



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ,
ПАТЕНТАМ И ТОВАРНЫМ ЗНАКАМ

(12) ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ

(21), (22) Заявка: 2006105646/04, 23.07.2004

(30) Конвенционный приоритет:
23.07.2003 US 60/489,854

(43) Дата публикации заявки: 10.09.2007 Бюл. № 25

(85) Дата перевода заявки РСТ на национальную фазу:
26.02.2006(86) Заявка РСТ:
US 2004/023745 (23.07.2004)(87) Публикация РСТ:
WO 2005/009387 (03.02.2005)

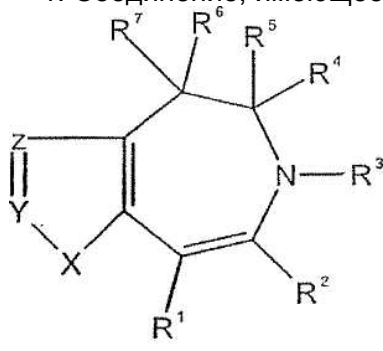
Адрес для переписки:
129010, Москва, ул. Б.Спасская, 25, стр.3,
ООО "Юридическая фирма Городисский и
Партнеры", пат.пов. Г.Б. Егоровой, рег.№ 513

(71) Заявитель(и):
ЭКСЕЛИКСИС, ИНК. (US)(72) Автор(ы):
МАРТИН Ричард (US),
ВАН Те-Линь (US),
ФЛЭТТ Брентон Т. (US),
ГУ Сяо-Хой (US)

(54) ПРОИЗВОДНЫЕ АЗЕПИНА В КАЧЕСТВЕ ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИХ АГЕНТОВ

(57) Формула изобретения

1. Соединение, имеющее формулу (I)

где X представляет собой NR^9 , O или $S(O)_t$, (где t равно от 0 до 2);Y представляет собой CR^{30} или N;Z представляет собой CR^{31} или N;

R^{30} и R^{31} являются, каждый, независимо выбранными из группы, состоящей из галогена, водорода, необязательно замещенного алкила, необязательно замещенного алкенила, необязательно замещенного алкинила, необязательно замещенного арила, необязательно замещенного гетероарила, необязательно замещенного циклоалкила, необязательно замещенного циклоалкилалкила, необязательно замещенного гетероциклила, необязательно замещенного гетероциклилалкила, необязательно замещенного аралкила, необязательно замещенного

гетероаралкила, $-OR^{32}$, $-SR^{32}$, $-N(R^{33})R^{34}$, $-N(R^{33})S(O)_2R^{23}$; $-N(R^{35})N(R^{33})R^{34}$, $-N(R^{35})N(R^{33})S(O)_2R^{23}$, $-C(O)R^{36}$, $-C(O)OR^{32}$, $-C(S)OR^{32}$, $-C(O)SR^{32}$, $-C(O)N(R^{33})R^{34}$, $-C(S)N(R^{33})R^{34}$, $-C(O)N(R^{33})S(O)_2R^{23}$, $-C(S)N(R^{33})S(O)_2R^{23}$, $-C(O)N(R^{35})N(R^{33})R^{34}$, $-C(S)N(R^{35})N(R^{33})R^{34}$ и $-C(O)N(R^{35})N(R^{33})S(O)_2R^{23}$; или

R^{30} и R^{31} вместе с атомами углерода, к которым они присоединены, образуют необязательно замещенное циклоалкильное кольцо, необязательно замещенное циклоалкенильное кольцо, необязательно замещенное циклоалкинильное кольцо, необязательно замещенное гетероциклильное кольцо, необязательно замещенное гетероарильное кольцо или необязательно замещенное арильное кольцо, за исключением замещенного или незамещенного фенила или замещенного или незамещенного нафтила;

R^{32} , R^{33} , R^{34} , R^{35} и R^{36} выбираются, как в (а) или (б), следующим образом:

(а) R^{32} , R^{33} , R^{34} , R^{35} и R^{36} представляют собой, каждый, независимо, водород, необязательно замещенный алкил, необязательно замещенный алкенил, необязательно замещенный алкинил, необязательно замещенный циклоалкил, необязательно замещенный арил, необязательно замещенный аралкил, необязательно замещенный гетероциклил, необязательно замещенный гетероарил, или необязательно замещенный гетероаралкил; или (б) R^{33} и R^{34} , вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют необязательно замещенное гетероциклильное кольцо или необязательно замещенное гетероарильное кольцо, а другие группы из R^{32} , R^{33} , R^{34} , R^{35} и R^{36} выбираются как в (а), выше;

R^1 и R^2 являются, каждый, независимо выбранными из группы, состоящей из галогена, водорода, необязательно замещенного алкила, необязательно замещенного алкенила, необязательно замещенного алкинила, необязательно замещенного арила, необязательно замещенного гетероарила, необязательно замещенного циклоалкила, необязательно замещенного гетероциклила, необязательно замещенного аралкила, необязательно замещенного гетероаралкила, $-OR^{14}$, $-SR^{14}$, $-N(R^{15})R^{16}$, $-N(R^{15})S(O)_2R^{23}$; $-N(R^{17})N(R^{15})R^{16}$, $-N(R^{17})N(R^{15})S(O)_2R^{23}$, $-C(O)R^{18}$, $-C(O)OR^{14}$, $-C(S)OR^{14}$, $-C(O)SR^{14}$, $-C(O)N(R^{15})R^{16}$, $-C(O)N(R^{15})S(O)_2R^{23}$, $-C(O)N(R^{15})N=R^{16}$, $-C(O)N(R^{17})N(R^{15})R^{16}$ и $-C(O)N(R^{17})N(R^{15})S(O)_2R^{23}$;

R^3 представляет собой водород, необязательно замещенный алкил, необязательно замещенный алкенил, необязательно замещенный алкинил, необязательно замещенный циклоалкил, необязательно замещенный арил, необязательно замещенный аралкил, необязательно замещенный гетероарил, необязательно замещенный гетероциклил, необязательно замещенный гетероаралкил, $-C(O)R^{10}$, $-C(O)OR^{10}$, $-S(O)_2R^{10}$, $-C(O)N(R^{11})R^{12}$, $-C(O)N(R^{11})S(O)_2R^{23}$, $-C(O)N(R^{13})N(R^{11})R^{12}$, $-C(O)N(R^{13})N(R^{11})S(O)_2R^{23}$, $-N(R^{13})C(O)R^{10}$, $-N(R^{13})C(O)N(R^{11})R^{12}$, $-N(R^{13})C(O)N(R^{11})S(O)_2R^{23}$, $-N(R^{10})C(O)N(R^{13})N(R^{11})R^{12}$, $-N(R^{10})C(O)N(R^{13})N(R^{11})S(O)_2R^{23}$, $-N(R^{13})C(O)OR^{10}$, $-P(O)OR^{10}$ или $-P(O)(OR^{19})OR^{12}$;

R^4 , R^5 , R^6 и R^7 являются, каждый, независимо выбранными из группы, состоящей из водорода, галогена, необязательно замещенного алкила, необязательно замещенного алкенила, необязательно замещенного алкинила, необязательно замещенного арила, необязательно замещенного гетероарила, необязательно замещенного циклоалкила, необязательно замещенного гетероциклила, необязательно замещенного аралкила, необязательно замещенного гетероаралкила, $-OR^{14}$, $-SR^{14}$, $-S(O)_2R^{14}$, $-N(R^{15})R^{16}$, $-N(R^{15})S(O)_2R^{23}$, $-N(R^{15})C(O)R^{23}$, $-C(O)R^{18}$, $-C(O)OR^{20}$, $-C(O)N(R^{21})R^{22}$, $-C(O)N(R^{21})S(O)_2R^{23}$; $-C(O)N(R^{24})N(R^{21})R^{22}$ и $-C(O)N(R^{24})N(R^{21})S(O)_2R^{23}$; или

R^6 и R^7 вместе образуют оксо, тиоксо, необязательно замещенную имино, необязательно замещенный оксим или необязательно замещенный гидразон, или R^6 и R^7 , вместе с атомом углерода, к которому они присоединены, образуют необязательно замещенную экзоциклическую двойную связь, и R^4 и R^5 являются такими, как описано выше; или

R^4 и R^5 вместе образуют оксо, тиоксо, необязательно замещенную имино,

необязательно замещенный оксим или optionally замещенный гидразон, или R^4 и R^5 , вместе с атомом углерода, к которому они присоединены, образуют optionally замещенную экзоциклическую двойную связь, и R^6 и R^7 являются такими, как описано выше; или

R^4 и R^5 , или R^4 и R^6 , или R^4 и R^7 , или R^5 и R^6 , или R^5 и R^7 , или R^6 и R^7 , вместе с атомом углерода, к которому они присоединены, образуют optionally замещенное циклоалкильное кольцо, optionally замещенное гетероциклическое кольцо, optionally замещенное циклоалкенильное кольцо или вместе образуют двойную связь, а другие группы из R^4 , R^5 , R^6 и R^7 являются такими, как описано выше; или R^4 и R^5 , вместе с атомом углерода, к которому они присоединены, и R^6 и R^7 , вместе с атомом углерода, к которому они присоединены, образуют optionally замещенное циклоалкильное кольцо, optionally замещенное гетероциклическое кольцо или optionally замещенное циклоалкенильное кольцо;

R^9 представляет собой водород, optionally замещенный алкил, $-C(O)R^{18}$, $-C(O)OR^{20}$ или $-S(O)_2R^{23}$;

R^{10} , R^{11} , R^{12} , R^{13} и R^{19} выбираются, как в (a) или (b), следующим образом:

(a) R^{10} , R^{11} , R^{12} , R^{13} и R^{19} представляют собой, каждый, независимо, водород, optionally замещенный алкил, optionally замещенный алкенил, optionally замещенный алкинил, optionally замещенный циклоалкил, optionally замещенный арил, optionally замещенный аралкил, optionally замещенный гетероциклил, optionally замещенный гетероарил или optionally замещенный гетероаралкил; или (b) R^{11} и R^{12} или R^{12} и R^{19} , вместе с атомами, к которым они присоединены, образуют optionally замещенное гетероциклическое кольцо или optionally замещенное гетероарильное кольцо; а другие группы из R^{10} , R^{11} , R^{12} , R^{13} и R^{19} выбираются как в (a), выше;

R^{14} , R^{15} , R^{16} , R^{17} и R^{18} выбираются, как в (a) или (b), следующим образом:

(a) R^{14} , R^{15} , R^{16} , R^{17} и R^{18} представляют собой, каждый, независимо, водород, optionally замещенный алкил, optionally замещенный алкенил, optionally замещенный алкинил, optionally замещенный циклоалкил, optionally замещенный арил, optionally замещенный аралкил, optionally замещенный гетероциклил, optionally замещенный гетероарил или optionally замещенный гетероаралкил; или (b) R^{15} и R^{16} , вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют optionally замещенное гетероциклическое кольцо или optionally замещенное гетероарильное кольцо, а другие группы из R^{14} , R^{15} , R^{16} , R^{17} и R^{18} выбираются как в (a) выше;

R^{20} , R^{21} , R^{22} и R^{24} выбираются, как в (a) или (b), следующим образом: (a) R^{20} , R^{21} , R^{22} и R^{24} представляют собой, каждый, независимо, водород, optionally замещенный алкил, optionally замещенный алкенил, optionally замещенный алкинил, optionally замещенный циклоалкил, optionally замещенный арил, optionally замещенный аралкил, optionally замещенный гетероциклил, optionally замещенный гетероарил или optionally замещенный гетероаралкил; или (b) R^{21} и R^{22} , вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют optionally замещенное гетероциклическое кольцо или optionally замещенное гетероарильное кольцо, а другие группы из R^{20} , R^{21} , R^{22} и R^{24} выбираются как в (a), выше;

R^{23} представляет собой optionally замещенный алкил, optionally замещенный алкенил, optionally замещенный алкинил, optionally замещенный циклоалкил, optionally замещенный арил, optionally замещенный аралкил, optionally замещенный гетероциклил, optionally замещенный гетероарил или optionally замещенный гетероаралкил;

каждый из R^1 - R^{24} и R^{31} - R^{36} , когда они замещены, являются замещенными одним или несколькими заместителями, каждый является независимо выбранным из Q^1 ;

каждый Q^1 независимо выбирается из галогена, псевдогалогена, оксо, тиоксо, циано,

тиоциано, изоциано, нитро, азидо, алкила, галогеналкила, алкенила, содержащего 1-2 двойные связи, алкинила, содержащего 1-2 тройные связи, циклоалкила, циклоалкенила, циклоалкинила, циклоалкилалкила, гетероциклила, гетероциклилалкила, арила, гетероарила, аралкила, аралкенила, аралкинила, гетероарилалкила, алкилидена, арилалкилидена, арилоксиарилкарбониламино, гидроксикарбонилалкилтио, галогенсульфонила, $-OR^{70}$, $-SR^{70}$, $-R^{60}-C(J)R^{71}$, $-R^{60}-N(R^{70})C(J)R^{71}$, $-OC(O)R^{71}$, $-R^{60}-N(R^{75})(R^{76})$, $-N^+(R^{77})_3$, $-P(R^{78})_2$, $-P(O)(R^{78})_2$, $-OP(O)(R^{78})_2$, $-N(R^{70})S(O)_2R^{71}$, $-S(O)_2R^{71}$, $-S(O)R^{82}$, $-OS(O)R^{83}$, $-OS(O)_2R^{83}$ или $-Si(R^{83})_3$;

две группы Q^1 , которые замещают атомы в 1,2 или 1,3 положении, вместе с атомами углерода, к которым они присоединены, образуют циклоалкильное кольцо, циклоалкенильное кольцо, циклоалкинильное кольцо или гетероциклильное кольцо; или

каждый из Q^1 является, независимо, незамещенным или замещенным одним или несколькими заместителями, независимо выбранными, каждый, из Q^2 ;

каждый из Q^2 является независимо выбранным из галогена, псевдогалогена, оксо, тиоксо, циано, тиоциано, изоциано, нитро, азидо, алкила, галогеналкила, алкенила, содержащего 1-2 двойные связи, алкинила, содержащего 1-2 тройные связи, циклоалкила, циклоалкенила, циклоалкинила, циклоалкилалкила, гетероциклила, гетероциклилалкила, арила, гетероарила, аралкила, аралкенила, аралкинила, гетероарилалкила, алкилидена, арилалкилидена, арилоксиарилкарбониламино, гидроксикарбонилалкилтио, галогенсульфонила, $-OR^{70}$, $-SR^{70}$, $-R^{60}-C(J)R^{71}$, $-R^{60}-N(R^{70})C(J)R^{71}$, $-OC(O)R^{71}$, $-R^{60}-N(R^{75})(R^{76})$, $-N^+(R^{77})_3$, $-P(R^{78})_2$, $-P(O)(R^{78})_2$, $-OP(O)(R^{78})_2$, $-N(R^{70})S(O)_2R^{71}$, $-S(O)_2R^{71}$, $-S(O)R^{82}$, $-OS(O)R^{83}$, $-OS(O)_2R^{83}$ или $-Si(R^{83})_3$;

две группы Q^2 , которые замещают атомы в 1,2 или 1,3 положении, вместе с атомами углерода, к которым они присоединены, образуют циклоалкильное кольцо, циклоалкенильное кольцо, циклоалкинильное кольцо или гетероциклильное кольцо;

каждый J представляет собой, независимо, O, S или $-NR^{70}$;

каждый R^{60} представляет собой, независимо, прямую связь или алкилен;

каждый R^{70} представляет собой, независимо, водород, алкил, алкенил, алкинил, циклоалкил, гетероциклил, арил, гетероарил, аралкил, галогеналкил, гетероциклилалкил или гетероаралкил;

каждый R^{71} представляет собой, независимо, водород, алкил, алкенил, алкинил, циклоалкил, гетероциклил, арил, гетероарил, аралкил, галогеналкил, гетероциклилалкил, гетероаралкил, $-OR^{72}$ или $-N(R^{73})R^{74}$;

R^{72} , R^{73} и R^{74} представляют собой, каждый, независимо, водород, алкил, алкенил, алкинил, циклоалкил, гетероциклил, арил, гетероарил, аралкил или гетероаралкил; или

R^{73} и R^{74} , вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют гетероциклильное кольцо или гетероарильное кольцо;

R^{75} и R^{76} представляют собой, каждый, независимо, водород, алкил, алкенил, алкинил, арил, аралкил, гетероарил, гетероаралкил, гетероциклил или гетероциклилалкил; или

R^{75} и R^{76} , вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют гетероциклильное кольцо или гетероарильное кольцо;

каждый R^{77} представляет собой, независимо, алкил, алкенил, циклоалкил, гетероциклил, арил, гетероарил, аралкил или гетероаралкил;

R^{78} представляет собой алкил, гетероарил, гетероциклил, арил, $-OR^{79}$ или $-N(R^{80})R^{81}$;

R^{79} представляет собой водород, алкил, алкенил, циклоалкил, гетероциклил, арил, гетероарил, аралкил или гетероаралкил;

R^{80} и R^{81} представляют собой, каждый, независимо, водород, алкил, алкенил, алкинил, циклоалкил, гетероциклил, арил, гетероарил, аралкил или гетероаралкил; или

R^{80} и R^{81} , вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют гетероциклильное кольцо или гетероарильное кольцо;

R^{82} представляет собой алкил, алкенил, циклоалкил, гетероциклил, арил, гетероарил, аралкил, гетероаралкил или $-OR^{83}$; и

каждый R^{83} представляет собой, независимо, алкил, алкенил, циклоалкил, гетероцикллил, арил, гетероарил, аралкил или гетероаралкил;

в виде отдельного изомера, смеси изомеров, или в качестве рацемической смеси изомеров; или в виде сольвата или полиморфа; или в виде пролекарства; или в виде их фармацевтически приемлемых солей.

2. Соединение по п.1, в котором

R^1 представляет

собой $-C(O)R^{18}$, $-C(O)OR^{14}$, $-C(S)OR^{14}$, $-C(OSR^{14})$, $-C(O)N(R^{15})R^{16}$, $-C(O)N(R^{15})S(O)_2R^{23}$, $-C(O)N(R^{15})N=R^{16}$, $-C(O)N(R^{17})N(R^{15})R^{16}$ или $-C(O)N(R^{17})N(R^{15})S(O)_2R^{23}$;

где R^{14} , R^{15} , R^{16} , R^{17} и R^{23} описаны в п.1.

3. Соединение по п.2, в котором R^3 представляет собой $-C(O)R^{10}$, $-C(O)OR^{10}$, $-S(O)_2R^{10}$ или $-C(O)N(R^{11})R^{12}$;

где R^{10} , R^{11} и R^{12} описаны в п.1.

4. Соединение по п.3, в котором R^2 представляет собой водород, галоген, необязательно замещенный алкил, необязательно замещенный алкенил или необязательно замещенный алкинил.

5. Соединение по п.4, в котором R^4 , R^5 , R^6 и R^7 выбираются из а), b), c), d), e), f), g), h) и i), ниже

a) R^4 и R^5 представляют собой, каждый, независимо, водород или галоген, и R^6 и R^7 представляют собой необязательно замещенный алкил;

b) R^6 и R^7 представляют собой, каждый, независимо, водород или галоген, и R^4 и R^5 представляют собой необязательно замещенный алкил;

c) R^4 , R^5 , R^6 и R^7 представляют собой, каждый, необязательно замещенный алкил;

d) R^4 и R^5 представляют собой, каждый, независимо, водород или галоген, и R^6 и R^7 , вместе с атомом углерода, к которому они присоединены, независимо, образуют необязательно замещенный циклоалкил или необязательно замещенное циклоалкенильное кольцо;

e) R^4 и R^5 представляют собой необязательно замещенный алкил и R^6 и R^7 , вместе с атомом углерода, к которому они присоединены, независимо образуют необязательно замещенный циклоалкил или необязательно замещенное циклоалкенильное кольцо;

f) R^4 и R^5 , вместе с атомом углерода, к которому они присоединены, независимо образуют необязательно замещенный циклоалкил или необязательно замещенное циклоалкенильное кольцо, и R^6 и R^7 представляют собой, каждый, независимо, водород или галоген;

g) R^4 и R^5 , вместе с атомом углерода, к которому они присоединены, независимо образуют необязательно замещенный циклоалкил или необязательно замещенное циклоалкенильное кольцо, и R^6 и R^7 представляют собой необязательно замещенный алкил;

h) R^4 и R^5 , вместе с атомом углерода, к которому они присоединены, независимо образуют необязательно замещенное циклоалкильное кольцо или необязательно замещенное циклоалкенильное кольцо, и R^6 и R^7 , вместе с атомом углерода, к которому они присоединены, независимо образуют необязательно замещенное циклоалкильное кольцо или необязательно замещенное циклоалкенильное кольцо; и

i) R^4 , R^5 , R^6 и R^7 представляют собой, каждый, независимо, водород или галоген.

6. Соединение по п.5, в котором

Y представляет собой CR^{30} ; и

R^{30} представляет собой галоген, водород, необязательно замещенный алкил, необязательно замещенный алкенил, необязательно замещенный алкинил, необязательно замещенный арил, необязательно замещенный гетероарил, необязательно замещенный циклоалкил, необязательно замещенный циклоалкилалкил, необязательно замещенный гетероцикллил, необязательно замещенный гетероциклилалкил, необязательно замещенный аралкил, необязательно замещенный

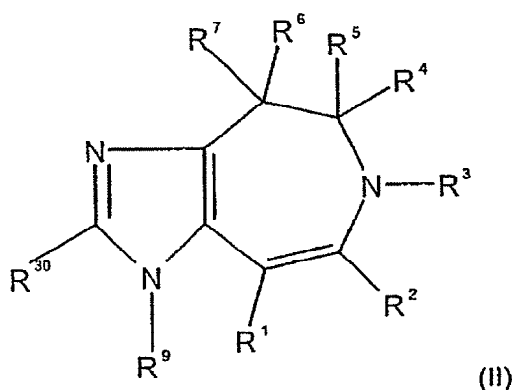
гетероаралкил, $-OR^{32}$, $-SR^{32}$, $-N(R^{33})R^{34}$, $-N(R^{33})S(O)_2R^{23}$; $-N(R^{35})N(R^{33})R^{34}$, $-N(R^{35})N(R^{33})S(O)_2R^{23}$, $-C(O)R^{36}$, $-C(O)OR^{32}$, $-C(S)OR^{32}$, $-C(O)SR^{32}$, $-C(O)N(R^{33})R^{34}$, $-C(S)N(R^{33})R^{34}$, $-C(O)N(R^{33})S(O)_2R^{23}$, $-C(S)N(R^{33})S(O)_2R^{23}$, $-C(O)N(R^{35})N(R^{33})R^{34}$, $-C(S)N(R^{35})N(R^{33})R^{34}$ или $-C(O)N(R^{35})N(R^{33})S(O)_2R^{23}$;

где R^{23} представляет собой необязательно замещенный алкил, необязательно замещенный алкенил, необязательно замещенный алкинил, необязательно замещенный циклоалкил, необязательно замещенный арил, необязательно замещенный аралкил, необязательно замещенный гетероциклил, необязательно замещенный гетероарил или необязательно замещенный гетероаралкил; и

где R^{32} , R^{33} , R^{34} , R^{35} и R^{36} выбираются, как в (а) или (b), следующим образом:

(а) R^{32} , R^{33} , R^{34} , R^{35} и R^{36} представляют собой, каждый, независимо, водород, необязательно замещенный алкил, необязательно замещенный алкенил, необязательно замещенный алкинил, необязательно замещенный циклоалкил, необязательно замещенный арил, необязательно замещенный аралкил, необязательно замещенный гетероциклил, необязательно замещенный гетероарил или необязательно замещенный гетероаралкил; или (b) R^{33} и R^{34} , вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют необязательно замещенное гетероциклическое кольцо или необязательно замещенное гетероарильное кольцо, а другие группы из R^{32} , R^{33} , R^{34} , R^{35} и R^{36} выбираются как в (а), выше.

7. Соединение по п.6, имеющее формулу (II)



или его фармацевтически приемлемое производное,

где R^1 представляет

собой $-C(O)OR^{14}$, $-C(S)OR^{14}$, $-C(O)SR^{14}$, $-C(O)N(R^{15})R^{16}$, $-C(O)N(R^{15})S(O)_2R^{23}$, $-C(O)N(R^{15})N(R^{16})$, $-C(O)N(R^{17})N(R^{15})R^{16}$ и $-C(O)N(R^{17})N(R^{15})S(O)_2R^{23}$;

R^2 представляет собой водород, галоген или необязательно замещенный алкил;

R^3 представляет собой $-C(O)R^{10}$;

R^4 и R^5 представляют собой, каждый, независимо, водород или галоген; или

R^4 и R^5 представляют собой, каждый, необязательно замещенный алкил;

R^6 и R^7 представляют собой, каждый, независимо, водород или галоген; или

R^6 и R^7 представляют собой, каждый, необязательно замещенный алкил; или

R^6 и R^7 вместе с атомом углерода, к которому они присоединены, образуют необязательно замещенное циклоалкильное кольцо или необязательно замещенное циклоалкенильное кольцо;

R^9 представляет собой водород, необязательно замещенный алкил, $-C(O)R^{18}$, или $-S(O)_2R^{23}$;

R^{10} представляет собой необязательно замещенный арил или необязательно замещенный гетероарил;

R^{14} , R^{15} , R^{16} , R^{17} и R^{18} представляют собой, каждый, независимо, водород, необязательно замещенный алкил, необязательно замещенный алкенил, необязательно замещенный алкинил, необязательно замещенный циклоалкил, необязательно замещенный арил, необязательно замещенный аралкил, необязательно замещенный

гетероциклил, необязательно замещенный гетероарил или необязательно замещенный гетероаралкил;

R^{23} представляет собой необязательно замещенный алкил, необязательно замещенный алкенил, необязательно замещенный алкинил, необязательно замещенный циклоалкил, необязательно замещенный арил, необязательно замещенный аралкил, необязательно замещенный гетероциклил, необязательно замещенный гетероарил или необязательно замещенный гетероаралкил; и

R^{30} представляет собой галоген, водород, необязательно замещенный алкил, необязательно замещенный алкенил, необязательно замещенный алкинил, необязательно замещенный циклоалкил, необязательно замещенный циклоалкилалкил, необязательно замещенный гетероциклил, необязательно замещенный гетероциклилалкил, необязательно замещенный арил, необязательно замещенный аралкил, необязательно замещенный гетероарил, необязательно замещенный гетероаралкил, $-OR^{32}$, $-SR^{32}$, $-N(R^{33})R^{34}$, $-N(R^{33})S(O)_2R^{23}$, $-N(R^{35})N(R^{33})R^{34}$, $-N(R^{35})N(R^{33})S(O)_2R^{23}$, $-C(O)R^{36}$, $-C(O)OR^{32}$, $-C(S)OR^{32}$, $-C(O)SR^{32}$, $-C(O)N(R^{33})R^{34}$, $-C(S)N(R^{33})R^{34}$, $-C(O)N(R^{33})S(O)_2R^{23}$, $-C(S)N(R^{33})S(O)_2R^{23}$, $-C(O)N(R^{35})N(R^{33})R^{34}$, $-C(S)N(R^{35})N(R^{33})R^{34}$ или $-C(O)N(R^{35})N(R^{33})S(O)_2R^{23}$.

8. Соединение по п.7, в котором

R^4 , R^5 , R^6 и R^7 представляют собой, каждый, независимо, водород или галоген; и

R^{30} выбирается из группы, состоящей из водорода, галогена, $-C(O)R^{36}$, $-C(O)OR^{32}$, $-C(S)OR^{32}$, $-C(O)SR^{32}$, $-C(O)N(R^{33})R^{34}$, $-C(S)N(R^{33})R^{34}$, $-C(O)N(R^{33})S(O)_2R^{23}$, $-C(S)N(R^{33})S(O)_2R^{23}$, $-C(O)N(R^{35})N(R^{33})R^{34}$, $-C(S)N(R^{35})N(R^{33})R^{34}$ и $-C(O)N(R^{35})N(R^{33})S(O)_2R^{23}$;

где R^{23} представляет собой необязательно замещенный алкил, необязательно замещенный алкенил, необязательно замещенный алкинил, необязательно замещенный циклоалкил, необязательно замещенный арил, необязательно замещенный аралкил, необязательно замещенный гетероциклил, необязательно замещенный гетероарил или необязательно замещенный гетероаралкил; и

где R^{32} , R^{33} , R^{34} , R^{35} и R^{36} выбираются, как в (а) или (b), следующим образом:

(а) R^{32} , R^{33} , R^{34} , R^{35} и R^{36} представляют собой, каждый, независимо, водород, необязательно замещенный алкил, необязательно замещенный алкенил, необязательно замещенный алкинил, необязательно замещенный циклоалкил, необязательно замещенный арил, необязательно замещенный аралкил, необязательно замещенный гетероциклил, необязательно замещенный гетероарил или необязательно замещенный гетероаралкил; или (b) R^{33} и R^{34} , вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют необязательно замещенное гетероциклильное кольцо или необязательно замещенное гетероарильное кольцо, а другие группы из R^{32} , R^{33} , R^{34} , R^{35} и R^{36} выбираются как в (а), выше.

9. Соединение по п.8, в котором указанное соединение представляет собой сложный этиловый эфир 6-(4-фтор-бензоил)-3,6,7,8-тетрагидро-имидазо[4,5-d]азепин-4-карбоновой кислоты.

10. Соединение по п.7, в котором

R^4 и R^5 представляют собой, каждый, независимо, водород или галоген; и

R^6 и R^7 представляют собой необязательно замещенный алкил; или

R^6 и R^7 , вместе с атомом углерода, к которому они присоединены, независимо образуют необязательно замещенное циклоалкильное кольцо.

11. Соединение по п.10, в котором

R^2 представляет собой водород, галоген или необязательно замещенный алкил; и

R^9 представляет собой водород.

12. Соединение по п.11, в котором R^{30} выбирается из группы, состоящей из $-C(O)R^{36}$, $-C(O)OR^{32}$, $-C(S)OR^{32}$, $-C(O)SR^{32}$, $-C(O)N(R^{33})R^{34}$, $-C(S)N(R^{33})R^{34}$, $-C(O)N(R^{33})S(O)_2R^{23}$, $-C(S)N(R^{33})S(O)_2R^{23}$, $-C(O)N(R^{35})N(R^{33})R^{34}$, $-C(S)N(R^{35})N(R^{33})R^{34}$ и $-C(O)N(R^{35})$

$N(R^{33})S(O)_2R^{23}$;

где R^{23} представляет собой необязательно замещенный алкил, необязательно замещенный алкенил, необязательно замещенный алкинил, необязательно замещенный циклоалкил, необязательно замещенный арил, необязательно замещенный аралкил, необязательно замещенный гетероциклил, необязательно замещенный гетероарил или необязательно замещенный гетероаралкил; и

где R^{32} , R^{33} , R^{34} , R^{35} и R^{36} выбираются, как в (а) или (b), следующим образом:

(а) R^{32} , R^{33} , R^{34} , R^{35} и R^{36} представляют собой, каждый, независимо, водород, необязательно замещенный алкил, необязательно замещенный алкенил, необязательно замещенный алкинил, необязательно замещенный циклоалкил, необязательно замещенный арил, необязательно замещенный аралкил, необязательно замещенный гетероциклил, необязательно замещенный гетероарил или необязательно замещенный гетероаралкил; или (b) R^{33} и R^{34} , вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют необязательно замещенное гетероциклильное кольцо или необязательно замещенное гетероарильное кольцо, а другие группы из R^{32} , R^{33} , R^{34} , R^{35} и R^{36} выбираются как в (а) выше.

13. Соединение по п.12, в котором R^1 представляет собой $-C(O)OCH_2CH_3$, $-C(O)OCH_3$, $-C(O)OCH(CH_3)_2$, $-C(O)OH$, $-C(O)OCH_2CH_2CH_3$, $-C(O)NHCH_3$, $-C(O)NHCH_2CH_3$, $-C(O)NHCH(CH_3)_2$, $-C(O)NH$ (циклопропил), $-C(O)NH$ (циклопентил), $-C(O)NCH(CH_3)(CH_2CH_3)$ или $-C(O)N(CH_3)$ (циклопропил).

14. Соединение по п.6, в котором

Z представляет собой CR^{31} ; и

R^{31} независимо выбирается из группы, состоящей из галогена, водорода, необязательно замещенного алкила, необязательно замещенного алкенила, необязательно замещенного алкинила, необязательно замещенного циклоалкила, необязательно замещенного циклоалкилалкила, необязательно замещенного гетероциклила, необязательно замещенного гетероциклилалкила, необязательно замещенного арила, необязательно замещенного аралкила, необязательно замещенного гетероарила, необязательно замещенного гетероаралкила, $-OR^{32}$, $-SR^{32}$, $-N(R^{33})R^{34}$, $-N(R^{33})S(O)_2R^{23}$; $-N(R^{35})N(R^{33})R^{34}$, $-N(R^{35})N(R^{33})S(O)_2R^{23}$, $-C(O)R^{36}$, $-C(O)OR^{32}$, $-C(S)OR^{32}$, $-C(O)SR^{32}$, $-C(O)N(R^{33})R^{34}$, $-C(S)N(R^{33})R^{34}$, $-C(O)N(R^{33})S(O)_2R^{23}$, $-C(S)N(R^{33})S(O)_2R^{23}$, $-C(O)N(R^{35})N(R^{33})R^{34}$, $-C(S)N(R^{35})N(R^{33})R^{34}$ и $-C(O)N(R^{35})N(R^{33})S(O)_2R^{23}$;

где R^{23} представляет собой необязательно замещенный алкил, необязательно замещенный алкенил, необязательно замещенный алкинил, необязательно замещенный циклоалкил, необязательно замещенный арил, необязательно замещенный аралкил, необязательно замещенный гетероциклил, необязательно замещенный гетероарил или необязательно замещенный гетероаралкил; и

где R^{32} , R^{33} , R^{34} , R^{35} и R^{36} выбираются, как в (а) или (b), следующим образом:

(а) R^{32} , R^{33} , R^{34} , R^{35} и R^{36} представляют собой, каждый, независимо, водород, необязательно замещенный алкил, необязательно замещенный алкенил, необязательно замещенный алкинил, необязательно замещенный циклоалкил, необязательно замещенный арил, необязательно замещенный аралкил, необязательно замещенный гетероциклил, необязательно замещенный гетероарил или необязательно замещенный гетероаралкил; или (b) R^{33} и R^{34} , вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют необязательно замещенное гетероциклильное кольцо или необязательно замещенное гетероарильное кольцо, а другие группы из R^{32} , R^{33} , R^{34} , R^{35} и R^{36} выбираются как в (а), выше.

15. Соединение по п.14, в котором

Z представляет собой CR^{31} ; и

R^{31} независимо выбирается из группы, состоящей из необязательно замещенного арила, необязательно замещенного аралкила, необязательно замещенного гетероарила, необязательно замещенного гетероаралкила, необязательно замещенного циклоалкила,

необязательно замещенного

гетероциклила, $-C(O)R^{36}$, $-C(O)OR^{32}$, $-C(S)OR^{32}$, $-C(O)SR^{32}$, $-C(O)N(R^{33})R^{34}$, $-C(S)N(R^{33})R^{34}$, $-C(O)N(R^{33})S(O)_2R^{23}$, $-C(S)N(R^{33})S(O)_2R^{23}$, $-C(O)N(R^{35})N(R^{33})R^{34}$, $-C(S)N(R^{35})N(R^{33})R^{34}$ и $-C(O)N(R^{35})N(R^{33})S(O)_2R^{23}$;

где R^{23} представляет собой optionally замещенный алкил, optionally замещенный алкенил, optionally замещенный алкинил, optionally замещенный циклоалкил, optionally замещенный арил, optionally замещенный аралкил, optionally замещенный гетероциклил, optionally замещенный гетероарил или optionally замещенный гетероаралкил; и

где R^{32} , R^{33} , R^{34} , R^{35} и R^{36} выбираются, как в (a) или (b), следующим образом:

(a) R^{32} , R^{33} , R^{34} , R^{35} и R^{36} представляют собой, каждый, независимо, водород, optionally замещенный алкил, optionally замещенный алкенил, optionally замещенный алкинил, optionally замещенный циклоалкил, optionally замещенный арил, optionally замещенный аралкил, optionally замещенный гетероциклил, optionally замещенный гетероарил или optionally замещенный гетероаралкил; или (b) R^{33} и R^{34} , вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют optionally замещенное гетероциклильное кольцо или optionally замещенное гетероарильное кольцо, а другие группы из R^{32} , R^{33} , R^{34} , R^{35} и R^{36} выбираются как в (a), выше.

16. Соединение по п.14, в котором X представляет собой O или $S(O)_t$, (где t равно 0-2).

17. Соединение по п.16, в котором R^4 , R^5 , R^6 и R^7 представляют собой, каждый независимо водород или галоген; и

R^{30} выбирается из группы, состоящей из водорода, галогена, $-C(O)R^{36}$, $C(O)OR^{32}$, $-C(S)OR^{32}$, $-C(O)SR^{32}$, $-C(O)N(R^{33})R^{34}$, $-C(S)N(R^{33})R^{34}$, $-C(O)N(R^{33})S(O)_2R^{23}$, $-C(S)N(R^{33})S(O)_2R^{23}$, $-C(O)N(R^{35})N(R^{33})R^{34}$, $-C(S)N(R^{35})N(R^{33})R^{34}$ и $-C(O)N(R^{35})N(R^{33})S(O)_2R^{23}$;

где R^{23} представляет собой optionally замещенный алкил, optionally замещенный алкенил, optionally замещенный алкинил, optionally замещенный циклоалкил, optionally замещенный арил, optionally замещенный аралкил, optionally замещенный гетероциклил, optionally замещенный гетероарил или optionally замещенный гетероаралкил; и

где R^{32} , R^{33} , R^{34} , R^{35} и R^{36} выбираются, как в (a) или (b), следующим образом:

(a) R^{32} , R^{33} , R^{34} , R^{35} и R^{36} представляют собой, каждый, независимо, водород, optionally замещенный алкил, optionally замещенный алкенил, optionally замещенный алкинил, optionally замещенный циклоалкил, optionally замещенный арил, optionally замещенный аралкил, optionally замещенный гетероциклил, optionally замещенный гетероарил или optionally замещенный гетероаралкил; или (b) R^{33} и R^{34} , вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют optionally замещенное гетероциклильное кольцо или optionally замещенное гетероарильное кольцо, а другие группы из R^{32} , R^{33} , R^{34} , R^{35} и R^{36} выбираются как в (a), выше.

18. Соединение по п.17, в котором указанное соединение представляет собой сложный этиловый эфир 6-(3,4-дифтор-бензоил)-5,6-дигидро-4H-тиено[2,3-d]азепин-8-карбоновой кислоты.

19. Соединение по п.16, в котором

R^4 и R^5 представляют собой, каждый, независимо, водород или галоген; и

R^6 и R^7 представляют собой optionally замещенный алкил; или

R^6 и R^7 , вместе с атомом углерода, к которому они присоединены, независимо образуют optionally замещенное циклоалкильное кольцо.

20. Соединение по п.19, в котором

R^2 представляет собой водород, галоген или optionally замещенный алкил; и

R^9 представляет собой водород.

21. Соединение по п.20, в котором R^{30} выбирается из группы, состоящей из $-C(O)R^{36}$, $-C(O)OR^{32}$, $-C(S)OR^{32}$, $-C(O)SR^{32}$, $-C(O)N(R^{33})R^{34}$, $-C(S)N(R^{33})R^{34}$, $-C(O)N(R^{33})S(O)_2R^{23}$, $-C(S)N(R^{33})S(O)_2R^{23}$, $-C(O)N(R^{35})N(R^{33})R^{34}$, $-C(S)N(R^{35})N(R^{33})R^{34}$ и $-C(O)N(R^{35})N(R^{33})S(O)_2R^{23}$;

где R^{23} представляет собой необязательно замещенный алкил, необязательно замещенный алкенил, необязательно замещенный алкинил, необязательно замещенный циклоалкил, необязательно замещенный арил, необязательно замещенный аралкил, необязательно замещенный гетероцикл, необязательно замещенный гетероарил или необязательно замещенный гетероаралкил; и

где R^{32} , R^{33} , R^{34} , R^{35} и R^{36} выбираются, как в (а) или (b), следующим образом: (а) R^{32} , R^{33} , R^{34} , R^{35} и R^{36} представляют собой, каждый, независимо, водород, необязательно замещенный алкил, необязательно замещенный алкенил, необязательно замещенный алкинил, необязательно замещенный циклоалкил, необязательно замещенный арил, необязательно замещенный аралкил, необязательно замещенный гетероцикл, необязательно замещенный гетероарил или необязательно замещенный гетероаралкил; или (b) R^{33} и R^{34} , вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют необязательно замещенное гетероциклическое кольцо или необязательно замещенное гетероарильное кольцо, а другие группы из R^{32} , R^{33} , R^{34} , R^{35} и R^{36} выбираются как в (а), выше.

22. Соединение по п.21, в котором R^1 представляет собой $-C(O)OCH_2CH_3$, $-C(O)OCH_3$, $-C(O)OCH(CH_3)_2$, $-C(O)OH$, $-C(O)OCH_2CH_2CH_3$, $-C(O)NHCH_3$, $-C(O)NHCH_2CH_3$, $-C(O)NHCH(CH_3)_2$, $-C(O)NH$ (циклопропил), $-C(O)NH$ (циклопентил), $-C(O)NCH(CH_3)(CH_2CH_3)$ или $-C(O)N(CH_3)$ (циклопропил); и

R^3 представляет собой $-C(O)R^{10}$, где R^{10} представляет собой необязательно замещенный арил, необязательно замещенный гетероарил, необязательно замещенный алкил или необязательно замещенный аралкил.

23. Соединение по п.22, в котором указанное соединение представляет собой сложный этиловый эфир 6-(3,4-дифтор-бензоил)-4,4-диметил-5,6-дигидро-4Н-тиено[2,3-d]азепин-8-карбоновой кислоты.

24. Соединение по п.14, в котором

X представляет собой NR^9 ;

R^9 представляет собой водород, необязательно замещенный алкил, $-C(O)R^{18}$ или $-S(O)_2R^{23}$; а R^{18} и R^{23} , каждый, независимо, необязательно замещенный алкил, необязательно замещенный алкенил, необязательно замещенный алкинил, необязательно замещенный циклоалкил, необязательно замещенный арил, необязательно замещенный аралкил, необязательно замещенный гетероцикл, необязательно замещенный гетероарил или необязательно замещенный гетероаралкил.

25. Соединение по п.24, в котором

R^4 и R^5 представляют собой, каждый, независимо, водород или галоген; и

R^6 и R^7 представляют собой необязательно замещенный алкил; или

R^6 и R^7 , вместе с атомом углерода, к которому они присоединены, независимо образуют необязательно замещенное циклоалкильное кольцо.

26. Соединение по п.25, в котором

R^2 представляет собой водород, галоген или необязательно замещенный алкил; и

R^9 представляет собой водород.

27. Соединение по п.26, в котором R^{30} выбирается из группы, состоящей из $-C(O)R^{36}$, $-C(O)OR^{32}$, $-C(S)OR^{32}$, $-C(O)SR^{32}$, $-C(O)N(R^{33})R^{34}$, $-C(S)N(R^{33})R^{34}$, $-C(O)N(R^{33})S(O)_2R^{23}$, $-C(S)N(R^{33})S(O)_2R^{23}$, $-C(O)N(R^{35})N(R^{33})R^{34}$, $-C(S)N(R^{35})N(R^{33})R^{34}$ и $-C(O)N(R^{35})N(R^{33})S(O)_2R^{23}$;

где R^{23} представляет собой необязательно замещенный алкил, необязательно замещенный алкенил, необязательно замещенный алкинил, необязательно замещенный

циклоалкил, необязательно замещенный арил, необязательно замещенный аралкил, необязательно замещенный гетероциклил, необязательно замещенный гетероарил или необязательно замещенный гетероаралкил; и

где R^{32} , R^{33} , R^{34} , R^{35} и R^{36} выбираются, как в (а) или (b), следующим образом:

(а) R^{32} , R^{33} , R^{34} , R^{35} и R^{36} представляют собой, каждый, независимо, водород, необязательно замещенный алкил, необязательно замещенный алкенил, необязательно замещенный алкинил, необязательно замещенный циклоалкил, необязательно замещенный арил, необязательно замещенный аралкил, необязательно замещенный гетероциклил, необязательно замещенный гетероарил или необязательно замещенный гетероаралкил; или (b) R^{33} и R^{34} , вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют необязательно замещенное гетероциклильное кольцо или необязательно замещенное гетероарильное кольцо, а другие группы из R^{32} , R^{33} , R^{34} , R^{35} и R^{36} выбираются как в (а), выше.

28. Соединение по п.27, в котором R^1 представляет собой $-C(O)OCH_2CH_3$, $-C(O)OCH_3$, $-C(O)OCH(CH_3)_2$, $-C(O)OH$, $-C(O)OCH_2CH_2CH_3$, $-C(O)NHCH_3$, $-C(O)NHCH_2CH_3$, $-C(O)NHCH(CH_3)_2$, $-C(O)NH$ (циклопропил), $-C(O)NH$ (циклопентил), $-C(O)NCH(CH_3)(CH_2CH_3)$ или $-C(O)N(CH_3)$ (циклопропил); и

R^3 представляет собой $-C(O)R^{10}$, где R^{10} представляет собой необязательно замещенный арил, необязательно замещенный гетероарил, необязательно замещенный алкил или необязательно замещенный аралкил.

29. Соединение по п.28, в котором указанное соединение выбирается из группы, состоящей из

сложного диэтилового эфира 6-(3,4-дифтор-бензоил)-4,4-диметил-1,4,5,6-тетрагидро-пирроло[2,3-d]азепин-2,8-дикарбоновой кислоты; и

8-изопропилового сложного эфира сложного 2-этилового эфира 6-(3,4-дифтор-бензоил)-4,4-диметил-1,4,5,6-тетрагидро-пирроло[2,3-d]азепин-2,8-дикарбоновой кислоты.

30. Соединение по п.29, в котором

R^4 , R^5 , R^6 и R^7 представляют собой, каждый, независимо, водород или галоген; и

R^{30} выбирается из группы, состоящей из водорода, галогена, $-C(O)R^{36}$, $-C(O)OR^{32}$, $-C(S)OR^{32}$, $-C(OSR^{32})$, $-C(O)N(R^{33})R^{34}$, $-C(S)N(R^{33})R^{34}$, $-C(O)N(R^{33})S(O)_2R^{23}$, $-C(S)N(R^{33})S(O)_2R^{23}$, $-C(O)N(R^{35})N(R^{33})R^{34}$, $-C(S)N(R^{35})N(R^{33})R^{34}$ и $-C(O)N(R^{35})N(R^{33})S(O)_2R^{23}$;

где R^{23} представляет собой необязательно замещенный алкил, необязательно замещенный алкенил, необязательно замещенный алкинил, необязательно замещенный циклоалкил, необязательно замещенный арил, необязательно замещенный аралкил, необязательно замещенный гетероциклил, необязательно замещенный гетероарил или необязательно замещенный гетероаралкил; и

где R^{32} , R^{33} , R^{34} , R^{35} и R^{36} выбираются, как в (а) или (b), следующим образом:

(а) R^{32} , R^{33} , R^{34} , R^{35} и R^{36} представляют собой, каждый, независимо, водород, необязательно замещенный алкил, необязательно замещенный алкенил, необязательно замещенный алкинил, необязательно замещенный циклоалкил, необязательно замещенный арил, необязательно замещенный аралкил, необязательно замещенный гетероциклил, необязательно замещенный гетероарил или необязательно замещенный гетероаралкил; или (b) R^{33} и R^{34} , вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют необязательно замещенное гетероциклильное кольцо или необязательно замещенное гетероарильное кольцо, а другие группы из R^{32} , R^{33} , R^{34} , R^{35} и R^{36} выбираются как в (а), выше.

31. Соединение по п.30, в котором указанное соединение представляет собой сложный 8-изопропиловый эфир сложного 2-этилового эфира 6-(3,4-дифтор-бензоил)-1,4,4-триметил-1,4,5,6-тетрагидро-пирроло[2,3-d]азепин-2,8-дикарбоновой кислоты.

32. Соединение по п.5, в котором

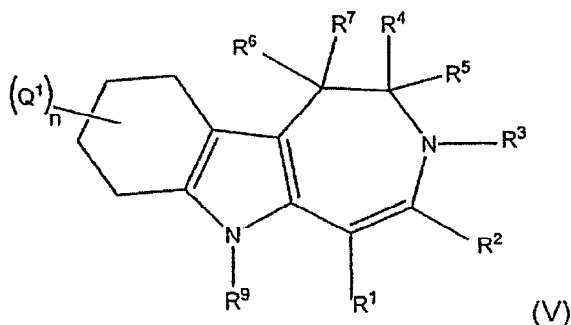
Y представляет собой CR^{30} ;

Z представляет собой CR^{31} ; и

R^{30} и R^{31} вместе с атомами углерода, с которыми они соединены, образуют необязательно замещенное циклоалкильное кольцо, необязательно замещенное циклоалкенильное кольцо, необязательно замещенное циклоалкинильное кольцо, необязательно замещенное гетероциклильное кольцо, необязательно замещенное гетероарильное кольцо или необязательно замещенное арильное кольцо, за исключением замещенного или незамещенного фенила и замещенного или незамещенного нафтила.

33. Соединение по п.32, в котором указанное необязательно замещенное циклоалкильное кольцо представляет собой необязательно замещенный циклопентил, необязательно замещенный циклогексил, необязательно замещенный циклогептил или необязательно замещенный циклооктил.

34. Соединение, имеющее формулу (V)



или его фармацевтически приемлемое производное, в котором n равно 0-8;

R^1 и R^2 являются, каждый, независимо выбранными из группы, состоящей из галогена, водорода, необязательно замещенного алкила, необязательно замещенного алкенила, необязательно замещенного алкинила, необязательно замещенного арила, необязательно замещенного гетероарила, необязательно замещенного циклоалкила, необязательно замещенного гетероциклила, необязательно замещенного аралкила, необязательно замещенного гетероаралкила, $-OR^{14}$, $-SR^{14}$, $-N(R^{15})R^{16}$, $-N(R^{15})S(O)_2R^{23}$, $-N(R^{17})N(R^{15})R^{16}$, $-N(R^{17})N(R^{15})S(O)_2R^{23}$, $-C(O)R^{18}$, $-C(O)OR^{14}$, $-C(S)OR^{14}$, $-C(O)SR^{14}$, $-C(O)N(R^{15})R^{16}$, $-C(O)N(R^{15})S(O)_2R^{23}$, $-C(O)N(R^{15})N=R^{16}$, $-C(O)N(R^{17})N(R^{15})R^{16}$ и $-C(O)N(R^{17})N(R^{15})S(O)_2R^{23}$;

R^3 представляет собой водород, необязательно замещенный алкил, необязательно замещенный алкенил, необязательно замещенный алкинил, необязательно замещенный циклоалкил, необязательно замещенный арил, необязательно замещенный аралкил, необязательно замещенный гетероарил, необязательно замещенный гетероциклил, необязательно замещенный гетероаралкил, $-C(O)R^{10}$, $-C(O)OR^{10}$, $-S(O)_2R^{10}$, $-C(O)N(R^{11})R^{12}$, $-C(O)N(R^{11})S(O)_2R^{23}$, $-C(O)N(R^{13})N(R^{11})R^{12}$, $-C(O)N(R^{13})N(R^{11})S(O)_2R^{23}$, $-N(R^{13})C(O)R^{10}$, $-N(R^{13})C(O)N(R^{11})R^{12}$, $-N(R^{13})C(O)N(R^{11})S(O)_2R^{23}$, $-N(R^{10})C(O)N(R^{13})N(R^{11})R^{12}$, $-N(R^{10})C(O)N(R^{13})N(R^{11})S(O)_2R^{23}$, $-N(R^{13})C(O)OR^{10}$, $-P(O)OR^{10}$ или $-P(O)(OR^{19})OR^{12}$;

R^4 , R^5 , R^6 и R^7 являются, каждый, независимо выбранными из группы, состоящей из водорода, галогена, необязательно замещенного алкила, необязательно замещенного алкенила, необязательно замещенного алкинила, необязательно замещенного арила, необязательно замещенного гетероарила, необязательно замещенного циклоалкила, необязательно замещенного гетероциклила, необязательно замещенного аралкила, необязательно замещенного гетероаралкила, $-OR^{14}$, $-SR^{14}$, $-S(O)_2R^{14}$, $-N(R^{15})R^{16}$, $-N(R^{15})S(O)_2R^{23}$, $-N(R^{15})C(O)R^{23}$, $-C(O)R^{18}$, $-C(O)OR^{20}$, $-C(O)N(R^{21})R^{22}$, $-C(O)N(R^{21})S(O)_2R^{23}$; $-C(O)N(R^{24})N(R^{21})R^{22}$ и $-C(O)N(R^{24})N(R^{21})S(O)_2R^{23}$; или

R^4 и R^5 , или R^4 и R^6 , или R^4 и R^7 , или R^5 и R^6 , или R^5 и R^7 , или R^6 и R^7 , вместе с атомом углерода, к которому они присоединены, образуют необязательно замещенное циклоалкильное кольцо, необязательно замещенное гетероциклильное кольцо,

необязательно замещенное циклоалкенильное кольцо или вместе образуют двойную связь, а другие группы из R^4 , R^5 , R^6 и R^7 являются такими, как описано выше; или R^6 и R^7 вместе образуют оксо, тиоксо, optionally замещенную имино, optionally замещенный оксим или optionally замещенный гидразон, или R^6 и R^7 , вместе с атомом углерода, к которому они присоединены, образуют optionally замещенную экзоциклическую двойную связь, и R^4 и R^5 являются такими, как описано выше;

R^9 представляет собой водород, optionally замещенный алкил, $-C(O)R^{18}$ или $-S(O)_2R^{23}$;

R^{10} , R^{11} , R^{12} , R^{13} и R^{19} выбираются, как в (a) или (b), следующим образом:

(a) R^{10} , R^{11} , R^{12} , R^{13} и R^{19} каждый независимо, представляют собой водород, optionally замещенный алкил, optionally замещенный алкенил, optionally замещенный алкинил, optionally замещенный циклоалкил, optionally замещенный арил, optionally замещенный аралкил, optionally замещенный гетероциклил, optionally замещенный гетероарил или optionally замещенный гетероаралкил; или (b) R^{11} и R^{12} или R^{12} и R^{19} , вместе с атомами, к которым они присоединены, образуют optionally замещенное гетероциклильное кольцо или optionally замещенное гетероарильное кольцо; а другие группы из R^{10} , R^{11} , R^{12} , R^{13} и R^{19} выбираются как в (a), выше;

R^{14} , R^{15} , R^{16} , R^{17} и R^{18} выбираются, как в (a) или (b), следующим образом:

(a) R^{14} , R^{15} , R^{16} , R^{17} и R^{18} представляют собой, каждый, независимо, водород, optionally замещенный алкил, optionally замещенный алкенил, optionally замещенный алкинил, optionally замещенный циклоалкил, optionally замещенный арил, optionally замещенный аралкил, optionally замещенный гетероциклил, optionally замещенный гетероарил или optionally замещенный гетероаралкил; или (b) R^{15} и R^{16} , вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют optionally замещенное гетероциклильное кольцо или optionally замещенное гетероарильное кольцо, а другие группы из R^{14} , R^{15} , R^{16} , R^{17} и R^{18} выбираются как в (a), выше;

R^{20} , R^{21} , R^{22} и R^{24} выбираются, как в (a) или (b), следующим образом: (a) R^{20} , R^{21} , R^{22} и R^{24} представляют собой, каждый, независимо, водород, optionally замещенный алкил, optionally замещенный алкенил, optionally замещенный алкинил, optionally замещенный циклоалкил, optionally замещенный арил, optionally замещенный аралкил, optionally замещенный гетероциклил, optionally замещенный гетероарил или optionally замещенный гетероаралкил; или (b) R^{21} и R^{22} , вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют optionally замещенное гетероциклильное кольцо или optionally замещенное гетероарильное кольцо, а другие группы из R^{20} , R^{21} , R^{22} и R^{24} выбираются как в (a), выше;

R^{23} представляет собой optionally замещенный алкил, optionally замещенный алкенил, optionally замещенный алкинил, optionally замещенный циклоалкил, optionally замещенный арил, optionally замещенный аралкил, optionally замещенный гетероциклил, optionally замещенный гетероарил или optionally замещенный гетероаралкил;

каждый из R^1 - R^{24} , когда замещен, являются замещенными одним или несколькими заместителями, каждый, независимо, выбранными из Q^1 ;

каждый Q^1 является независимо выбранным из галогена, псевдогалогена, оксо, тиоксо, циано, тиоциано, изоциано, нитро, азидо, алкила, галогеналкила, алкенила, содержащего 1-2 двойных связи, алкинила, содержащего 1-2 тройных связи, циклоалкила, циклоалкенила, циклоалкинила, циклоалкилалкила, гетероциклила, гетероциклилалкила, арила, гетероарила, аралкила, аралкенила, аралкинила, гетероарилалкила, алкилидена, арилалкилидена, арилоксиарилкарбониламино, гидроксикарбонилалкилтио, галогенсульфонила, $-OR^{70}$, $-SR^{70}$, $-R^{60}-C(J)R^{71}$, $-R^{60}-N(R^{70})C(J)R^{71}$, $-OC(O)R^{71}$, $-R^{60}-N(R^{75})(R^{76})$, $-N^+(R^{77})_3$, $-P(R^{78})_2$, $-P(O)(R^{78})_2$, $-OP(O)(R^{78})_2$, $-N(R^{70})S(O)_2R^{71}$, $-S(O)_2R^{71}$, $-S(O)R^{82}$

, $-\text{OS}(\text{O})\text{R}^{83}$, $-\text{OS}(\text{O})_2\text{R}^{83}$ или $-\text{Si}(\text{R}^{83})_3$;

две группы Q^1 , которые замещают атомы в 1,2 или 1,3 положении, вместе с атомами углерода, с которыми они соединены, образуют циклоалкильное кольцо, циклоалкенильное кольцо, циклоалкинильное кольцо или гетероциклильное кольцо; или

каждый из Q^1 является, независимо, незамещенным или замещенным одним или несколькими заместителями, независимо выбранными, каждый, из Q^2 ;

каждый Q^2 независимо выбирается из галогена, псевдогалогена, оксо, тиоксо, циано, тиоциано, изоциано, нитро, азидо, алкила, галогеналкила, алкенила, содержащего 1-2 двойных связи, алкинила, содержащего 1-2 тройных связи, циклоалкила, циклоалкенила, циклоалкинила, циклоалкилалкила, гетероциклила, гетероциклилалкила, арила, гетероарила, аралкила, аралкенила, аралкинила, гетероарилалкила, алкилидена, арилалкилидена, арилоксиарилкарбониламино, гидроксикарбонилалкилтио, галогенсульфонила, $-\text{OR}^{70}$, $-\text{SR}^{70}$, $-\text{R}^{60}-\text{C}(\text{J})\text{R}^{71}$, $-\text{R}^{60}-\text{N}(\text{R}^{70})\text{C}(\text{J})\text{R}^{71}$, $-\text{OC}(\text{O})\text{R}^{71}$, $-\text{R}^{60}-\text{N}(\text{R}^{75})(\text{R}^{76})$, $-\text{N}^+(\text{R}^{77})_3$, $-\text{P}(\text{R}^{78})_2$, $-\text{P}(\text{O})(\text{R}^{78})_2$, $-\text{OP}(\text{O})(\text{R}^{78})_2$, $-\text{N}(\text{R}^{70})\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{71}$, $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{71}$, $-\text{S}(\text{O})\text{R}^{82}$, $-\text{OS}(\text{O})\text{R}^{83}$, $-\text{OS}(\text{O})_2\text{R}^{83}$ или $-\text{Si}(\text{R}^{83})_3$;

две группы Q^2 , которые замещают атомы в 1,2 или 1,3 положении, вместе с атомами углерода, к которым они присоединены, образуют циклоалкильное кольцо, циклоалкенильное кольцо, циклоалкинильное кольцо или гетероциклильное кольцо;

каждый J представляет собой, независимо, O, S или $-\text{NR}^{70}$;

каждый R^{60} представляет собой, независимо, прямую связь или алкилен;

каждый R^{70} представляет собой, независимо, водород, алкил, алкенил, алкинил, циклоалкил, гетероциклил, арил, гетероарил, аралкил, галогеналкил, гетероциклилалкил или гетероаралкил;

каждый R^{71} представляет собой, независимо, водород, алкил, алкенил, алкинил, циклоалкил, гетероциклил, арил, гетероарил, аралкил, галогеналкил, гетероциклилалкил, гетероаралкил, $-\text{OR}^{72}$ или $-\text{N}(\text{R}^{73})\text{R}^{74}$;

R^{72} , R^{73} и R^{74} представляют собой, каждый, независимо, водород, алкил, алкенил, алкинил, циклоалкил, гетероциклил, арил, гетероарил, аралкил или гетероаралкил; или

R^{73} и R^{74} , вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют гетероциклильное кольцо или гетероарильное кольцо;

R^{75} и R^{76} представляют собой, каждый, независимо, водород, алкил, алкенил, алкинил, арил, аралкил, гетероарил, гетероаралкил, гетероциклил или гетероциклилалкил; или

R^{75} и R^{76} , вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют гетероциклильное кольцо или гетероарильное кольцо;

каждый R^{77} представляет собой, независимо, алкил, алкенил, циклоалкил, гетероциклил, арил, гетероарил, аралкил или гетероаралкил;

R^{78} представляет собой алкил, гетероарил, гетероциклил, арил, $-\text{OR}^{79}$ или $-\text{N}(\text{R}^{80})\text{R}^{81}$;

R^{79} представляет собой водород, алкил, алкенил, циклоалкил, гетероциклил, арил, гетероарил, аралкил или гетероаралкил;

R^{80} и R^{81} представляют собой, каждый, независимо, водород, алкил, алкенил, алкинил, циклоалкил, гетероциклил, арил, гетероарил, аралкил или гетероаралкил; или

R^{80} и R^{81} , вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют гетероциклильное кольцо или гетероарильное кольцо;

R^{82} представляет собой алкил, алкенил, циклоалкил, гетероциклил, арил, гетероарил, аралкил, гетероаралкил или $-\text{OR}^{83}$; и

каждый R^{83} представляет собой, независимо, алкил, алкенил, циклоалкил, гетероциклил, арил, гетероарил, аралкил или гетероаралкил.

35. Соединение по п.34, в котором

R^3 представляет собой $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{10}$;

где R^{10} представляет собой необязательно замещенный арил, необязательно замещенный гетероарил, необязательно замещенный алкил или необязательно замещенный аралкил.

36. Соединение по п.35, в котором

R^1 представляет собой $-C(O)R^{18}$, $-C(O)OR^{14}$ или $-C(O)N(R^{15})R^{16}$, где R^{14} и R^{15} представляют собой необязательно замещенный алкил, необязательно замещенный циклоалкил или необязательно замещенный гетероциклил, R^{16} представляет собой водород, и R^{18} представляет собой необязательно замещенный алкил.

37. Соединение по п.36, в котором

R^2 представляет собой галоген, водород, необязательно замещенный алкил, необязательно замещенный алкенил, необязательно замещенный алкинил, необязательно замещенный арил, необязательно замещенный гетероарил, необязательно замещенный циклоалкил, необязательно замещенный гетероциклил, необязательно замещенный аралкил или необязательно замещенный гетероаралкил.

38. Соединение по п.37, в котором

R^2 представляет собой водород, галоген или необязательно замещенный алкил; и

R^9 представляет собой водород или необязательно замещенный алкил.

39. Соединение по п.38, в котором R^4 , R^5 , R^6 и R^7 выбираются из а), b), c), d), e), f), g) и h), ниже

a) R^4 и R^5 представляют собой, каждый, независимо, водород или галоген, и R^6 и R^7 представляют собой необязательно замещенный алкил;

b) R^6 и R^7 представляют собой, каждый, независимо, водород или галоген, и R^4 и R^5 представляют собой необязательно замещенный алкил;

c) R^4 , R^5 , R^6 и R^7 представляют собой, каждый, необязательно замещенный алкил;

d) R^4 и R^5 представляют собой, каждый, независимо, водород или галоген, и R^6 и R^7 , вместе с атомом углерода, к которому они присоединены, независимо образуют необязательно замещенный циклоалкил или необязательно замещенное циклоалкенильное кольцо;

e) R^4 и R^5 представляют собой необязательно замещенный алкил, и R^6 и R^7 , вместе с атомом углерода, к которому они присоединены, независимо образуют необязательно замещенный циклоалкил или необязательно замещенное циклоалкенильное кольцо;

f) R^4 и R^5 , вместе с атомом углерода, к которому они присоединены, независимо образуют необязательно замещенный циклоалкил или необязательно замещенное циклоалкенильное кольцо, и R^6 и R^7 представляют собой, каждый, независимо, водород или галоген;

g) R^4 и R^5 , вместе с атомом углерода, к которому они присоединены, независимо образуют необязательно замещенный циклоалкил или необязательно замещенное циклоалкенильное кольцо, и R^6 и R^7 представляют собой необязательно замещенный алкил;

h) R^4 и R^5 , вместе с атомом углерода, к которому они присоединены, независимо образуют необязательно замещенное циклоалкильное кольцо или необязательно замещенное циклоалкенильное кольцо, и R^6 и R^7 , вместе с атомом углерода, к которому они присоединены, независимо образуют необязательно замещенное циклоалкильное кольцо или необязательно замещенное циклоалкенильное кольцо; и

i) R^4 , R^5 , R^6 и R^7 представляют собой, каждый, независимо, водород или галоген.

40. Соединение по п.39, в котором

R^4 и R^5 представляют собой, каждый, независимо, водород или галоген; и

R^6 и R^7 представляют собой необязательно замещенный алкил; или

R^6 и R^7 , вместе с атомом углерода, к которому они присоединены, независимо образуют необязательно замещенное циклоалкильное кольцо.

41. Соединение по п.40, в котором

R^2 представляет собой водород, галоген или необязательно замещенный алкил; и

R^9 представляет собой водород.

42. Соединение по п.41, в котором R^1 представляет собой $-C(O)OCH_2CH_3$, $-C(O)OCH_3$, $-C(O)OCH(CH_3)_2$, $-C(O)OH$, $-C(O)OCH_2CH_2CH_3$

, -C(O)NHCH₃, -C(O)NHCH₂CH₃, -C(O)NHCH(CH₃)₂,
 , -C(O)NH(циклопропил), -C(O)NH(циклопентил), -C(O)NCH(CH₃)(CH₂CH₃)
 или -C(O)N(CH₃)(циклопропил); и

R³ представляет собой -C(O)R¹⁰, где R¹⁰ представляет собой необязательно замещенный арил, необязательно замещенный гетероарил, необязательно замещенный алкил или необязательно замещенный аралкил.

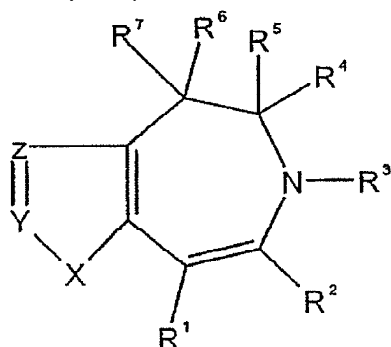
43. Соединение по п.42, в котором указанное соединение представляет собой сложный этиловый эфир 3-(4-фтор-бензоил)-1,1-диметил-1,2,3,6,7,8,9,10-октагидро-азепино[4,5-b]индол-5-карбоновой кислоты.

44. Соединение по п.39, в котором R⁴, R⁵, R⁶ и R⁷ представляют собой, каждый, независимо, водород или галоген.

45. Соединение по п.44, в котором указанное соединение представляет собой сложный этиловый эфир 3-(4-фтор-бензоил)-1,2,3,4,5,6,7,8,9,10-декагидро-азепино[4,5-b]индол-5-карбоновой кислоты или

сложный этиловый эфир 3-(4-фтор-бензоил)-1,2,3,6,7,8,9,10-октагидро-азепино[4,5-b]индол-5-карбоновой кислоты.

46. Фармацевтическая композиция, содержащая соединение, имеющее формулу (I)



(I)

где X представляет собой NR⁹, O или S(O)_t (где t равно 0-2);

Y представляет собой CR³⁰ или N;

Z представляет собой CR³¹ или N;

R³⁰ и R³¹ являются, каждый, независимо, выбранными из группы, состоящей из галогена, водорода, необязательно замещенного алкила, необязательно замещенного алкенила, необязательно замещенного алкинила, необязательно замещенного арила, необязательно замещенного гетероарила, необязательно замещенного циклоалкила, необязательно замещенного циклоалкилалкила, необязательно замещенного гетероциклила, необязательно замещенного гетероциклилалкила, необязательно замещенного аралкила, необязательно замещенного гетероаралкила, -OR³², -SR³², -N(R³³)R³⁴, -N(R³³)S(O)₂R²³; -N(R³⁵)N(R³³)R³⁴, -N(R³⁵)N(R³³)S(O)₂R²³, -C(O)R³⁶, -C(O)OR³², -C(S)OR³², -C(O)SR³², -C(O)N(R³³)R³⁴, -C(S)N(R³³)R³⁴, -C(O)N(R³³)S(O)₂R²³, -C(S)N(R³³)S(O)₂R²³, -C(O)N(R³⁵)N(R³³)R³⁴, -C(S)N(R³⁵)N(R³³)R³⁴ и -C(O)N(R³⁵)N(R³³)S(O)₂R²³; или

R³⁰ и R³¹, вместе с атомами углерода, с которыми они соединены, образуют необязательно замещенное циклоалкильное кольцо, необязательно замещенное циклоалкенильное кольцо, необязательно замещенное циклоалкинильное кольцо, необязательно замещенное гетероциклильное кольцо, необязательно замещенное гетероарильное кольцо или необязательно замещенный арил, за исключением замещенного или незамещенного фенила или замещенного или незамещенного нафтила;

R³², R³³, R³⁴, R³⁵ и R³⁶ выбираются, как в (а) или (б), следующим образом:

(а) R³², R³³, R³⁴, R³⁵ и R³⁶ представляют собой, каждый, независимо, водород, необязательно замещенный алкил, необязательно замещенный алкенил, необязательно замещенный алкинил, необязательно замещенный циклоалкил, необязательно замещенный арил, необязательно замещенный аралкил, необязательно замещенный

гетероциклил, необязательно замещенный гетероарил или необязательно замещенный гетероаралкил; или (b) R^{33} и R^{34} , вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют необязательно замещенное гетероциклильное кольцо или необязательно замещенное гетероарильное кольцо, а другие группы из R^{32} , R^{33} , R^{34} , R^{35} и R^{36} выбираются, как в (а) выше;

R^1 и R^2 являются, каждый, независимо выбранными из группы, состоящей из галогена, водорода, необязательно замещенного алкила, необязательно замещенного алкенила, необязательно замещенного алкинила, необязательно замещенного арила, необязательно замещенного гетероарила, необязательно замещенного циклоалкила, необязательно замещенного гетероциклила, необязательно замещенного аралкила, необязательно замещенного гетероаралкила, $-OR^{14}$, $-SR^{14}$, $-N(R^{15})R^{16}$, $-N(R^{15})S(O)_2R^{23}$; $-N(R^{17})N(R^{15})R^{16}$, $-N(R^{17})N(R^{15})S(O)_2R^{23}$, $-C(O)R^{18}$, $-C(O)OR^{14}$, $-C(S)OR^{14}$, $-C(O)SR^{14}$, $-C(O)N(R^{15})R^{16}$, $-C(O)N(R^{15})S(O)_2R^{23}$, $-C(O)N(R^{15})N=R^{16}$, $-C(O)N(R^{17})N(R^{15})R^{16}$ и $-C(O)N(R^{17})N(R^{15})S(O)_2R^{23}$;

R^3 представляет собой водород, необязательно замещенный алкил, необязательно замещенный алкенил, необязательно замещенный алкинил, необязательно замещенный циклоалкил, необязательно замещенный арил, необязательно замещенный аралкил, необязательно замещенный гетероарил, необязательно замещенный гетероциклил, необязательно замещенный

гетероаралкил, $-C(O)R^{10}$, $-C(O)OR^{10}$, $-S(O)_2R^{10}$, $-C(O)N(R^{11})R^{12}$, $-C(O)N(R^{11})S(O)_2R^{23}$, $-C(O)N(R^{13})N(R^{11})R^{12}$, $-C(O)N(R^{13})N(R^{11})S(O)_2R^{23}$, $-N(R^{13})C(O)R^{10}$, $-N(R^{13})C(O)N(R^{11})R^{12}$, $-N(R^{13})C(O)N(R^{11})S(O)_2R^{23}$, $-N(R^{10})C(O)N(R^{13})N(R^{11})R^{12}$, $-N(R^{10})C(O)N(R^{13})N(R^{11})S(O)_2R^{23}$, $-N(R^{13})C(O)OR^{10}$, $-P(O)OR^{10}$ или $-P(O)(OR^{19})OR^{12}$;

R^4 , R^5 , R^6 и R^7 являются, каждый, независимо выбранными из группы, состоящей из водорода, галогена, необязательно замещенного алкила, необязательно замещенного алкенила, необязательно замещенного алкинила, необязательно замещенного арила, необязательно замещенного гетероарила, необязательно замещенного циклоалкила, необязательно замещенного гетероциклила, необязательно замещенного аралкила, необязательно замещенного

гетероаралкила, $-OR^{14}$, $-SR^{14}$, $-S(O)_2R^{14}$, $-N(R^{15})R^{16}$, $-N(R^{15})S(O)_2R^{23}$, $-N(R^{15})C(O)R^{23}$, $-C(O)R^{18}$, $-C(O)OR^{20}$, $-C(O)N(R^{21})R^{22}$, $-C(O)N(R^{21})S(O)_2R^{23}$; $-C(O)N(R^{24})N(R^{21})R^{22}$ и $-C(O)N(R^{24})N(R^{21})S(O)_2R^{23}$; или

R^6 и R^7 вместе образуют оксо, тиоксо, необязательно замещенную имино, необязательно замещенный оксим или необязательно замещенный гидразон, или R^6 и R^7 , вместе с атомом углерода, к которому они присоединены, образуют необязательно замещенную экзоциклическую двойную связь, и R^4 и R^5 являются такими, как описано выше; или

R^4 и R^5 вместе образуют оксо, тиоксо, необязательно замещенную имино, необязательно замещенный оксим или необязательно замещенный гидразон, или R^4 и R^5 , вместе с атомом углерода, к которому они присоединены, образуют необязательно замещенную экзоциклическую двойную связь, и R^6 и R^7 являются такими, как описано выше; или

R^4 и R^5 , или R^4 и R^6 , или R^4 и R^7 , или R^5 и R^6 , или R^5 и R^7 , или R^6 и R^7 , вместе с атомом углерода, к которому они присоединены, образуют необязательно замещенное циклоалкильное кольцо, необязательно замещенное гетероциклильное кольцо, необязательно замещенное циклоалкенильное кольцо или вместе образуют двойную связь, а другие группы из R^4 , R^5 , R^6 и R^7 являются такими, как описано выше; или R^4 и R^5 , вместе с атомом углерода, к которому они присоединены, и R^6 и R^7 , вместе с атомом углерода, к которому они присоединены, образуют необязательно замещенное циклоалкильное кольцо, необязательно замещенное гетероциклильное кольцо или необязательно замещенное циклоалкенильное кольцо;

R^9 представляет собой водород, необязательно замещенный алкил, $-C(O)R^{18}$, $-C(O)OR^{20}$ или $-S(O)_2R^{23}$;

R^{10} , R^{11} , R^{12} , R^{13} и R^{19} выбираются, как в (а) или (b), следующим образом:
 (а) R^{10} , R^{11} , R^{12} , R^{13} и R^{19} , каждый, независимо, представляют собой водород, необязательно замещенный алкил, необязательно замещенный алкенил, необязательно замещенный алкинил, необязательно замещенный циклоалкил, необязательно замещенный арил, необязательно замещенный аралкил, необязательно замещенный гетероциклил, необязательно замещенный гетероарил или необязательно замещенный гетероаралкил; или (b) R^{11} и R^{12} или R^{12} и R^{19} , вместе с атомами, с которыми они соединены, образуют необязательно замещенное гетероциклильное кольцо или необязательно замещенное гетероарильное кольцо; и другие группы из R^{10} , R^{11} , R^{12} , R^{13} и R^{19} выбираются, как в (а), выше;

R^{14} , R^{15} , R^{16} , R^{17} и R^{18} выбираются, как в (а) или (b), следующим образом:
 (а) R^{14} , R^{15} , R^{16} , R^{17} и R^{18} представляют собой, каждый, независимо, водород, необязательно замещенный алкил, необязательно замещенный алкенил, необязательно замещенный алкинил, необязательно замещенный циклоалкил, необязательно замещенный арил, необязательно замещенный аралкил, необязательно замещенный гетероциклил, необязательно замещенный гетероарил или необязательно замещенный гетероаралкил; или (b) R^{15} и R^{16} , вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют необязательно замещенное гетероциклильное кольцо или необязательно замещенное гетероарильное кольцо, а другие группы из R^{14} , R^{15} , R^{16} , R^{17} и R^{18} выбираются как в (а), выше;

R^{20} , R^{21} , R^{22} и R^{24} выбираются, как в (а) или (b), следующим образом: (а) R^{20} , R^{21} , R^{22} и R^{24} представляют собой, каждый, независимо, водород, необязательно замещенный алкил, необязательно замещенный алкенил, необязательно замещенный алкинил, необязательно замещенный циклоалкил, необязательно замещенный арил, необязательно замещенный аралкил, необязательно замещенный гетероциклил, необязательно замещенный гетероарил, или необязательно замещенный гетероаралкил; или (b) R^{21} и R^{22} , вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют необязательно замещенное гетероциклильное кольцо или необязательно замещенное гетероарильное кольцо, а другие группы из R^{20} , R^{21} , R^{22} и R^{24} выбираются, как в (а), выше;

R^{23} представляет собой необязательно замещенный алкил, необязательно замещенный алкенил, необязательно замещенный алкинил, необязательно замещенный циклоалкил, необязательно замещенный арил, необязательно замещенный аралкил, необязательно замещенный гетероциклил, необязательно замещенный гетероарил или необязательно замещенный гетероаралкил;

каждый из R^1 - R^{24} и R^{30} - R^{36} , когда они замещены, являются замещенными одним или несколькими заместителями, каждый независимо, выбранными из Q^1 ;

каждый Q^1 является независимо выбранным из галогена, псевдогалогена, оксо, тиоксо, циано, тиоциано, изоциано, нитро, азидо, алкила, галогеналкила, алкенила, содержащего 1-2 двойных связи, алкинила, содержащего 1-2 тройных связи, циклоалкила, циклоалкенила, циклоалкинила, циклоалкилалкила, гетероциклила, гетероциклилалкила, арила, гетероарила, аралкила, аралкенила, аралкинила, гетероарилалкила, алкилидена, арилалкилидена, арилоксиарилкарбониламино, гидроксикарбонилалкилтио, галогенсульфонила, $-OR^{70}$, $-SR^{70}$, $-R^{60}-C(J)R^{71}$, $-R^{60}-N(R^{70})C(J)R^{71}$, $-OC(O)R^{71}$, $-R^{60}-N(R^{75})(R^{76})$, $-N^+(R^{77})_3$, $-P(R^{78})_2$, $-P(O)(R^{78})_2$, $-OP(O)(R^{78})_2$, $-N(R^{70})S(O)_2R^{71}$, $-S(O)_2R^{71}$, $-S(O)R^{82}$, $-OS(O)R^{83}$, $-OS(O)_2R^{83}$ или $-Si(R^{83})_3$;

две Q^1 группы, которые замещают атомы в 1,2 или 1,3 положении, вместе с атомами углерода, с которыми они соединены, образуют циклоалкильное кольцо, циклоалкенильное кольцо, циклоалкинильное кольцо или гетероциклильное кольцо; или

каждый из Q^1 является, независимо, незамещенным или замещенным одним или несколькими заместителями, независимо выбранными, каждый, из Q^2 ;

каждый Q^2 является независимо выбранным из галогена, псевдогалогена, оксо, тиоксо, циано, тиоциано, изоциано, нитро, азидо, алкила, галогеналкила, алкенила, содержащего

1-2 двойных связи, алкинила, содержащего 1-2 тройных связи, циклоалкила, циклоалкенила, циклоалкинила, циклоалкилалкила, гетероциклила, гетероциклилалкила, арила, гетероарила, аралкила, аралкенила, аралкинила, гетероарилалкила, алкилидена, арилалкилидена, арилоксиарилкарбониламино, гидроксикарбонилалкилтио, галогенсульфонила, $-OR^{70}$, $-SR^{70}$, $-R^{60}-C(J)R^{71}$, $-R^{60}-N(R^{70})C(J)R^{71}$, $-OC(O)R^{71}$, $-R^{60}-N(R^{75})(R^{76})$, $-N^+(R^{77})_3$, $-P(R^{78})_2$, $-P(O)(R^{78})_2$, $-OP(O)(R^{78})_2$, $-N(R^{70})S(O)_2R^{71}$, $-S(O)_2R^{71}$, $-S(O)R^{82}$, $-OS(O)R^{83}$, $-OS(O)_2R^{83}$ или $-Si(R^{83})_3$;

две группы Q^2 , которые замещают атомы в 1,2 или 1,3 положении, вместе с атомами углерода, с которыми они соединены, образуют циклоалкильное кольцо, циклоалкенильное кольцо, циклоалкинильное кольцо или гетероциклильное кольцо;

каждый J представляет собой, независимо, O, S или $-NR^{70}$;

каждый R^{60} представляет собой, независимо, прямую связь или алкилен;

каждый R^{70} представляет собой, независимо, водород, алкил, алкенил, алкинил, циклоалкил, гетероциклил, арил, гетероарил, аралкил, галогеналкил, гетероциклилалкил или гетероаралкил;

каждый R^{71} представляет собой, независимо, водород, алкил, алкенил, алкинил, циклоалкил, гетероциклил, арил, гетероарил, аралкил, галогеналкил, гетероциклилалкил, гетероаралкил, $-OR^{72}$ или $-N(R^{73})R^{74}$;

R^{72} , R^{73} и R^{74} представляют собой, каждый, независимо, водород, алкил, алкенил, алкинил, циклоалкил, гетероциклил, арил, гетероарил, аралкил или гетероаралкил; или

R^{73} и R^{74} , вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют гетероциклильное кольцо или гетероарильное кольцо;

R^{75} и R^{76} представляют собой, каждый, независимо, водород, алкил, алкенил, алкинил, арил, аралкил, гетероарил, гетероаралкил, гетероциклил или гетероциклилалкил; или

R^{75} и R^{76} , вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют гетероциклильное кольцо или гетероарильное кольцо;

каждый R^{77} представляет собой, независимо, алкил, алкенил, циклоалкил, гетероциклил, арил, гетероарил, аралкил или гетероаралкил;

R^{78} представляет собой алкил, гетероарил, гетероциклил, арил, $-OR^{79}$ или $-N(R^{80})R^{81}$;

R^{79} представляет собой водород, алкил, алкенил, циклоалкил, гетероциклил, арил, гетероарил, аралкил или гетероаралкил;

R^{80} и R^{81} представляют собой, каждый, независимо, водород, алкил, алкенил, алкинил, циклоалкил, гетероциклил, арил, гетероарил, аралкил или гетероаралкил; или

R^{80} и R^{81} , вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют гетероциклильное кольцо или гетероарильное кольцо;

R^{82} представляет собой алкил, алкенил, циклоалкил, гетероциклил, арил, гетероарил, аралкил, гетероаралкил или $-OR^{83}$; и

каждый R^{83} представляет собой, независимо, алкил, алкенил, циклоалкил, гетероциклил, арил, гетероарил, аралкил или гетероаралкил;

в виде отдельного изомера, смеси изомеров или в виде рацемической смеси изомеров; или в виде сольвата или полиморфа; или в виде пролекарства; или в виде их фармацевтически приемлемой соли.

47. Способ лечения, профилактики или облегчения одного или нескольких симптомов заболевания или расстройства, в которое вовлечена активность X рецептора фарнезоидов, включающий в себя введение субъекту, нуждающемуся в этом, эффективного количества вещества по пп.1-46.

48. Способ по п.47, в котором заболевание или расстройство выбирается из гиперлипидемии, гиперхолестеринемии, гипертриглицеридемии, дислипидемии, липодистрофии, атеросклероза, атеросклеротического заболевания, осложнений атеросклеротического заболевания, атеросклеротического сердечно-сосудистого заболевания, Синдрома X, сахарного диабета, диабета II типа, нечувствительности к инсулину, гипергликемии, холестаза и тучности.