое заболевание представляет собой диабет II типа, резистентность к инсулину, сердечно-сосудистое заболевание, аритмию, атеросклероз, ишемическую болезнь сердца, гипертриглицеридемию, дислипидемию, ретинопатию, нефропатию, нейропатию, ожирение и макулярный отек.

30. Способ по п. 29, отличающийся тем, что воспалительное заболевание связано с воспалительным заболеванием кишечника.

31. Способ по п. 30, отличающийся тем, что воспалительное заболевание кишечника представляет собой илеит, язвенный колит, синдром Беррета или болезнь Крона.

32. Способ по любому из пп. 20-31, отличающийся тем, что введение проводят перорально, парентерально, подкожно, путем инъекции или путем инфузии.

33. Способ по любому из пп. 20-32, отличающийся тем, что пациента отбирают для лечения на основании амплификации генов и/или повышенной опухолевой экспрессии PI5P4K.

34. Способ по п. 34, отличающийся тем, что амплифицируемым и/или экспрессируемым геном является ген PI5P4Ka, ген PI5P4Kβ или ген PI5P4Kγ.

35. Способ по любому из пп. 20-32, отличающийся тем, что пациента отбирают для лечения на основании опухолевой экспрессии мутаций p53.

36. Способ по любому из пп. 20-32, отличающийся тем, что введение соединения индуцирует изменение клеточного цикла или жизнеспособности клеток.

37. Способ индукции блокировки клеточного цикла, апоптоза в опухолевых клетках и/или повышенной опухолеспецифической Т-клеточной иммунности, включающий

приведение клеток в контакт с эффективным количеством соединения по любому из пп. 1-18.

38. Соединение по любому из пп. 1-18 для применения в производстве лекарственного средства для лечения заболевания, связанного с ингибированием PI5P4K.

39. Применение соединения по любому из пп. 1-18 при лечении заболевания, связанного с ингибированием PI5P4K.