



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА  
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ,  
ПАТЕНТАМ И ТОВАРНЫМ ЗНАКАМ

## (12) ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ

(21), (22) Заявка: 2007126761/04, 12.12.2005

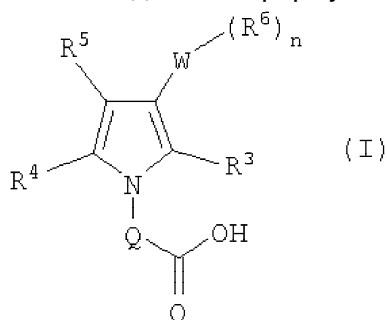
(30) Конвенционный приоритет:  
14.12.2004 GB 0427381.9

(43) Дата публикации заявки: 27.01.2009 Бюл. № 3

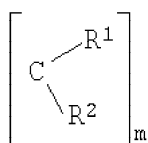
(85) Дата перевода заявки РСТ на национальную фазу:  
16.07.2007(86) Заявка РСТ:  
EP 2005/013297 (12.12.2005)(87) Публикация РСТ:  
WO 2006/063763 (22.06.2006)Адрес для переписки:  
101000, Москва, пер. М.Златоустинский, 10,  
кв.15, бюро "ЕВРОМАРКПАТ", И.А.Веселицкой(71) Заявитель(и):  
НОВАРТИС АГ (CH)(72) Автор(ы):  
АДКОК Клэр (GB),  
ЛЕБЛАН Катрин (GB),  
САНДХЭМ Дейвид Эндрю (GB),  
УОТСОН Саймон Джеймс (GB),  
БАЛА Камиеш Джагдис (GB)(54) ПРОИЗВОДНЫЕ ПИРРОЛА, ОБЛАДАЮЩИЕ АНТАГОНИСТИЧЕСКОЙ АКТИВНОСТЬЮ ПО ОТНОШЕНИЮ К РЕЦЕПТОРУ CRTh<sub>2</sub>

(57) Формула изобретения

1. Соединение формулы (I)



в форме свободного основания или фармацевтически приемлемой соли, в которой Q обозначает



R<sup>1</sup> и R<sup>2</sup> независимо обозначают H, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-алкил или совместно с атомом углерода, к которому они присоединены, образуют двухвалентную C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-циклоалифатическую группу;

R<sup>3</sup> и R<sup>4</sup> независимо выбраны из группы, включающей H и C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-алкил;

R<sup>5</sup> выбран из группы, включающей H,

галоген, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-алкил, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-галогеналкил, C<sub>3</sub>-C<sub>15</sub>-карбоциклическую группу, нитрогруппу, цианогруппу, SO<sub>2</sub>R<sup>5a</sup>, SOR<sup>5b</sup>, SR<sup>5c</sup>, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-алкилкарбонил, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-алкоксикарбонил, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-алкоксигруппу, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-галогеналкоксигруппу, карбоксигруппу, карбокси-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-алкил, аминокгруппу, амино(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-алкил), C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-алкиламиногруппу, ди(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-алкил)аминогруппу, SO<sub>2</sub>NR<sup>5d</sup> R<sup>5e</sup>, -C(O)NR<sup>5f</sup> R<sup>5g</sup>, C<sub>6</sub>-C<sub>15</sub>-ароматическую карбоциклическую группу и 4-10-членную гетероциклическую группу, содержащую один или более гетероатомов, выбранных из группы, включающей кислород, азот и серу;

R<sup>5a</sup>, R<sup>5b</sup> и R<sup>5c</sup> независимо выбраны из группы, включающей C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-алкил, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-гидроксиалкил, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-алкиламино(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-алкил), ди(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-алкил)амино(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-алкил), C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-цианоалкил, C<sub>3</sub>-C<sub>15</sub>-карбоциклическую группу, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-галогеналкил и 4-10-членную гетероциклическую группу, содержащую один или более гетероатомов, выбранных из группы, включающей кислород, азот и серу;

R<sup>5d</sup>, R<sup>5e</sup>, R<sup>5f</sup> и R<sup>5g</sup> независимо обозначают H, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-алкил, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-гидроксиалкил, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-алкиламино(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-алкил), ди(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-алкил)амино(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-алкил), C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-цианоалкил, C<sub>3</sub>-C<sub>15</sub>-карбоциклическую группу, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-галогеналкил, 4-10-членную гетероциклическую группу, содержащую один или более гетероатомов, выбранных из группы, включающей кислород, азот и серу, или совместно с атомом азота, к которому они присоединены, образуют C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>-гетероциклическую группу;

R<sup>6</sup> выбран из группы, включающей H, галоген, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-алкил, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-галогеналкил, C<sub>3</sub>-C<sub>15</sub>-карбоциклическую группу, нитрогруппу, цианогруппу, SO<sub>2</sub>R<sup>6a</sup>, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-алкилкарбонил, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-алкоксикарбонил, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-алкоксигруппу, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-галогеналкоксигруппу, -SR<sup>6d</sup>, карбоксигруппу, карбокси-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-алкил, аминокгруппу, амино(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-алкил), C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-алкиламино(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-алкил), ди(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-алкил)амино(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-алкил), C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-алкиламиногруппу, ди(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-алкил)аминогруппу, SO<sub>2</sub>NR<sup>6c</sup> R<sup>6b</sup>, -C(O)NR<sup>6e</sup>R<sup>6f</sup>, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-гидроксиалкил, NR<sup>6g</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>6h</sup>, NR<sup>6i</sup>(CO)R<sup>6j</sup>, SOR<sup>6k</sup>, C<sub>6</sub>-C<sub>15</sub>-ароматическую карбоциклическую группу и 4-10-членную гетероциклическую группу, содержащую один или более гетероатомов, выбранных из группы, включающей кислород, азот и серу;

R<sup>6a</sup>, R<sup>6k</sup> и R<sup>6b</sup> независимо выбраны из группы, включающей C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-алкил, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-гидроксиалкил, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-алкиламино(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-алкил), ди(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-алкил)амино(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-алкил), C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-цианоалкил, C<sub>3</sub>-C<sub>15</sub>-карбоциклическую группу, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-галогеналкил и 4-10-членную гетероциклическую группу, содержащую один или более гетероатомов, выбранных из группы, включающей кислород, азот и серу;

R<sup>6c</sup>, R<sup>6d</sup>, R<sup>6e</sup> и R<sup>6f</sup> независимо обозначают H, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-алкил, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-гидроксиалкил, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-алкиламино(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-алкил), ди(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-алкил)амино(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-алкил), C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-цианоалкил, C<sub>3</sub>-C<sub>15</sub>-карбоциклическую группу, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-галогеналкил, 4-10-членную гетероциклическую группу, содержащую один или более гетероатомов, выбранных из группы, включающей кислород, азот и серу, или совместно с атомом азота, к которому они присоединены, образуют C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>-гетероциклическую группу;

R<sup>6g</sup> и R<sup>6i</sup> независимо выбраны из группы, включающей H, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-алкил, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-гидроксиалкил, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-алкиламино(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-алкил), ди(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-алкил)амино(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-алкил), C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-цианоалкил, C<sub>3</sub>-C<sub>15</sub>-карбоциклическую группу, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-галогеналкил и 4-10-членную гетероциклическую группу, содержащую один или более гетероатомов, выбранных из группы, включающей кислород, азот и серу;

R<sup>6h</sup> и R<sup>6j</sup> независимо выбраны из группы, включающей C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-алкил, C<sub>3</sub>-C<sub>15</sub>-карбоциклическую группу, 4-10-членную гетероциклическую группу, содержащую один или более гетероатомов, выбранных из группы, включающей кислород, азот и серу, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-гидроксиалкил,

амино(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-алкил), C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-алкиламино(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-алкил), ди(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-алкил)амино(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-алкил) и C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-цианоалкил;

W выбран из группы, включающей C<sub>3</sub>-C<sub>15</sub> карбоциклическую группу и 4-10-членный гетероцикл, содержащий один или более гетероатомов, выбранных из группы, включающей кислород, азот и серу;

m обозначает целое число, равное 1-3; и

n обозначает целое число, равное 1-4.

2. Соединение формулы (I) по п.1 в форме свободного основания или фармацевтически приемлемой соли,

в которой символы обозначают указанные ниже значения независимо, совместно или в любой комбинации или субкомбинации:

(i) R<sup>1</sup> и R<sup>2</sup> независимо обозначают H или C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-алкил;

(ii) R<sup>3</sup> и R<sup>4</sup> обозначают H или C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-алкил;

(iii) R<sup>5</sup> обозначает цианогруппу;

(iv) R<sup>6</sup> обозначает H, галоген, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-алкил, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-галогеналкил, цианогруппу, SO<sub>2</sub>R<sup>6a</sup> и -SR<sup>6b</sup>;

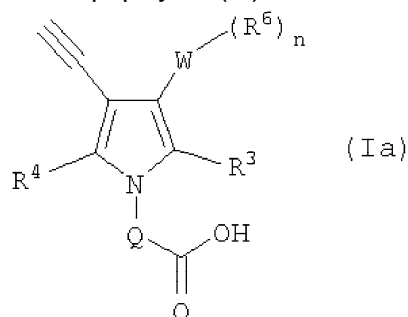
(v) R<sup>6a</sup> и R<sup>6b</sup> независимо выбраны из группы, включающей C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-алкил, C<sub>3</sub>-C<sub>15</sub>-карбоциклическую группу и C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-галогеналкил;

(vi) W обозначает C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> карбоциклическую группу или 4-10-членную гетероциклическую группу, содержащую один или более кольцевых атомов кислорода;

(vii) m равно 1; и

(viii) n обозначает целое число, равное 1-4.

3. Соединение по п.1 в форме свободного основания или фармацевтически приемлемой соли формулы (Ia)



4. Соединение по п.3, в форме свободного основания или фармацевтически приемлемой соли, в котором

R<sup>3</sup> и R<sup>4</sup> обозначают H; и

R<sup>6</sup> выбран из группы, включающей H, галоген, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> галогеналкил, цианогруппу, SO<sub>2</sub>R<sup>6a</sup> и -SR<sup>6b</sup>;

R<sup>6a</sup> и R<sup>6b</sup> независимо выбраны из группы, включающей C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкил, C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-карбоциклическую группу и C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-галогеналкил; и n обозначает целое число, равное 2-3.

5. Соединение по п.1, выбранное из группы, включающей:

[3-(3,5-бис-трифторметилфенил)-4-цианопиррол-1-ил]-уксусную кислоту;

[3-циано-4-(3,5-дихлорфенил)-пиррол-1-ил]-уксусную кислоту;

[3-циано-4-(2,2-дифторбензо[1,3]диоксол-4-ил)-пиррол-1-ил]-уксусную кислоту;

[3-циано-4-(2,3-дихлорфенил)-пиррол-1-ил]-уксусную кислоту;

(3-циано-4-фенилпиррол-1-ил)уксусную кислоту;

(3-бензо[1,3]диоксол-4-ил-4-цианопиррол-1-ил)-уксусную кислоту;

[3-(2-хлорфенил)-4-цианопиррол-1-ил]-уксусную кислоту;

[3-(3-хлорфенил)-4-цианопиррол-1-ил]-уксусную кислоту;

[3-(4-хлорфенил)-4-цианопиррол-1-ил]-уксусную кислоту;

[3-циано-4-(4-фторфенил)-пиррол-1-ил]-уксусную кислоту;

[3-циано-4-(4-трифторметилфенил)-пиррол-1-ил]-уксусную кислоту;

[3-циано-4-(3-трифторметилфенил)-пиррол-1-ил]-уксусную кислоту;

[3-циано-4-(3-цианофенил)-пиррол-1-ил]-уксусную кислоту;  
[3-циано-4-(3,5-дифторфенил)-пиррол-1-ил]-уксусную кислоту;  
[3-циано-4-(2,5-дихлорфенил)-пиррол-1-ил]-уксусную кислоту;  
[3-(3-хлор-2-фторфенил)-4-цианопиррол-1-ил]-уксусную кислоту;  
[3-(2-хлор-5-трифторметилфенил)-4-цианопиррол-1-ил]-уксусную кислоту;  
[3-циано-4-(2-цианофенил)-пиррол-1-ил]-уксусную кислоту;  
[3-циано-4-(3-фторфенил)-пиррол-1-ил]-уксусную кислоту;  
[3-циано-4-(2,6-дихлорфенил)-пиррол-1-ил]-уксусную кислоту;  
[3-(2,5-бис-трифторметилфенил)-4-цианопиррол-1-ил]-уксусную кислоту;  
[3-(2-хлор-3-трифторметилфенил)-4-цианопиррол-1-ил]-уксусную кислоту;  
[3-циано-4-(2-фтор-3-трифторметилфенил)-пиррол-1-ил]-уксусную кислоту;  
[3-циано-4-(2-трифторметилфенил)-пиррол-1-ил]-уксусную кислоту;  
[3-(3-хлор-2-фтор-5-трифторметилфенил)-4-цианопиррол-1-ил]-уксусную кислоту;  
[3-циано-4-(3-фтор-5-трифторметилфенил)-пиррол-1-ил]-уксусную кислоту;  
[3-циано-4-(3-трифторметилсульфанилфенил)-пиррол-1-ил]-уксусную кислоту;  
[3-циано-4-(3-метансульфонилфенил)-пиррол-1-ил]-уксусную кислоту;  
[3-(3-хлор-5-цианофенил)-4-цианопиррол-1-ил]-уксусную кислоту;  
4-(3,5-бис-трифторметилфенил)-1-карбоксиметил-1Н-пиррол-3-карбоновую кислоту;  
[3-(3,5-бис-трифторметилфенил)-4-диметилкарбамоилпиррол-1-ил]-уксусную кислоту;  
[3-(3-хлор-5-трифторметилфенил)-4-цианопиррол-1-ил]-уксусную кислоту;  
3-циано-4-(3-пиридин-3-илпиррол-1-ил)-уксусную кислоту;  
3-циано-4-(3,5-диметоксифенил)-пиррол-1-ил]-уксусную кислоту;  
(3-бензофуран-2-ил-4-цианопиррол-1-ил)-уксусную кислоту;  
[3-циано-4-(3-йод-5-трифторметилфенил)-пиррол-1-ил]-уксусную кислоту;  
[3-циано-4-(3-циано-5-трифторметилфенил)-пиррол-1-ил]-уксусную кислоту;  
[3-циано-4-(3-этансульфонил-5-трифторметилфенил)-пиррол-1-ил]-уксусную кислоту;  
[3-циано-4-[3-(пиперидин-1-сульфонил)-5-трифторметилфенил]-пиррол-1-ил]-уксусную кислоту;  
[3-циано-4-[3-(этилметилсульфамоил)-5-трифторметилфенил]-пиррол-1-ил]-уксусную кислоту;  
[3-циано-4-[3-(пирролидин-1-сульфонил)-5-трифторметилфенил]-пиррол-1-ил]-уксусную кислоту;  
[3-циано-4-(3-диэтилсульфамоил-5-трифторметилфенил)-пиррол-1-ил]-уксусную кислоту;  
[3-циано-4-{3[4-(2-цианэтил)пиперазин-1-сульфонил]-5-трифторметилфенил}]-пиррол-1-ил]-уксусную кислоту;  
[3-(3-бутилсульфамоил-5-трифторметилфенил)-4-цианопиррол-1-ил]-уксусную кислоту;  
3-циано-4-{3[(2-цианэтил)метилсульфамоил-5-трифторметилфенил]-пиррол-1-ил]-уксусную кислоту;  
{3-циано-4-[3-(морфолин-4-сульфонил)-5-трифторметилфенил]-пиррол-1-ил]-уксусную кислоту;  
{3-циано-4-[3-(2,2-диметилпропилсульфамоил)-5-трифторметилфенил]-пиррол-1-ил]-уксусную кислоту;  
{3-[3-(бутилметилсульфамоил)-5-трифторметилфенил]-4-цианопиррол-1-ил]-уксусную кислоту;  
[3-циано-4-(циклобутилсульфамоил-5-трифторметилфенил)-пиррол-1-ил]-уксусную кислоту;  
[3-циано-4-(циклогексилсульфамоил-5-трифторметилфенил)-пиррол-1-ил]-уксусную кислоту;  
3-циано-4-(3-трифторметансульфонилфенил)-пиррол-1-ил]-уксусную кислоту;  
{3-[3-хлор-5-(пиперидин-1-сульфонил)-фенил]-4-цианопиррол-1-ил]-уксусную кислоту;  
{3-[3-хлор-5-(пирролидин-1-сульфонил)-фенил]-4-цианопиррол-1-ил]-уксусную кислоту;  
3-(3-бутилсульфамоил-5-хлорфенил)-4-цианопиррол-1-ил]-уксусную кислоту;  
{3-[3-хлор-5-(морфолин-4-сульфонил)-фенил]-4-цианопиррол-1-ил]-уксусную кислоту;  
(3-{3-хлор-5-[4-(2-цианэтил)-пиперазин-1-сульфонил]-фенил}-4-цианопиррол-1-ил)-уксусную кислоту;

[3-(3-хлор-5-этансульфонилфенил)-4-цианопиррол-1-ил]-уксусную кислоту;  
 (3-{3-хлор-5-[(2-гидроксиэтил)-метилсульфамоил]-фенил}-4-цианопиррол-1-ил)-уксусную кислоту;  
 {3-[3-(бутан-1-сульфонил)-5-трифторметилфенил]-4-цианопиррол-1-ил}-уксусную кислоту;  
 {3-циано-4-(3-(пропан-1-сульфонил)-5-трифторметилфенил)-пиррол-1-ил}-уксусную кислоту;  
 [3-циано-4-(4'-фтор-5-трифторметилбифенил-3-ил)-пиррол-1-ил]-уксусную кислоту;  
 3-(3-хлор-5-диметилсульфамоилфенил)-4-цианопиррол-1-ил]-уксусную кислоту;  
 [3-циано-4-(3-диметилсульфамоил-5-трифторметилфенил)-пиррол-1-ил]-уксусную кислоту;  
 {3-циано-4-(3-(пропан-2-сульфонил)-5-трифторметилфенил)-пиррол-1-ил}-уксусную кислоту;  
 [3-циано-4-(3-метансульфонил-5-трифторметилфенил)-пиррол-1-ил]-уксусную кислоту; и  
 2-[3-(3,5-бис-трифторметилфенил)-4-цианопиррол-1-ил]-пропионовую кислоту.

6. Соединение по любому из пп.1-5, предназначенное для применения в качестве фармацевтического средства.

7. Фармацевтические композиции, включающие соединение по любому из пп.1-5.

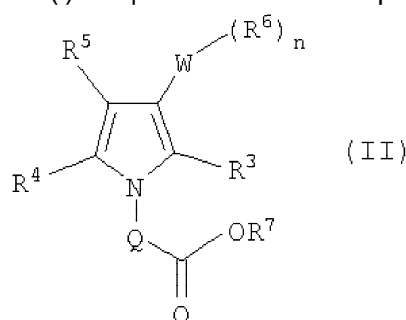
8. Применение соединения по любому из пп.1-5 для приготовления лекарственного средства, предназначенного для лечения заболевания, опосредуемого рецептором CRTh<sub>2</sub>.

9. Применение соединения по любому из пп.1-5 для приготовления лекарственного средства, предназначенного для лечения воспалительного или аллергического патологического состояния, предпочтительно - воспалительного или обструктивного заболевания дыхательных путей.

10. Комбинация соединения по любому из пп.1-5 с противовоспалительным, бронхорасширяющим, антигистаминным или противокашлевым лекарственным веществом.

11. Способ получения соединений формулы (I) по п.1 в форме свободного основания или фармацевтически приемлемой соли, включающий стадии:

(i) отщепления сложной эфирной группы -COOR<sup>7</sup> в соединении формулы (II)

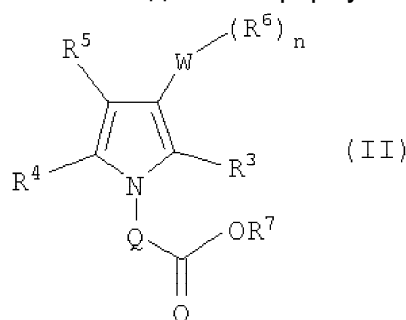


в которой R<sup>7</sup> обозначает C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-алкил;

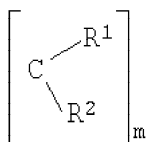
а все иные радикалы обладают значениями, определенными выше; и

(ii) восстановления полученного соединения формулы (I), в форме свободного основания или фармацевтически приемлемой соли.

12. Соединение формулы (II)



в форме свободного основания или фармацевтически приемлемой соли, в которой Q обозначает



$R^1$  и  $R^2$  независимо обозначают H,  $C_1$ - $C_8$ -алкил или совместно с атомом углерода, к которому они присоединены, образуют двухвалентную  $C_3$ - $C_8$ -циклоалифатическую группу;

$R^3$  и  $R^4$  независимо выбраны из группы, включающей H и  $C_1$ - $C_8$ -алкил;

$R^5$  выбран из группы, включающей H, галоген,  $C_1$ - $C_8$ -алкил,  $C_1$ - $C_8$ -галогеналкил,  $C_3$ - $C_{15}$ -карбоциклическую группу, нитрогруппу, цианогруппу,  $SO_2R^{5a}$ ,  $SOR^{5b}$ ,  $SR^{5c}$ ,  $C_1$ - $C_8$ -алкилкарбонил,  $C_1$ - $C_8$ -алкоксикарбонил,  $C_1$ - $C_8$ -алкоксигруппу,  $C_1$ - $C_8$ -галогеналкоксигруппу, карбоксигруппу, карбокси- $C_1$ - $C_8$ -алкил, аминогруппу, амино( $C_1$ - $C_8$ -алкил),  $C_1$ - $C_8$ -алкиламиногруппу, ди( $C_1$ - $C_8$ -алкил)аминогруппу,  $SO_2NR^{5d}$   $R^{5e}$ ,  $-C(O)NR^{5f}$   $R^{5g}$ ,  $C_6$ - $C_{15}$ -ароматическую карбоциклическую группу и 4-10-членную гетероциклическую группу, содержащую один или более гетероатомов, выбранных из группы, включающей кислород, азот и серу;

$R^{5a}$ ,  $R^{5b}$  и  $R^{5c}$  независимо выбраны из группы, включающей  $C_1$ - $C_8$ -алкил,  $C_1$ - $C_8$ -гидроксиалкил,  $C_1$ - $C_8$ -алкиламино( $C_1$ - $C_8$ -алкил), ди( $C_1$ - $C_8$ -алкил)амино( $C_1$ - $C_8$ -алкил),  $C_1$ - $C_8$ -цианоалкил,  $C_3$ - $C_{15}$ -карбоциклическую группу,  $C_1$ - $C_8$ -галогеналкил и 4-10-членную гетероциклическую группу, содержащую один или более гетероатомов, выбранных из группы, включающей кислород, азот и серу;

$R^{5d}$ ,  $R^{5e}$ ,  $R^{5f}$  и  $R^{5g}$  независимо обозначают H,  $C_1$ - $C_8$ -алкил,  $C_1$ - $C_8$ -гидроксиалкил,  $C_1$ - $C_8$ -алкиламино( $C_1$ - $C_8$ -алкил), ди( $C_1$ - $C_8$ -алкил)амино( $C_1$ - $C_8$ -алкил),  $C_1$ - $C_8$ -цианоалкил,  $C_3$ - $C_{15}$ -карбоциклическую группу,  $C_1$ - $C_8$ -галогеналкил, 4-10-членную гетероциклическую группу, содержащую один или более гетероатомов, выбранных из группы, включающей кислород, азот и серу, или совместно с атомом азота, к которому они присоединены, образуют  $C_4$ - $C_{10}$ -гетероциклическую группу;

$R^6$  выбран из группы, включающей H, галоген,  $C_1$ - $C_8$ -алкил,  $C_1$ - $C_8$ -галогеналкил,  $C_3$ - $C_{15}$ -карбоциклическую группу, нитрогруппу, цианогруппу,  $SO_2R^{6a}$ ,  $C_1$ - $C_8$ -алкилкарбонил,  $C_1$ - $C_8$ -алкоксикарбонил,  $C_1$ - $C_8$ -алкоксигруппу,  $C_1$ - $C_8$ -галогеналкоксигруппу,  $-SR^{6b}$ , карбоксигруппу, карбокси- $C_1$ - $C_8$ -алкил, аминогруппу, амино( $C_1$ - $C_8$ -алкил),  $C_1$ - $C_8$ -алкиламино( $C_1$ - $C_8$ -алкил), ди( $C_1$ - $C_8$ -алкил)амино( $C_1$ - $C_8$ -алкил),  $C_1$ - $C_8$ -алкиламиногруппу, ди( $C_1$ - $C_8$ -алкил)аминогруппу,  $SO_2NR^{6c}$   $R^{6d}$ ,  $-C(O)NR^{6e}$   $R^{6f}$ ,  $C_1$ - $C_8$ -гидроксиалкил,  $NR^{6g}$   $SO_2R^{6h}$ ,  $NR^{6i}$   $(CO)R^{6j}$ ,  $SOR^{6k}$ ,  $C_6$ - $C_{15}$ -ароматическую карбоциклическую группу и 4-10-членную гетероциклическую группу, содержащую один или более гетероатомов, выбранных из группы, включающей кислород, азот и серу;

$R^{6a}$ ,  $R^{6k}$  и  $R^{6b}$  независимо выбраны из группы, включающей  $C_1$ - $C_8$ -алкил,  $C_1$ - $C_8$ -гидроксиалкил,  $C_1$ - $C_8$ -алкиламино( $C_1$ - $C_8$ -алкил), ди( $C_1$ - $C_8$ -алкил)амино( $C_1$ - $C_8$ -алкил),  $C_1$ - $C_8$ -цианоалкил,  $C_3$ - $C_{15}$ -карбоциклическую группу,  $C_1$ - $C_8$ -галогеналкил и 4-10-членную гетероциклическую группу, содержащую один или более гетероатомов, выбранных из группы, включающей кислород, азот и серу;

$R^{6c}$ ,  $R^{6d}$ ,  $R^{6e}$  и  $R^{6f}$  независимо обозначают H,  $C_1$ - $C_8$ -алкил,  $C_1$ - $C_8$ -гидроксиалкил,  $C_1$ - $C_8$ -алкиламино( $C_1$ - $C_8$ -алкил), ди( $C_1$ - $C_8$ -алкил)амино( $C_1$ - $C_8$ -алкил),  $C_1$ - $C_8$ -цианоалкил,  $C_3$ - $C_{15}$ -карбоциклическую группу,  $C_1$ - $C_8$ -галогеналкил, 4-10-членную гетероциклическую группу, содержащую один или более гетероатомов, выбранных из группы, включающей кислород, азот и серу, или совместно с атомом азота, к которому они присоединены, образуют  $C_4$ - $C_{10}$ -гетероциклическую группу;

$R^{6g}$  и  $R^{6i}$  независимо выбраны из группы, включающей Н,  $C_1$ - $C_8$ -алкил,  $C_1$ - $C_8$ -гидроксиалкил,  $C_1$ - $C_8$ -алкиламино( $C_1$ - $C_8$ -алкил), ди( $C_1$ - $C_8$ -алкил)амино( $C_1$ - $C_8$ -алкил),  $C_1$ - $C_8$ -цианоалкил,  $C_3$ - $C_{15}$ -карбоциклическую группу,  $C_1$ - $C_8$ -галогеналкил и 4-10-членную гетероциклическую группу, содержащую один или более гетероатомов, выбранных из группы, включающей кислород, азот и серу;

$R^{6h}$  и  $R^{6j}$  независимо выбраны из группы, включающей  $C_1$ - $C_8$ -алкил,  $C_3$ - $C_{15}$ -карбоциклическую группу, 4-10-членную гетероциклическую группу, содержащую один или более гетероатомов, выбранных из группы, включающей кислород, азот и серу,  $C_1$ - $C_8$ -гидроксиалкил, амино( $C_1$ - $C_8$ -алкил),  $C_1$ - $C_8$ -алкиламино( $C_1$ - $C_8$ -алкил), ди( $C_1$ - $C_8$ -алкил)амино( $C_1$ - $C_8$ -алкил) и  $C_1$ - $C_8$ -цианоалкил;

$R^7$  обозначает  $C_1$ - $C_8$ -алкил;

W выбран из группы, включающей  $C_3$ - $C_{15}$  карбоциклическую группу и 5-10-членный гетероцикл, содержащий один или более гетероатомов, выбранных из группы, включающей кислород, азот и серу;

m обозначает целое число, равное 1-3; и

n обозначает целое число, равное 1-4.