



(19) **RU** <sup>(11)</sup> **2 221 795** <sup>(13)</sup> **C2**  
(51) МПК<sup>7</sup> **C 07 D 405/14, 401/04, 403/04, 409/14, 413/14, A 61 K 31/4439, 31/506, A 61 P 11/06, 3/00, 19/02**

РОССИЙСКОЕ АГЕНТСТВО  
ПО ПАТЕНТАМ И ТОВАРНЫМ ЗНАКАМ

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ПАТЕНТУ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

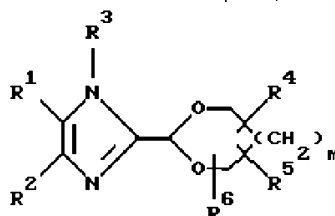
(21), (22) Заявка: 2000100951/04, 12.06.1998  
(24) Дата начала действия патента: 12.06.1998  
(30) Приоритет: 12.06.1997 GB 9712270.09  
10.07.1997 US 60/052,185  
21.11.1997 GB 9724678.9  
14.05.1998 US 60/085,499  
(43) Дата публикации заявки: 10.08.2002  
(46) Дата публикации: 20.01.2004  
(56) Ссылки: RU 94035761 A1, 20.04.1997. EP 0506437 A, 30.09.1992. WO 9205148 A, 02.04.1992. WO 9314082 A, 22.07.1993. WO 9314081 A, 22.07.1993. RU 94046382 A1, 27.10.1996. RU 9402325 A1, 10.08.1996.  
(85) Дата перевода заявки РСТ на национальную фазу: 12.01.2000  
(86) Заявка РСТ: GB 98/01711 (12.06.1998)  
(87) Публикация РСТ: WO 98/56788 (17.12.1998)  
(98) Адрес для переписки: 129010, Москва, ул. Б. Спасская, 25, стр.3, ООО "Юридическая фирма Городисский и Партнеры", пат.пов. Н.Г.Лебедевой

(71) Заявитель: АВЕНТИС ФАРМА ЛИМИТЕД (GB)  
(72) Изобретатель: БАМБОРАФ Пол Линдсэй (GB), КОЛЛИС Алан Джон (GB), ХОЛЛИ Фрэнк (GB), ЛЬЮИС Ричард Алан (GB), ЛИТГОЕ Дэвид Джон (GB), МакКЕННА Джэффри Марк (GB), МакЛЭЙ Йэйн МакФарлейн (GB), ПОРТЕР Барри (GB), РЭТКЛИФФ Эндрю Джэймс (GB), УОЛЛЭЙС Пол Эндрю (GB)  
(73) Патентообладатель: АВЕНТИС ФАРМА ЛИМИТЕД (GB)  
(74) Патентный поверенный: Лебедева Наталья Георгиевна

(54) ИМИДАЗОЛИЛ-ЦИКЛИЧЕСКИЕ АЦЕТАЛИ, ПРОМЕЖУТОЧНЫЕ СОЕДИНЕНИЯ, ФАРМАЦЕВТИЧЕСКАЯ КОМПОЗИЦИЯ И СПОСОБ ЛЕЧЕНИЯ

(57) Изобретение относится к новым имидазолил-циклическим ацеталам формулы I, где R<sup>1</sup> - необязательно замещенный 4-пиридил или необязательно замещенный 4-пиримидинил; R<sup>2</sup> - фенил, замещенный галогеном; R<sup>3</sup> - водород; R<sup>4</sup> обозначает группу - L<sup>3</sup>-R<sup>14</sup>; R<sup>5</sup> - водород, алкил или гидроксиалкил; или R<sup>4</sup> и R<sup>5</sup>, когда присоединены к одному и тому же атому углерода, могут образовывать с указанным атомом углерода ядро циклоалкила или группу C=CH<sub>2</sub>; R<sup>6</sup> - водород или алкил и m=1; L<sup>3</sup> и R<sup>14</sup> имеют значения, указанные в описании, и их фармацевтически приемлемым солям и сольватам (к примеру, гидратам), которые обладают ингибирующей

активностью в отношении TNF-альфа, а также к промежуточным соединениям, фармацевтической композиции и способу лечения. Технический результат - получение новых соединений, используемых в производстве лекарственных средств для лечения состояния, которое может быть улучшено введением ингибитора TNF-альфа, а именно для лечения астмы или воспаления суставов. 9 с. и 15 з.п. ф-лы, 14 табл.





RUSSIAN AGENCY  
FOR PATENTS AND TRADEMARKS

(19) **RU** <sup>(11)</sup> **2 221 795** <sup>(13)</sup> **C2**  
(51) Int. Cl.<sup>7</sup> **C 07 D 405/14, 401/04,**  
**403/04, 409/14, 413/14, A 61 K**  
**31/4439, 31/506, A 61 P 11/06,**  
**3/00, 19/02**

## (12) ABSTRACT OF INVENTION

(21), (22) Application: 2000100951/04, 12.06.1998  
(24) Effective date for property rights: 12.06.1998  
(30) Priority: 12.06.1997 GB 9712270.09  
10.07.1997 US 60/052,185  
21.11.1997 GB 9724678.9  
14.05.1998 US 60/085,499  
(43) Application published: 10.08.2002  
(46) Date of publication: 20.01.2004  
(85) Commencement of national phase: 12.01.2000  
(86) PCT application:  
GB 98/01711 (12.06.1998)  
(87) PCT publication:  
WO 98/56788 (17.12.1998)  
(98) Mail address:  
129010, Moskva, ul. B. Spasskaja, 25, str.3,  
OOO "Juridicheskaja firma Gorodisskij i  
Partnery", pat.pov. N.G.Lebedevoj

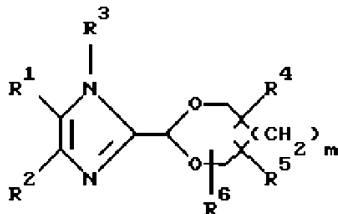
(71) Applicant:  
AVENTIS FARMA LIMITED (GB)  
(72) Inventor: BAMBORAF Pol Lindsej (GB),  
KOLLIS Alan Dzhon (GB), KhOLLI Frehnik  
(GB), L'JuIS Richard Alan (GB), LITGOE Dehvid  
Dzhon (GB), MakKENNA Dzhehfri Mark  
(GB), MakLEhJ Jehjn MakFarlejn (GB), PORTER  
Barri (GB), REhTKLIFF Ehndrju Dzhehjms  
(GB), UOLLEhJS Pol Ehndrju (GB)  
(73) Proprietor:  
AVENTIS FARMA LIMITED (GB)  
(74) Representative:  
Lebedeva Natal'ja Georgievna

(54) IMIDAZOLYL-CYCLIC ACETALS, INTERMEDIATE COMPOUNDS, PHARMACEUTICAL COMPOSITION AND TREATMENT METHOD

(57) Abstract:

FIELD: organic chemistry, medicine, pharmacy. SUBSTANCE: invention relates to new imidazolyl-cyclic acetals of the formula (I)

wherein



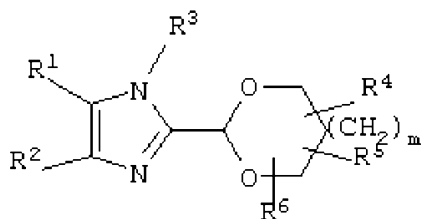
R<sup>1</sup> means optionally substituted 4-pyridyl or optionally substituted 4-pyrimidinyl; R<sup>2</sup> means phenyl substituted with halogen atom; R<sup>3</sup> means hydrogen atom; R<sup>4</sup> means group -L<sup>3</sup>-R<sup>14</sup>; R<sup>5</sup> means hydrogen atom, alkyl or hydroxyalkyl; or R<sup>4</sup> and R<sup>5</sup> bound with a common carbon atom can form with indicated

carbon atom cycloalkyl nucleus or group C=CH<sub>2</sub>; R<sup>6</sup> means hydrogen atom or alkyl; m = 1; L<sup>3</sup> and R<sup>14</sup> have values given in the description. Invention relates to their pharmaceutically acceptable salts and solvates (for examples, to hydrates) that elicit inhibitory activity with respect to TNF-alpha (tumor necrosis factor-alpha) and to intermediate compounds, pharmaceutical composition and to method for treatment. Invention provides preparing new compounds used in producing medicinal agents for treatment of state that can be improved by administration of TNF-alpha inhibitor, namely, for treatment of asthma or inflammation of articulations. EFFECT: improved treatment method, valuable medicinal properties of compounds. 24 cl, 14 tbl, 40 ex

Текст описания в факсимильном виде (см. графическую часть)а

### Формула изобретения:

1. Имидазолил-циклические ацетали формулы (I)



(I)

где R<sup>1</sup> обозначает необязательно замещенный 4-пиридил или необязательно замещенный 4-пиримидинил;

R<sup>2</sup> обозначает фенил, замещенный галогеном;

R<sup>3</sup> обозначает водород;

R<sup>4</sup> обозначает группу -L<sup>3</sup>-R<sup>14</sup> [где L<sup>3</sup> обозначает непосредственно химическую связь или линейный или разветвленный алкиленовый мостик, содержащий от 1 до 6 атомов углерода (необязательно замещенных оксо) и R<sup>14</sup> обозначает водород, алкил, азидо, гидроксид, алкокси, арил, арилалкилокси, арилокси, карбокси, гетероарил, гетероциклоалкил, -NY<sup>4</sup>Y<sup>5</sup> (где Y<sup>4</sup> и Y<sup>5</sup> независимо обозначают водород, арил, циклоалкил, гетероциклоалкил, гетероарил или алкил, необязательно замещенный арилом, циклоалкилом, гетероарилом, гетероциклоалкилом, гидрокси, либо группа -NY<sup>4</sup>Y<sup>5</sup> может образовывать 5-7-членный циклический амин, который (i) может необязательно быть замещенным одним или более заместителями, которые выбирают из алкокси, карбоксамида, карбокси, гидрокси, оксо (или его 5, 6 или 7-членное циклическое

ацеталь-производное), R<sup>9</sup> или алкила, замещенного карбокси, карбоксамида или гидрокси, (ii) может также содержать дополнительный гетероатом, который выбирают из O, S, SO<sub>2</sub> и (iii) может также быть конденсированным с дополнительным гетероциклоалкилом, образуя систему двухъядерных циклов), где R<sup>9</sup> обозначает алкил, арил, арилалкил, циклоалкил, гетероарил, гетероарилалкил или гетероциклоалкил,

-N(R<sup>10</sup>)-C(=Z)-R<sup>15</sup> (где R<sup>15</sup> обозначает алкил, алкокси, арил, арилалкилокси, циклоалкил, гетероарил);

-N(R<sup>10</sup>)-C(=Z)-L<sup>4</sup>-R<sup>16</sup> (где R<sup>16</sup> обозначает алкокси, арил, арилалкилокси, а L<sup>4</sup> обозначает линейный или разветвленный алкиленовый мостик, содержащий от 1 до 6 углеродных атомов), -NH-C(=Z)-NH-R<sup>15</sup>, -NH-C(=Z)-NH-L<sup>4</sup>-R<sup>16</sup>, N(R<sup>10</sup>)-SO<sub>2</sub>-R<sup>15</sup>, N(R<sup>10</sup>)-SO<sub>2</sub>-L<sup>4</sup>-R<sup>16</sup> или -C(=Z)-NY<sup>4</sup>Y<sup>5</sup>];

R<sup>5</sup> обозначает водород, алкил или гидроксиалкил или

R<sup>4</sup> и R<sup>5</sup>, когда присоединены к одному и тому же атому углерода, могут образовывать с указанным атомом углерода ядро циклоалкила или группу C=CH<sub>2</sub>;

R<sup>6</sup> обозначает водород или алкил и m=1,

и фармацевтически приемлемые соли и сольваты (к примеру, гидраты) соединений формулы (I).

2. Соединение по п.1, где R<sup>1</sup> обозначает 2-замещенный 4-пиримидинил.

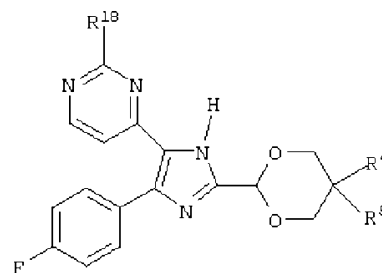
3. Соединение по п.2, где 2-заместитель обозначает группу, которую выбирают из R<sup>17</sup>Z<sup>3</sup>- [где R<sup>17</sup> обозначает алкил, арил, или гетероарил, замещенный алкокси, арилом, циклоалкилом, гетероарилом, гетероциклоалкилом, -CO<sub>2</sub>R<sup>10</sup> или -NY<sup>4</sup>Y<sup>5</sup>, а Z<sup>3</sup> обозначает O] и Y<sup>4</sup>Y<sup>5</sup>N-.

4. Соединение по п.2, где 2-заместитель обозначает -NY<sup>4</sup>Y<sup>5</sup> (где один из Y<sup>4</sup> и Y<sup>5</sup> обозначает водород, а другой обозначает водород, арил, циклоалкил, гетероциклоалкил, гетероарил или алкил, необязательно замещенный арилом, циклоалкилом, гетероарилом, гетероциклоалкилом, гидрокси).

5. Соединение по п.4, где R<sup>2</sup> обозначает 4-фторфенил.

6. Соединение по любому из предшествующих пунктов, где R<sup>6</sup> обозначает водород.

7. Соединение формулы (Ib)



(Ib)

где R<sup>4</sup> и R<sup>5</sup> принимают указанные в п.1 значения, а R<sup>18</sup> обозначает R<sup>17</sup>Z<sup>3</sup>- или Y<sup>4</sup>Y<sup>5</sup>N- (где R<sup>17</sup>, Y<sup>4</sup>, Y<sup>5</sup> и Z<sup>3</sup> принимают значения, указанные в пп.1 и 4),

и фармацевтически приемлемые соли и сольваты соединений формулы (Ib).

8. Соединение по любому из предшествующих пунктов, где R<sup>4</sup> обозначает группу -L<sup>3</sup>R<sup>14</sup> [в которой L<sup>3</sup> обозначает непосредственную химическую связь, а R<sup>14</sup> выбирают из алкила, -NY<sup>4</sup>Y<sup>5</sup>, -N(R<sup>10</sup>)-C(=Z)-R<sup>15</sup>, -NH-C(=Z)-NH-L<sup>4</sup>-R<sup>16</sup>, -C(=Z)-NY<sup>4</sup>Y<sup>5</sup> и C(=Z)-OR<sup>9</sup>].

9. Соединение по одному из пп.1-8, где R<sup>4</sup> обозначает группу -L<sup>3</sup>R<sup>14</sup> [в которой L<sup>3</sup> обозначает метиленовый мостик, а R<sup>14</sup> выбирают из арила, гетероарила, гидрокси, -N(R<sup>10</sup>)-C(=Z)-R<sup>15</sup>, -N(R<sup>10</sup>)-C(=Z)-L<sup>4</sup>-R<sup>16</sup>, -NH-C(=Z)-NH-L<sup>4</sup>-R<sup>16</sup>, -NY<sup>4</sup>Y<sup>5</sup>, N(R<sup>10</sup>)-SO<sub>2</sub>-R<sup>15</sup> и -NH-C(=Z)-NH-R<sup>15</sup>].

10. Соединение по любому из предшествующих пунктов, где R<sup>5</sup> обозначает водород, C<sub>1-4</sub>алкил или гидроксипалкил.

11. Соединение по п.10, где R<sup>5</sup> обозначает метил.

12. Соединение по одному из пп.7-11, где R<sup>18</sup> обозначает -NY<sup>4</sup>Y<sup>5</sup>, в котором Y<sup>4</sup> обозначает водород, а Y<sup>5</sup> выбирают из группы, включающей: арил, арилалкил, циклоалкил, гетероарилалкил и C<sub>2-6</sub>алкил, замещенный гидроксидом, алкокси.

13. Соединение по п.1, которое выбирают из группы, включающей:

{2-[5-(2-циклопропиламинопиримидин-4-ил)-4-(4-фторфенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-морфолин-4-илметанон (Соединение GH);

{2-[5-(2-(циклопропилметиламино)пиримидин-4-ил)-4-(4-фторфенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-(4-метилпиперазин-1-ил)-метанон (Соединение A1325);

циклопропиламид

2-[4-(4-фторфенил)-5-(2-пропиламинопиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты (Соединение A780);

пропиламид 2-[4-(4-фторфенил)-5-[2-(2-метоксиэтиламино)пиримидин-4-ил]-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты (Соединение A823),

и фармацевтически приемлемые соли и сольваты таких соединений.

14. Фармацевтическая композиция, обладающая ингибирующей активностью в отношении TNF-альфа и включающая соединения по п.1 вместе с фармацевтически приемлемым носителем или эксципиентом.

15. Соединение по п.1, обладающее ингибирующей активностью в отношении TNF-альфа.

16. Соединение по п.1, используемое в производстве лекарственного средства для лечения состояния, которое может быть улучшено введением ингибитора TNF-альфа.

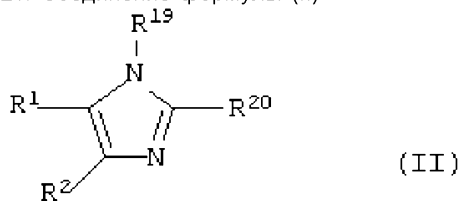
17. Соединение по п.16, используемое в производстве лекарственного средства для лечения астмы.

18. Соединение по п.16, используемое в производстве лекарственного средства для лечения воспаления суставов.

19. Фармацевтическая композиция для лечения состояния, которое может быть улучшено введением ингибитора TNF-альфа, включающая эффективное количество соединения по п.1.

20. Способ лечения пациента (человека или животного), страдающего или подверженного состоянию, которые могут быть улучшены введением ингибитора TNF-альфа, включающий введение указанному пациенту эффективного количества соединения по п.1.

21. Соединение формулы (II)



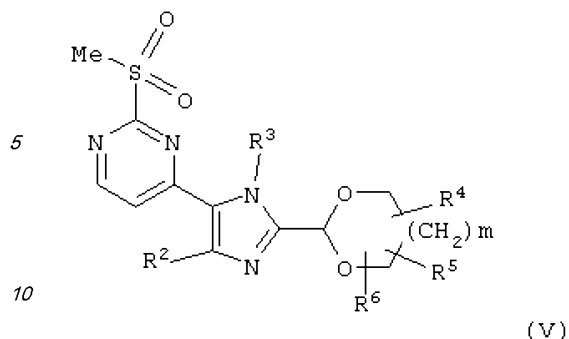
где R<sup>1</sup> обозначает необязательно замещенный гетероарил;

R<sup>2</sup> обозначает необязательно замещенный арил или необязательно замещенный гетероарил;

R<sup>19</sup> обозначает водород или защитную группу;

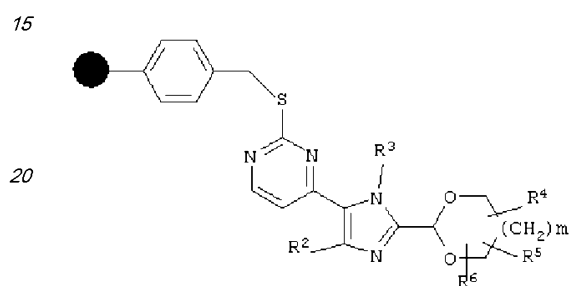
R<sup>20</sup> обозначает -CHO или -CH(OMe)<sub>2</sub>.

22. Соединение формулы (V)



где R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> и m принимают значения, указанные в п.1.

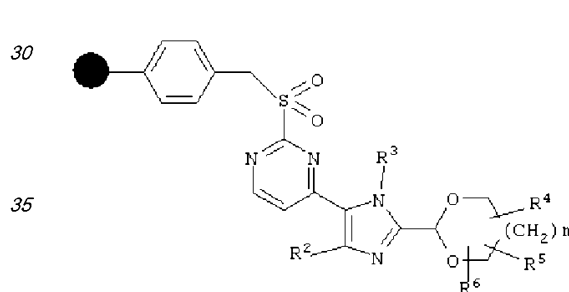
23. Смола C:



Смола C

где R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> и m принимают значения, указанные в п.1.

24. Смола D:



Смола D

где R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> и m принимают значения, указанные в п.1.

Приоритет по пунктам и признакам:

12.06.1997 и 10.07.1997 по пп.1 и 14-20 для соединений формулы 1, транс-изомер,

где R<sup>1</sup> представляет 4-пиридирил;

R<sup>2</sup> представляет 4-фторфенил; R<sup>3</sup>-H;

m=1; R<sup>4</sup> представляет -L<sup>3</sup>-R<sup>14</sup>, где L<sup>3</sup>-метил,

замещенный оксо, R<sup>14</sup>-морфолин-4-ил;

R<sup>5</sup> представляет метил и R<sup>6</sup> - водород, а также фармацевтически приемлемые соли и сольваты такого соединения;

21.11.1997 и 14.05.1998 по пп.1 и 14-20 для мезилатной соли соединения формулы 1,

транс-изомер, где R<sup>1</sup> представляет

4-пиридирил; R<sup>2</sup> представляет 4-фторфенил;

R<sup>3</sup>-H; m=1; R<sup>4</sup> представляет -L<sup>3</sup>-R<sup>14</sup>, где

L<sup>3</sup>-метил, замещенный оксо,

R<sup>14</sup>-морфолин-4-ил; R<sup>5</sup> представляет метил и

R<sup>6</sup> - водород, а также фармацевтически приемлемые соли и сольваты такого соединения;

12.06.1998 по пп.1-14 для других

указанных в п.1 определений радикалов

R<sup>1</sup>-R<sup>6</sup> и по пп.2-13 и 21-24.

Настоящее изобретение касается имидазолил-циклических ацеталей, их получения, содержащих эти соединения фармацевтических композиций и их фармацевтического применения в лечении болезней, поддающихся модулированию путём ингибирования TNF.

Фактор некроза опухолей (TNF) является важным провоспалительным цитокином, вызывающим геморрагический некроз опухолей и обладающим другими важными биологическими активностями. TNF высвобождается, среди прочих клеток, активированными макрофагами, активированными Т-лимфоцитами (тимус-зависимыми лимфоцитами), природными клетками-киллерами, тучными клетками и базофильными, фибробластными, эндотелиальными клетками, и астроцитами головного мозга.

Основные действия TNF in vivo в целом могут быть классифицированы как воспалительные и катаболические. Он играет роль посредника эндотоксического бактериально-токсического шока, воспаления суставов и дыхательных путей, состояний иммунодефицита, отторжения аллотрансплантата и связанной со злокачественной болезнью кахексии, и некоторых паразитических инфекций. Ввиду связи высоких уровней TNF в сыворотке крови с неблагоприятными прогнозами в отношении сепсиса, гемологичной болезни и респираторного дистресс-

синдрома взрослых, и роли TNF во многих других иммунологических процессах, этот фактор считается важным посредником общего воспаления.

TNF служит затравкой или активирует нейтрофилы, эозинофилы и эндотелиальные клетки, высвобождая нарушающие ткани медиаторы и повышая экспрессию адгезионных молекул. В фибробластах TNF стимулирует продуцирование коллагеназы, фермента, причастного к разрушению суставов при ревматоидном артрите. TNF также активирует моноциты, макрофаги и Т-лимфоциты, что вызывает продуцирование колониестимулирующих факторов и других про-воспалительных цитокинов, таких как IL-1, IL-6, IL-8 и GM-CSF, которые в некоторых случаях опосредуют конечные действия TNF. Способность TNF активировать Т-лимфоциты, моноциты и макрофаги и родственные клетки причастна к развитию инфекции вируса иммунодефицита человека (HIV). Для того чтобы эти клетки стали инфицированы HIV и имела место HIV-репликация, клетки должны поддерживаться в активированном состоянии. Показано, что цитокины, такие как TNF, активируют HIV-репликацию в моноцитах и макрофагах. Предполагается, что особенности эндотоксинового бактериально-токсического шока, такие как лихорадка, метаболический ацидоз, гипотензия и интраваскулярная коагуляция опосредованы через действия TNF. Кахексия, связанная с некоторыми состояниями болезни опосредуется через косвенные воздействия на катаболизм протеинов. TNF также промотирует резорбцию костей и синтез белка

на острой стадии.

TNF-альфа ингибирует транскрипцию С-гена поверхностно-активного белка, что может способствовать аномальностям поверхностно-активного гомеостаза, связанным с лёгочной травмой и инфекцией, индуцирует гиперсекрецию муцина и опосредует рекруитмент нейтрофилов и эозинофилов при воспалении дыхательных путей. Хотя TNF-альфа ингибирует синтез коллагена в фибробластах, ряд исследований указывает на то, что он является про-фиброзным *in vivo*. Таким образом, ингибируя продуцирование TNF-альфа, соединения по изобретению обладают возможностями подавления воспаления и ремоделирования дыхательных путей, встречающихся при астме.

TNF-альфа ингибирует способность инсулина стимулировать усвоение глюкозы жировой тканью. Считается, что при ожирении избыточное продуцирование TNF приводит к инсулин-резистентному состоянию. Таким образом, блокируя высвобождение TNF, соединения по изобретению обладают противо-диабетической способностью.

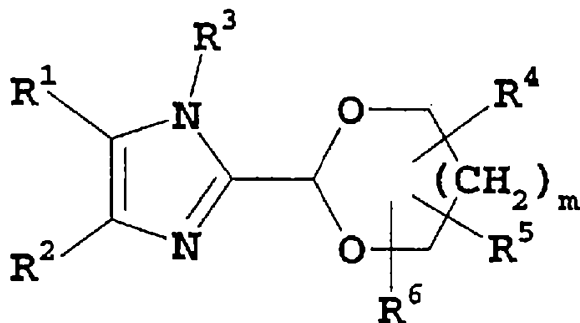
TNF может индуцировать развитие кровеносных сосудов в обычно бессосудистой ткани, возможно через прямую регуляцию других про-воспалительных цитокинов, прямую регуляцию адгезионных молекул, стимуляцию экспрессии матрикс-металлопротеиназы, и увеличивает продуцирование простагландина. Таким образом, ингибирование высвобождения TNF-альфа соединениями по изобретению будет помогать при болезнях, обусловленных развитием кровеносных сосудов, включающих артрит, диабе-

тические ретинопатии, и болезнях вызванных ишемией (инфаркт миокарда) и раковой опухолью.

В данном описании рассматривается проблема, касающаяся болезней, вызванных TNF, включая болезни, связанные с продуцированием самого TNF, и болезни, связанные с другими цитокинами, такими как, но не в порядке ограничения, IL-1 или IL-6, модулируемыми по ассоциации с TNF. К примеру, болезни, связанные с IL-1, при которых продуцируется или действует IL-1, являющиеся обострёнными или секретированными в отношении TNF, следует считать болезнями, связанными с TNF. В описании, если не указано особо, TNF-альфа и TNF-бета вместе называются также "TNF", поскольку существует близкая структурная гомология между TNF-альфа (кахектином) и TNF-бета (лимфотоксином) и каждый из них обладает способностью вызывать аналогичные биологические ответные реакции и связываться с тем же самым клеточным рецептором.

Авторами найдена новая группа имидазолил-циклических ацеталей, обладающих ценными фармацевтическими свойствами, в частности, способностью регулировать белки, что опосредует цитологическую активность, к примеру TNF.

Итак, один из аспектов настоящего изобретения направлен на соединения общей формулы (I):



(I)

где:

$R^1$  обозначает необязательно замещённый гетероарил;

$R^2$  обозначает необязательно замещённый арил или необязательно замещённый гетероарил;

$R^3$  обозначает группу  $-L^1-R^7$  или  $-L^2-R^8$

[где  $L^1$  обозначает линейный или разветвлённый алкиленовый мостик, содержащий от 1 до 6 атомов углерода, необязательно замещённых галогеном или оксо;  $R^7$  обозначает водород, арил, циано, циклоалкил, гетероарил, гетероциклоалкил, нитро,  $-S(O)_nR^9$ , (где  $R^9$  обозначает алкил, арил, арилалкил, циклоалкил, гетероарил, гетероарилалкил или гетероциклоалкил и  $n$  обозначает 0 или целое число 1 или 2),  $-NHSO_2R^9$ ,  $-C(=Z)OR^{10}$  (где  $Z$  обозначает атом кислорода или серы, а  $R^{10}$  обозначает водород или  $R^9$ ),  $-C(=Z)R^{10}$ ,  $-OR^{10}$ ,  $-N(R^{11})-C(=Z)R^9$  (где  $R^{11}$  обозначает водород или алкил),  $-NY^1Y^2$  (где  $Y^1$  и  $Y^2$  независимо обозначают водород, алкенил, алкил, алкинил, арил, арилалкил, циклоалкенил, циклоалкил, гетероарил или гетероарилалкил, или группа  $-NY^1Y^2$  может

образовывать 5-7-членный циклический амин, который необязательно может содержать дополнительный гетероатом, который выбирают из O, S или  $NY^3$  (где  $Y^3$  обозначает водород, алкил, арил, арилалкил,  $-CHO$ ,  $-C(=Z)R^9$  или  $-SO_2R^9$ ) или который может также быть конденсирован с дополнительными арил-, гетероарил-, гетероциклоалкил- или циклоалкильными кольцами, образуя систему из двухъядерных или трёхъядерных циклов},  $-SO_2-NY^1Y^2$ ,  $-C(=Z)-NY^1Y^2$ ,  $-N(R^{11})-C(=Z)-NY^1Y^2$ ,  $-N(OR^{10})-C(=Z)-NY^1Y^2$ ,  $-N(OR^{10})-C(=Z)R^{10}$ ,  $-C(=NOR^{10})R^{10}$ ,  $-C(=Z)NR^{10}OR^{12}$  (где  $R^{12}$  обозначает водород, алкил, арил или арилалкил),  $-N(R^{11})-C(=NR^{13})-NY^1Y^2$  (где  $R^{13}$  обозначает водород, циано, алкил, циклоалкил или арил) или  $-N(R^{11})-C(=Z)OR^{11}$ ;  $L^2$  обозначает непосредственную химическую связь или линейную или разветвлённую углеродную цепь, включающую от 2 до 6 атомов углерода и содержит двойную или тройную углерод-углеродную связь; а  $R^8$  обозначает водород, арил, циклоалкенил, циклоалкил, гетероарил или гетероциклоалкил];

$R^4$  обозначает группу  $-L^3-R^{14}$

[где  $L^3$  обозначает непосредственную химическую связь или линейный или разветвлённый алкиленовый мостик, содержащий от 1 до 6 атомов углерода (необязательно замещённых галогеном, гидроксигруппой, алкоксигруппой или оксогруппой) и  $R^{14}$  обозначает водород, алкил, азидо, гидроксигруппу, алкоксигруппу, арил, арилалкилокси, арилокси, карбокси (или кислотную биоизостеру), циклоалкилокси, гетероарил, гетероарилалкилокси, гетероарилокси, гетероциклоалкил, гетероциклоалкилокси, нитро,  $-NY^4Y^5$ , {где  $Y^4$  и  $Y^5$

независимо обозначают водород, арил, циклоалкил, гетероциклоалкил, гетероарил или алкил, необязательно замещённый алкокси, арилом, циано, циклоалкилом, гетероарилом, гетероциклоалкилом, гидроксид, оксо,  $-\text{CO}_2\text{R}^{10}$ ,  $-\text{CONY}^1\text{Y}^2$  или  $\text{NY}^1\text{Y}^2$ , либо группа  $-\text{NY}^4\text{Y}^5$  может образовывать 5-7-членный циклический амин, который (i) может необязательно быть замещённым одним или более заместителями, которые выбирают из алкокси, карбоксамида, карбокси, гидроксид, оксо (или его 5,6 или 7-членное циклическое ацеталь-производное),  $\text{R}^9$  или алкила, замещённого карбокси, карбоксамида или гидроксид, (ii) может также содержать дополнительный гетероатом, который выбирают из O, S,  $\text{SO}_2$  или  $\text{NY}^6$  (где  $\text{Y}^6$  обозначает водород, алкил, арил, арилалкил,  $-\text{C}(=\text{Z})\text{R}^9$ ,  $-\text{C}(=\text{Z})\text{OR}^9$  или  $-\text{SO}_2\text{R}^9$ ) и (iii) может также быть конденсированным с дополнительными арил-, гетероарил-, гетероциклоалкил- или циклоалкильными кольцами, образуя систему двухъядерных или трёхъядерных циклов},  $-\text{N}(\text{R}^{10})-\text{C}(=\text{Z})-\text{R}^{15}$  (где  $\text{R}^{15}$  обозначает алкил, алкокси, арил, арилалкилокси, циклоалкил, гетероарил, гетероарилалкокси или гетероциклоалкил);  $-\text{N}(\text{R}^{10})-\text{C}(=\text{Z})-\text{L}^4-\text{R}^{16}$  (где  $\text{R}^{16}$  обозначает алкокси, арил, арилалкилокси, арилалкилоксикарбониламино, карбокси (или кислотную биоизостеру), циклоалкил, циано, галоген, гетероарил, гетероарилалкокси, гетероциклоалкил, гидроксид или  $-\text{NY}^1\text{Y}^2$ , а  $\text{L}^4$  обозначает линейный или разветвлённый алкиленовый мостик, содержащий от 1 до 6 углеродных атомов),  $-\text{NH}-\text{C}(=\text{Z})-\text{NH}-\text{R}^{15}$ ,  $-\text{NH}-\text{C}(=\text{Z})-\text{NH}-\text{L}^4-\text{R}^{16}$ ,  $\text{N}(\text{R}^{10})-\text{SO}_2-\text{R}^{15}$ ,  $\text{N}(\text{R}^{10})-\text{SO}_2-\text{L}^4-\text{R}^{16}$ ,  $-\text{S}(\text{O})_n\text{R}^9$ ,  $-\text{C}(=\text{Z})-\text{NY}^4\text{Y}^5$  или

$C(=Z)-OR^9$ ;

$R^5$  обозначает водород, алкил или гидроксипалкил; или

$R^4$  и  $R^5$ , когда присоединены к одному и тому же атому углерода, могут образовывать с указанным атомом углерода ядро циклоалкила, циклоалкенила или гетероциклоалкила или группу  $C=CH_2$ ;

$R^6$  обозначает водород или алкил и

$m$  обозначает нуль или целое число 1 или 2;

и их N-оксиды и пролекарства, и фармацевтически приемлемые соли и сольваты (к примеру, гидраты) соединений формулы (I) и их N-оксиды, и пролекарства.

Подразумевается, что в настоящем изобретении термин "соединения по изобретению" и эквивалентные выражения охватывают соединения общей формулы (I), как она определена выше, и, где контекст это допускает, данное выражение включает N-оксиды, пролекарства, фармацевтически приемлемые соли и сольваты, к примеру, гидраты. Аналогично в отношении промежуточных соединений, не зависимо от того, перечислены они или нет в приложенных пунктах, там, где контекст это допускает, подразумевается, что понятия включают N-оксиды, пролекарства, фармацевтически приемлемые соли и сольваты. Для ясности отдельные примеры, когда контекст это позволяет, иногда включены в текст, но эти примеры являются чисто иллюстративными и не имеется в виду, что они исключают другие примеры, когда контекст их допускает.

Следует понимать, что когда  $m$  равно нулю, циклическая

система ацеталя в формуле (I) обозначает ядро 1,3-диоксолана; когда  $m$  равно 1, циклическая система ацеталя в формуле (I) обозначает 1,3-диоксан; а когда  $m$  равно 2, циклическая система ацеталя в формуле (I) обозначает 1,3-диоксепан.

Как использовано выше и в дальнейшем тексте описания изобретения, подразумевается, что, если не указано особо, то приведенные ниже термины имеют следующие значения:

"Пациент" включает как человека, так и других млекопитающих.

"Кислотная биоизостера" означает группу, имеющую физические и химические сходства с карбокси группой, дающие близкое подобие биологических свойств (смотри, Lipinski, Annual Reports in Medicinal Chemistry, 1986, 21, page 283 "Bioisosterism In Drug Design"; Yun, Hwahak Sekye, 1993, 33, pages 576-579 "Application Of Bioisosterism To New Drug Design"; Zhao, Huaxue Tongbao, 1995, pages 34-38 "Bioisosteric Replacement And Development Of Lead Compounds In Drug Design"; Graham, Theochem, 1995, 343, 105-109 "Theoretical Studies Applied To Drug Design: ab initio Electronic Distributions In Bioisosteres"). Примеры пригодных кислотных биоизостер включают:  $-C(=O)-NHOH$ ,  $-C(=O)-CH_2OH$ ,  $-C(=O)-CH_2SH$ ,  $-C(=O)-NH-CN$ , сульфо, фосфоно, алкилсульфонилкарбамоил, тетразолил, арилсульфонилкарбамоил, гетероарилсульфонилкарбамоил, N-метоксикарбамоил, 3-гидрокси-3-циклобутен-1,2-дион, 3,5-диоксо-1,2,4-оксадиазолидинил или гетероцикли-

ческие фенолы, такие как 3-гидроксиизоксазолил и 3-гидрокси-1-метилпиразолил.

“Ацил” означает Н-СО- или алкил-СО- группу, в которой алкильная группа является указанной выше.

“Ациламино” означает ацил-NH- группу, где ацил является указанным выше.

“Алкенил” означает алифатическую углеводородную группу, содержащую углерод-углеродную двойную связь, эта группа может быть линейной или разветвлённой и приблизительно с 2-15 атомами углерода в цепи. Предпочтительные алкенильные группы имеют приблизительно от 2 до 12 атомов углерода в цепи; и более желательно, приблизительно 2-4 атома углерода в цепи. “Разветвлённый”, как использовано здесь и далее в тексте, означает, что одна или более алкильных групп, таких как метил, этил или пропил, присоединены к линейной цепи; здесь, линейной цепи алкенила. “Низший алкенил” означает, что в цепи, которая может быть линейной или разветвлённой, около 2-4 атомов углерода. Характерные примеры алкенильных групп включают этенил, пропенил, н-бутенил, изо-бутенил, 3-метилбут-2-енил, н-пентенил, гептенил, октенил, циклогексил-бутенил и деценил.

“Алкокси” означает алкил-О- группу, в которой алкильная группа является указанной выше. Характерные примеры алкокси-групп включают метокси, этокси, н-пропокси, изо-пропокси, н-бутокси и гептокси.

“Алкоксиметил” означает алкил-О-CH<sub>2</sub>- группу, в которой

алкильная группа является указанной выше. Характерные примеры алкоксиметильных групп включают метоксиметил и этоксиметил.

“Алкоксикарбонил” означает алкил-O-CO- группу, в которой алкильная группа является указанной выше. Характерные примеры алкоксикарбонильных групп включают метокси- и этоксикарбонил.

“Алкил” означает, если не оговорено особо, алифатическую углеводородную группу, которая может быть линейной или разветвлённой, приблизительно с 1-15 атомами углерода в цепи, необязательно замещённой одним или более атомами галогена. Заслуживающие особого внимания алкильные группы имеют приблизительно от 1 до 6 атомов углерода. Характерные примеры алкильных групп для  $R^5$ ,  $R^6$  и в  $R^4$  включают  $C_{1-4}$ алкильные группы, такие как метил, этил, н-пропил и изопропил.

“Алкенил” означает линейный или разветвлённый двухвалентный углеводородный радикал приблизительно с 1-15 атомами углерода. Заслуживающими особого внимания алкиленовыми группами являются алкиленовые группы с 1-6 атомами углерода. Характерные примеры групп включают метилен и этилен.

“Алкилсульфинил” означает алкил-SO- группу, в которой алкильная группа является указанной выше. Предпочтительными группами являются те, в которых алкильная группа является  $C_{1-4}$ алкилом.

“Алкилсульфонил” означает алкил-SO<sub>2</sub>- группу, в которой

алкильная группа является указанной выше. Предпочтительными группами являются те, в которых алкильная группа является C<sub>1-4</sub>алкилом.

“Алкилсульфонилкарбамоил” означает алкил-SO<sub>2</sub>-NH-C(=O)-группу, в которой алкильная группа является указанной выше. Предпочтительными алкилсульфонилкарбамоил-группами являются те, в которых алкильная группа является C<sub>1-4</sub>алкилом.

“Алкилтио” означает алкил-S-группу, в которой алкильная группа является указанной выше. Характерные примеры алкилтио-групп включают метилтио, этилтио, изопропилтио и гептилтио.

“Алкинил” означает алифатическую углеводородную группу, содержащую углерод-углеродную тройную связь, которая может быть линейной или разветвлённой, приблизительно с 2-15 атомами углерода в цепи. Предпочтительные алкинильные группы имеют приблизительно от 2 до 12 атомов углерода в цепи; и более желательно, приблизительно 2-4 атома углерода в цепи. Характерные примеры алкинильных групп включают этинил, пропинил, н-бутинил, изо-бутинил, 3-метилбут-2-инил и н-пентинил.

“Ароил” означает арил-CO-группу, в которой арильная группа является указанной выше. Характерные примеры групп включают бензоил и 1- и 2-нафтоил.

“Ароиламино” означает ароил-NH-группу, где ароил является указанным выше.

“Арил” как группа или часть группы обозначает: (i) нео-

бязательно замещённый моноциклический или полициклический ароматический углеводородный радикал приблизительно с 6-14 атомами углерода, такой как фенил или нафтил; или (ii) необязательно замещённый частично насыщенный многоядерный ароматический карбоциклический радикал, в котором арил- и циклоалкил- или циклоалкенил- группа конденсированы вместе, что даёт циклическую структуру, такую как кольцо тетрагидронафтила, инденила или инданила. Арильные группы могут быть замещены одним или более заместителями арильных групп, которые могут быть одинаковыми или различными, где понятие "заместитель арильных групп" включает, к примеру, ацил, ациламино, алкокси, алкоксикарбонил, алкилендиокси, алкилсульфинил, алкилсульфонил, алкилтио, ароил, ароиламино, арил, ариалалкилокси, ариалалкилоксикарбонил, ариалалкилтио, арилокси, арилоксикарбонил, арилсульфинил, арилсульфонил, арилтио, карбокси, циано, галоген, гетероароил, гетероарил, гетероарилалкилокси, гетероароиламино, гетероарилокси, гидроксид, нитро, трифторметил,  $Y^7Y^8N-$ ,  $Y^7Y^8NCO-$ ,  $Y^7Y^8NSO_2-$  (где  $Y^7$  и  $Y^8$  независимо обозначают водород, алкил, арил, ариалалкил, гетероарил и гетероарилалкил),  $Y^7Y^8N-C_{2-6}алкилен-Z^2-$  (где  $Z^2$  обозначает O,  $NR^5$  или  $S(O)_n$ ), алкилC(=O)- $Y^7N-$ , алкилSO<sub>2</sub>- $Y^7N-$  или алкил, необязательно замещённый арилом, гетероарилом, гидроксид или  $Y^7Y^8N-$ . Предпочтительные заместители арильных групп в R<sup>2</sup> включают галоген, алкокси, трифторметил, алкилтио, алкилсульфинил,  $Y^7Y^8N-$ , алкилC(=O)- $Y^7N-$  или алкилSO<sub>2</sub>- $Y^7N-$ , более предпочтителен фтор.

“Арилалкил” означает арил-алкил- группу, в которой арильная и алкильная группы являются указанными выше. Предпочтительные арилалкильные группы включают группы, содержащие  $C_{1-4}$ алкил- радикал. Характерные примеры арилалкильных групп включают бензил, 2-фенетил и нафтенметил (нафталинметил ?).

“Арилалкилокси” означает арилалкил-O- группу, в которой арилалкильные группы являются указанными выше. Характерные примеры арилалкилокси- групп включают бензилокси и 1- или 2-нафталинметокси.

“Арилалкилоксикарбонил” означает арилалкил-O-CO- группу, в которой арилалкильные группы являются указанными выше. Характерным примером арилалкилоксикарбонильной группы является бензилоксикарбонил.

“Арилалкилтио” означает арилалкил-S- группу, в которой арилалкильная группа является указанной выше. Характерным примером арилалкилтио- группы является бензилтио.

“Арилокси” означает арил-O- группу, в которой арильная группа является указанной выше. Характерные примеры арилокси- групп включают необязательно замещённый фенокси или нафтокси.

“Арилоксикарбонил” означает арил-O-CO- группу, в которой арильная группа является указанной выше. Характерные примеры арилоксикарбонильных групп включают феноксикарбонил и нафтоксикарбонил.

“Арилсульфинил” означает арил-SO- группу, в которой

арильная группа является указанной выше.

“Арилсульфонил” означает арил-SO<sub>2</sub>- группу, в которой арильная группа является указанной выше.

“Арилсульфонилкарбамоил” означает арил-SO<sub>2</sub>-NH-C(=O)- группу, в которой арильная группа является указанной выше.

“Арилтио” означает арил-S- группу, в которой арильная группа является указанной выше. Характерные примеры арилтио- групп включают фенилтио и нафтилтио.

“Азагетероарил” означает ароматический карбоциклический радикал приблизительно с 5-10 членами кольца, в котором один из членов кольца является азотом, а другие члены кольца выбирают из углерода, кислорода, серы или азота. Примеры не- обязательно замещённых азагетероарильных групп включают пи- ридил, пиримидинил, хинолинил, изохинолинил, хиназолинил, имидазолил и бензимидазолил, необязательно замещённый одним или более “заместителями гетероарильных групп”. Предпоч- тительные азагетероарильные группы в R<sup>1</sup> включают необя- зательно замещённый пиридил или пиримидинил. Предпочти- тельные заместители гетероарильных групп, когда R<sup>1</sup> является пиримидинилом, включают R<sup>17</sup>Z<sup>3</sup>- [где R<sup>17</sup> обозначает алкил, арил, циклоалкил, гетероарил, гетероциклоалкил или алкил, замещённый алкокси, арилом, циано, циклоалкилом, гетеро- арилом, гетероциклоалкилом, гидроксигруппой, оксо-, -CO<sub>2</sub>R<sup>10</sup>, -CONY<sup>1</sup>Y<sup>2</sup> или -NY<sup>4</sup>Y<sup>5</sup>, а Z<sup>3</sup> обозначает O или S(O)<sub>n</sub>] и Y<sup>4</sup>Y<sup>5</sup>N-.

“Циклоалкенил” означает необязательно замещённую не- ароматическую систему из моноядерных или полиядерных циклов,

содержащую, по меньшей мере, одну углерод-углеродную двойную связь и имеющую порядка 5-10 атомов углерода. Характерные примеры моноядерных циклоалкенильных колец включают циклопентенил, циклогексенил и циклогептенил. Характерные примеры полиядерных циклоалкенильных колец включают норборненил. Циклоалкенильная группа может быть замещена одним или более заместителями, которые выбирают, к примеру, из галогена или алкила.

“Циклоалкоксиметил” означает циклоалкил-О-CH<sub>2</sub>- группу, в которой циклоалкильная группа является указанной выше. Характерные примеры циклоалкоксиметильных групп включают циклопропилоксиметил и цикlopентилоксиметил.

“Циклоалкил” означает необязательно замещённую неароматическую систему из моноядерных или полиядерных циклов, приблизительно с 3-10 атомами углерода. Характерные примеры моноядерных циклоалкильных колец включают циклопропил, цикlopентил, циклогексил и циклогептил. Характерные примеры полиядерных циклоалкильных колец включают пергидронафтил, адамант-(1- или 2-)ил и норборнил и спироциклические группы, к примеру, спиро[4,4]нон-2-ил. Когда R<sup>3</sup> обозначает или содержит циклоалкильное кольцо, он может главным образом представлять 3-7-членный моноядерный цикл, в частности, циклогексил. Циклоалкильная группа может быть замещенной одним или более (к примеру, 1, 2 или 3) заместителями, которые выбирают, к примеру, из группы, включающей: алкил, арил, арилалкил, галоген, галоидзамещённый алкил (такой как три-

фторметил), гидроксипалкил, гидроксип, алкокси,  $-S(O)_n$ -алкил,  $-NY^1Y^2$  или  $-CO_2R^{12}$ .

“Циклоалкилалкил” означает циклоалкил-алкил- группу, в которой циклоалкильный и алкильный радикалы являются указанными выше. Характерные примеры моноциклических циклоалкилалкильных групп включают циклопропилметил, циклопентилметил, циклогексилметил и циклогептилметил.

“Циклоалкилокси” означает циклоалкил-О- группу, в которой циклоалкильная группа является указанной выше. Характерные примеры циклоалкилокси- групп включают циклопропилокси, циклопентилокси, циклогексилокси и циклогептилокси.

“Галоид” или “галоген” означает фтор, хлор, бром или иод. Предпочтительны фтор или хлор.

“Гетероароил” означает гетероарил-СО- группу, в которой гетероарильная группа является указанной выше. Характерные примеры групп включают пиридилкарбонил.

“Гетероароиламино” означает гетероароил-NH- группу, в которой гетероароил- группа является указанной выше.

“Гетероарил” как группа или часть группы означает необязательно замещённый ароматический монопядерный или полиядерный органический радикал приблизительно с 5-10 членами кольца, в котором один или более членов кольца является/являются отличающимся от углерода элементом/элементами, к примеру, азотом, кислородом или серой. Примеры пригодных необязательно замещённых гетероарильных групп включают бензимидазолил-, фурил-, имидазолил-, изоксазолил-, изохи-

нолинил-, изотиазолил-, оксадиазолил-, пиазанил-, пирида-  
зинил-, пиазолил-, пиридил-, пиаимидини-л-, пирролил-,  
хиназолинил-, хиолинил-, 1,3,4-тиадиазолил-, тиазолил-,  
тиенил- и тиазолил- группы. Когда  $R^1$  обозначает необя-  
зательно замещённую гетероарильную группу, он может, в  
частности, представлять необязательно замещённую "азагетеро-  
арильную" группу. Гетероарильные группы могут быть замещены  
одним или более заместителями гетероарильных групп, которые  
могут быть одинаковыми или различными, где "заместитель  
гетероарильной группы" включает, к примеру, ацил, ациламино,  
алкоксикарбонил, алкилендиокси, ароил, ароиламино, арил,  
арилалкилоксикарбонил, арилоксикарбонил, карбокси, циано,  
галоген, гетероароил, гетероарил, гетероароиламино, гид-  
рокси, нитро, трифторметил,  $R^{17}Z^3$ -,  $Y^4Y^5N$ -,  $Y^4Y^5N-CO$ -,  
 $Y^4Y^5NSO_2$ -, алкил $SO_2-Y^4N$ - или алкил, необязательно замещённый  
арилом, гетероарилом, гидрокси, оксо,  $-CO_2R^{10}$ ,  $-CONY^1Y^2$  или  
 $Y^4Y^5N$ -.

"Гетероарилалкил" означает гетероарил-алкил- группу, в  
которой гетероарильный и алкильный радикалы являются ука-  
занными выше. Предпочтительные гетероарилалкильные группы  
содержат  $C_{1-4}$ алкил- радикал. Характерные примеры гетероарил-  
алкильных групп включают пиридилметил.

"Гетероарилалкилокси" означает гетероарилалкил-О- груп-  
пу, в которой гетероарилалкильная группа является указанной  
выше. Характерные примеры гетероарилалкилокси- групп включа-  
ют необязательно замещённый пиридилметокси.

“Гетероарилокси” означает гетероарил-О- группу, в которой гетероарильная группа является указанной выше. Характерные примеры гетероарилокси- групп включают необязательно замещённый пиридилокси.

“Гетероарилсульфонилкарбамоил” означает гетероарил-SO<sub>2</sub>-NH-C(=O)- группу, в которой гетероарильная группа является указанной выше.

“Гетероциклоалкил” означает циклоалкильную группу приблизительно с 3-7 членами цикла, содержащую один или более гетероатомов, которые выбирают из O, S или NY<sup>3</sup>. Характерные примеры гетероциклоалкильных групп включают простые 5-7-членные циклические эфиры, такие как тетрагидрофуран и пергидропиран.

“Гетероциклоалкилалкил” означает гетероциклоалкилалкильную группу, в которой гетероциклоалкильная и алкильная группы являются указанными выше.

“Гетероциклоалкилокси” означает гетероциклоалкил-О- группу, в которой гетероциклоалкил является указанным выше.

“Гидроксиалкил” означает HO-алкил- группу, в которой алкил является указанным выше. Предпочтительные гидроксиалкильные группы содержат C<sub>1-4</sub>алкил. Характерные примеры гидроксиалкильных групп включают гидроксиметил и 2-гидроксиэтил.

“Y<sup>7</sup>Y<sup>8</sup>N-” означает замещённую или незамещённую аминогруппу, где Y<sup>7</sup> и Y<sup>8</sup> являются указанными выше. Характерные примеры групп включают амина(H<sub>2</sub>N-), метиламино, этилметил-

амино, диметиламино и диэтиламино.

"Y<sup>7</sup>Y<sup>8</sup>NCO-" означает замещённую или незамещённую карбамоил- группу, где Y<sup>7</sup> и Y<sup>8</sup> являются указанными выше. Характерными примерами групп являются карбамоил(H<sub>2</sub>NCO-) и диметилкарбамоил(Me<sub>2</sub>NCO-).

"Y<sup>7</sup>Y<sup>8</sup>NSO<sub>2</sub>-" означает замещённую или незамещённую сульфамойл- группу, где Y<sup>7</sup> и Y<sup>8</sup> являются указанными выше. Характерными примерами групп являются сульфамойл(H<sub>2</sub>NSO<sub>2</sub>-) и диметилсульфамойл(Me<sub>2</sub>NSO<sub>2</sub>-).

"Пролекарство" означает соединение, превращаемое метаболическими путями (к примеру, гидролизом) in vivo в соединение формулы (I), включая его N-оксиды. К примеру, сложный эфир соединения формулы (I), содержащий гидроксильную группу, может быть превращён гидролизом in vivo в материнскую молекулу. Или же сложный эфир соединения формулы (I), содержащий карбоксильную группу, может быть превращён гидролизом in vivo в материнскую молекулу.

"Сольват" означает физическую ассоциацию соединения по изобретению с одной или более молекулами растворителя. Эта физическая ассоциация включает водородную связь. В некоторых случаях сольват может поддаваться выделению, к примеру, когда одна или более молекул растворителя включены в кристаллическую решётку твёрдого кристаллического вещества. Понятие "сольват" охватывает как фазу раствора, так и поддающиеся выделению сольваты. Характерные представители соль-

ватов включают гидраты, этаноляты, метаноляты и тому подобные.

Пригодными сложными эфирами соединений формулы (I), содержащими гидроксильную группу, являются, к примеру, ацетаты, цитраты, лактаты, тартраты, малонаты, оксалаты, салицилаты, пропионаты, сукцинаты, фумараты, малеаты, метилен-бис-*b*-гидроксинафтоаты, гентизаты, изоэтионаты, ди-*p*-толуилтартраты, метансульфонаты, этансульфонаты, бензолсульфонаты, *p*-толуолсульфонаты, циклогексилсульфаматы и хинаты.

Пригодными сложными эфирами соединений формулы (I), содержащими карбоксильную группу являются, к примеру, эфиры, описанные в F.J.Leinweber, Drug Metab. Res., 1987, 18, page 379.

Особенно полезный класс сложных эфиров соединений формулы (I), содержащих гидроксильную группу, может быть образован из кислотных остатков, которые выбирают из числа описанных в Bundgaard et.al., J. Med. Chem., 1989, 32, page 2503-2507, и включает замещённые (аминометил)-бензоаты, к примеру, диалкиламино-метилбензоаты, в которых две алкильные группы могут быть соединены вместе или могут прерываться атомом кислорода или необязательно замещённым атомом азота, к примеру, алкилированным атомом азота, в частности, (морфолино-метил)бензоаты, к примеру, 3- или 4-(морфолинометил)-бензоаты и (4-алкилпиперазин-1-ил)бензоаты, к примеру, 3- или 4-(4-алкилпиперазин-1-ил)бензоаты.

Некоторые из соединений по данному изобретению являются основными, и такие соединения полезны в форме свободного основания или в форме его фармацевтически приемлемой кислотной аддитивной соли.

Кислотные аддитивные соли более удобны для применения; а практически, использование солевой формы по своему существу равноценно использованию формы свободного основания. Кислоты, которые могут быть использованы для получения кислотных аддитивных солей включают преимущественно те, которые дают в комбинации со свободным основанием фармацевтически приемлемые соли, т.е. соли, анионы которых являются нетоксичными для пациента при фармацевтических дозах солей, с тем чтобы полезные ингибирующие действия, присущие свободному основанию, не были испорчены побочными действиями, связанными с анионами. Хотя фармацевтически приемлемые соли указанных основных соединений предпочтительны, все кислотные аддитивные соли пригодны в качестве источников для получения свободной основной формы, даже если конкретная соль, сама по себе, требуется только как промежуточный продукт, как, к примеру, когда соль получают только в целях очистки и идентификации, или когда её используют в качестве промежуточного соединения при получении фармацевтически приемлемой соли способом ионного обмена. Фармацевтически приемлемые соли, подпадающие под рамки объёма изобретения и приложенных пунктов, включают соли, полученные с неорганическими и органическими кислотами, и включают

галоидводороды, к примеру, хлористоводородные и бромистоводородные соли, сульфаты, фосфаты, нитраты, сульфаматы, ацетаты, цитраты, лактаты, тартраты, малонаты, оксалаты, салицилаты, пропионаты, сукцинаты, фумараты, малеаты, метил-лен-бис-*b*-гидроксинафтоаты, гентизаты, изозтионаты, ди-*p*-толуоилтартраты, метансульфонаты, этансульфонаты, бензол-сульфонаты, *p*-толуолсульфонаты, циклогексилсульфаматы и хинаты.

Когда соединения по изобретению являются замещёнными кислотным остатком, могут быть получены основные аддитивные соли, представляющие просто более удобную для применения форму, на практике же, применение солевой формы по своему существу равноценно использованию формы свободной кислоты. Основания, которые могут быть использованы для получения основных аддитивных солей, включают предпочтительно те, которые дают в сочетании со свободной кислотой фармацевтически приемлемые соли, то есть соли, чьи катионы нетоксические для пациента при фармацевтических дозах солей, с тем, чтобы полезные ингибирующие действия, присущие свободному основанию, не были испорчены побочными действиями, связанными с катионами. Фармацевтически приемлемые соли, включающие соли, происходящие от солей щелочных и щелочно-земельных металлов и подпадающие под рамки объёма изобретения и приложенных пунктов, включают соли, полученные из следующих оснований: гидрида натрия, гидроокиси натрия, гидроокиси калия, гидроокиси кальция, гидроокиси алюминия,

гидроокиси лития, гидроокиси магния, гидроокиси цинка, аммиака, этилендиамина, N-метил-глюкамина, лизина, аргинина, орнитина, холина, N,N'-дибензилэтилендиамина, хлорпрокаина, диэтанолamina, прокаина, N-бензилфенетиламина, диэтиламина, пиперазина, трис(гидроксиметил)аминометана, гидроокиси тетраметиламмония и тому подобных.

Наряду с пригодностью их самих в качестве активных соединений, соли соединений по изобретению полезны в целях очистки соединений, к примеру, на основании использования различий в растворимости между солями и материнскими соединениями, побочными продуктами и/или исходными веществами, по методикам, хорошо известным специалистам в соответствующей области.

В отношении вышеуказанной формулы (I) заслуживают внимания и предпочтительны следующие группировки:

$R^1$  может, в частности, обозначать необязательно замещённый азатетероарил, такой как необязательно замещённый пиридил, пиримидинил, хинолинил, изохинолинил, хиназолинил, имидазолил или бензимидазолил (к примеру, необязательно замещённый 4-пиридил, 4-пиримидинил, 4-хинолинил, 6-изохинолинил, 4-хиназолинил, 1-имидазолил или 1-бензимидазолил). Предпочтительно  $R^1$  является необязательно замещённым 4-пиридилом или 4-пиримидинилом, в особенности, незамещённым 4-пиридилом или 2-замещённым 4-пиримидинилом. Предпочтительные заместители включают  $C_{1-4}$ алкил, особенно метил,  $-NY^4Y^5$  (в особенности где, по меньшей мере, один из  $Y^4$

и  $Y^5$  обозначает водород) или  $-OR^{17}$  (особенно где  $R^{17}$  обозначает циклоалкил).

$R^2$  преимущественно обозначает необязательно замещённый фенил, в особенности замещённый галогеном, в частности, фтором или хлором, или алкилтио- или алкилсульфинил- группу, в особенности метилтио- или метилсульфинил-, или трифторметил- группу. Более предпочтительно  $R^2$  обозначает фенил, замещённый атомом галогена (к примеру, фтором), в особенности в 4-положении.

$R^3$  может, в частности, обозначать водород или  $C_{1-4}$ алкил, преимущественно водород.

$R^4$  может, в частности, обозначать группу  $-L^3-R^{14}$ , где  $L^3$  обозначает непосредственную химическую связь, а  $R^{14}$  является  $-NY^4Y^5$ , где  $Y^4$  и  $Y^5$  принимают вышеуказанные значения, в особенности, где  $Y^4$  и  $Y^5$  обозначают водород.

$R^4$  может также, в частности, обозначать группу  $-L^3-R^{14}$ , где  $L^3$  обозначает непосредственную химическую связь, а  $R^{14}$  является  $-N(R^{10})-C(=Z)-R^{15}$ , где  $Z$ ,  $R^{10}$  и  $R^{15}$  принимают вышеуказанные значения, в особенности, где  $Z$  обозначает кислород,  $R^{10}$  обозначает водород, а  $R^{15}$  обозначает алкил (в частности, метил), арил (к примеру, замещённый или, более желательно, незамещённый фенил) или гетероарил.

$R^4$  может также, в частности, обозначать группу  $-L^3-R^{14}$ , где  $L^3$  обозначает непосредственную химическую связь, а  $R^{14}$  является  $-N(R^{10})-C(=Z)-L^4-R^{16}$ , где  $Z$ ,  $L^4$ ,  $R^{10}$  и  $R^{16}$  принимают вышеуказанные значения, в особенности, где  $Z$  обозначает

кислород,  $L^4$  обозначает метилен,  $R^{10}$  обозначает водород, а  $R^{16}$  обозначает арил (к примеру, замещённый или, более желательно, незамещённый фенил) или гетероарил.

$R^4$  может также, в частности, обозначать группу  $-L^3-R^{14}$ , где  $L^3$  обозначает непосредственную химическую связь, а  $R^{14}$  является  $-C(=Z)-NY^4Y^5$ , где  $Z$  принимает вышеуказанные значения, в особенности, обозначает кислород, и  $Y^4$  и  $Y^5$  принимают вышеуказанные значения, в особенности, где  $Y^4$  и  $Y^5$  обозначают водород или  $Y^4$  обозначает водород, а  $Y^5$  обозначает арил, арилалкил, гетероарил или гетероарилалкил.

$R^4$  может также, в частности, обозначать группу  $-L^3-R^{14}$ , где  $L^3$  обозначает непосредственную химическую связь, а  $R^{14}$  является  $-C(=Z)-NY^4Y^5$ , где  $Z$  принимает вышеуказанные значения, в особенности, обозначает кислород, и группа  $-NY^4Y^5$  образует 5-7 членный циклический амин [который необязательно может содержать дополнительный гетероатом, который выбирают из O, S или  $NY^6$  (где  $Y^6$  принимает вышеуказанные значения)], предпочтительно, 5-7 членный циклический амин, необязательно содержащий кислород, в частности, морфолиновый цикл.

$R^4$  может также, в частности, обозначать группу  $-L^3-R^{14}$ , где  $L^3$  обозначает непосредственную химическую связь, а  $R^{14}$  является  $-C(=Z)-OR^9$ , где  $Z$  и  $R^9$  принимают вышеуказанные значения, в особенности, где  $Z$  обозначает кислород, а  $R^9$  обозначает  $C_{1-4}$ алкил, предпочтительно, метил.

$R^4$  может также, в частности, обозначать группу  $-L^3-R^{14}$ , где  $L^3$  обозначает непосредственную химическую связь, в

особенности, метилен или этилен, а  $R^{14}$  является алкилом, в особенности, метилом.

$R^4$  может также, в частности, обозначать группу  $-L^3-R^{14}$ , где  $L^3$  обозначает  $C_{1-6}$ алкилен, в особенности, метилен, а  $R^{14}$  является гидроксигруппой.

$R^4$  может также, в частности, обозначать группу  $-L^3-R^{14}$ , где  $L^3$  обозначает  $C_{1-6}$ алкилен, в особенности, метилен, а  $R^{14}$  является  $-N(R^{10})-C(=Z)-R^{15}$ , где  $Z$ ,  $R^{10}$  и  $R^{15}$  принимают вышеуказанные значения, в особенности, где  $Z$  обозначает кислород,  $R^{10}$  обозначает водород, а  $R^{15}$  обозначает алкил, арил или гетероарил.

$R^4$  может также, в частности, обозначать группу  $-L^3-R^{14}$ , где  $L^3$  обозначает  $C_{1-6}$ алкилен, в особенности, метилен, а  $R^{14}$  является  $-N(R^{10})-C(=Z)-L^4-R^{16}$ , где  $Z$ ,  $L^4$ ,  $R^{10}$  и  $R^{15}$  принимают вышеуказанные значения, в особенности, где  $Z$  обозначает кислород,  $L^4$  обозначает  $C_{1-6}$ алкилен, в особенности, метилен,  $R^{10}$  обозначает водород, а  $R^{16}$  обозначает арил или гетероарил.

$R^4$  может также, в частности, обозначать группу  $-L^3-R^{14}$ , где  $L^3$  обозначает  $C_{1-6}$ алкилен, в особенности, метилен, а  $R^{14}$  является  $-NHC(=Z)-NH-R^{15}$ , где  $Z$  и  $R^{15}$  принимают вышеуказанные значения, в особенности, где  $R^{15}$  обозначает алкил, арил или гетероарил.

$R^4$  может также, в частности, обозначать группу  $-L^3-R^{14}$ , где  $L^3$  обозначает  $C_{1-6}$ алкилен, в особенности, метилен, а  $R^{14}$  является  $-NH-C(=Z)-NH-L^4-R^{16}$ , где  $Z$ ,  $L^4$  и  $R^{16}$  принимают вышеуказанные значения, в особенности, где  $L^4$  обозначает мети-

лен, а  $R^{15}$  обозначает арил или гетероарил.

$R^4$  может также, в частности, обозначать группу  $-L^3-R^{14}$ , где  $L^3$  обозначает  $C_{1-6}$ алкилен, в особенности,  $C_{1-3}$ алкилен, предпочтительно метилен, а  $R^{14}$  является  $-NY^4Y^5$ , где  $Y^4$  и  $Y^5$  принимают вышеуказанные значения, особенно, где  $Y^4$  и  $Y^5$  обозначают водород.

$R^4$  может также, в частности, обозначать группу  $-L^3-R^{14}$ , где  $L^3$  обозначает  $C_{1-6}$ алкилен, в особенности, метилен или этилен, а  $R^{14}$  является арилом или гетероарилом.

$R^4$  может также, в частности, обозначать группу  $-L^3-R^{14}$ , где  $L^3$  обозначает  $C_{1-6}$ алкилен, в особенности, метилен, а  $R^{14}$  является  $-N(R^{10})-SO_2-R^{15}$ , где  $R^{10}$  и  $R^{15}$  принимают вышеуказанные значения, в особенности, где  $R^{10}$  обозначает водород, а  $R^{15}$  обозначает алкил, арил или гетероарил.

$R^4$  может также, в частности, обозначать группу  $-L^3-R^{14}$ , где  $L^3$  обозначает  $C_{1-6}$ алкилен, в особенности, метилен, а  $R^{14}$  является  $-N(R^{10})-SO_2-L^4-R^{15}$ , где  $L^4$ ,  $R^{10}$  и  $R^{15}$  принимают вышеуказанные значения, в особенности, где  $L^4$  обозначает метилен,  $R^{10}$  обозначает водород, а  $R^{15}$  обозначает алкил, арил или гетероарил.

$R^5$  может, в частности, обозначать водород или  $C_{1-4}$ алкил, в особенности, метил.

$R^5$  может также, в частности, обозначать гидроксиалкил, в особенности, гидроксиметил.

$R^4$  и  $R^5$  вместе с атомом углерода, к которому они присоединены, могут, в частности, обозначать группу  $C=CH_2$  или

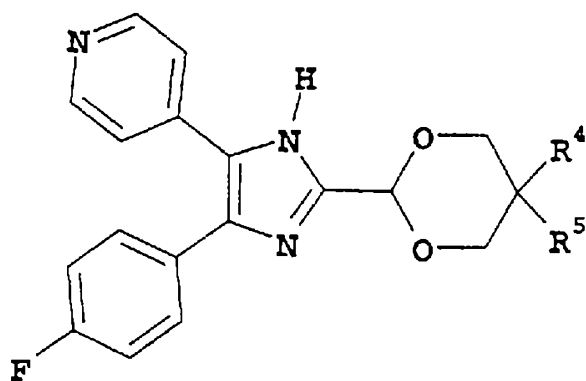
простой 5-7-членный циклический эфир, такой как тетрагидрофуран-2-ил или пергидропиран-2-ил.

$R^6$  может, в частности, обозначать водород или  $C_{1-4}$ алкил, в особенности, водород.

$m$  предпочтительно обозначает целое число 1.

Следует учитывать, что настоящее изобретение охватывает все уместные комбинации упомянутых здесь заслуживающих особого внимания и предпочтительных групп.

Особой группой соединений по изобретению являются соединения формулы (Ia):



(Ia)

где  $R^4$  и  $R^5$  являются указанными выше, и их N-оксиды и пролекарства, и фармацевтически приемлемые соли и сольваты (к примеру, гидраты) соединений формулы (Ia) и их N-оксиды и пролекарства.

Предпочтительны соединения формулы (Ia), в которой  $R^4$  обозначает группу  $-L^3-R^{14}$ , где  $L^3$  обозначает непосредственную химическую связь, а  $R^{14}$  является  $-NY^4Y^5$ , где  $Y^4$  и  $Y^5$  принимают вышеуказанные значения, в особенности, где  $Y^4$  и  $Y^5$  обозначают

водород.

Также предпочтительны соединения формулы (Ia), в которой  $R^4$  обозначает группу  $-L^3-R^{14}$ , где  $L^3$  обозначает непосредственную химическую связь, а  $R^{14}$  является  $-N(R^{10})-C(=Z)-R^{15}$ , где  $Z$ ,  $R^{10}$  и  $R^{15}$  принимают вышеуказанные значения, в особенности, где  $Z$  обозначает кислород,  $R^{10}$  обозначает водород, а  $R^{15}$  обозначает алкил (в частности, метил), арил (к примеру, замещённый или, более желательно, незамещённый фенил) или гетероарил.

Также предпочтительны соединения формулы (Ia), в которой  $R^4$  обозначает группу  $-L^3-R^{14}$ , где  $L^3$  обозначает непосредственную химическую связь, а  $R^{14}$  является  $-N(R^{10})-C(=Z)-L^4-R^{16}$ , где  $Z$ ,  $L^4$ ,  $R^{10}$  и  $R^{16}$  принимают вышеуказанные значения, в особенности, где  $Z$  обозначает кислород,  $L^4$  обозначает метилен,  $R^{10}$  обозначает водород, а  $R^{16}$  обозначает арил (к примеру, замещённый или, более желательно, незамещённый фенил) или гетероарил.

Также предпочтительны соединения формулы (Ia), в которой  $R^4$  обозначает группу  $-L^3-R^{14}$ , где  $L^3$  обозначает непосредственную химическую связь, а  $R^{14}$  является  $-C(=Z)-NY^4Y^5$ , где  $Z$  принимает вышеуказанные значения, в особенности, обозначает кислород, и  $Y^4$  и  $Y^5$  принимают вышеуказанные значения, в особенности, где  $Y^4$  и  $Y^5$  обозначают водород или  $Y^4$  обозначает водород, а  $Y^5$  обозначает арил, гетероарил или гетероарилалкил.

Также предпочтительны соединения формулы (Ia), в кото-

рой  $R^4$  обозначает группу  $-L^3-R^{14}$ , где  $L^3$  обозначает непосредственную химическую связь, а  $R^{14}$  является  $-C(=Z)-NY^4Y^5$ , где  $Z$  принимает вышеуказанные значения, в особенности, обозначает кислород, и группа  $-NY^4Y^5$  образует 5-7 членный циклический амин [который необязательно может содержать дополнительный гетероатом, который выбирают из O, S или  $NY^6$  (где  $Y^6$  принимает вышеуказанные значения)], предпочтительно, 5-7 членный циклический амин, необязательно содержащий кислород, в частности, морфолиновый цикл.

Также предпочтительны соединения формулы (Ia), в которой  $R^4$  обозначает группу  $-L^3-R^{14}$ , где  $L^3$  обозначает непосредственную химическую связь, а  $R^{14}$  является  $-C(=Z)-OR^9$ , где  $Z$  и  $R^9$  принимают вышеуказанные значения, в особенности, где  $Z$  обозначает кислород, а  $R^9$  обозначает  $C_{1-4}$ алкил, предпочтительно, метил.

Также предпочтительны соединения формулы (Ia), в которой  $R^4$  обозначает группу  $-L^3-R^{14}$ , где  $L^3$  обозначает непосредственную химическую связь, в особенности, метилен или этилен, а  $R^{14}$  является алкилом, в особенности, метилом.

Также предпочтительны соединения формулы (Ia), в которой  $R^4$  обозначает группу  $-L^3-R^{14}$ , где  $L^3$  обозначает  $C_{1-6}$ алкилен, в особенности, метилен, а  $R^{14}$  является гидроксигруппой.

Также предпочтительны соединения формулы (Ia), в которой  $R^4$  обозначает группу  $-L^3-R^{14}$ , где  $L^3$  обозначает  $C_{1-6}$ алкилен, в особенности, метилен, а  $R^{14}$  является  $-N(R^{10})-C(=Z)-R^{15}$ , где  $Z$ ,  $R^{10}$  и  $R^{15}$  принимают вышеуказанные значения,

в особенности, где Z обозначает кислород,  $R^{10}$  обозначает водород, а  $R^{15}$  обозначает алкил, арил или гетероарил.

Также предпочтительны соединения формулы (Ia), в которой  $R^4$  обозначает группу  $-L^3-R^{14}$ , где  $L^3$  обозначает  $C_{1-6}$ алкилен, в особенности, метилен, а  $R^{14}$  является  $-N(R^{10})-C(=Z)-L^4-R^{16}$ , где Z,  $L^4$ ,  $R^{10}$  и  $R^{15}$  принимают вышеуказанные значения, в особенности, где Z обозначает кислород,  $L^4$  обозначает  $C_{1-6}$ алкилен, в особенности, метилен,  $R^{10}$  обозначает водород, а  $R^{16}$  обозначает арил или гетероарил.

Также предпочтительны соединения формулы (Ia), в которой  $R^4$  обозначает группу  $-L^3-R^{14}$ , где  $L^3$  обозначает  $C_{1-6}$ алкилен, в особенности, метилен, а  $R^{14}$  является  $-NH-C(=Z)-NH-R^{15}$ , где Z и  $R^{15}$  принимают вышеуказанные значения, в особенности, где  $R^{15}$  обозначает алкил, арил или гетероарил.

Также предпочтительны соединения формулы (Ia), в которой  $R^4$  обозначает группу  $-L^3-R^{14}$ , где  $L^3$  обозначает  $C_{1-6}$ алкилен, в особенности, метилен, а  $R^{14}$  является  $-NH-C(=Z)-NH-L^4-R^{16}$ , где Z,  $L^4$  и  $R^{16}$  принимают вышеуказанные значения, в особенности, где  $L^4$  обозначает метилен, а  $R^{15}$  обозначает арил или гетероарил.

Также предпочтительны соединения формулы (Ia), в которой  $R^4$  обозначает группу  $-L^3-R^{14}$ , где  $L^3$  обозначает  $C_{1-6}$ алкилен, в особенности,  $C_{1-3}$ алкилен, предпочтительно метилен, а  $R^{14}$  является  $-NY^4Y^5$ , где  $Y^4$  и  $Y^5$  принимают вышеуказанные значения, в особенности, где  $Y^4$  и  $Y^5$  обозначают водород.

Также предпочтительны соединения формулы (Ia), в которой  $R^4$  обозначает группу  $-L^3-R^{14}$ , где  $L^3$  обозначает  $C_1$ -алкилен, в особенности, метилен или этилен, а  $R^{14}$  является арилом или гетероарилом.

Также предпочтительны соединения формулы (Ia), в которой  $R^4$  обозначает группу  $-L^3-R^{14}$ , где  $L^3$  обозначает  $C_1$ -алкилен, в особенности, метилен, а  $R^{14}$  является  $-N(R^{10})-SO_2-R^{15}$ , где  $R^{10}$  и  $R^{15}$  принимают вышеуказанные значения, в особенности, где  $R^{10}$  обозначает водород, а  $R^{15}$  обозначает алкил, арил или гетероарил.

Также предпочтительны соединения формулы (Ia), в которой  $R^4$  обозначает группу  $-L^3-R^{14}$ , где  $L^3$  обозначает  $C_1$ -алкилен, в особенности, метилен, а  $R^{14}$  является  $-N(R^{10})-SO_2-L^4-R^{15}$ , где  $L^4$ ,  $R^{10}$  и  $R^{15}$  принимают вышеуказанные значения, в особенности, где  $L^4$  обозначает метилен,  $R^{10}$  обозначает водород, а  $R^{15}$  обозначает алкил, арил или гетероарил.

Предпочтительны соединения формулы (Ia), в которой  $R^5$  обозначает водород,  $C_{1-4}$ алкил (к примеру, метил) или гидроксис $C_{1-4}$ алкил (к примеру, гидроксиметил), в особенности, метил.

Также предпочтительны соединения формулы (Ia), в которой  $R^4$  и  $R^5$  вместе с атомом углерода, к которому они присоединены, обозначают группу  $C=CH_2$  или простой 5-7-членный циклический эфир, такой как тетрагидрофуран-2-ил или пергидропиран-2-ил.

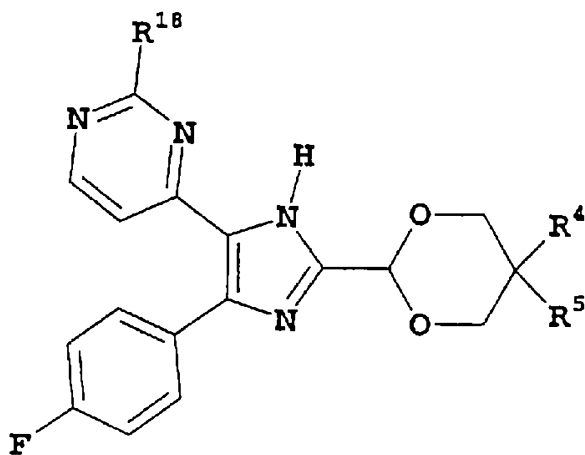
Предпочтительной группой соединений по изобретению являются соединения формулы (Ia), в которой  $R^4$  обозначает

группу  $-L^3-R^{14}$  {где  $L^3$  обозначает непосредственную химическую связь, а  $R^{14}$  обозначает (i)  $-NY^4Y^5$ , предпочтительно  $-NH_2$ ; (ii)  $-N(R^{10})-C(=Z)-R^{15}$ , предпочтительно,  $-NH-C(=O)-\text{алкил}$ ,  $-NH-C(=O)-\text{арил}$  или  $-NH-C(=O)-\text{гетероарил}$ , в особенности,  $-NH-C(=O)-\text{арил}$ , в частности, где арил является замещённым, или более предпочтительно, незамещённым фенилом; (iii)  $-N(R^{10})-C(=Z)-L^4-R^{16}$ , предпочтительно  $-NH-C(=O)-CH_2-\text{арил}$  или  $-NH-C(=O)-CH_2-\text{гетероарил}$ , в частности, где арил является замещённым, или более предпочтительно, незамещённым фенилом; (iv)  $-C(=Z)-NY^4Y^5$ , предпочтительно  $-C(=O)-NH_2$ ; (v)  $-C(=Z)-NY^4Y^5$ , предпочтительно  $-C(=O)-NY^4Y^5$ , где группа  $-NY^4Y^5$  образует 5-7-членный циклический амин [который необязательно может содержать дополнительный гетероатом, который выбирают из O, S или  $NY^6$  (где  $Y^6$  принимает вышеуказанные значения), предпочтительно 5-7-членный циклический амин, необязательно содержащий кислород, в особенности, морфолиновый цикл]; (vi)  $C(=Z)-OR^9$ , в частности,  $-CO_2Me$ ; или (vii) алкил, в особенности метил} и  $R^5$  обозначает водород,  $C_{1-4}$ алкил (к примеру, метил) или гидроксиг $C_{1-4}$ алкил (к примеру, гидроксиметил), в особенности метил; и их N-оксиды и пролекарства, и фармацевтически приемлемые соли и сольваты (к примеру, гидраты) соединений формулы (Ia) и их N-оксиды и пролекарства.

Еще одной предпочтительной группой соединений формулы (Ia) являются соединения, в которых  $R^4$  представляет группу  $-L^3-R^{14}$

{где  $L^3$  является метиленовым мостиком, а  $R^{14}$  означает (i) гидрокси; (ii)  $-N(R^{10})-C(=Z)-R^{15}$  предпочтительно  $-NH-C(=O)$ -алкил,  $-NH-C(=O)$ -арил или  $-NH-C(=O)$ -гетероарил; (iii)  $-N(R^{10})-C(=Z)-L^4-R^{16}$ , предпочтительно  $-NH-C(=O)-CH_2$ -арил или  $-NH-C(=O)-CH_2$ -гетероарил; (iv)  $-NH-C(=Z)-NH-R^{15}$ , предпочтительно  $-NH-C(=O)-NH$ -алкил,  $-NH-C(=O)-NH$ -арил или  $-NH-C(=O)-NH$ -гетероарил; (v)  $NH-C(=Z)-NH-L^4-R^{16}$ , предпочтительно  $-NH-C(=O)-NH-CH_2$ -алкил,  $-NH-C(=O)-NH-CH_2$ -арил или  $-NH-C(=O)-NH-CH_2$ -гетероарил; (vi)  $-NY^4Y^5$ , предпочтительно  $-NH_2$ ; (vii) арил; (viii) гетероарил; (ix)  $-N(R^{10})-SO_2-R^{15}$ , предпочтительно  $-NH-SO_2$ -алкил,  $NH-SO_2$ -арил или  $-NH-SO_2$ -гетероарил} и  $R^5$  представляет водород,  $C_{1-4}$ алкил (например, метил) или гидрокси  $C_{1-4}$ алкил (например, гидроксиметил), в особенности, метил; их N-оксиды и пролекарства; и фармацевтически приемлемые соли и сольваты (например, гидраты) указанных соединений формулы (Ia) и их N-оксиды и пролекарства.

Дополнительной, заслуживающей особого внимания группой соединений по изобретению являются соединения формулы (Ib):



(Ib)

где  $R^4$  и  $R^5$  принимают вышеуказанные значения, а  $R^{18}$  обозначает  $R^{17}Z^3-$  или  $Y^4Y^5N-$  (где  $R^{17}$ ,  $Y^4$ ,  $Y^5$  и  $Z^3$  принимают вышеуказанные значения) и их N-оксиды и пролекарства; и фармацевтически приемлемые соли и сольваты (к примеру, гидраты) соединений формулы (Ib) и их N-оксиды и пролекарства.

Предпочтительны соединения формулы (Ib), в которой  $R^4$  обозначает группу  $-L^3-R^{14}$ , где  $L^3$  обозначает непосредственную химическую связь, а  $R^{14}$  является  $-NY^4Y^5$ , где  $Y^4$  и  $Y^5$  принимают вышеуказанные значения, в особенности, где  $Y^4$  и  $Y^5$  обозначают водород.

Также предпочтительны соединения формулы (Ib), в которой  $R^4$  обозначает группу  $-L^3-R^{14}$ , где  $L^3$  обозначает непосредственную химическую связь, а  $R^{14}$  является  $-N(R^{10})-C(=Z)-R^{15}$ , где  $Z$ ,  $R^{10}$  и  $R^{15}$  принимают вышеуказанные значения, в особенности, где  $Z$  обозначает кислород,  $R^{10}$  обозначает водород, а  $R^{15}$  обозначает алкил (в частности, метил), арил (к

примеру, замещённый или, более желательно, незамещённый фенил) или гетероарил.

Также предпочтительны соединения формулы (Ib), в которой  $R^4$  обозначает группу  $-L^3-R^{14}$ , где  $L^3$  обозначает непосредственную химическую связь, а  $R^{14}$  является  $-N(R^{10})-C(=Z)-L^4-R^{16}$ , где  $Z$ ,  $L^4$ ,  $R^{10}$  и  $R^{16}$  принимают вышеуказанные значения, в особенности, где  $Z$  обозначает кислород,  $L^4$  обозначает метилен,  $R^{10}$  обозначает водород, а  $R^{16}$  обозначает арил (к примеру, замещённый или, более желательно, незамещённый фенил) или гетероарил.

Также предпочтительны соединения формулы (Ib), в которой  $R^4$  обозначает группу  $-L^3-R^{14}$ , где  $L^3$  обозначает непосредственную химическую связь, а  $R^{14}$  является  $-C(=Z)-NY^4Y^5$ , где  $Z$  принимает вышеуказанные значения, в особенности, обозначает кислород, и  $Y^4$  и  $Y^5$  принимают вышеуказанные значения, в особенности, где  $Y^4$  и  $Y^5$  обозначают водород или  $Y^4$  обозначает водород, а  $Y^5$  обозначает арил, гетероарил или гетероарилалкил.

Также предпочтительны соединения формулы (Ib), в которой  $R^4$  обозначает группу  $-L^3-R^{14}$ , где  $L^3$  обозначает непосредственную химическую связь, а  $R^{14}$  является  $-C(=Z)-NY^4Y^5$ , где  $Z$  принимает вышеуказанные значения, в особенности, обозначает кислород, и группа  $-NY^4Y^5$  образует 5-7 членный циклический амин [который необязательно может содержать дополнительный гетероатом, который выбирают из O, S или  $NY^6$  (где  $Y^6$  принимает вышеуказанные значения)], предпочтительно,

5-7 членный циклический амин, необязательно содержащий кислород, в частности, морфолиновый цикл.

Также предпочтительны соединения формулы (Ib), в которой  $R^4$  обозначает группу  $-L^3-R^{14}$ , где  $L^3$  обозначает непосредственную химическую связь, а  $R^{14}$  является  $-C(=Z)-OR^9$ , где  $Z$  и  $R^9$  принимают вышеуказанные значения, в особенности, где  $Z$  обозначает кислород, а  $R^9$  обозначает  $C_{1-4}$ алкил, предпочтительно, метил.

Также предпочтительны соединения формулы (Ib), в которой  $R^4$  обозначает группу  $-L^3-R^{14}$ , где  $L^3$  обозначает непосредственную химическую связь, в особенности, метилен или этилен, а  $R^{14}$  является алкилом, в особенности, метилом.

Также предпочтительны соединения формулы (Ib), в которой  $R^4$  обозначает группу  $-L^3-R^{14}$ , где  $L^3$  обозначает  $C_{1-6}$ алкилен, в особенности, метилен, а  $R^{14}$  является гидроксигруппой.

Также предпочтительны соединения формулы (Ib), в которой  $R^4$  обозначает группу  $-L^3-R^{14}$ , где  $L^3$  обозначает  $C_{1-6}$ алкилен, в особенности, метилен, а  $R^{14}$  является  $-N(R^{10})-C(=Z)-R^{15}$ , где  $Z$ ,  $R^{10}$  и  $R^{15}$  принимают вышеуказанные значения, в особенности, где  $Z$  обозначает кислород,  $R^{10}$  обозначает водород, а  $R^{15}$  обозначает алкил, арил или гетероарил.

Также предпочтительны соединения формулы (Ib), в которой  $R^4$  обозначает группу  $-L^3-R^{14}$ , где  $L^3$  обозначает  $C_{1-6}$ алкилен, в особенности, метилен, а  $R^{14}$  является  $-N(R^{10})-C(=Z)-L^4-R^{16}$ , где  $Z$ ,  $L^4$ ,  $R^{10}$  и  $R^{16}$  принимают вышеуказанные значения, в особенности, где  $Z$  обозначает кислород,  $L^4$  обозначает  $C_{1-}$

алкилен, в особенности, метилен,  $R^{10}$  обозначает водород, а  $R^{16}$  обозначает арил или гетероарил.

Также предпочтительны соединения формулы (Ib), в которой  $R^4$  обозначает группу  $-L^3-R^{14}$ , где  $L^3$  обозначает  $C_{1-6}$ алкилен, в особенности, метилен, а  $R^{14}$  является  $-NH-C(=Z)-NH-R^{15}$ , где  $Z$  и  $R^{15}$  принимают вышеуказанные значения, в особенности, где  $R^{15}$  обозначает алкил, арил или гетероарил.

Также предпочтительны соединения формулы (Ib), в которой  $R^4$  обозначает группу  $-L^3-R^{14}$ , где  $L^3$  обозначает  $C_{1-6}$ алкилен, в особенности, метилен, а  $R^{14}$  является  $-NH-C(=Z)-NH-L^4-R^{16}$ , где  $Z$ ,  $L^4$  и  $R^{16}$  принимают вышеуказанные значения, в особенности, где  $L^4$  обозначает метилен, а  $R^{15}$  обозначает арил или гетероарил.

Также предпочтительны соединения формулы (Ib), в которой  $R^4$  обозначает группу  $-L^3-R^{14}$ , где  $L^3$  обозначает  $C_{1-6}$ алкилен, в особенности,  $C_{1-3}$ алкилен, предпочтительно метилен, а  $R^{14}$  является  $-NY^4Y^5$ , где  $Y^4$  и  $Y^5$  принимают вышеуказанные значения, в особенности, где  $Y^4$  и  $Y^5$  обозначают водород.

Также предпочтительны соединения формулы (Ib), в которой  $R^4$  обозначает группу  $-L^3-R^{14}$ , где  $L^3$  обозначает  $C_{1-6}$ алкилен, в особенности, метилен или этилен, а  $R^{14}$  является арилом или гетероарилом.

Также предпочтительны соединения формулы (Ib), в которой  $R^4$  обозначает группу  $-L^3-R^{14}$ , где  $L^3$  обозначает  $C_{1-6}$ алкилен, в особенности, метилен, а  $R^{14}$  является  $-N(R^{10})-SO_2-R^{15}$ , где  $R^{10}$  и  $R^{15}$  принимают вышеуказанные значения, в осо-

бенности, где  $R^{10}$  обозначает водород, а  $R^{15}$  обозначает алкил, арил или гетероарил.

Также предпочтительны соединения формулы (Ib), в которой  $R^4$  обозначает группу  $-L^3-R^{14}$ , где  $L^3$  обозначает  $C_{1-6}$ алкилен, в особенности, метилен, а  $R^{14}$  является  $-N(R^{10})-SO_2-L^4-R^{15}$ , где  $L^4$ ,  $R^{10}$  и  $R^{15}$  принимают вышеуказанные значения, в особенности, где  $L^4$  обозначает метилен,  $R^{10}$  обозначает водород, а  $R^{15}$  обозначает алкил, арил или гетероарил.

Предпочтительны соединения формулы (Ib), в которой  $R^5$  обозначает водород,  $C_{1-4}$ алкил (к примеру, метил) или гидроксис $C_{1-4}$ алкил (к примеру, гидроксиметил), в особенности, метил.

Также предпочтительны соединения формулы (Ib), в которой  $R^4$  и  $R^5$  вместе с атомом углерода, к которому они присоединены, обозначают группу  $C=CH_2$  или простой 5-7-членный циклический эфир, такой как тетрагидрофуран-2-ил или пергидропиран-2-ил.

Предпочтительны соединения формулы (Ib), в которой  $R^{18}$  обозначает  $-NY^4Y^5$ , где  $Y^4$  и  $Y^5$  принимают вышеуказанные значения, в особенности, где  $Y^4$  обозначает водород, а  $Y^5$  обозначает (i) арилалкил, в особенности, необязательно замещенный бензил или необязательно замещенный  $\alpha$ -метилбензил (в котором фенильная группа может быть необязательно замещенной одним или более заместителями арильных групп, в частности, галогеном, метокси, трифторметилом, метилом и метилendiокси); (ii) гетероарилалкил, в особенности, азатетероарил-алкил, конкретнее, азатетероарил- $CH_2$ -; (iii)  $C_{2-6}$ алкил, замещенный алкокси, в

особенности,  $C_{2-6}$ алкил, замещенный метокси; (iv)  $C_{2-6}$ алкил, замещенный  $-NY^1Y^2$ , в особенности,  $C_{2-6}$ алкил, замещенный  $-NMe_2$ ; (v)  $C_{2-6}$ алкил, замещенный гидроксигруппой; (vi) циклоалкил или (vii) арил, в особенности, фенил, необязательно замещенный одним или более заместителями арильных групп, в частности, галогеном, метокси, трифторметилом, метилом или метилendioкси.

Также предпочтительны соединения формулы (Ib), в которой  $R^{18}$  обозначает  $-OR^{17}$ , где  $R^{17}$  принимает вышеуказанные значения, в особенности, где  $R^{17}$  обозначает алкил, арил (в особенности, фенил, необязательно замещенный одним или более заместителями арильных групп, в частности, галогеном, метокси, трифторметилом, метилом или метилendioкси) или циклоалкил.

Предпочтительной группой соединений по изобретению являются соединения формулы (Ib), в которой  $R^4$  обозначает группу  $-L^3-R^{14}$  {где  $L^3$  обозначает непосредственную химическую связь, а  $R^{14}$  обозначает (i)  $-NY^4Y^5$ , предпочтительно  $-NH_2$ ; (ii)  $-N(R^{10})-C(=Z)-R^{15}$ , предпочтительно,  $-NH-C(=O)-$ алкил,  $-NH-C(=O)-$ арил или  $-NH-C(=O)-$ гетероарил, в особенности,  $-NH-C(=O)-$ арил, в частности, где арил является замещенным, или более предпочтительно, незамещенным фенилом; (iii)  $-N(R^{10})-C(=Z)-L^4-R^{16}$ , предпочтительно  $-NH-C(=O)-CH_2-$ арил или  $-NH-C(=O)-CH_2-$ гетероарил, в частности, где арил является замещенным, или более предпочтительно, незамещенным фенилом;

(iv)  $-C(=Z)-NY^4Y^5$ , предпочтительно  $-C(=O)-NH_2$ ; (v)  $-C(=Z)-NY^4Y^5$ , предпочтительно  $-C(=O)-NY^4Y^5$ , где группа  $-NY^4Y^5$  образует 5-7-членный циклический амин [который необязательно может содержать дополнительный гетероатом, который выбирают из O, S или  $NY^6$  (где  $Y^6$  принимает вышеуказанные значения), предпочтительно 5-7-членный циклический амин, необязательно содержащий кислород, в особенности, морфолиновый цикл]; (vi)  $C(=Z)-OR^9$ , в частности,  $-CO_2Me$ ; или (vii) алкил, в особенности метил},  $R^5$  обозначает водород,  $C_{1-4}$ алкил (к примеру, метил) или гидроксигруппа  $C_{1-4}$ алкил (к примеру, гидроксиметил), в особенности метил; и  $R^{18}$  обозначает  $-NY^4Y^5$  {где  $Y^4$  и  $Y^5$  принимают вышеуказанные значения, в особенности, где  $Y^4$  обозначает водород, а  $Y^5$  обозначает (i) арилалкил, в особенности, бензил или  $\alpha$ -метилбензил; (ii) гетероарилалкил, в особенности, азатетероарил-алкил, конкретнее, азатетероарил- $CH_2$ -; (iii)  $C_{2-6}$ алкил, замещенный алкокси, в особенности,  $C_{2-6}$ алкил, замещенный метокси; (iv)  $C_{2-6}$ алкил, замещенный  $-NY^1Y^2$ , в особенности,  $C_{2-6}$ алкил, замещенный  $-NMe_2$ ; (v)  $C_{2-6}$ алкил, замещенный гидрокси; (vi) циклоалкил или (vii) арил, в особенности, фенил, необязательно замещенный одним или более заместителями арильных групп, в частности, галогеном, метокси, трифторметилом, метилом или метилendiокси} или  $-OR^{17}$ , где  $R^{17}$  обозначает алкил или циклоалкил; и их N-оксиды и пролекарства, и фармацевтически приемлемые соли и сольваты (к примеру, гидраты) соединений формулы (Ib) и их N-оксиды и пролекарства.

Ещё одной предпочтительной группой соединений по изобретению являются соединения формулы (Ib), в которой  $R^4$  обозначает группу  $-L^3-R^{14}$  {где  $L^3$  обозначает метиленовый мостик, а  $R^{14}$  обозначает (i) гидроксигруппу; (ii)  $-N(R^{10})-C(=Z)-R^{15}$ , предпочтительно,  $-NH-C(=O)-$ алкил,  $-NH-C(=O)-$ арил или  $-NH-C(=O)-$ гетероарил; (iii)  $-N(R^{10})-C(=Z)-L^4-R^{16}$ , предпочтительно  $-NH-C(=O)-CH_2-$ арил или  $-NH-C(=O)-CH_2-$ гетероарил; (iv)  $-NH-C(=Z)-NH-R^{15}$ , предпочтительно  $-NH-C(=O)-NH-$ алкил,  $-NH-C(=O)-NH-$ арил или  $-NH-C(=O)-NH-$ гетероарил; (v)  $-NH-C(=Z)-NH-L^4-R^{16}$ , предпочтительно  $-NH-C(=O)-NH-CH_2-$ алкил,  $-NH-C(=O)-NH-CH_2-$ арил или  $-NH-C(=O)-NH-CH_2-$ гетероарил; (vi)  $-NY^4Y^5$ , предпочтительно  $-NH_2$ ; (vii) арил; (viii) гетероарил; (ix)  $-N(R^{10})-SO_2-R^{15}$ , предпочтительно  $-NH-SO_2-$ алкил,  $-NH-SO_2-$ арил или  $-NH-SO_2-$ гетероарил} и  $R^5$  обозначает водород,  $C_{1-4}$ алкил (к примеру, метил) или гидроксигруппа  $C_{1-4}$ алкил (к примеру, гидроксиметил), в особенности метил; и  $R^{18}$  обозначает  $-NY^4Y^5$  {где  $Y^4$  и  $Y^5$  принимают вышеуказанные значения, в особенности, где  $Y^4$  обозначает водород, а  $Y^5$  обозначает (i) арилалкил, в особенности, бензил или  $\alpha$ -метилбензил; (ii) гетероарилалкил, в особенности, азатетероарилалкил, конкретнее, азатетероарил- $CH_2-$ ; (iii)  $C_{2-6}$ алкил, замещённый алкокси, в особенности,  $C_{2-6}$ алкил, замещённый метокси; (iv)  $C_{2-6}$ алкил, замещённый  $-NY^1Y^2$ , в особенности,  $C_{2-6}$ алкил, замещённый  $-NMe_2$ ; (v)  $C_{2-6}$ алкил, замещённый гидроксигруппой; или (vi) циклоалкил} или  $-OR^{17}$ , где  $R^{17}$  обозначает алкил или циклоалкил; и их N-оксиды и пролекарства; и фармацевтически приемлемые соли и сольваты

(к примеру, гидраты) соединений формулы (Ib) и их N-оксиды и пролекарства.

Особую группу соединений по изобретению составляют соединения, которые выбирают из следующей группы, включающей:

{2-[5-(4-фтор-фенил)-4-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, цис-изомер, (соединение А);

{2-[5-(4-фтор-фенил)-4-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, транс-изомер, (соединение В);

4-[2-(5,5-диметил)-[1,3]диоксан-2-ил]-5-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-4-ил]-пиридин, (соединение С);

С-[5-метил-2-{5-(4-фтор-фенил)-4-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил}-[1,3]диоксан-5-ил]-метиламин, цис- и транс-изомеры, (соединение D);

2,2,2-трифтор-N-[5-метил-2-{5-(4-фтор-фенил)-4-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил}-[1,3]диоксан-5-ил]-ацетамид, цис- и транс- изомеры, (соединение E);

2,2,2-трифтор-N-[5-метил-2-{5-(4-фтор-фенил)-4-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил}-[1,3]диоксан-5-ил]-ацетамид, цис-изомер, (соединение F);

2,2,2-трифтор-N-[5-метил-2-{5-(4-фтор-фенил)-4-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил}-[1,3]диоксан-5-ил]-ацетамид, транс-изомер, (соединение G);

4-[2-(5-азидометил-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-

фтор-фенил)-1H-имидазол-4-ил]-пиридин, цис- и транс- изомеры, (соединение H);

4-[2-(5-бензил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-4-ил]-пиридин, цис- и транс- изомеры, (соединение I);

метилвый эфир 2-[5-(4-фтор-фенил)-4-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, цис- и транс- изомеры, (соединение J);

4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(1,8,10-триокса-спиро[5,5]ундец-9-ил)-1H-имидазол-4-ил]-пиридин, (соединение K);

4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(1,7,9-триокса-спиро[4,5]дец-8-ил)-1H-имидазол-4-ил]-пиридин, (соединение L);

4-[2-(5-метил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3H-имидазол-4-ил]-пиридин, (соединение M);

4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-метилен-[1,3]диоксан-2-ил)-3H-имидазол-4-ил]-пиридин, (соединение N);

4-[2-[1,3]диоксан-2-ил-5-(4-фтор-фенил)-3H-имидазол-4-ил]-пиридин, (соединение O);

4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(4-метил-[1,3]диоксан-2-ил)-3H-имидазол-4-ил]-пиридин, (R/S) (R/S) изомеры, (соединение P);

4-[2-(4,6-диметил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3H-имидазол-4-ил]-пиридин, (R/S) (R/S) (R/S) изомеры, (соединение Q);

4-[2-(5-бензилокси-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3H-имидазол-4-ил]-пиридин, цис- и транс- изомеры, (соединение R);

4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-фенил-[1,3]диоксан-2-ил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиридин, цис- и транс- изомеры, (соединение S);

4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(4-изопропил-5,5-диметил-[1,3]диоксан-2-ил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиридин, (R/S) (R/S) изомеры, (соединение T);

4-[2-(5,5-диэтил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиридин, (соединение U);

4-[2-(2,4-диокса-спиро[5,5]ундец-8-ен-3-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиридин, цис- и транс- изомеры, (соединение V);

N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-бензамид, цис- и транс- изомеры, (соединение W);

1-(4-фтор-фенил)-3-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-тиомочевина, цис- и транс- изомеры, (соединение X);

1-(2,6-диметил-фенил)-3-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-тиомочевина, цис- и транс- изомеры, (соединение Y);

4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-метил-5-пиррол-1-ил-[1,3]диоксан-2-ил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиридин, цис- и транс- изомер, (соединение Z);

C-[5-метил-2-{5-(4-фтор-фенил)-4-пиридин-4-ил-1Н-имидазол-2-ил}-[1,3]диоксан-5-ил]-метиламин, транс-изомер, (соединение AA);

С-[5-метил-2-{5-(4-фтор-фенил)-4-пиридин-4-ил-1Н-имидазол-2-ил}-[1,3]диоксан-5-ил]-метиламин, цис-изомер, (соединение АВ);

2,2,2-трифтор-N-[5-метил-2-{5-(4-фтор-фенил)-4-пиридин-4-ил-1Н-имидазол-2-ил}-[1,3]диоксан-5-илметил]-ацетамид, транс-изомер, (соединение АС);

2,2,2-трифтор-N-[5-метил-2-{5-(4-фтор-фенил)-4-пиридин-4-ил-1Н-имидазол-2-ил}-[1,3]диоксан-5-илметил]-ацетамид, цис-изомер, (соединение АД);

5-метил-2-{5-(4-фтор-фенил)-4-пиридин-4-ил-1Н-имидазол-2-ил}-[1,3]диоксан-5-иламин, цис-изомер, (соединение АЕ);

5-метил-2-{5-(4-фтор-фенил)-4-пиридин-4-ил-1Н-имидазол-2-ил}-[1,3]диоксан-5-иламин, транс-изомер, (соединение АF);

5-метил-2-{5-(4-фтор-фенил)-4-пиридин-4-ил-1Н-имидазол-2-ил}-[1,3]диоксан-5-иламин, цис- и транс-изомеры, (соединение АG);

2-[5-(4-фтор-фенил)-4-пиридин-4-ил-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновая кислота, транс-изомер, (соединение АH);

2-[5-(4-фтор-фенил)-4-пиридин-4-ил-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновая кислота, цис-изомер, (соединение АI);

бензиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, цис-изомер, (соединение АJ);

бензиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1Н-имида-

зол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение AK);

(2-гидрокси-этил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение AL);

(2-метокси-этил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение AM);

амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение AN);

(пиридин-2-илметил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение AO);

(пиридин-3-илметил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение AP);

(пиридин-4-илметил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение AQ);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-(4-метил-пиперазин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение AR);

(3-диметиламино-пропил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение AS);

[2-(1H-индол-3-ил)-этил]-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение AT);

(3-гидрокси-пропил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение AU);

(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение AV);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение AW);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-пирролидин-1-ил-метанон, транс-изомер, (соединение AX);

бутиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение AY);

дипропиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение AZ);

(3-метокси-пропил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение BA);

фенетил-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты,

транс-изомер, (соединение BB);

(2-пиридин-2-ил-этил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение BC);

(фуран-2-илметил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение BD);

(2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение BE);

диметиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение BF);

пропиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение BG);

циклопропиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение BH);

циклопентиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение BI);

циклогексиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение BJ);

(2-метокси-этил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, цис-изомер, (соединение BK);

(2-гидрокси-этил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, цис-изомер, (соединение BL);

амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, цис-изомер, (соединение BM);

(пиридин-2-илметил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, цис-изомер, (соединение BN);

(пиридин-3-илметил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, цис-изомер, (соединение BO);

(пиридин-4-илметил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, цис-изомер, (соединение BP);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-метанон, цис-изомер, (соединение BQ);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-(4-метил-пиперазин-1-ил)-метанон, цис-изомер, (соединение BR);

(3-диметиламино-пропил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбо-

вой кислоты, цис-изомер, (соединение BS);

[2-(1H-индол-3-ил)-этил]-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3] диоксан-5-карбоновой кислоты, цис-изомер, (соединение BT);

(3-гидрокси-пропил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3] диоксан-5-карбоновой кислоты, цис-изомер, (соединение BU);

фенетил-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3] диоксан-5-карбоновой кислоты, цис-изомер, (соединение BV);

(3-метокси-пропил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3] диоксан-5-карбоновой кислоты, цис-изомер, (соединение BW);

(2-пиридин-2-ил-этил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3] диоксан-5-карбоновой кислоты, цис-изомер, (соединение BX);

(фуран-2-илметил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3] диоксан-5-карбоновой кислоты, цис-изомер, (соединение BY);

(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3] диоксан-5-карбоновой кислоты, цис-изомер, (соединение BZ);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3] диоксан-5-ил}-пирролидин-1-ил-метанон, цис-изомер, (соединение CA);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-

5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-пиперидин-1-ил-метанон, цис-изомер, (соединение CB);

пропиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, цис-изомер, (соединение CC);

бутиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, цис-изомер, (соединение CD);

циклопропиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, цис-изомер, (соединение CE);

циклопентиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, цис-изомер, (соединение CF);

циклогексиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, цис-изомер, (соединение CG);

метиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, цис-изомер, (соединение CH);

(2-диметиламино-этил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, цис-изомер, (соединение CI);

диметиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, цис-изомер, (соединение CJ);

дипропиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, цис-изомер, (соединение СК);

этиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, цис-изомер, (соединение CL);

метиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение CM);

(2-диметиламино-этил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение CN);

этиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение CO);

1-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-3-фенилмочевина, цис-изомер, (соединение CP);

1-этил-3-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-мочевина, цис-изомер, (соединение CQ);

1-(3,5-диметил-изоксалол-4-ил)-3-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-мочевина, цис-изомер, (соединение CR);

1-бензил-3-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-мочевина, цис-изомер,

(соединение CS);

1-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-3-(2-тиофен-2-ил-этил)-мочевина, цис-изомер, (соединение CT);

1-(3-ацетил-фенил)-3-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-3-мочевина, цис-изомер, (соединение CU);

1-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-3-фенил-мочевина, транс-изомер, (соединение CV);

3-(3-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-уреидо)-бензойная кислота, транс-изомер, (соединение CW);

1-бензил-3-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-мочевина, транс-изомер, (соединение CX);

1-этил-3-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-мочевина, транс-изомер, (соединение CY);

1-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-3-(2-тиофен-2-ил-этил)-мочевина, транс-изомер, (соединение CZ);

1-бензил-3-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-мочевина, цис-изомер, (соединение DA);

1-этил-3-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имида-

зол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-мочевина, цис-изомер, (соединение DB);

1-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-3-фенил-мочевина, цис-изомер, (соединение DC);

1-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-3-фенил-мочевина, транс-изомер, (соединение DD);

1-бензил-3-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-мочевина, транс-изомер, (соединение DE);

1-этил-3-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-мочевина, транс-изомер, (соединение DF);

1-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-3-(2-морфолин-4-ил-этил)-тиомочевина, цис-изомер, (соединение DG);

1-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-3-фуран-3-илметил-тиомочевина, цис-изомер, (соединение DH);

1-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-3-пиридин-3-ил-тиомочевина, цис-изомер, (соединение DI);

1-бензо[1,3]диоксол-5-ил-3-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-тиомочевина, цис-изомер, (соединение DJ);

1-бензо[1,3]диоксол-5-илметил-3-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-тиомочевина, цис-изомер, (соединение DK);

1-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-3-пиридин-3-ил-тиомочевина, транс-изомер, (соединение DL);

1-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-3-(2-морфолин-4-ил-этил)-тиомочевина, транс-изомер, (соединение DM);

1-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-3-фуран-2-илметил-тиомочевина, транс-изомер, (соединение DN);

1-бензо[1,3]диоксол-5-илметил-3-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-тиомочевина, транс-изомер, (соединение DO);

1-бензо[1,3]диоксол-5-ил-3-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-тиомочевина, цис-изомер, (соединение DP);

1-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-3-фуран-2-илметил-тиомочевина, цис-изомер, (соединение DQ);

3-(3-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-тиоуреидо)-бензойная кислота, цис-изомер, (соединение DR);

1-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-3-пиридин-3-ил-тиомоче-

вина, цис-изомер, (соединение DS);

1-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-3-(2-морфолин-4-ил-этил)-тиомочевина, цис-изомер, (соединение DT);

1-бензо[1,3]диоксол-5-илметил-3-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-тиомочевина, цис-изомер, (соединение DU);

N-(2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-ацетамид, цис-изомер, (соединение DV);

N-(2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-2-фенил-ацетамид, цис-изомер, (соединение DW);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-амид циклогексанкарбоновой кислоты, цис-изомер, (соединение DX);

2-бензилокси-N-(2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-ацетамид, транс-изомер, (соединение DY);

2-бензилокси-N-(2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-ацетамид, цис-изомер, (соединение DZ);

N-(2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-ацетамид, транс-изомер, (соединение EA);

N-(2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-

ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-2-фенил-ацетамид, транс-изомер, (соединение EB);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-амид циклогексанкарбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение EC);

N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-2-фенил-ацетамид, цис-изомер, (соединение ED);

2-бензилокси-N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-ацетамид, цис-изомер, (соединение EE);

N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-2-бензамид, цис-изомер, (соединение EF);

N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-ацетамид, цис-изомер, (соединение EG);

N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-2-фенил-ацетамид, цис-изомер, (соединение EH);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-амид циклогексанкарбоновой кислоты, цис-изомер, (соединение EI);

N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-ацетамид, транс-изомер, (соединение EJ);

N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-2-фенил-ацетамид, транс-изомер, (соединение EK);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-амид циклогексанкарбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение EL);

N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-2-фенил-ацетамид, транс-изомер, (соединение EM);

4-{2-[5-(4-фтор-фенил)-4-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илкарбамоил}-масляная кислота, цис-изомер, (соединение EN);

4-({2-[5-(4-фтор-фенил)-4-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-карбамоил)-масляная кислота, цис-изомер, (соединение EO);

4-{2-[5-(4-фтор-фенил)-4-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илкарбамоил}-пропионовая кислота, цис-изомер, (соединение EP);

4-({2-[5-(4-фтор-фенил)-4-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-карбамоил)-пропионовая кислота, цис-изомер, (соединение EQ);

4-({2-[5-(4-фтор-фенил)-4-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-карбамоил)-пропионовая кислота, транс-изомер, (соединение ER);

N-{2-[5-(4-фтор-фенил)-4-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-метансульфонамид, цис-изомер,

(соединение ES);

N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-метансульфонамид, цис-изомер, (соединение ET);

N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-бензолсульфонамид, цис-изомер, (соединение EU);

N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-С-фенил-метансульфонамид, цис-изомер, (соединение EV);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-амид тиофен-2-сульфоновой кислоты, цис-изомер, (соединение EW);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-амид 3,5-диметил-изоксазол-4-сульфоновой кислоты, цис-изомер, (соединение EX);

N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-метансульфонамид, транс-изомер, (соединение EY);

N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-бензолсульфонамид, транс-изомер, (соединение EZ);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-амид тиофен-2-сульфоновой кислоты, транс-изомер, (соединение FA);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-амид 3,5-диметил-изоксазол-4-сульфоновой кислоты, транс-изомер, (соединение FB);

3-амино-N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-пропионамид, транс-изомер, (соединение FC);

3-амино-N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-пропионамид, цис-изомер, (соединение FD);

4-амино-N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-бутирамид, транс-изомер, (соединение FE);

4-амино-N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-бутирамид, цис-изомер, (соединение FF);

2-амино-N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-ацетамид, транс-изомер, (соединение FG);

2-амино-N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-ацетамид, цис-изомер, (соединение FH);

бензиловый эфир (3-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илкарбамоил}-этил)-карбаминовой кислоты, транс-изомер, (соединение FI);

бензиловый эфир (3-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илкарбамоил}-этил)-

карбаминовой кислоты, цис-изомер, (соединение FJ);

бензиловый эфир (3-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илкарбамоил}-пропил)-карбаминовой кислоты, транс-изомер, (соединение FK);

бензиловый эфир (3-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илкарбамоил}-пропил)-карбаминовой кислоты, цис-изомер, (соединение FL);

бензиловый эфир (3-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илкарбамоил}-метил)-карбаминовой кислоты, транс-изомер, (соединение FM);

бензиловый эфир (3-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илкарбамоил}-метил)-карбаминовой кислоты, цис-изомер, (соединение FN);

4-диметиламино-N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-бутирамид, цис- и транс- изомеры, (соединение FO);

N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-бензамид, транс-изомер, (соединение FR);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-(4-гидрокси-пиперидин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение FS);

(1,4-диокса-8-аза-спиро[4,5]дец-8-ил)-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-метанон, транс-изомер, (соединение FT);

этиловый эфир 1-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1Н-

имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбонил}-пиперидин-4-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение FU);

1-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбонил}-пиперидин-4-карбоновая кислота, транс-изомер, (соединение FV);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-тиоморфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение FW);

(1,1-диоксотiomорфолин-4-ил)-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-метанон, транс-изомер, (соединение FX);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-(3-гидроксиметил-пиперидин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение FY);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-(3-гидрокси-пиперидин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение FZ);

(2,6-диметил-морфолин-4-ил)-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-метанон, транс-изомер, (соединение GA);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-(3-гидрокси-пирролидин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение GB);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-(4-метокси-пиперидин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение GC);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-[4-(2-гидрокси-этил)-пиперидин-1-ил]-метанон, транс-изомер, (соединение GD);

{5-амино-2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, цис-изомер, (соединение LE);

{5-амино-2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, транс-изомер, (соединение LF);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-нитро-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, цис-изомер, (соединение LG);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-нитро-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, транс-изомер, (соединение LH);

C-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5,5-диметил-[1,3]диоксан-4-ил}-метиламин, (соединение LI);

4-[2-(5,5-диметил-4-нитрометил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3H-имидазол-4-ил]-пиридин, (соединение LJ) и соответствующие N-оксиды и их пролекарства; и фармацевтически приемлемые соли и сольваты (к примеру, гидраты) таких соединений и их N-оксиды и пролекарства.

Дополнительную особую группу соединений по изобретению составляют соединения, которые выбирают из следующей группы, включающей:

{2-[5-(2-циклопропиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение GH);

{2-[5-(2-амино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение GI);

{2-[5-(2-диметиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение GJ);

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-гидрокси-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение GK);

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-метокси-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение GL);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метиламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение GM);

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(1-этоксикарбонилпиперидин-4-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение GN);

{2-[5-(2-циклогексиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение GO);

2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-гидрокси-этиламино)-пирими-

дин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3] диоксан-5-ил)-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение GP);

{2-[5-[2-(2-амино-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3] диоксан-5-ил)-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение GQ);

[2-{4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[3-(5H-имидазол-1-ил)-пропиламино]-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3] диоксан-5-ил]-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение GR);

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-морфолин-4-ил-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3] диоксан-5-ил)-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение GS);

2-[5-(2-бензиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3] диоксан-5-ил)-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение GT);

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(1-фенил-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3] диоксан-5-ил)-морфолин-4-ил-метанон, R изомер, транс-изомер, (соединение GU);

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(1-фенил-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3] диоксан-5-ил)-морфолин-4-ил-метанон, S изомер, транс-изомер, (соединение GV);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-фениламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3] диоксан-5-ил)-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение GW);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пиперидин-1-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3] диоксан-5-ил)-морфолин-4-

ил-метанон, транс-изомер, (соединение GX);

[2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиридин-4-илметил)-амино]-  
пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-  
ил)-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение GY);

[2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиридин-2-илметил)-амино]-  
пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-  
ил)-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение GZ);

[2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиридин-3-илметил)-амино]-  
пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-  
ил)-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение HA);

[2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(фуран-2-илметил)-амино]-  
пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-  
ил)-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение HB);

[2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(тиофен-2-илметил)-амино]-  
пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-  
ил)-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение HC);

[2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(тетрагидро-фуран-2-илме-  
тил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]-  
диоксан-5-ил)-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соеди-  
нение HD);

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-{2-(4-метил-пиперазин-1-ил)-пи-  
римидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-  
морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение HE);

(2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-морфолин-4-ил-пиримидин-4-  
ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-морфолин-4-  
ил-метанон, транс-изомер, (соединение HF);

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-метокси-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение FG);

{2-[5-[2-(3-диметиламино-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение HH);

{2-[5-[2-(2-диметиламино-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение HI);

(4-{5-(4-фтор-фенил)-2-[5-метил-5-(морфолин-4-карбонил)-[1,3]диоксан-2-ил]-3H-имидазол-4-ил}-пиримидин-2-иламино)-уксусная кислота, транс-изомер, (соединение HJ);

3-(4-{5-(4-фтор-фенил)-2-[5-метил-5-(морфолин-4-карбонил)-[1,3]диоксан-2-ил]-3H-имидазол-4-ил}-пиримидин-2-иламино)-пропионовая кислота, транс-изомер, (соединение HK);

4-[2-(5,5-диметил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3H-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламин, (соединение HL);

{4-[2-(5,5-диметил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3H-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-метил-амин, (соединение HM);

{4-[2-(5,5-диметил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3H-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-диметил-амин, (соединение HN);

циклопропил-{4-[2-(5,5-диметил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3H-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-амин, (соединение HO);

циклогексил-{4-[2-(5,5-диметил-[1,3] диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-амин, (соединение HQ);

2-{4-[2-(5,5-диметил-[1,3] диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-этанол, (соединение HR);

N1-{4-[2-(5,5-диметил-[1,3] диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-этан-1,2-диамин, (соединение HS);

{4-[2-(5,5-диметил-[1,3] диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-[3-(5Н-имидазол-1-ил)-пропил]-амин, (соединение HT);

{4-[2-(5,5-диметил-[1,3] диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-[3-морфолин-4-ил-пропил]-амин, (соединение HU);

3-{4-[2-(5,5-диметил-[1,3] диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-пропан-1-ол, (соединение HV);

бензил-{4-[2-(5,5-диметил-[1,3] диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-амин, (соединение HW);

{4-[2-(5,5-диметил-[1,3] диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-(1-фенил-этил)-амин, R-изомер, (соединение HX);

{4-[2-(5,5-диметил-[1,3] диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-(1-фенил-этил)-амин, S-

изомер, (соединение HY);

{ 4-[2-(5,5-диметил-[1,3] диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-  
3H-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-фенил-амин, (соединение  
HZ);

4-[2-(5,5-диметил-[1,3] диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-  
3H-имидазол-4-ил]-2-пиперидин-1-ил}-пиримидин, (соединение  
IA);

{ 4-[2-(5,5-диметил-[1,3] диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-  
3H-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-пиридин-4-илметил-амин,  
(соединение IB);

{ 4-[2-(5,5-диметил-[1,3] диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-  
3H-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-пиридин-2-илметил-амин,  
(соединение IC);

{ 4-[2-(5,5-диметил-[1,3] диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-  
3H-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-пиридин-3-илметил-амин,  
(соединение ID);

{ 4-[2-(5,5-диметил-[1,3] диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-  
3H-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-(фуран-2-илметил)-амин,  
(соединение IE);

{ 4-[2-(5,5-диметил-[1,3] диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-  
3H-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-(тиофен-2-илметил)-амин,  
(соединение IF);

{ 4-[2-(5,5-диметил-[1,3] диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-  
3H-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-(тетрагидро-фуран-2-илме-  
тил)-амин, (соединение IG);

4-[2-(5,5-диметил-[1,3] диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-

3H-имидазол-4-ил]-2-(4-метил-пиперазин-1-ил)-пиримидин,  
(соединение IH);

4-{4-[2-(5,5-диметил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3H-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-морфолин, (соединение IJ);

{4-[2-(5,5-диметил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3H-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-(3-метокси-пропил)-амин,  
(соединение IK);

{4-[2-(5,5-диметил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3H-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-(2-метокси-этил)-амин,  
(соединение IL);

N-{4-[2-(5,5-диметил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3H-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-N',N'-диметил-пропан-1,3-диамин, (соединение IM);

N-{4-[2-(5,5-диметил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3H-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-N',N'-диметил-этан-1,2-диамин, (соединение IN);

{2-[5-(2-амино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, транс-изомер, (соединение IO);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метокси-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-метанол, транс-изомер, (соединение IP);

{2-[5-(2-бензилокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-метанол, транс-изомер, (соединение IQ);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-фенокси-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение IR);

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-метокси-этокси)-пиримидин-4-ил]-1Н-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение IS);

{2-[5-[2-(2-диметиламино-этокси)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение IT);

{2-[5-(2-циклогексилокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение IU);

{2-[5-(2-изопропокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение IW);

4-[2-(5,5-диметил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-2-метокси-пиримидин, (соединение IY);

2-бензилокси-4-[2-(5,5-диметил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин, (соединение IZ);

4-[2-(5,5-диметил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-2-фенокси-пиримидин, (соединение JA);

4-[2-(5,5-диметил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-2-(2-метокси-этокси)-пиримидин, (соединение JB);

(2-{4-[2-(5,5-диметил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-илокси}-этил)-диметил-

амин, (соединение JC);

2-циклогексилокси-4-[2-(5,5-диметил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин, (соединение JD);

2-изопропокси-4-[2-(5,5-диметил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин, (соединение JE);

4-[2-(5-амино-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламин, цис-изомер, (соединение JF);

{4-[2-(5-амино-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-метил-амин, цис-изомер, (соединение JG);

{4-[2-(5-амино-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-диметил-амин, цис-изомер, (соединение JH);

{4-[2-(5-амино-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-циклопропил-амин, цис-изомер, (соединение JI);

{4-[2-(5-амино-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-пиперидин-4-ил-амин, цис-изомер, (соединение JJ);

{4-[2-(5-амино-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-циклогексил-амин, цис-изомер, (соединение JK);

2-{4-[2-(5-амино-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-этанол, цис-

изомер, (соединение JL);

N1-{4-[2-(5-амино-5-метил-[1,3] диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-этан-1,2-диамин, цис-изомер, (соединение JM);

{4-[2-(5-амино-5-метил-[1,3] диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-[3-(5Н-имидазол-1-ил)-пропил]-амин, цис-изомер, (соединение JN);

{4-[2-(5-амино-5-метил-[1,3] диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-[3-морфолин-4-ил-пропил]-амин, цис-изомер, (соединение JO);

3-{4-[2-(5-амино-5-метил-[1,3] диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-пропан-1-ол, цис-изомер, (соединение JP);

{4-[2-(5-амино-5-метил-[1,3] диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-бензил-амин, цис-изомер, (соединение JQ);

{4-[2-(5-амино-5-метил-[1,3] диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-(1-фенил-этил)-амин, R-изомер, цис-изомер (соединение JR);

{4-[2-(5-амино-5-метил-[1,3] диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-(1-фенил-этил)-амин, S-изомер, цис-изомер (соединение JS);

{4-[2-(5-амино-5-метил-[1,3] диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-фенил-амин, цис-изомер, (соединение JT);

2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пиперидин-1-ил-пиримидин-4-

ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-иламин, цис-изомер, (соединение JU);

{4-[2-(5-амино-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3H-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-пиридин-4-илметиламин, цис-изомер, (соединение JV);

{4-[2-(5-амино-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3H-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-пиридин-2-илметиламин, цис-изомер, (соединение JW);

{4-[2-(5-амино-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3H-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-пиридин-3-илметиламин, цис-изомер, (соединение JX);

{4-[2-(5-амино-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3H-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-(фуран-2-илметил)-амин, цис-изомер, (соединение JY);

{4-[2-(5-амино-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3H-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-(тиофен-2-илметил)-амин, цис-изомер, (соединение JZ);

{4-[2-(5-амино-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3H-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амин, цис-изомер, (соединение KA);

2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-метил-пиперазин-1-ил)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-иламин, цис-изомер, (соединение KB);

2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-морфолин-4-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-иламин, цис-изомер, (соединение KC);

{4-[2-(5-амино-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-(3-метокси-пропил)-амин, цис-изомер, (соединение KD);

{4-[2-(5-амино-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-(2-метокси-этил)-амин, цис-изомер, (соединение KE);

N-{4-[2-(5-амино-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-N', N'-диметил-пропан-1,3-диамин, цис-изомер, (соединение KF);

N-{4-[2-(5-амино-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-N', N'-диметил-этан-1,2-диамин, цис-изомер, (соединение KG);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфонилпиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение KH);

2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфонилпиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5,5-диметил-[1,3]диоксан, (соединение KI);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфонил-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, транс-изомер, (соединение KJ);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфонил-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, цис-изомер, (соединение KK);

2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфонилпиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан, (соединение KL);

4-[2-[1,3]диоксан-2-ил]-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-

ил]-2-метилсульфонил-пиримидин, (соединение KM);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфонил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, транс-изомер, (соединение KN);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфонил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, цис-изомер, (соединение KO);

2,2,2-трифтор-N-[2-{4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфонилпиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил]-ацетамид, цис-изомер, (соединение KP);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфанилпиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-метанол, транс-изомер, (соединение KQ);

2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфанилпиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5,5-диметил-[1,3]диоксан, (соединение KR);

2,2,2-трифтор-N-[2-{4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфанил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил]-ацетамид, цис-изомер, (соединение KS);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфанил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, цис-изомер, (соединение KT);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфанил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, транс-изомер, (соединение KU);

4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-метилен-[1,3]диоксан-2-ил)-3H-имидазол-4-ил]-2-метилсульфанил-пиримидин, (соединение KV);

4-[2-[1,3]диоксан-2-ил-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-2-метилсульфанил-пиримидин, (соединение KW);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфанил-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, транс-изомер, (соединение KX);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфанил-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, цис-изомер, (соединение KY);

С-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфанил-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-метиламин, цис-изомер, (соединение KZ);

амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфанил-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, цис-изомер, (соединение LA);

2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфанил-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновая кислота, цис-изомер, (соединение LB);

метиловый эфир 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфанил-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение LC);

метиловый эфир 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфанил-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, цис-изомер, (соединение LD);

2,2,2-трифтор-N-{2-[5-(2-метилсульфонил-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-ацетамид, цис-изомер, (соединение LE);

2,2,2-трифтор-N-{2-[5-(2-метилсульфонил-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-ацетамид, транс-изомер, (соединение LL);

метилловый эфир 2-[4-(4-фторфенил)-5-(2-метилсульфонил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение LM);

метилловый эфир 2-[4-(4-фторфенил)-5-(2-метиленсульфонил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, цис-изомер, (соединение LN) и соответствующие N-оксиды и их пролекарства; и фармацевтически приемлемые соли и сольваты (к примеру, гидраты) таких соединений и их N-оксиды и пролекарства.

Предпочтительные соединения по изобретению включают:

{2-[5-(4-фтор-фенил)-4-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, цис-изомер, (соединение A);

C-[5-метил-2-{5-(4-фтор-фенил)-4-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил}]-[1,3]диоксан-5-ил]-метиламин, цис- и транс-изомеры, (соединение D);

4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(4-изопропил-5,5-диметил-[1,3]диоксан-2-ил)-3H-имидазол-4-ил]-пиридин, (R/S) (R/S) изомеры, (соединение T);

C-[5-метил-2-(5-фенил-4-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил)-[1,3]диоксан-5-ил]-метиламин, транс-изомер, (соединение AA);

C-[5-метил-2-(5-фенил-4-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил)-

[1,3]диоксан-5-ил]-метиламин, цис-изомер, (соединение АВ);

5-метил-2-{5-(4-фтор-фенил)-4-пиридин-4-ил-1Н-имидазол-2-ил}-[1,3]диоксан-5-иламин, цис-изомер, (соединение АЕ);

5-метил-2-{5-(4-фтор-фенил)-4-пиридин-4-ил-1Н-имидазол-2-ил}-[1,3]диоксан-5-иламин, транс-изомер, (соединение АF);

5-метил-2-{5-(4-фтор-фенил)-4-пиридин-4-ил-1Н-имидазол-2-ил}-[1,3]диоксан-5-иламин, цис- и транс- изомеры, (соединение АG);

амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение АN);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение АW);

амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, цис-изомер, (соединение ВM);

2-амино-N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-ацетамид, транс-изомер, (соединение FГ);

2-амино-N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-ацетамид, цис-изомер, (соединение FН);

N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-бензамид, транс-изомер, (соединение FР) и соответствующие N-оксиды и их пролекарства; и

фармацевтически приемлемые соли и сольваты (к примеру, гидраты) таких соединений и их N-оксиды и пролекарства.

Дополнительные предпочтительные соединения по изобретению включают:

{2-[5-(2-циклопропиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение GH);

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-метокси-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение GL);

2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(1-этоксикарбонилпиперидин-4-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение GN);

{2-[5-(2-циклогексиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение GO) и соответствующие N-оксиды и их пролекарства; и фармацевтически приемлемые соли и сольваты (к примеру, гидраты) таких соединений и их N-оксиды и пролекарства.

Особенно предпочтительным соединением по изобретению является {2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение AW) и соответствующий N-оксид и его пролекарства; и фармацевтически приемлемые соли и сольваты (к примеру, гидраты) этого соединения и его N-оксид и проле-

карства, в особенности соль с метансульфокислотой, представленная соединением GP.

Соединения по изобретению обладают полезным фармакологическим действием и поэтому их включают в фармацевтические композиции и используют для лечения пациентов, страдающих определённым заболеванием внутренних органов. Таким образом, согласно ещё одному аспекту, настоящее изобретение обеспечивает соединения по изобретению и композиции, содержащие соединения по изобретению, для применения в терапии.

Соединения, охватываемые объёмом настоящего изобретения, согласно описанным в литературе испытаниям и описанным здесь методикам испытаний in vitro и in vivo являются ингибиторами воспроизведения фактора некроза опухолей (TNF), в особенности, TNF-альфа, считается, что эти результаты испытаний коррелируются с фармакологической активностью на людях и других млекопитающих. Таким образом, в дополнительном варианте практического воплощения, настоящее изобретение даёт соединения по изобретению и композиции, содержащие соединения по изобретению, для применения в лечении пациентов, страдающих заболеваниями, или склонных к заболеваниям, симптомы которых могут быть улучшены введением ингибитора TNF, в особенности, TNF-альфа. К примеру, соединения по изобретению полезны в лечении воспаления суставов, включая артрит, ревматоидный артрит и другие состояния артрита, такие как ревматоидный спондилит, подагрический артрит,

рит, травматический артрит, артрит после коревой краснухи, псориатический артрит и остеоартрит. Кроме того, соединения пригодны для лечения острого синовита, туберкулёза, атеросклероза, мышечной дегенерации, кахексии, болезни Рейтера, эндотоксии, сепсиса, септического шока, эндотоксинового бактериально-токсического шока, грамотрицательного сепсиса, подагры, синдрома токсического шока, хронических лёгочных воспалительных заболеваний, включающих астму и респираторный дистресс-синдром взрослых, силикоз, лёгочный саркоидоз, резорбции костей, остеопороза, рестеноза, синдрома сердечной недостаточности и ишемического синдрома миокарда, сердечного и почечного реперфузионного повреждения, тромбоза, гломеруло-нефрита, гомологичной болезни, отторжения аллотрансплантата и лепры. Кроме того, соединения полезны в лечении инфекционных заболеваний, таких как вирусные инфекции, к примеру, HIV, вирус цитомегалии (CMV), грипп, аденовирус и группа вирусов герпеса, паразитические инфекции, к примеру, малярия, такая как церебральная малярия, инфекция брожения и микоз, к примеру, грибковый менингит; лихорадка и миалгия, вызванные инфекцией; СПИД; связанный со СПИДом комплекс (ARC); вторичная кахексия при инфекции или злокачественном заболевании; вторичная кахексия при синдроме приобретённого иммунодефицита (СПИДе) или раке; келоидное или рубцовое образование ткани; повышение температуры (pyresis); диабет; воспалительные заболевания кишечника, такие как болезнь

Крона и неспецифический язвенный колит; экзема; контактный дерматит; псориаз; солнечная эритема и конъюнктивит.

Соединения по изобретению полезны также в лечении болезней или травм головного мозга, последствием которых является избыточное продуцирование TNF-альфа, таких как рассеянный склероз, болезнь Альцгеймера, травма, припадок и другие ишемические состояния.

Соединения по изобретению могут также быть полезны в подавлении болезней, связанных с избыточным продуцированием других про-воспалительных цитокинов, IL-1, IL-6 и IL-8.

Особым вариантом воплощения терапевтических способов по данному изобретению является лечение астмы.

Другой особый вариант воплощения терапевтических способов по данному изобретению составляет лечение воспаления суставов.

Согласно ещё одной отличительной особенности данного изобретения, предложен способ лечения пациентов, страдающих или подверженных заболеваниям, которые могут быть улучшены введением ингибитора TNF, в особенности, TNF-альфа, к примеру, указанным здесь состояниям, включающий введение пациенту эффективного количества соединения по изобретению или композиции, содержащей соединение по изобретению. Предполагается, что "эффективное количество" соответствует количеству соединения по изобретению, эффективному в ингибировании TNF, а следовательно, в оказании желаемого терапевтического действия.

Подразумевается, что ссылка на лечение включает кроме профилактической терапии также и лечение существующих состояний.

Настоящее изобретение также охватывает фармацевтические композиции, включающие по меньшей мере одно из соединений по изобретению в сочетании с фармацевтически приемлемым носителем или эксципиентом.

Соединение по изобретению могут быть введены любыми подходящими способами. На практике соединения по изобретению могут быть введены парентерально, местно, ректально, перорально или путём ингаляции, в особенности оральным путём.

Композиции по изобретению могут быть получены обычными способами с применением одного или большего числа фармацевтически приемлемых адъювантов или эксципиентов. Адъюванты включают, в частности, разбавители, стерильную водную среду и различные не-токсические органические растворители. Композиции могут быть представлены в форме таблеток, пилюль, гранул, порошков, водных растворов или суспензий, растворов для инъекции, эликсиров или сиропов, и могут содержать один или большее число агентов, которые выбирают из группы, включающей подсластители, корригенты, красители или стабилизаторы, чтобы получить фармацевтически приемлемые препараты. Выбор среды для лекарства и содержания активного вещества в ней обычно осуществляется в соответствии с растворимостью и химическими свойствами активного соединения, конкретным способом введения и с учётом мер предос-

торожности, которые должны соблюдаться в фармацевтической практике. К примеру, для получения таблеток могут быть использованы эксципиенты, такие как лактоза, цитрат натрия, карбонат кальция, дикальций-фосфат, и дезинтегрирующие средства, такие как крахмал, альгиновые кислоты и некоторые комплексные силикаты, объединённые со смазывающими веществами, такими как стеарат магния, натрий-лаурилсульфат и тальк. Для получения капсул удобно использовать лактозу и высокомолекулярные полиэтиленгликоли. Когда используют водные суспензии, они могут содержать эмульгирующие средства или агенты, способствующие образованию суспензии. Могут также быть использованы разбавители, такие как сахароза, этанол, полиэтиленгликоль, глицерин и хлороформ или их смеси.

Для парентерального введения применяют эмульсии, суспензии или растворы продуктов по изобретению в растительном масле, к примеру, кунжутном масле, арахисовом масле или оливковом масле, или водно-органические растворы, такие как в воде и пропиленгликоле, в пригодных для инъекции сложных органических эфирах, таких как этилолеат, а также стерильные водные растворы фармацевтически приемлемых солей. Растворы солей продуктов по изобретению особенно пригодны для введения путём внутримышечной или подкожной инъекции. Водные растворы, включающие также растворы солей в чистой дистиллированной воде, могут быть использованы для внутривенного введения при условии, что их pH доведен до пригодного, что они в разумной степени содержат буфер и

превращены в изотонические с помощью достаточного количества глюкозы или хлористого натрия, и что они стерилизованы путём нагревания, облучения или микрофльтрации.

Для местного введения могут быть использованы гели (с водной или спиртовой основой), кремы или мази, содержащие соединения по изобретению. Соединения по изобретению могут также быть включены в гель или матричную основу для нанесения на пластырь, что даёт возможность регулируемого отпуска соединения через трансдермальный барьер.

Для введения путём ингаляции соединения по изобретению могут быть растворены или суспендированы в пригодном носителе для использования в распылителе или в аэрозоле суспензии или раствора, или могут быть абсорбированы или адсорбированы на пригодном твёрдом носителе для применения в ингаляторе с сухим порошком.

Твёрдые композиции для ректального введения включают суппозитории, сформулированные в соответствии с хорошо известными способами и содержащие по меньшей мере одно соединение по изобретению.

Процентное содержание активного ингредиента в композициях по изобретению может варьироваться, необходимо, чтобы оно составляло количество, позволяющее получить пригодную дозировку.

Очевидно, несколько форм унифицированных доз может быть введено приблизительно в одно время. Используемая доза определяется лечащим врачом и зависит от желаемого

терапевтического воздействия, способа введения и продолжительности лечения и состояния пациента.

Для взрослых доза обычно составляет приблизительно от 0,001 до 50, предпочтительно, приблизительно от 0,001 до 5, мг/кг веса тела в день при ингаляции, приблизительно от 0,01 до 100, предпочтительно, приблизительно от 0,1 до 70, в особенности, от 0,5 до 10, мг/кг веса тела в день при пероральном введении, и приблизительно от 0,001 до 10, предпочтительно, приблизительно от 0,01 до 1, мг/кг веса тела в день при внутривенном введении. В каждом конкретном случае доза определяется в соответствии с факторами, характерными для нуждающегося в лечении пациента, такими как возраст, вес, общее состояние здоровья и другими характеристиками, которые могут влиять на эффективность медицинского препарата.

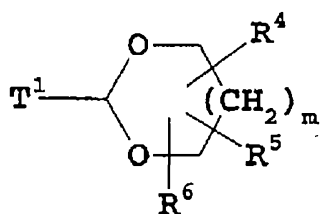
Соединения по изобретению можно вводить так часто, как это необходимо в целях получения желаемого терапевтического воздействия. Некоторые пациенты могут быстро реагировать на большую или меньшую дозу и могут найти достаточной более слабую поддерживающую дозу. Для других пациентов может быть необходимо подвергаться длительному лечению при норме от 1 до 4 доз ежедневно, согласно с физиологическими потребностями каждого конкретного пациента. Обычно активный продукт может быть введен перорально 1-4 раза в день. Конечно, некоторым пациентам необходимо предписывать не более одной или двух доз на день.

Соединения по изобретению могут быть получены применением или адаптацией известных способов, под которыми подразумеваются использованные прежде или описанные в литературе способы.

Соединения по изобретению могут быть получены способами, аналогичными описанным в EP424195 и EP506437.

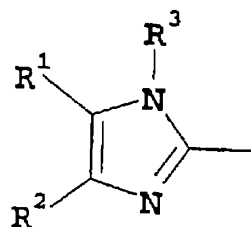
В описанных ниже реакциях может возникнуть необходимость защищать реакционно-способные функциональные группы, к примеру, гидрокси-, amino-, имино- тио- или карбокси- группы, когда их желательно сохранить в конечном продукте, чтобы избежать их нежелательного участия в реакциях. Обычные защитные группы могут быть использованы согласно стандартным методикам, к примеру, смотри T.W.Green and P.G.M.Wuts в "Protective Groups in Organic Chemistry" John Wiley and Sons, 1991.

Соединения по изобретению могут быть представлены формулой (Ic):



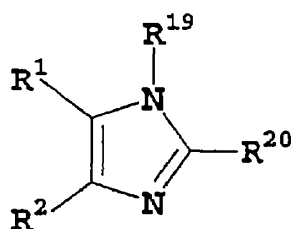
(Ic)

где R⁴, R⁵, R⁶ и m принимают вышеуказанные значения, а T¹ обозначает группу формулы:



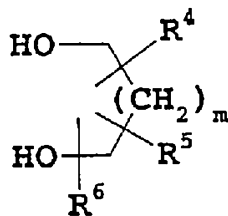
где  $R^1$ ,  $R^2$  и  $R^3$  принимают вышеуказанные значения.

В способе (А) соединения формулы (I), где  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  и  $m$  принимают вышеуказанные значения, а  $R^3$  обозначает водород, могут быть получены по реакции соединений формулы (II):



(II)

где  $R^1$  и  $R^2$  принимают вышеуказанные значения, а  $R^{19}$  обозначает водород или подходящую защитную группу, такую как 2-триметилсиланил-этоксиметил, которую в последствии удаляют в кислых реакционных условиях, и  $R^{20}$  обозначает  $-CHO$  или  $-CH(OMe)_2$ , с соединениями формулы (III):



(III)

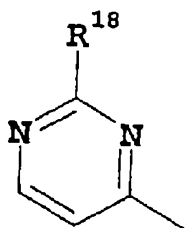
где  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  и  $m$  принимают вышеуказанные значения. Реакцию удобно проводить в присутствии кислотного катализатора, такого как пиридиный-4-толуол-сульфонат или 4-толуолсульфокислота, в инертном растворителе, таком как толуол, при нагревании до температуры кипения с обратным холодильником, с азеотропным удалением образующейся при реакции воды.

Соединения формулы (I), где  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  и  $m$  принимают вышеуказанные значения, а  $R^3$  обозначает группу  $-L^1-R^7$  (где  $L^1$  и  $R^7$  принимают вышеуказанные значения) или

$-L^2-R^8$  (где  $L^2$  является указанным выше, а  $R^8$  обозначает арил, циклоалкенил, циклоалкил, гетероарил, гетероциклоалкил), могут быть так же получены по реакции соединений формулы (II), где  $R^1$  и  $R^2$  принимают вышеуказанные значения, а  $R^{19}$  обозначает группу  $-L^1-R^7$  (где  $L^1$  и  $R^7$  принимают вышеуказанные значения) или  $-L^2-R^8$  (где  $L^2$  является указанным выше, а  $R^8$  обозначает арил, циклоалкенил, циклоалкил, гетероарил, гетероциклоалкил) и  $R^{20}$  обозначает  $-\text{CHO}$  или  $-\text{CH}(\text{OMe})_2$ , с соединениями формулы (III), где  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  и  $m$  принимают вышеуказанные значения.

В способе (B) соединения формулы (I), где  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^5$ ,

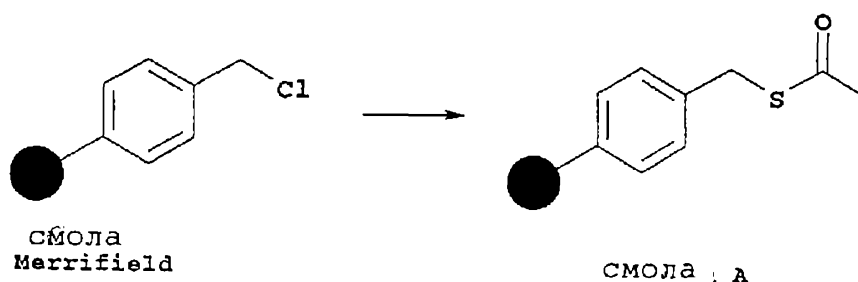
$R^6$  и  $m$  принимают вышеуказанные значения, а  $R^1$  обозначает группу (IV):



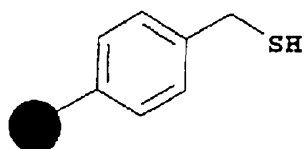
(IV)

где  $R^{18}$  обозначает  $Y^4Y^5N-$  (в котором  $Y^4$  и  $Y^5$  принимают вышеуказанные значения), могут быть получены:

(i) обработкой смолы Merrifield'а (хлорметилполистирольной смолы) тиацетатом калия в инертном растворителе, таком как диметилформамид, при температуре близкой к комнатной, с образованием смолы А;

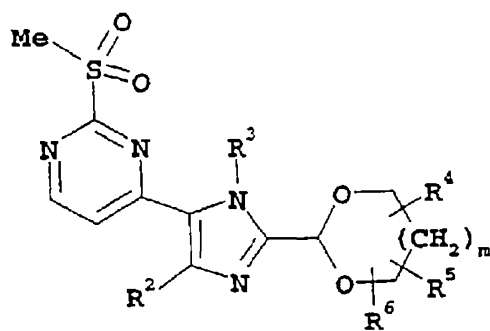


(ii) реакцией смолы А с боргидридом лития в инертном растворителе, таком как тетрагидрофуран, и при температуре близкой к комнатной, с образованием смолы В;



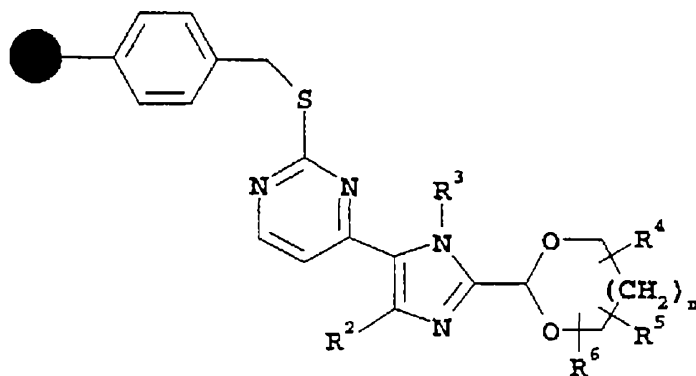
смола В

(iii) реакцией смолы В с гидридом щелочного металла, таким как гидрид натрия, в инертном растворителе, таком как диметилформамид, при температуре близкой к комнатной, с последующей обработкой соединением формулы (V);



(V)

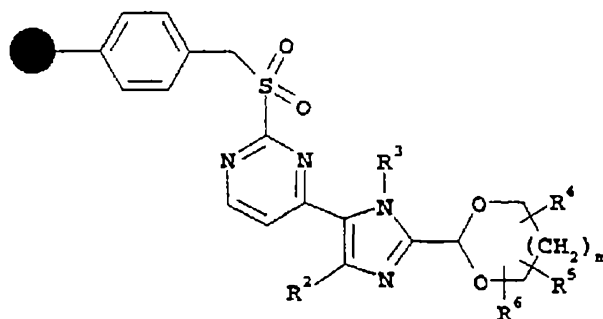
где  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  и  $m$  принимают вышеуказанные значения, при температуре приблизительно от близкой к комнатной до  $80^{\circ}\text{C}$ , с образованием смолы С;



смола С

где  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  и  $n$  принимают вышеуказанные значения; с последующими соответствующими взаимопреращениями функциональных групп, к примеру, указанными ниже.

(iv) реакцией смолы С, где  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  и  $n$  принимают вышеуказанные значения, с м-хлорнадбензойной кислотой, в инертном растворителе или предпочтительно, в смеси инертных растворителей, такой как смесь дихлорметана и метанола, с образованием смолы D, где  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  и  $n$  принимают вышеуказанные значения;



смола D

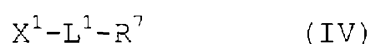
(v) реакцией смолы D, где  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  и  $m$  принимают вышеуказанные значения, с аминами формулы  $\text{HNY}^4\text{Y}^5$ , где  $\text{Y}^4$  и  $\text{Y}^5$  принимают вышеуказанные значения, в инертном растворителе, таком как диметоксиэтан, и при температуре порядка  $70^\circ\text{C}$ .

Соединения формулы (I), где  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  и  $m$  принимают вышеуказанные значения, а  $R^1$  обозначает группу (IV), где  $R^{18}$  обозначает  $-\text{OR}^{17}$  или  $-\text{SR}^{17}$  группу (в которой  $R^{17}$  является указанным выше), могут быть получены по реакции смолы D, где  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  и  $m$  принимают вышеуказанные значения, с соединениями формул  $R^{17}\text{OH}$  или  $R^{17}\text{SH}$  (где  $R^{17}$  является указанным выше), в присутствии гидрида щелочного металла, такого как гидрид натрия, в инертном растворителе, таком как диметилформамид, и при температуре приблизительно от близкой к комнатной до  $80^\circ\text{C}$ ..

Согласно ещё одной характерной особенности данного

изобретения, соединения по изобретению могут быть получены взаимопревращением других соединений по изобретению.

К примеру, соединения формулы (I), где  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  и  $m$  принимают вышеуказанные значения, а  $R^3$  обозначает группу  $-L^1-R^7$  (в которой  $L^1$  обозначает линейный или разветвлённый алкиленовый мостик с 1-6 атомами углерода, а  $R^7$  является указанным выше), могут быть получены алкилированием соединений формулы (I), где  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  и  $m$  принимают вышеуказанные значения, а  $R^3$  обозначает водород, алкилгалогенидом формулы (IV):



где  $L^1$  и  $R^7$  такие, как указано непосредственно выше, а  $X^1$  обозначает атом галогена, предпочтительно, атом брома. Алкилирование может, к примеру, быть проведено в присутствии основания, такого как гидрид щелочного металла, например, гидрид натрия, в диметилформамиде или диметилсульфоксиде при температуре приблизительно от  $0^\circ\text{C}$  до  $100^\circ\text{C}$ .

В качестве другого примера взаимопревращения, соединения формулы (I), где  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  и  $m$  принимают вышеуказанные значения, а  $R^3$  обозначает группу  $-L^2-R^8$  (в которой  $L^2$  обозначает линейную или разветвлённую углеродную цепь, включающую от 2 до 6 атомов углерода и содержащую двойную или тройную углерод-углеродную связь, а  $R^8$  обозначает арил, циклоалкенил, циклоалкил, гетероарил, гетероциклоалкил), могут быть так же получены алкилированием соединений формулы (I), где  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  и  $m$  принимают

вышеуказанные значения, а  $R^3$  обозначает водород, соединениями формулы (V):



где  $L^2$  и  $R^8$  такие, как указано непосредственно выше, а  $X^1$  обозначает атом галогена, предпочтительно, атом брома.

В качестве другого примера взаимопревращения, соединения формулы (Ic), где  $T^1$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  и  $m$  принимают вышеуказанные значения, а  $R^4$  содержит  $-NH_2$  группу, могут быть получены по реакции соединений формулы (Ic), где  $T^1$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  и  $m$  принимают вышеуказанные значения, а  $R^4$  содержит  $-NHC(=O)CF_3$  группу, с основанием, таким как карбонат калия или аммония, в метаноле или смеси метанола и воды, при температуре порядка температуры перегонки.

В качестве иного примера взаимопревращения, соединения формулы (Ic), где  $T^1$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  и  $m$  принимают вышеуказанные значения, а  $R^4$  содержит  $-N(R^{10})-C(=O)-R^{15}$  или  $-N(R^{10})-C(=O)-L^4-R^{16}$  группу (где  $R^{10}$ ,  $R^{15}$ ,  $R^{16}$  и  $L^4$  принимают вышеуказанные значения) могут быть получены по реакции соединений формулы (Ic), где  $T^1$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  и  $m$  принимают вышеуказанные значения, а  $R^4$  содержит  $-NHR^{10}$  группу (в которой  $R^{10}$  является указанным выше), с соответственно замещённым хлорангидридом  $Cl-C(=O)-R^{15}$  или  $Cl-C(=O)-L^4-R^{16}$  (где  $R^{15}$ ,  $R^{16}$  и  $L^4$  принимают вышеуказанные значения) в присутствии триэтиламина в инертном растворителе, таком как тетрагидрофуран, и при температуре близкой к комнатной.

В качестве иного примера взаимопревращения, соединения

формулы (Ic), где  $T^1$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  и  $m$  принимают вышеуказанные значения, а  $R^4$  содержит  $-NH-C(=O)-R^{15}$  или  $-NH-C(=O)-L^4-R^{16}$  группу (где  $R^{15}$ ,  $R^{16}$  и  $L^4$  принимают вышеуказанные значения), могут быть получены по реакции соединений формулы (Ic), где  $T^1$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  и  $m$  принимают вышеуказанные значения, а  $R^4$  содержит  $-NH_2$  группу, с соответственно замещённой кислотой  $HO-C(=O)-R^{15}$  или  $HO-C(=O)-L^4-R^{16}$  (где  $R^{15}$ ,  $R^{16}$  и  $L^4$  принимают вышеуказанные значения) соответственно, в присутствии *O*-(7-азабензотриазол-1-ил)-1,1,3,3-тетраметилуроний-гексафторфосфата и диизопропилэтиламина в диметилформамиде при комнатной температуре. Для реакции могут быть использованы другие стандартные методики пептидного присоединения, такие как обработка карбодиимидом, к примеру, дициклогексилкарбодиимидом, в присутствии триэтиламина, или обработка 1-гидроксибензотриазолом и карбодиимидом, таким как 1-(3-диметиламинопропил)-3-этилкарбодиимид, в инертном растворителе, таком как диметилформамид, и при температуре близкой к комнатной.

В качестве другого примера взаимопревращения, соединения формулы (Ic), где  $T^1$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  и  $m$  принимают вышеуказанные значения, а  $R^4$  содержит  $-NH-C(=O)-R^{15}$  или  $-NH-C(=O)-L^4-R^{16}$  группу (где  $R^{15}$ ,  $R^{16}$  и  $L^4$  принимают вышеуказанные значения), могут быть получены по реакции соединений формулы (Ic), где  $T^1$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  и  $m$  принимают вышеуказанные значения, а  $R^4$  содержит  $-NH_2$  группу, с соответственно замещённым ангидридом кислоты  $R^{15}-C(=O)-O-C(=O)-R^{15}$  или  $R^{16}-L^4-C(=O)-O-C(=O)-$

$L^4-R^{16}$  (где  $R^{15}$ ,  $R^{16}$  и  $L^4$  принимают вышеуказанные значения) в присутствии триэтиламина или пиридина в инертном растворителе, таком как тетрагидрофуран, и при температуре близкой к комнатной.

В качестве другого примера взаимопревращения, соединения формулы (Ic), где  $T^1$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  и  $m$  принимают вышеуказанные значения, а  $R^4$  содержит  $-NH-C(=O)-NH-R^{15}$  или  $-NH-C(=O)-NH-L^4-R^{16}$  группу (где  $R^{15}$ ,  $R^{16}$  и  $L^4$  принимают вышеуказанные значения), могут быть получены по реакции соединений формулы (Ic), где  $T^1$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  и  $m$  принимают вышеуказанные значения, а  $R^4$  содержит  $-NH_2$  группу, с соответственно замещённым изоцианатом  $O=C=N-R^{15}$  или  $O=C=N-L^4-R^{16}$  (где  $R^{15}$ ,  $R^{16}$  и  $L^4$  принимают вышеуказанные значения) в инертном растворителе, таком как тетрагидрофуран, и при температуре близкой к комнатной.

В качестве другого примера взаимопревращения, соединения формулы (Ic), где  $T^1$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  и  $m$  принимают вышеуказанные значения, а  $R^4$  содержит  $-NH-C(=S)-NH-R^{15}$  или  $-NH-C(=S)-NH-L^4-R^{16}$  группу (где  $R^{15}$ ,  $R^{16}$  и  $L^4$  принимают вышеуказанные значения), могут быть получены по реакции соединений формулы (Ic), где  $T^1$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  и  $m$  принимают вышеуказанные значения, а  $R^4$  содержит  $-NH_2$  группу, с соответственно замещённым изотиоцианатом  $S=C=N-R^{15}$  или  $S=C=N-L^4-R^{16}$  (где  $R^{15}$ ,  $R^{16}$  и  $L^4$  принимают вышеуказанные значения), в инертном растворителе, таком как тетрагидрофуран, и при температуре порядка температуры перегонки.

В качестве другого примера взаимопревращения, соединения формулы (Ic), где  $T^1$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  и  $m$  принимают вышеуказанные значения, а  $R^4$  содержит  $-\text{CO}_2\text{H}$  группу, могут быть получены гидролизом соответствующих соединений формулы (Ic), где  $T^1$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  и  $m$  принимают вышеуказанные значения, а  $R^4$  содержит  $-\text{CO}_2\text{R}^{21}$  группу (где  $\text{R}^{21}$  является вышеуказанным). Гидролиз удобно осуществлять посредством щелочного гидролиза с применением основания, такого как гидроокись или карбонат щелочного металла, в присутствии смеси водно/органических растворителей с применением органических растворителей, таких как диоксан, тетрагидрофуран или метанол, при температуре приблизительно от температуры окружающей среды до температуры перегонки. Гидролиз также может быть осуществлен посредством кислотного гидролиза с применением неорганической кислоты, такой как соляная кислота, и в присутствии смеси водно/органических растворителей с применением органических растворителей, таких как диоксан или тетрагидрофуран, при температуре приблизительно от  $50^\circ\text{C}$  до  $80^\circ\text{C}$ .

В качестве другого примера взаимопревращения, соединения формулы (Ic), где  $T^1$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  и  $m$  принимают вышеуказанные значения, а  $R^4$  содержит  $-\text{C}(=\text{O})-\text{NY}^4\text{Y}^5$  группу (где  $\text{Y}^4$  и  $\text{Y}^5$  принимают вышеуказанные значения), могут быть получены по реакции соединений формулы (Ic), где  $T^1$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  и  $m$  принимают вышеуказанные значения, а  $R^4$  содержит  $-\text{CO}_2\text{H}$  группу, с соответственно замещённым амином формулы  $\text{HNY}^4\text{Y}^5$  (где  $\text{Y}^4$  и  $\text{Y}^5$

принимают вышеуказанные значения). Реакцию сочетания удобно проводить в присутствии 1-гидроксибензотриазола и карбодиимида, такого как 1-(3-диметиламинопропил)-3-этилкарбодимид, в инертном растворителе, таком как диметилформамид, и при температуре близкой к комнатной. Или же реакция может быть осуществлена первоначальной конверсией кислоты формулы (Ic), где  $R^4$  содержит  $-CO_2H$  группу, до соответствующего хлорангидрида (к примеру, по реакции с тионилхлоридом или оксалилхлоридом при комнатной температуре) с последующей обработкой соответственно замещённым амином формулы  $HNY^4Y^5$ .

В качестве другого примера взаимопревращения, соединения формулы (I), содержащие сульфоксидные мостики, могут быть получены окислением соответствующих соединений, содержащих  $-S-$  мостики. К примеру, окисление удобно осуществлять посредством реакции с надкислотой, к примеру, 3-хлорнадбензойной кислотой, предпочтительно в инертном растворителе, к примеру, дихлорметане, преимущественно при температуре, близкой к комнатной, или же иначе, через кислый пероксомоносульфат калия в среде, такой как водный метанол, доведенной буфером до pH 5, при температурах приблизительно от  $0^\circ C$  до комнатной температуры. Этот последний способ предпочтителен для соединений, содержащих неустойчивую к кислотам группу.

В качестве иного примера взаимопревращения, соединения формулы (Ic), где  $T^1$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  и  $n$  принимают вышеуказанные значения, а  $R^4$  содержит  $-N(R^{10})-SO_2-R^{15}$  или  $-N(R^{10})-SO_2-L^4-R^{16}$

группу (где  $R^{10}$ ,  $R^{15}$ ,  $R^{16}$  и  $L^4$  принимают вышеуказанные значения) могут быть получены из соответствующих соединений формулы (Ic), где  $T^1$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  и  $m$  принимают вышеуказанные значения, а  $R^4$  содержит  $-NH_2$  группу, обработкой соответственно замещённым хлорангидридом  $Cl-SO_2-R^{15}$  или  $Cl-SO_2-L^4-R^{16}$  (где  $R^{15}$ ,  $R^{16}$  и  $L^4$  принимают вышеуказанные значения), в присутствии пригодного основания, такого как триэтиламин, в инертном растворителе, таком как тетрагидрофуран, и при температуре близкой к комнатной.

В качестве другого примера взаимопревращения, соединения формулы (I), содержащие сульфоновые мостики, могут быть получены окислением соответствующих соединений, содержащих  $-S-$  или сульфоксидные мостики. К примеру, соединения формулы (Ib), где  $R^{18}$  обозначает  $-SO_2Me$ , удобно получать по реакции соединений формулы (Ib), где  $R^{18}$  обозначает  $-SMe$ , с надкислотой, к примеру, 3-хлорнадбензойной кислотой, предпочтительно в инертном растворителе, таком как дихлорметан, при температуре приблизительно от  $0^\circ C$  до комнатной температуры.

В качестве другого примера взаимопревращения, соединения формулы (Ib), где  $R^4$  и  $R^5$  принимают вышеуказанные значения, а  $R^{18}$  обозначает  $-NY^4Y^5$  группу (где  $Y^4$ , обозначает водород, а  $Y^5$  является указанным выше) могут быть получены по реакции соединений формулы (Ib), где  $R^{18}$  обозначает  $-SO_2Me$  группу, с соответственно замещённым амином формулы  $Y^5NH_2$  (где  $Y^5$  принимает вышеуказанные значения). Реакцию удобно

проводить в инертном растворителе, таком как диметил-формамид, при температуре порядка 100°C. Когда Y<sup>5</sup> обозначает водород, реакцию удобно проводить в запаянном сосуде. Когда Y<sup>5</sup> обозначает арил, к примеру, фенил, реакцию удобно проводить с литио-анионом амина.

В качестве другого примера взаимопревращения, соединения формулы (Ib), где R<sup>4</sup> и R<sup>5</sup> принимают вышеуказанные значения, а R<sup>18</sup> обозначает -OR<sup>17</sup> группу (где R<sup>17</sup> является указанным выше) могут быть получены по реакции соединений формулы (Ib), где R<sup>18</sup> обозначает -SO<sub>2</sub>Me группу, с соответственно замещённым спиртом формулы R<sup>17</sup>OH (где R<sup>17</sup> принимает вышеуказанные значения). Реакцию удобно проводить в присутствии гидрида щелочного металла, такого как гидрид натрия, в смеси инертных растворителей, к примеру, тетрагидрофурана и диметилформамида, и при температуре близкой к комнатной.

Следует учитывать, что соединения по изобретению могут содержать асимметрические центры. Эти асимметрические центры могут независимо быть R или S конфигурации. Для специалистов в соответствующей области, очевидно, что некоторые соединения по изобретению могут также обладать геометрической изомерией. Понятно, что настоящее изобретение включает отдельные геометрические изомеры и стереоизомеры соединений вышеуказанной формулы (I), и их смеси, включая рацемические смеси. Такие изомеры могут быть выделены из их смесей применением или адаптацией известных способов, к примеру,

хроматографическими способами и способами перекристаллизации, или их получают отдельно из соответствующих изомеров их промежуточных соединений. Вдобавок, в ситуациях, когда возможны таутомеры соединений формулы (I), подразумевается, что настоящее изобретение включает все таутомерные формы соединений.

Согласно ещё одной отличительной особенности изобретения, кислотные аддитивные соли соединений по изобретению могут быть получены по реакции свободного основания с соответствующей кислотой с применением или адаптацией известных способов. К примеру, кислотные аддитивные соли соединений по данному изобретению могут быть получены либо растворением свободного основания в воде или водном спиртовом растворе, или в других пригодных растворителях, содержащих соответствующую кислоту, и выделением соли путём упаривания раствора, либо по реакции свободного основания и кислоты в органическом растворителе, таком как тетрагидрофуран, в этом случае соли разделяют непосредственно или они могут быть получены при концентрации раствора.

Соединения по изобретению могут быть восстановлены из их кислотных аддитивных солей с применением или адаптацией известных способов. К примеру, исходные соединения по изобретению могут быть восстановлены из их кислотных аддитивных солей при обработке щёлочью, к примеру, водным раствором бикарбоната натрия или водным раствором аммиака.

Согласно ещё одной отличительной особенности изобре-

ния, основные аддитивные соли соединений по изобретению могут быть получены по реакции свободной кислоты с соответствующим основанием с применением или адаптацией известных способов. К примеру, основные аддитивные соли соединений по данному изобретению могут быть получены либо растворением свободной кислоты в воде или водном спиртовом растворе, или в других пригодных растворителях, содержащих соответствующее основание, и выделением соли путём упаривания раствора, либо по реакции свободной кислоты и основания в органическом растворителе, в этом случае соли разделяют непосредственно или они могут быть получены при концентрации раствора.

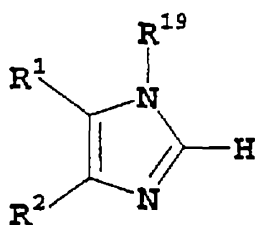
Соединения по изобретению могут быть восстановлены из их основных аддитивных солей с применением или адаптацией известных способов. К примеру, исходные соединения по изобретению могут быть восстановлены из их основных аддитивных солей при обработке кислотой, к примеру, соляной кислотой.

Соединения по настоящему изобретению удобно получать, либо они образуются при получении по способу изобретения, в виде сольватов (к примеру, гидратов). Гидраты соединений по данному изобретению удобно получать перекристаллизацией из воды.

Исходные вещества и промежуточные соединения могут быть получены применением или адаптацией известных способов, к примеру, способами, описанными в ссылочных примерах или по их очевидным химическим эквивалентам.

Промежуточные соединения формулы (II), где  $R^1$  и  $R^2$  принимают вышеуказанные значения,  $R^{19}$  обозначает 2-триметилсиланил-этоксиметил- группу, а  $R^{20}$  обозначает  $-\text{CH}(\text{OMe})_2$ , могут быть получены реакцией соединений формулы (II), где  $R^1$  и  $R^2$  принимают вышеуказанные значения,  $R^{19}$  обозначает 2-триметилсиланил-этоксиметил- группу, а  $R^{20}$  обозначает  $-\text{CHO}$ , с триметилортоформиатом в присутствии кислотного катализатора, такого как 4-толуолсульфокислота, в метаноле при температуре перегонки.

Промежуточные соединения формулы (II), где  $R^1$  и  $R^2$  принимают вышеуказанные значения,  $R^{19}$  обозначает 2-триметилсиланил-этоксиметил- группу, а  $R^{20}$  обозначает  $-\text{CHO}$ , могут быть получены реакцией соединений формулы (1):

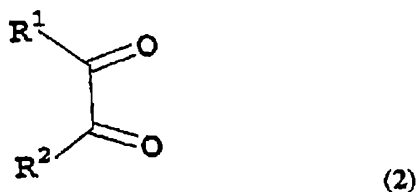


(1)

где  $R^1$  и  $R^2$  принимают вышеуказанные значения,  $R^{19}$  обозначает 2-триметилсиланил-этоксиметил- группу, с алкиллитием, таким как бутиллитий или литий-диизопропиламид, в инертном растворителе, таком как тетрагидрофуран, при температуре порядка  $-78^\circ\text{C}$ , и последующей реакцией с N-формилморфолином.

Промежуточные соединения формулы (II), где  $R^1$  и  $R^2$  принимают вышеуказанные значения,  $R^{19}$  обозначает водород, а  $R^{20}$

обозначает  $-\text{CH}(\text{OMe})_2$ , могут быть получены реакцией соединений формулы (2):



где  $\text{R}^1$  и  $\text{R}^2$  принимают вышеуказанные значения, с глиоксаль-1,1-диметилацеталем и ацетатом аммония. Реакцию удобно проводить в смеси инертных растворителей, таких как трет-бутил-метилвый эфир и метанол, и при температуре близкой к комнатной.

Промежуточные соединения формулы (II), где  $\text{R}^1$ ,  $\text{R}^2$  принимают вышеуказанные значения,  $\text{R}^{19}$  обозначает  $-\text{L}^1-\text{R}^7$  или  $-\text{L}^2-\text{R}^8$  группу (где  $\text{R}^7$ ,  $\text{L}^1$  и  $\text{L}^2$  принимают вышеуказанные значения, а  $\text{R}^8$  обозначает арил, циклоалкенил, циклоалкил, гетероарил, гетероциклоалкил) и  $\text{R}^{20}$  обозначает  $-\text{CHO}$ , могут так же быть получены реакцией соединений формулы (1), где  $\text{R}^1$ ,  $\text{R}^2$  и  $\text{R}^{19}$  принимают вышеуказанные значения, с бутиллитием и последующей реакцией с N-формилморфолином.

Промежуточные соединения формулы (III), где  $\text{R}^4$  обозначает азидометил- группу,  $\text{R}^5$  обозначает метильную группу,  $\text{R}^6$  обозначает водород, а  $m$  равен 1, и где оба заместителя,  $\text{R}^4$  и  $\text{R}^5$ , присоединены в положение 2, могут быть получены по реакции 5-азидометил-2,5-диметил-1,3-диоксана (полученного по методике из J.Org.Chem., 1992, 57, page 6080) с

неорганической кислотой, к примеру, соляной кислотой, в смеси водного и органического растворителей, таких как тетрагидрофуран и вода, при температуре перегонки.

Промежуточные 1,3-пропандиолы формулы (III), где  $R^4$  обозначает  $-NHC(=O)CF_3$  группу,  $R^5$  обозначает метильную группу,  $R^6$  обозначает водород, а  $m$  равен 1, и где оба заместителя,  $R^4$  и  $R^5$ , присоединены в положение 2, могут быть получены по реакции 2-амино-2-метил-1,3-пропандиола с трифторуксусной кислотой в присутствии основания, такого как карбонат калия, в инертном растворителе, таком как диметилформамид, при температуре близкой к комнатной.

Промежуточные 1,3-пропандиолы формулы (III), где  $R^4$  обозначает  $-C(=O)-NY^4Y^5$  группу (в которой  $Y^4$  и  $Y^5$  принимают вышеуказанные значения),  $R^5$  обозначает метильную группу,  $R^6$  обозначает водород, а  $m$  равен 1, и где оба заместителя,  $R^4$  и  $R^5$ , присоединены в положение 2, могут быть получены по реакции 2-карбокси-2-метил-1,3-пропандиола с амином формулы  $HNY^4Y^5$ , где  $Y^4$  и  $Y^5$  принимают вышеуказанные значения. Реакцию сочетания удобно проводить с карбодиимидом, таким как дициклогексилкарбодиимид, в присутствии 1-гидроксибензотриазола и диизопропилэтиламина, в инертном растворителе, таком как ацетонитрил, и при температуре приблизительно от комнатной до  $55^\circ C$ . Для реакции могут быть использованы другие стандартные методики пептидного присоединения, такие как описаны выше.

Смола формулы Смола С, где  $R^3$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  и  $m$  принимают вы-

вышеуказанные значения, а  $R^4$  содержит  $-C(=O)-NY^4Y^5$  группу, могут быть получены из соответствующей смолы С, где  $R^3$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  и  $m$  принимают вышеуказанные значения, а  $R^4$  содержит  $-C(=O)-OR^{21}$  группу (где  $R^{21}$  обозначает алкил, арил или арилалкил) путём: (i) обработки гидроокисью щелочного металла, такой как гидроокись натрия, в смеси воды со смешиваемым с водой инертным органическим растворителем, таким как тетрагидрофуран, и при температуре приблизительно от комнатной до  $70^\circ C$ ; (ii) обработки полученной смолы, где  $R^4$  содержит  $-C(=O)-OH$  группу, раствором оксалилхлорида в инертном растворителе, таком как дихлорметан, при температуре близкой к комнатной; (iii) обработки полученной смолы, где  $R^4$  содержит  $-C(=O)-Cl$  группу, амином формулы  $HN Y^4 Y^5$  в инертном растворителе, таком как дихлорметан, при температуре близкой к комнатной.

Смолы формулы **Смола С**, где  $R^3$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  и  $m$  принимают вышеуказанные значения, а  $R^4$  содержит  $-N(R^{10})-C(=O)-R^{15}$  или  $-N(R^{10})-C(=O)-L^4-R^{16}$  группу (где  $R^{10}$ ,  $R^{15}$ ,  $R^{16}$  и  $L^4$  принимают вышеуказанные значения) могут быть получены из соответствующей смолы С, где  $R^3$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  и  $m$  принимают вышеуказанные значения, а  $R^4$  содержит  $-NH_2$  группу, путём обработки соответственно замещённым хлорангидридом  $Cl-C(=O)-R^{15}$  или  $Cl-C(=O)-L^4-R^{16}$  (где  $R^{15}$ ,  $R^{16}$  и  $L^4$  принимают вышеуказанные значения) в присутствии триэтиламина в инертном растворителе, таком как тетрагидрофуран, и при температуре близкой к комнатной.

Смолы формулы **Смола С**, где  $R^3$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  и  $m$  принимают вышеуказанные значения, а  $R^4$  содержит  $-N(R^{10})-SO_2-R^{15}$  или  $-N(R^{10})-SO_2-L^4-R^{16}$  группу (где  $R^{10}$ ,  $R^{15}$ ,  $R^{16}$  и  $L^4$  принимают вышеуказанные значения), могут быть получены из соответствующей смолы С, где  $R^3$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  и  $m$  принимают вышеуказанные значения, а  $R^4$  содержит  $-NH_2$  группу, обработкой соответственно замещённым хлорангидридом  $Cl-SO_2-R^{15}$  или  $Cl-SO_2-L^4-R^{16}$  (где  $R^{15}$ ,  $R^{16}$  и  $L^4$  принимают вышеуказанные значения), в присутствии триэтиламина, в инертном растворителе, таком как тетрагидрофуран, и при температуре близкой к комнатной.

Соединения формулы (1), где  $R^1$  и  $R^2$  принимают вышеуказанные значения,  $R^{19}$  обозначает 2-триметилсиланил-этоксиметил- группу, могут быть получены по реакции соединений формулы (1), где  $R^1$  и  $R^2$  принимают вышеуказанные значения,  $R^{19}$  обозначает атом водорода, с 2-(триметилсилил)этоксиметилхлоридом в присутствии гидроксида натрия, в инертном растворителе, таком как диметилформамид, и при температуре близкой к комнатной.

Соединения формулы (1), где  $R^1$  и  $R^2$  принимают вышеуказанные значения,  $R^{19}$  обозначает группу  $-L^1-R^7$  (где  $L^1$  и  $R^7$  принимают вышеуказанные значения) или  $-L^2-R^8$  (где  $L^2$  принимает вышеуказанные значения, а  $R^8$  обозначает арил, циклоалкенил, циклоалкил, гетероарил, гетероциклоалкил), могут так же быть получены по реакции соединений формулы (1), где  $R^1$  и  $R^2$  принимают вышеуказанные значения,  $R^{19}$

обозначает атом водорода, с алкилгалогенидом формулы (V) или (VI) соответственно, в присутствии гидрида натрия.

Соединения формулы (1), где  $R^1$  и  $R^2$  принимают вышеуказанные значения,  $R^{19}$  обозначает атом водорода, могут быть получены применением или адаптацией известных в литературе способов, к примеру, Boehm et. al., J.Med.Chem., 1996, 39, page 3829.

Промежуточные соединения формул (II), (III), (IV), смола С и смола D являются новыми соединениями и, как таковые, они сами, и описанные здесь способы их получения, составляют дополнительные отличительные особенности настоящего изобретения.

Настоящее изобретение дополнительно раскрывается, но не ограничивается, последующими иллюстративными примерами и ссылочными примерами.

#### Пример 1

##### Соединения А, В и С

Раствор 4-[5(4)-(4-фтор-фенил)-2-формил-1-[(2-(триметилсилил)этокси)метил]-1H-имидазол-4(5)-ил]-пиридина (1,1 г, ссылочный пример 1), 1,1,1-трис(гидроксиметил)-этана (1,66 г) и пиридиний-4-толуолсульфоната (0,13 г) в сухом толуоле (20 мл) осторожно нагревают до температуры кипения с обратным холодильником в течение 20 часов с азеотропным удалением воды. После охлаждения до комнатной температуры реакционную смесь обрабатывают этилацетатом (100 мл), затем

трижды промывают водой (20 мл), после чего сушат над сульфатом магния и затем упаривают. Оставшееся масло подвергают флэш хроматографии на силикагеле, элюируя смесью дихлорметана и метанола (24:1, в отношении объёмов), что даёт {2-[5-(4-фтор-фенил)-4-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, цис-изомер, (соединение А) в виде белого твёрдого вещества, т.пл. 270-272°C. [Элементный анализ: С, 64,22; Н, 5,71; N, 10,81; F, 4,91 %. Рассчитано для  $C_{20}H_{20}FN_3O_3 \cdot H_2O$ : С, 64,67; Н, 5,97; N, 11,31; F, 5,11 %]; и {2-[5-(4-фтор-фенил)-4-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, транс-изомер, (соединение В) в виде желтовато-коричневого твёрдого вещества, т.пл. 250-255°C. [Элементный анализ: С, 64,22; Н, 5,71; N, 10,81; F, 4,91 %. Рассчитано: С, 65,03; Н, 5,46; N, 11,38; F, 5,14 %].

Проводя реакцию аналогичным способом, но используя 2,2-диметил-1,3-пропандиол, получают 4-[2-(5,5-диметил)-[1,3]диоксан-2-ил]-5-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-4-ил]-пиридин, (соединение С) в виде твёрдого вещества кремового цвета; т.пл. 248-249°C (с разложением). [Элементный анализ: С, 66,75; Н, 5,74; N, 11,42 %. Рассчитано для  $C_{20}H_{20}FN_3O_2 \cdot 0,5H_2O$ : С, 66,28; Н, 5,84; N, 11,59 %].

#### Пример 2

##### Соединение D

Раствор 4-[2-(5-азидометил-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-4-ил]-пиридина, цис- и транс-изомеров [1,56 г, соединение Н] в метаноле (100 мл)

обрабатывают формиатом аммония (1 г), затем 10% палладием на активированном угле (0,15 г). После перемешивания в течение 3,5 часов реакционную смесь фильтруют через диатомовую землю, затем упаривают. Оставшийся оранжевый твёрдый продукт подвергают флэш хроматографии на силикагеле, элюируя смесью дихлорметана, пентана, метанола и концентрированного аммиака (55:25:18:2, в отношении объёмов), что даёт С-[5-метил-2-{5-(4-фтор-фенил)-4-пиридин-4-ил-1Н-имидазол-2-ил}-[1,3]диоксан-5-ил]-метиламин, цис- и транс-изомеры, (соединение D); (0,68 г) в виде жёлтого твёрдого вещества.

### Пример 3

#### Соединения E-Z

Перемешиваемый раствор 4-[2-диметоксиметил-5(4)-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-4(5)-ил]-пиридина (5,75 г, ссылочный пример 3) и 2-метил-2-трифторацетамидо-1,3-пропандиола (7,38 г, ссылочный пример 4) и 4-толуолсульфоислоты (8,03 г) в сухом тетрагидрофуране (200 мл) нагревают до температуры кипения с обратным холодильником в течение 6 часов. После охлаждения смесь оставляют при комнатной температуре на 4 дня, затем распределяют между этилацетатом и насыщенным раствором бикарбоната натрия. Органическую фазу дважды промывают водой (100 мл), затем рассолом (100 мл), после чего сушат над сульфатом магния и затем упаривают, что даёт 2,2,2-трифтор-N-[5-метил-2-{5-(4-фтор-фенил)-4-пиридин-4-ил-1Н-имидазол-2-ил}-[1,3]диоксан-5-ил]-ацетамид, цис- и транс- изомеры, (соединение E). Остаток подвергают флэш

хроматографии на силикагеле, элюируя смесью дихлорметана и метанола (95:5, в отношении объемов), что даёт: 2,2,2-трифтор-N-[5-метил-2-(5-(4-фтор-фенил)-4-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил)-[1,3]диоксан-5-ил]-ацетамид, цис-изомер, (соединение F);  $MH^+$  451; и 2,2,2-трифтор-N-[5-метил-2-(5-(4-фтор-фенил)-4-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил)-[1,3]диоксан-5-ил]-ацетамид, транс-изомер, (соединение G).  $MH^+$  451.

Проводя реакцию аналогичным способом, но используя 2-азидометил-2-метил-1,3-пропандиол (ссылочный пример 5), получают 4-[2-(5-азидометил-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-4-ил]-пиридин, цис- и транс-изомеры, (соединение H) в виде белого твёрдого вещества.

Проводя реакцию аналогичным способом, но используя 2-бензил-1,3-пропандиол и подвергая сырой продукт препаративной тонкослойной хроматографии на силикагеле, элюируя смесью дихлорметана и метанола (9:1, в отношении объемов), получают 4-[2-(5-бензил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-4-ил]-пиридин, цис- и транс-изомеры, (соединение I).  $R_f$  0,46 при использовании смеси дихлорметана и метанола (9:1, в отношении объемов).  $MH^+$  416.

Проводя реакцию аналогичным способом, но используя метил-2,2-бис(гидроксиметил)пропионат и подвергая сырой продукт препаративной тонкослойной хроматографии на силикагеле, элюируя смесью дихлорметана и метанола (9:1, в отношении объемов), получают метиловый эфир 2-[5-(4-фтор-фенил)-4-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диок-

сан-5-карбоновой кислоты, цис- и транс- изомеры, (соединение J).  $R_F$  0,71 при использовании смеси дихлорметана и метанола (9:1, в отношении объёмов).  $MN^+$  398.

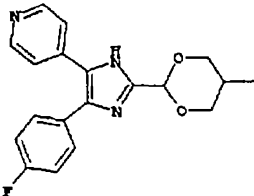

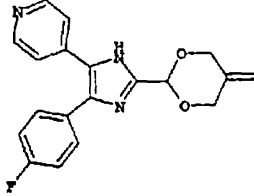

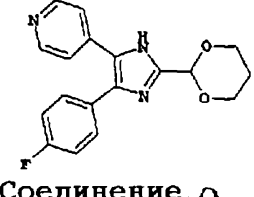

Проводя реакцию аналогичным способом, но используя 2,2-бис(гидроксиметил)тетрагидропиран, проводя реакцию в диметилформамиде при 50°C и подвергая сырой продукт препаративной тонкослойной хроматографии на силикагеле, дважды элюируя смесью дихлорметана и метанола (19:1, в отношении объёмов), получают 4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(1,8,10-триокса-спиро[5,5]ундец-9-ил)-1H-имидазол-4-ил]-пиридин, (соединение K), в виде смеси изомеров.  $R_F$  0,45 и 0,48 при использовании смеси дихлорметана и метанола (19:1, в отношении объёмов) в качестве элюента.  $MN^+$  396.

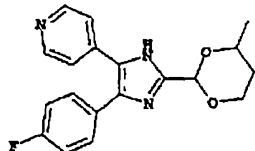

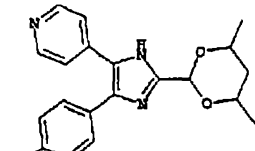

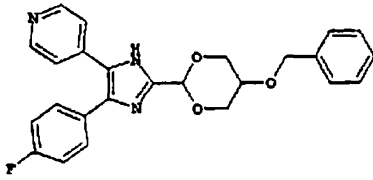
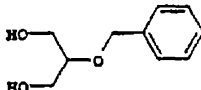
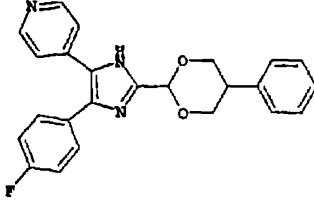
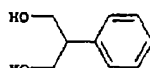
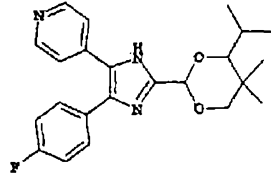
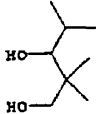
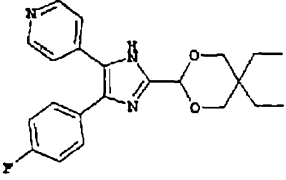

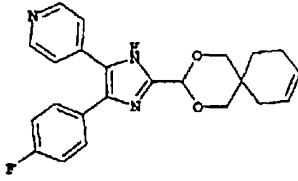

Проводя реакцию аналогичным способом, но используя 2,2-бис(гидроксиметил)тетрагидрофуран, проводя реакцию в диметилформамиде при 50°C и подвергая сырой продукт препаративной тонкослойной хроматографии на силикагеле, дважды элюируя смесью дихлорметана и метанола (19:1, в отношении объёмов), получают 4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(1,7,9-триокса-спиро[4,5]дец-8-ил)-1H-имидазол-4-ил]-пиридин, (соединение L), в виде смеси изомеров.  $R_F$  0,39 и 0,45 при использовании смеси дихлорметана и метанола (19:1, в отношении объёмов) в качестве элюента.  $MN^+$  382.

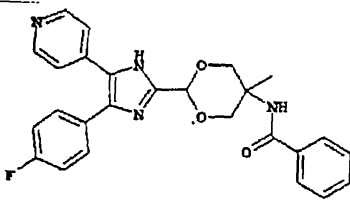
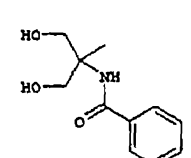
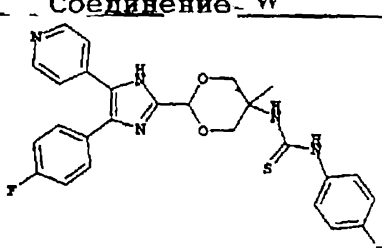
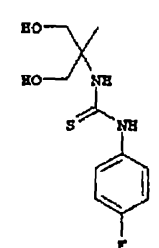
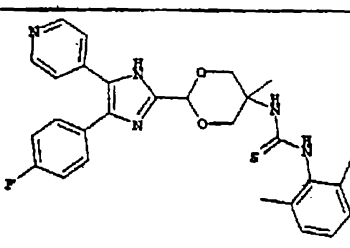
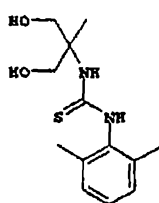
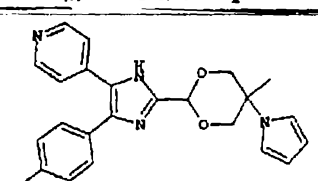
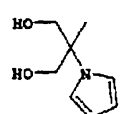
Проводя реакцию аналогичным способом, но используя соответственно замещённые 1,3-пропандиолы, проводя реакцию в дихлорметане при комнатной температуре в течение 3 дней и

подвергая сырой продукт препаративной тонкослойной хроматографии на силикагеле, получают соединения М-Z, изображенные в таблице 1. Для соединений М-V и соединения Z элюентом является смесь дихлорметана и метанола (9:1, в отношении объемов); для соединения W используемым элюентом является этилацетат и затем смесь дихлорметана и метанола (14:1, в отношении объемов); а для соединений X-Y используемым элюентом является смесь дихлорметана и метанола (14:1, в отношении объемов).

Таблица 1

Структура и номер соединения	Используемый в реакции замещенный 1,3-пропандиол	R <sub>f</sub>	Молекуляр-формула	MH <sup>+</sup> (интенсивность) (MS-ESI)
 Соединение М		0.41	C <sub>19</sub> H <sub>18</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	340 (100%)
 Соединение N		0.40	C <sub>19</sub> H <sub>16</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	338 (100%)
 Соединение O		0.37	C <sub>18</sub> H <sub>16</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	326 (100%)

 <p>Соединение P</p>		0.40	C19H18FN3O2	340 (100%)
 <p>Соединение Q</p>		0.44	C20H20FN3O2	354 (50%) 169 (100%)
 <p>Соединение R</p>		0.47 & 0.31	C25H22FN3O3	432 (100%)
 <p>Соединение S</p>		0.20 & 0.18	C24H20FN3O2	402 (100%)
 <p>Соединение T</p>		0.43	C23H26FN3O2	396 (100%)
 <p>Соединение U</p>		0.30	C22H24FN3O2	382 (100%)
 <p>Соединение V</p>		0.30	C23H22FN3O2	392 (100%)

 Соединение W		0.14	C <sub>26</sub> H <sub>23</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	459 (100%)
 Соединение X		0.20	C <sub>26</sub> H <sub>23</sub> F <sub>2</sub> N <sub>5</sub> O <sub>2</sub> S	508 (100%)
 Соединение Y		0.25 & 0.18	C <sub>28</sub> H <sub>28</sub> FN <sub>5</sub> O <sub>2</sub> S	518 (100%)
 Соединение Z		0.31	C <sub>23</sub> H <sub>21</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	405 (100%)

Пример 4

Соединения AA и AB

Раствор 2,2,2-трифтор-N-[5-метил-2-{5-(4-фтор-фенил)-4-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил}-[1,3]диоксан-5-илметил]-

ацетамида, транс- изомера [1,04 г, соединение AC] и карбоната калия (1,55 г) в метаноле (150 мл) нагревают до температуры кипения с обратным холодильником в течение 24 часов. После охлаждения до комнатной температуры смесь распределяют между этилацетатом и водой. Водный слой обрабатывают хлористым натрием и трижды экстрагируют этилацетатом (50 мл). Объединённые органические фазы упаривают. Оставшееся масло подвергают флэш хроматографии на силикагеле, элюируя смесью дихлорметана, пентана, метанола и концентрированного аммиака (55:25:18:2, в отношении объёмов), что даёт C-[5-метил-2-{5-(4-фтор-фенил)-4-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил}-[1,3]диоксан-5-ил]-метиламин, транс-изомер, (0,51 г, соединение AA). МН<sup>+</sup> 369.

Проводя реакцию аналогичным способом, но используя 2,2,2-трифтор-N-[5-метил-2-{5-(4-фтор-фенил)-4-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил}-[1,3]диоксан-5-илметил]-ацетамид, цис-изомер, [соединение AD] получают C-[5-метил-2-{5-(4-фтор-фенил)-4-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил}-[1,3]диоксан-5-ил]-метиламин, цис-изомер, (соединение AB). МН<sup>+</sup> 369.

#### Пример 5

#### Соединения AC и AD

Суспензию C-[5-метил-2-{5-(4-фтор-фенил)-4-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил}-[1,3]диоксан-5-ил]-метиламина, (0,68 г, цис- и транс-изомеры, соединение D) в дихлорметане (35 мл) обрабатывают триэтиламинем (0,72 мл), затем трифторуксусным ангидридом (0,72 мл). После перемешивания при комнатной

температуре в течение 4,5 часов реакционную смесь распределяют между этилацетатом и водой. Органическую фазу промывают водой, затем рассолом, после чего сушат над сульфатом магния и затем упаривают. Остаток подвергают флэш хроматографии на силикагеле, элюируя смесью этилацетата и метанола (9:1, в отношении объемов), что даёт 2,2,2-трифтор-N-[5-метил-2-{5-(4-фтор-фенил)-4-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил}-[1,3]диоксан-5-илметил]-ацетамид, цис- и транс- изомеры. Смесь подвергают препаративной ЖХВР, используя метанол и воду 40/60-5/95 в отношении объемов за период 20 минут, получая 2,2,2-трифтор-N-[5-метил-2-{5-(4-фтор-фенил)-4-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил}-[1,3]диоксан-5-илметил]-ацетамид, транс- изомер, (0,75 г, соединение AC,  $R_T=11,99$ ) и 2,2,2-трифтор-N-[5-метил-2-{5-(4-фтор-фенил)-4-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил}-[1,3]диоксан-5-илметил]-ацетамид, цис-изомер, (0,3 г, соединение AD,  $R_T=10,8$ ).

#### Пример 6

##### Соединения AE, AF и AG

Перемешиваемый раствор 2,2,2-трифтор-N-[5-метил-2-{5-(4-фтор-фенил)-4-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил}-[1,3]диоксан-5-ил]-ацетамида, цис- изомера, (1,75 г, соединение F) и карбоната калия (1,07 г) в смеси метанола (200 мл) и воды (5 мл) нагревают до температуры кипения с обратным холодильником в течение 8 часов. После охлаждения до комнатной температуры смесь упаривают и подвергают азеотропной перегонке с толуолом. Остаток обрабатывают двуокисью кремния

и фильтруют через слой двуокиси кремния, промывая смесью дихлорметана и метанола (4:1, в отношении объёмов), что даёт 5-метил-2-{5-(4-фтор-фенил)-4-пиридин-4-ил-1Н-имидазол-2-ил}-[1,3]диоксан-5-иламин, цис-изомер, (1,3 г, соединение АЕ) в виде жёлтого твёрдого вещества.

Проводя реакцию аналогичным способом, но используя соединение G, получают 5-метил-2-{5-(4-фтор-фенил)-4-пиридин-4-ил-1Н-имидазол-2-ил}-[1,3]диоксан-5-иламин, транс-изомер, (соединение АF).

Проводя реакцию аналогичным способом, но используя соединение E, получают 5-метил-2-{5-(4-фтор-фенил)-4-пиридин-4-ил-1Н-имидазол-2-ил}-[1,3]диоксан-5-иламин, цис- и транс- изомеры, (соединение АG).

Пример 7

#### Соединения АН и АI

Раствор метилового эфира 2-[5-(4-фтор-фенил)-4-пиридин-4-ил-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, цис- и транс- изомеров, (0,34 г, соединение J) в метаноле (15 мл) обрабатывают водным раствором гидроокиси натрия (1,71 мл, 1 н), затем нагревают до температуры кипения с обратным холодильником в течение 7 часов. После охлаждения до комнатной реакцию смесь упаривают. Оставшийся порошок кремового цвета растворяют в метаноле (10 мл) и раствор подкисливают до pH 5-6, добавляя ледяную уксусную кислоту. Образовавшийся белый осадок фильтруют и промывают пентаном, получая 2-[5-(4-фтор-фенил)-4-пиридин-4-ил-1Н-

имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновую кислоту, транс-изомер, (0,11 г, соединение АН).  $R_F$  0,15 ( $CH_2Cl_2/CH_3OH$ , 9:1, проявлено пять раз),  $MN^+$  384. Фильтрат плюс промывные воды абсорбируют двуокисью кремния и подвергают флэш хроматографии на двуокиси кремния, элюируя смесью дихлорметана и метанола (9:1, в отношении объёмов), что даёт 2-[5-(4-фтор-фенил)-4-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновую кислоту, цис-изомер, (0,14 г, соединение AI) в виде белого твёрдого вещества.  $R_F$  0,25 ( $CH_2Cl_2/CH_3OH$ , 9:1, проявлено пять раз),  $MN^+$  384.

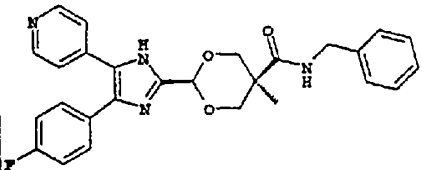
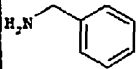
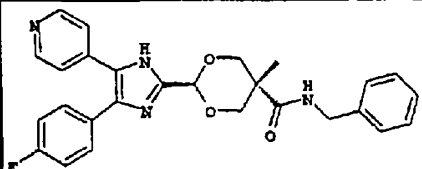
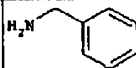
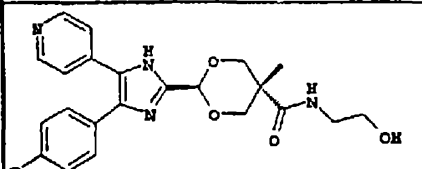
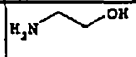
#### Пример 8

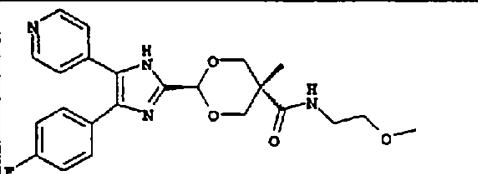
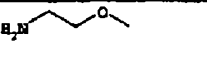
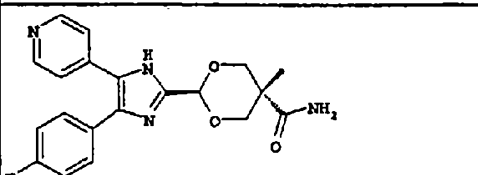
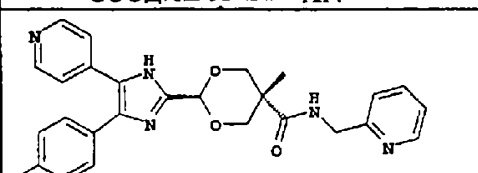
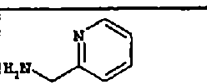
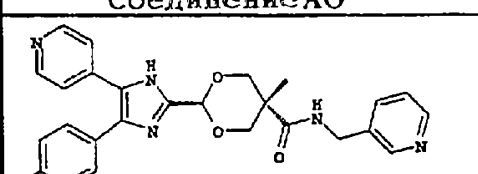
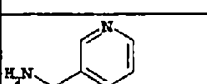
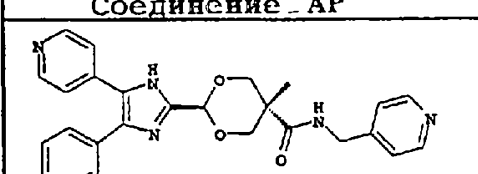
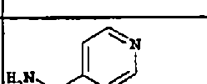
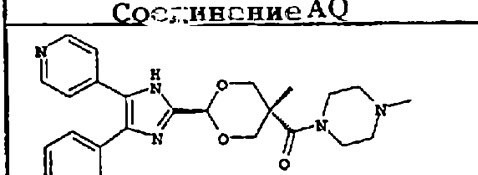
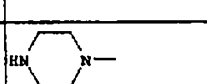
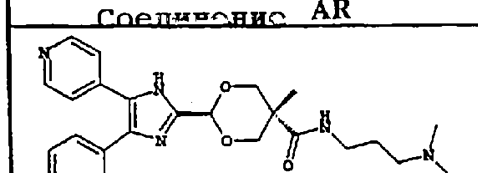
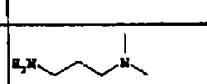
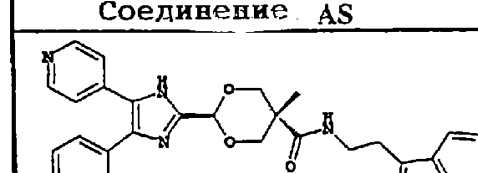

##### Соединения AJ-CO и FS-GD

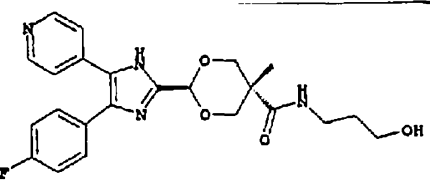

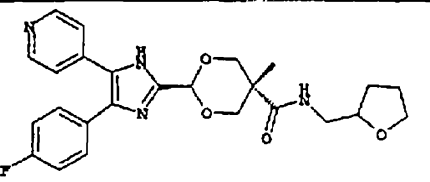
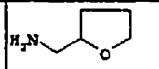
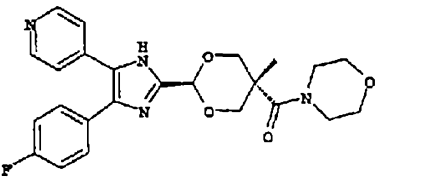
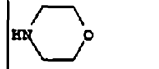
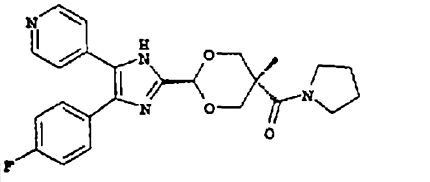

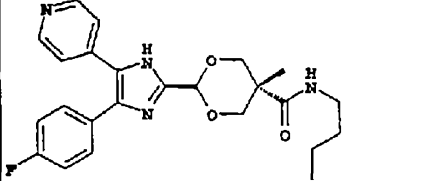
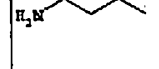
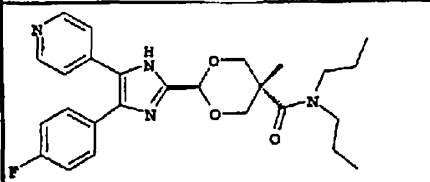

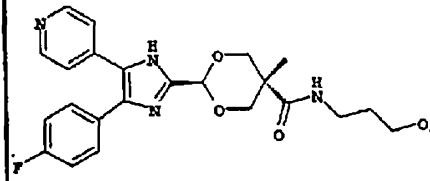
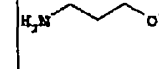
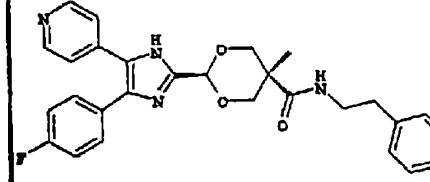
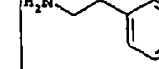
Раствор 2-[5-(4-фтор-фенил)-4-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, цис- или транс- изомера, (1 эквивалент, соединение АН или AI), соответственно замещённого амина формулы  $HN Y^4 Y^5$  [1,1 эквивалента, см. таблицу 2], 1-(3-диметиламино-пропил)-3-этилкарбодиимида [1,1 эквивалента], 1-гидроксibenзотриазол-гидрата [1,1 эквивалента] и N,N-диизопропилэтиламина [3 эквивалента] в сухом диметилформамиде перемешивают при комнатной температуре в течение 18 часов. Реакционную смесь упаривают и остаток распределяют между этилацетатом и водой. Органическую фазу промывают рассолом, затем упаривают, получая соединения AJ-CO и FS-GD, изображённые в таблице 2 (соединение FV получают последующим щелочным гидролизом промежуточного сложного эфира). Приведенные значения  $R_F$  определены при

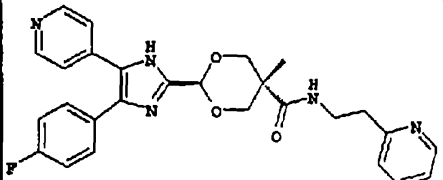
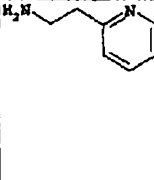
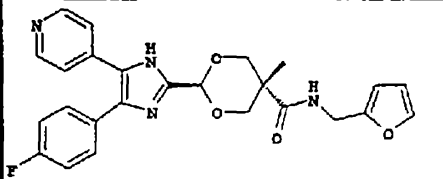
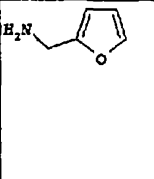
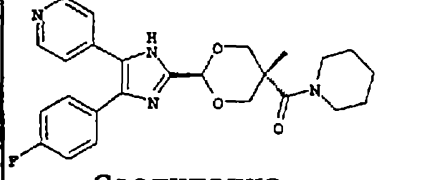
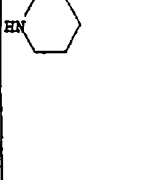
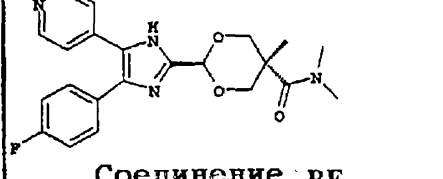
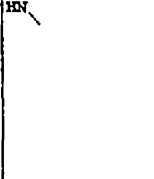
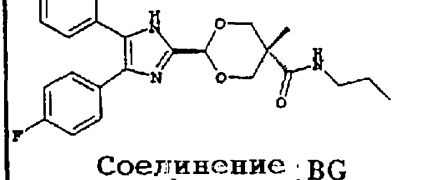
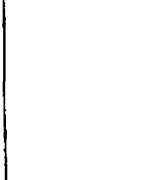
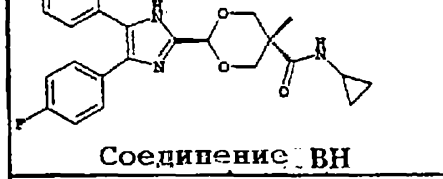

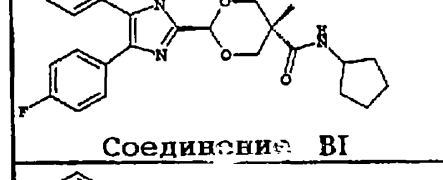
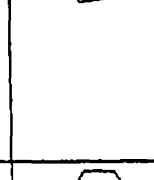
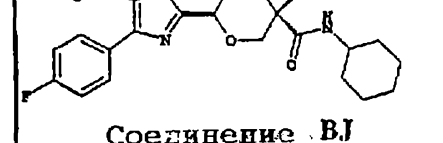

использовании смеси дихлорметана и метанола (9:1, в отношении объёмов) в качестве элюента [\* в одном случае использована смесь этилацетата и метанола (9:1, в отношении объёмов)] .

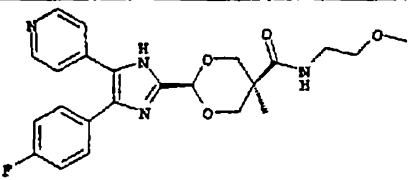

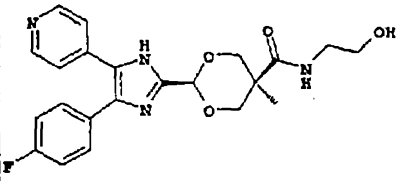
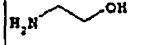
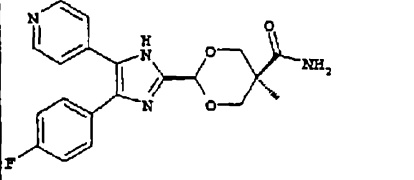
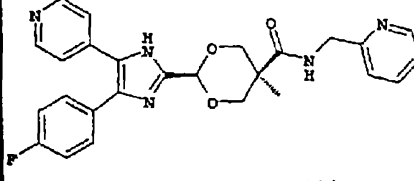
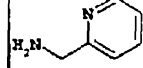
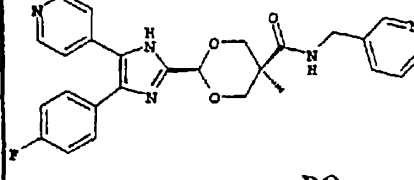
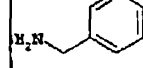
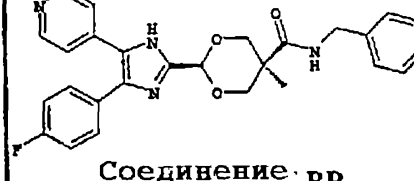
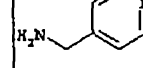
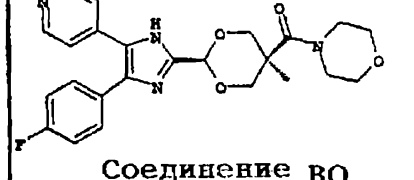

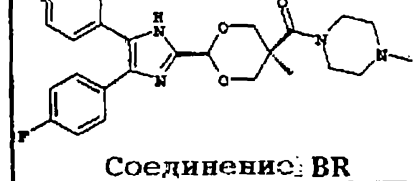

Таблица 2

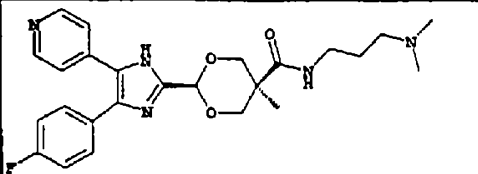
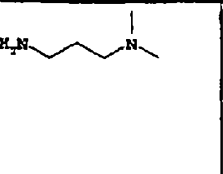
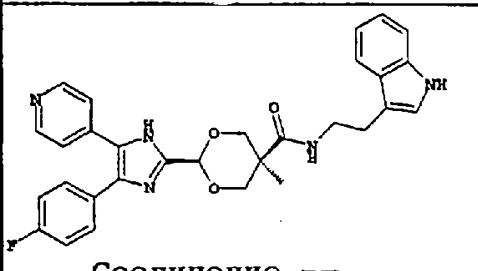
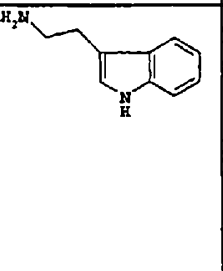
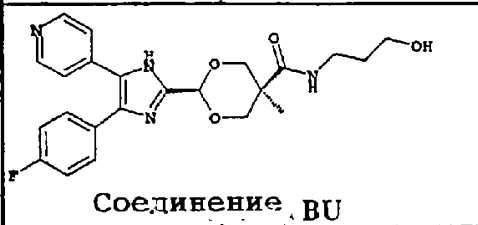
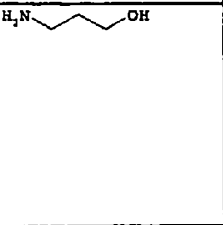

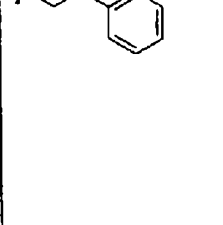
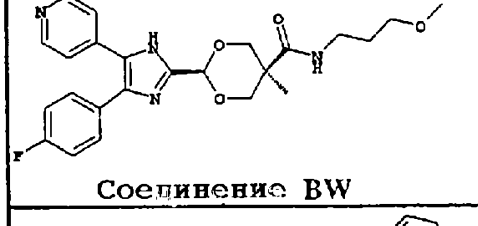
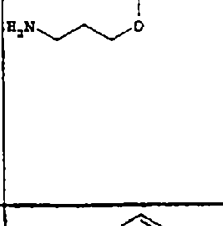
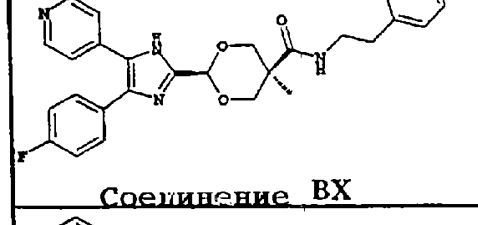
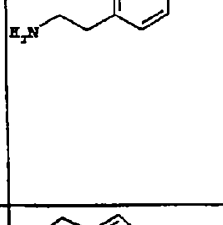
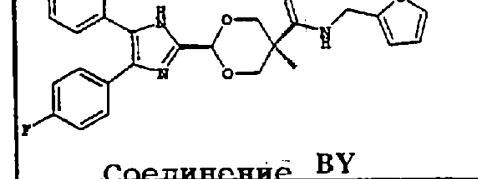
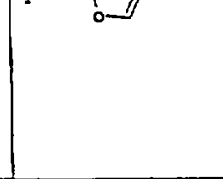
Структура и номер соединения	HNy4y5	R <sub>F</sub>	Молекулярная формула	MH <sup>+</sup> интенсивность)
 Соединение AJ		0.33	C <sub>27</sub> H <sub>25</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	473 (70%)  418 (100%)
 Соединение AK		0.35	C <sub>27</sub> H <sub>25</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	473 (20%)  418 (100%)
 Соединение AL		0.13	C <sub>22</sub> H <sub>23</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>4</sub>	427 (100%)

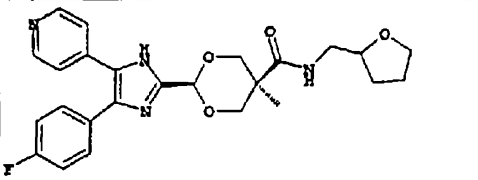
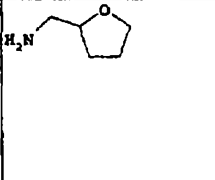
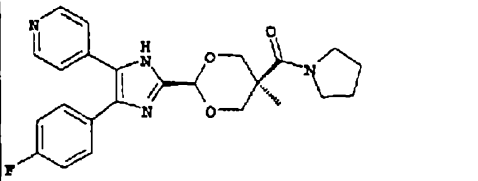
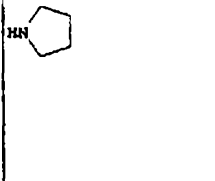
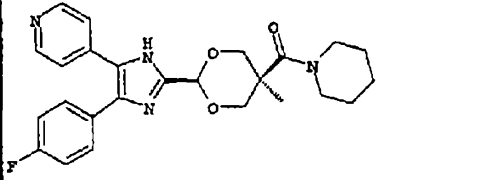
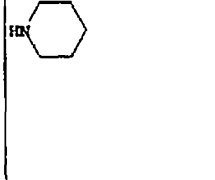
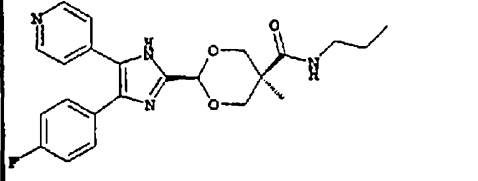
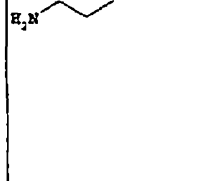
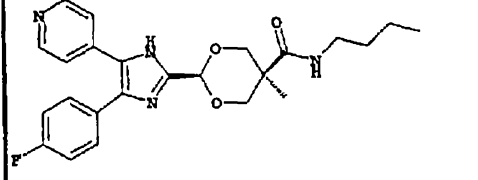
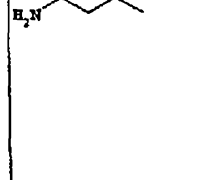
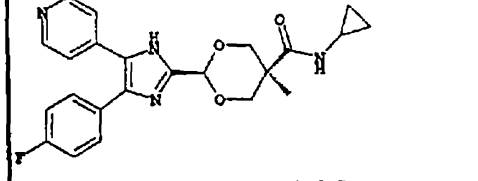
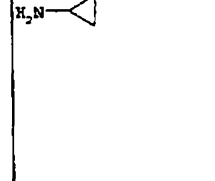
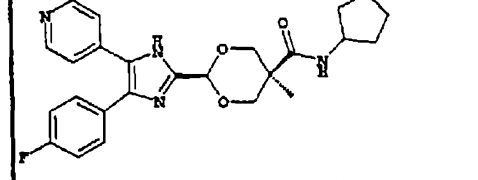
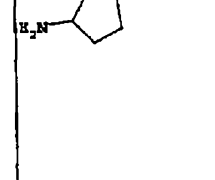
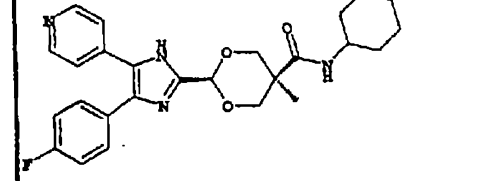
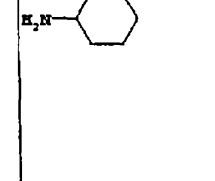
 <p>Соединение AM</p>		0.28	C23H25FN4O4	<p>441 (20%)</p> <p>384 (100%)</p>
 <p>Соединение AN</p>	NH <sub>2</sub>	0.14	C20H19FN4O3	<p>383 (100%)</p>
 <p>Соединение AO</p>		0.29	C26H24FN5O3	<p>474 (100%)</p>
 <p>Соединение AP</p>		0.18	C26H24FN5O3	<p>474 (100%)</p>
 <p>Соединение AQ</p>		0.16	C26H24FN5O3	<p>474 (100%)</p>
 <p>Соединение AR</p>		0.09	C25H28FN5O3	<p>466 (100%)</p>
 <p>Соединение AS</p>		0.14	C25H30FN5O3	<p>468 (100%)</p>
 <p>Соединение AT</p>		0.25	C30H28FN5O3	<p>526 (100%)</p>

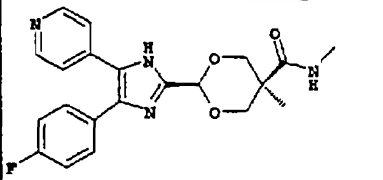
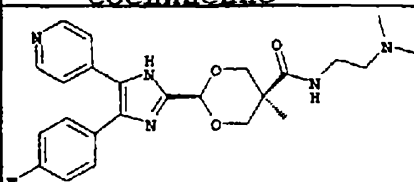
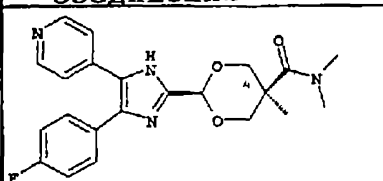
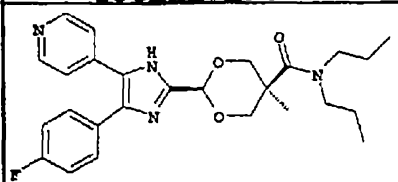
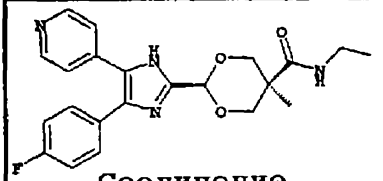
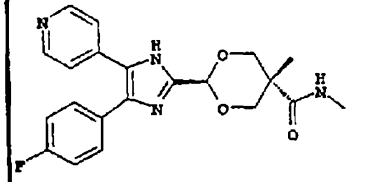
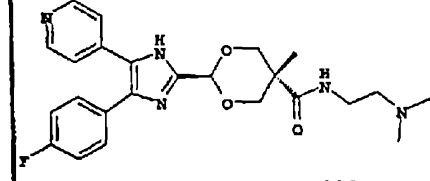
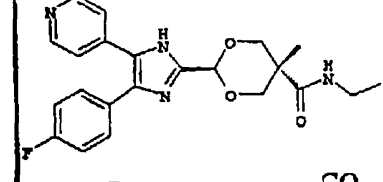
 <p>Соединение AU</p>		0.09	C23H25FN4O4	441 (100%)
 <p>Соединение AV</p>		0.32	C25H27FN4O4	467 (100%)
 <p>Соединение AW</p>		0.32	C24H25FN4O4	453 (100%)
 <p>Соединение AX</p>		0.39	C24H25FN4O3	437 (50%)  384 (100%)
 <p>Соединение AY</p>		0.33	C24H27FN4O3	439 (100%)
 <p>Соединение AZ</p>		0.41	C26H31FN4O3	467 (100%)
 <p>Соединение BA</p>		0.29	C24H27FN4O4	455 (40%)  384 (100%)
 <p>Соединение BB</p>		0.33	C28H27FN4O3	487 (100%)

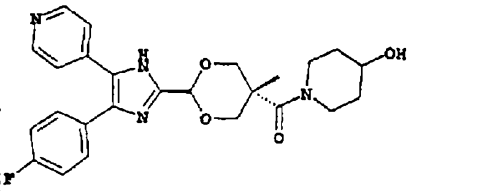
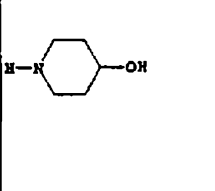
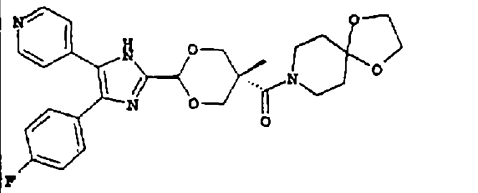
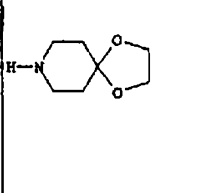
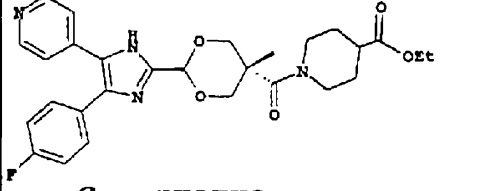
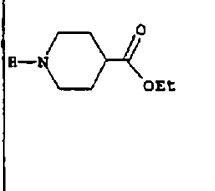
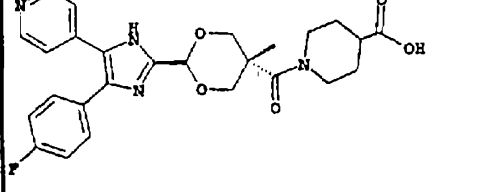
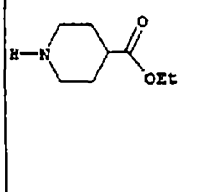
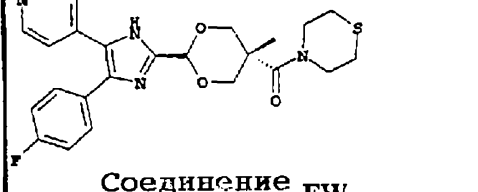
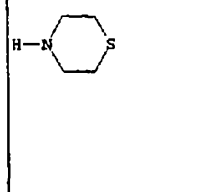
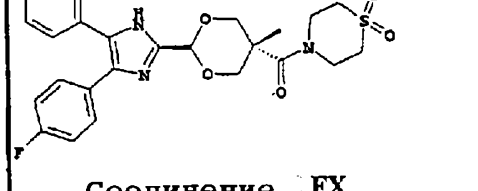
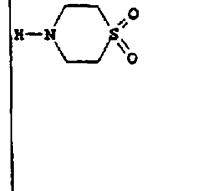
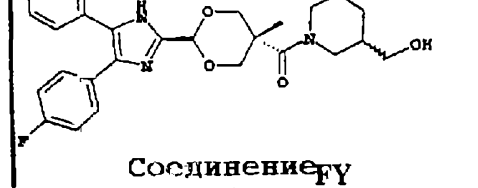
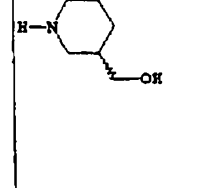
 <p>Соединение BC</p>		0.24	C27H26FN5O3	488 (100%)
 <p>Соединение BD</p>		0.32	C25H23FN4O4	463 (100%)
 <p>Соединение BE</p>		0.36	C25H27FN4O3	451 (30%)  384 (100%)
 <p>Соединение BF</p>		0.28	C22H23FN4O3	411 (11%)  384 (100%)
 <p>Соединение BG</p>		0.29	C23H25FN4O3	425 (70%)  384 (100%)
 <p>Соединение BH</p>		0.22	C23H23FN4O3	423 (25%)  384 (100%)
 <p>Соединение BI</p>		0.32	C25H27FN4O3	451 (100%)
 <p>Соединение BJ</p>		0.36	C26H29FN4O3	465 (100%)

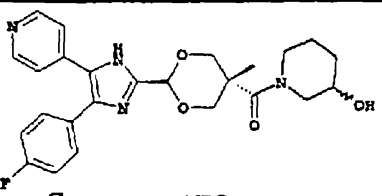
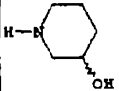
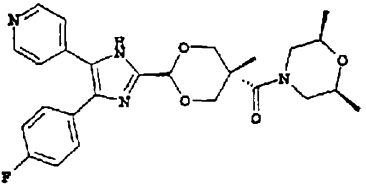
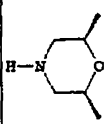
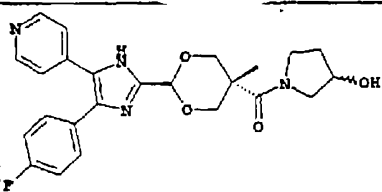
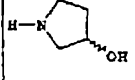
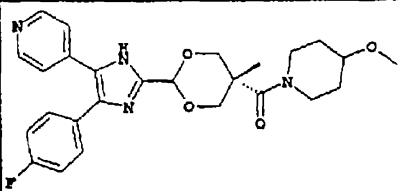
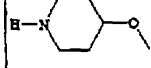
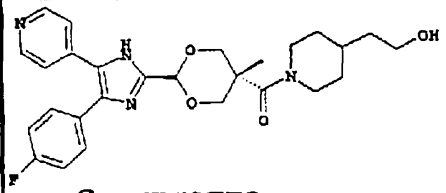
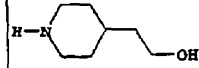
 <p>Соединение BK</p>		0.29	C23H25FN4O4	441 (100%)
 <p>Соединение BL</p>		0.18	C22H23FN4O4	427 (100%)
 <p>Соединение BM</p>	NH <sub>2</sub>	0.16	C20H19FN4O3	383 (100%)
 <p>Соединение BN</p>		0.25	C26H24FN5O3	474 (100%)
 <p>Соединение BO</p>		0.13	C26H24FN5O3	474 (100%)
 <p>Соединение BP</p>		0.10	C26H24FN5O3	474 (100%)
 <p>Соединение BQ</p>		0.36	C24H25FN4O4	453 (100%)
 <p>Соединение BR</p>		0.08	C25H28FN5O3	466 (100%)

 <p>Соединение BS</p>		0.13	C <sub>25</sub> H <sub>30</sub> FN <sub>5</sub> O <sub>3</sub>	468 (100%)
 <p>Соединение BT</p>		0.28	C <sub>30</sub> H <sub>28</sub> FN <sub>5</sub> O <sub>3</sub>	526 (100%)
 <p>Соединение BU</p>		0.08	C <sub>23</sub> H <sub>25</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>4</sub>	441 (100%)
 <p>Соединение BV</p>		0.37	C <sub>28</sub> H <sub>27</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	487 (100%)
 <p>Соединение BW</p>		0.28	C <sub>24</sub> H <sub>27</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>4</sub>	455 (100%)
 <p>Соединение BX</p>		0.25	C <sub>27</sub> H <sub>26</sub> FN <sub>5</sub> O <sub>3</sub>	488 (100%)
 <p>Соединение BY</p>		0.33	C <sub>25</sub> H <sub>23</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>4</sub>	463 (100%)

 <p>Соединение BZ</p>		0.34	C25H27FN4O4	467 (100%)
 <p>Соединение CA</p>		0.38	C24H25FN4O3	437 (10%)  384 (100%)
 <p>Соединение CB</p>		0.40	C25H27FN4O3	451 (60%)  384 (100%)
 <p>Соединение CC</p>		0.26	C23H25FN4O3	425 (40%)  384 (100%)
 <p>Соединение CD</p>		0.31	C24H27FN4O3	439 (100%)
 <p>Соединение CE</p>		0.24	C23H23FN4O3	423 (15%)  384 (100%)
 <p>Соединение CF</p>		0.32	C25H27FN4O3	451 (35%)  384 (100%)
 <p>Соединение CG</p>		0.32	C26H29FN4O3	465 (100%)

 <p>Соединение CH</p>	$H_2N-CH_3 \cdot HCl$	0.22	C21H21FN4O3	397 (50%)  384 (100%)
 <p>Соединение CI</p>	$H_2N-CH_2-CH_2-N(CH_3)_2$	0.11	C24H28FN5O3	454 (100%)
 <p>Соединение CJ</p>	$HN(CH_3)_2 \cdot HCl$	0.33	C22H23FN4O3	411 (70%)  384 (100%)
 <p>Соединение CK</p>	$HN(CH_2CH_3)_2$	0.40	C26H31FN4O3	467 (100%)
 <p>Соединение CL</p>	$H_2N-CH_2CH_3 \cdot HCl$	0.30	C22H23FN4O3	411 (60%)  384 (100%)
 <p>Соединение CM</p>	$H_2N-CH_3 \cdot HCl$	0.15	C21H21FN4O3	397 (45%)  384 (100%)
 <p>Соединение CN</p>	$H_2N-CH_2-CH_2-N(CH_3)_2$	0.07	C24H28FN5O3	454 (40%)  418 (100%)
 <p>Соединение CO</p>	$H_2N-CH_2CH_3 \cdot HCl$	0.23	C22H23FN4O3	411 (34%)  384 (100%)

 <p>Соединение FS</p>		0.55	C27H29FN4O5	467 (100%)
 <p>Соединение FT</p>		0.71	C25H27FN4O4	509 (100%)
 <p>Соединение FU</p>		0.73	C28H31FN4O5	523 (100%)
 <p>Соединение FV</p>		0.29	C26H27FN4O5	495 (100%)
 <p>Соединение FW</p>		0.76	C24H25FN4O3S	469 (100%)
 <p>Соединение FX</p>		0.4	C24H25FN4O5S	501 (100%)
 <p>Соединение FY</p>		0.62	C26H29FN4O4	481 (100%)

 <p>Соединение FZ</p>		0.59	C <sub>25</sub> H <sub>27</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>4</sub>	467 (100%)
 <p>Соединение GA</p>		0.71	C <sub>26</sub> H <sub>29</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>4</sub>	481 (100%)
 <p>Соединение GB</p>		0.53	C <sub>24</sub> H <sub>25</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>4</sub>	453 (100%)
 <p>Соединение GC</p>		0.58*	C <sub>26</sub> H <sub>29</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>4</sub>	481 (100%)
 <p>Соединение GD</p>		0.72	C <sub>27</sub> H <sub>31</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>4</sub>	495 (100%)

### Пример 9

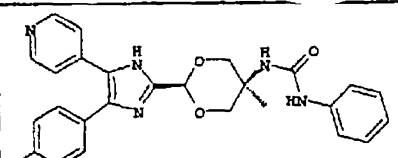
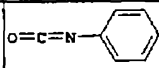
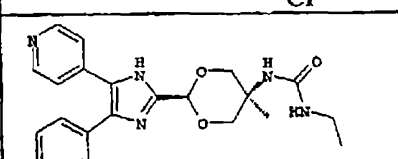
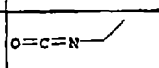
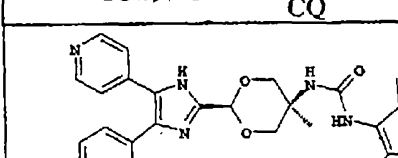
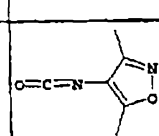
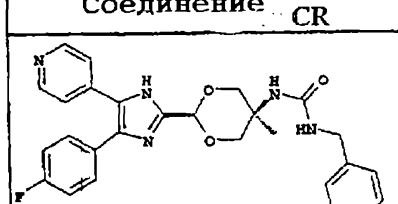
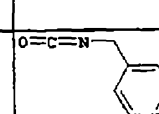
#### Соединения CP-DF

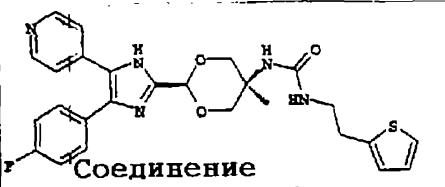
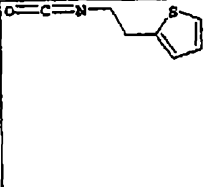
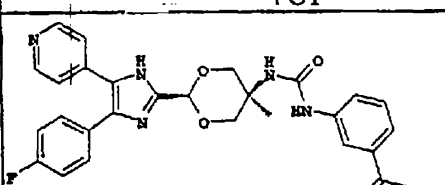
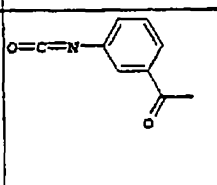
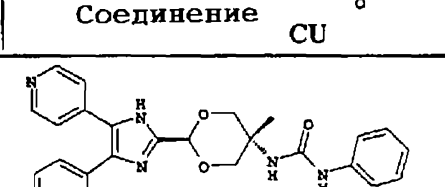
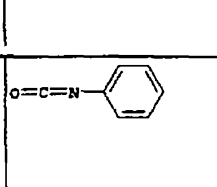
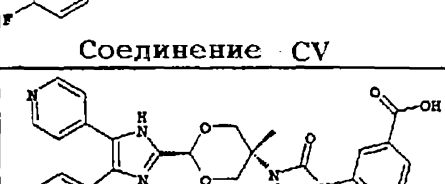
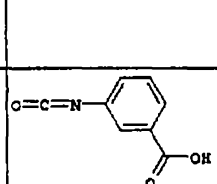
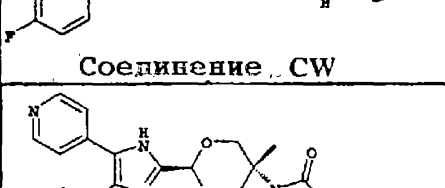
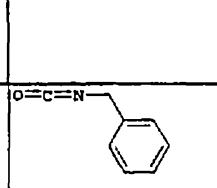
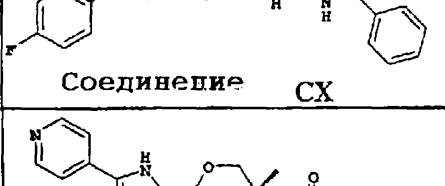
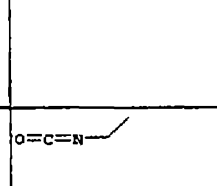
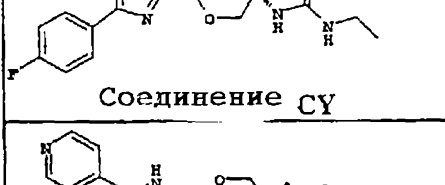
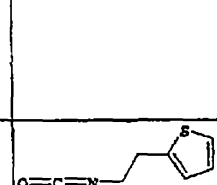
Раствор 5-метил-2-{5-(4-фтор-фенил)-4-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил}-[1,3]диоксан-5-иламина, цис- или транс- изомера, (1 эквивалент, соединение AE или AF) и соответственно замещённого изоцианата формулы  $O=C=N-R^{15}$  или  $O=C=N-L^4-R^{16}$  [1 эквивалент, см. таблицу 3] в сухом тетрагидрофуране переме-

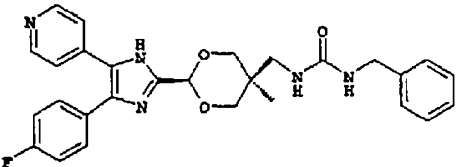
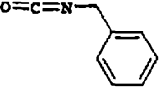
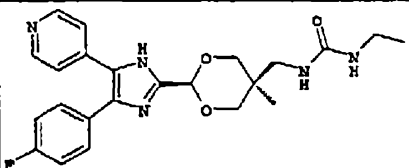

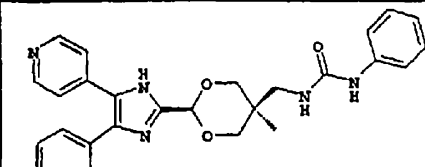
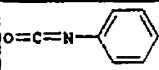
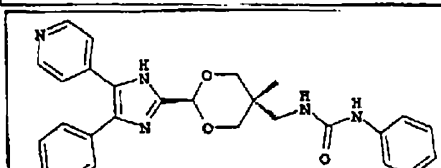
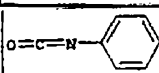
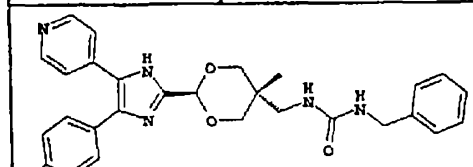
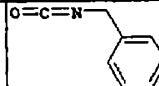
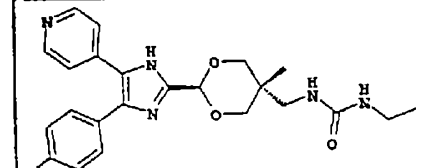
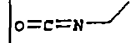
шивают при комнатной температуре в течение 30 минут. Реакционную смесь упаривают в вакууме, получая соединения CP-CZ, изображённые в таблице 3. Приведенные значения  $R_F$  определены при использовании смеси дихлорметана и метанола (9:1, в отношении объёмов) в качестве элюента.

Проводя реакцию аналогичным способом, но используя соединение AA или соединение AB, получают соединения DA-DF, изображённые в таблице 3. Приведенные значения  $R_F$  определены при использовании смеси дихлорметана и метанола (9:1, в отношении объёмов) в качестве элюента.

Таблица 3

Структура и номер соединения	$O=C=N-R^{15}$ или $O=C=N-L^4-R^{16}$	$R_F$	Молекулярная формула	$MH^+$ (интенсивность)
 Соединение CP		0.46	C <sub>26</sub> H <sub>23</sub> FN <sub>5</sub> O <sub>3</sub>	474 (100%)
 Соединение CQ		0.41	C <sub>22</sub> H <sub>24</sub> FN <sub>5</sub> O <sub>3</sub>	426 (100%)
 Соединение CR		0.41	C <sub>25</sub> H <sub>25</sub> FN <sub>6</sub> O <sub>4</sub>	493 (100%)
 Соединение CS		0.50	C <sub>27</sub> H <sub>26</sub> FN <sub>5</sub> O <sub>3</sub>	488 (70%)  423 (100%)

 <p>Соединение CT</p>		0.50	C26H26FN5O3S	508 (100%)
 <p>Соединение CU</p>		0.51	C28H26FN5O4	516 (100%)
 <p>Соединение CV</p>		0.40	C26H24FN5O3	474 (100%)
 <p>Соединение CW</p>		0.36	C27H24FN5O5	MH 516 (100%)
 <p>Соединение CX</p>		0.39	C27H26FN5O3	488 (100%)
 <p>Соединение CY</p>		0.24	C22H24FN5O3	426 (100%)
 <p>Соединение CZ</p>		0.40	C26H26FN5O3S	508 (100%)

 <p>Соединение DA</p>		0.46	C28H28FN5O3	502 (100%)
 <p>Соединение DB</p>		0.39	C23H26FN5O3	440 (100%)
 <p>Соединение DC</p>		0.48	C27H26FN5O3	489 (100%)
 <p>Соединение DD</p>		0.42	C27H26FN5O3	488 (100%)
 <p>Соединение DE</p>		0.40	C28H28FN5O3	502 (100%)
 <p>Соединение DF</p>		0.23	C23H26FN5O3	440 (100%)

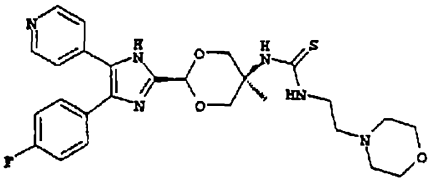
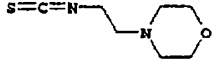
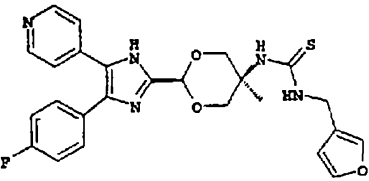
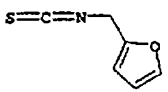
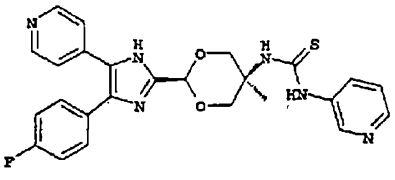
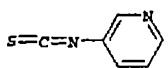
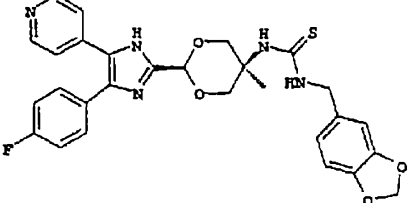
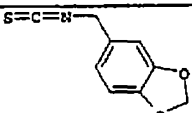
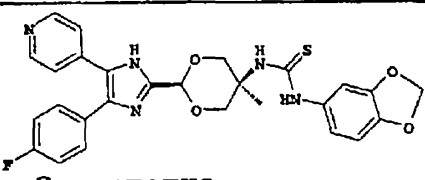
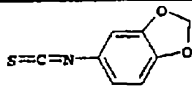
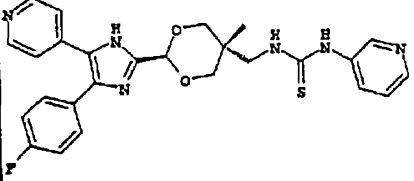
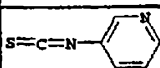
Пример 10

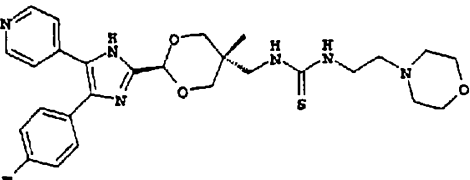
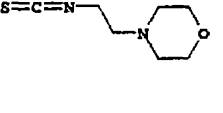
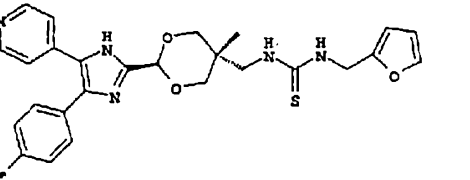
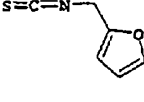
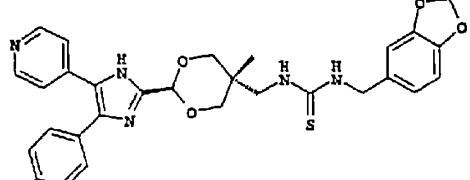
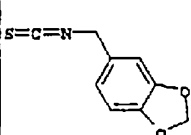
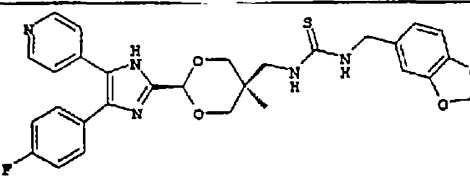
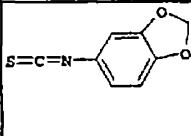
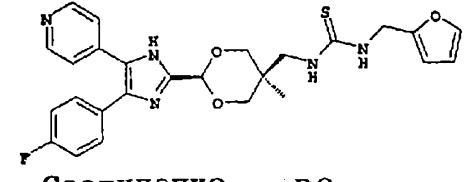
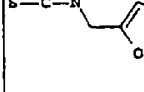
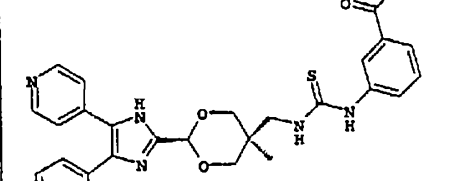
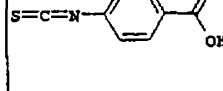
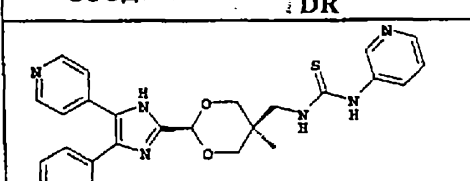
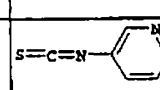
Соединения DG-DU

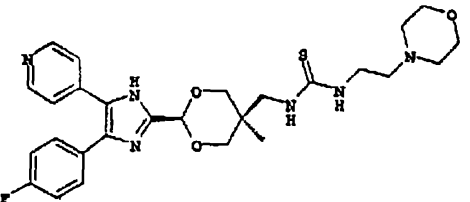
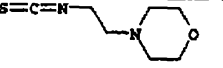
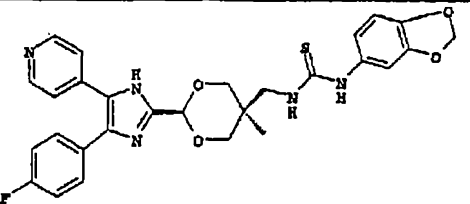
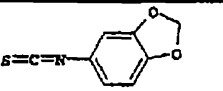
Раствор 5-метил-2-{5-(4-фтор-фенил)-4-пиридин-4-ил-1Н-имидазол-2-ил}-[1,3]диоксан-5-иламина, цис- или транс- изомера, (1 эквивалент, соединение АЕ или АF) и соответственно замещенного изотиоцианата формулы  $S=C=N-R^{15}$  или  $S=C=N-L^4-R^{16}$  [1 эквивалент, см. таблицу 3] в сухом тетрагидрофуране нагревают до температуры кипения с обратным холодильником в течение 18 часов. После охлаждения реакционную смесь упаривают в вакууме и чистят препаративной хроматографией на силикагеле, элюируя смесью дихлорметана и метанола (9:1, в отношении объёмов), что даёт соединения DG-DK, изображённые в таблице 4. Приведенные значения  $R_F$  определены при использовании смеси дихлорметана и метанола (9:1, в отношении объёмов) в качестве элюента.

Проводя реакцию аналогичным способом, но используя соединение АА или соединение АВ, получают соединения DL-DU, изображённые в таблице 4. Приведенные значения  $R_F$  определены при использовании смеси дихлорметана и метанола (9:1, в отношении объёмов) в качестве элюента.

Таблица 4

Структура и номер соединения	$S=C=N \cdot R^{15}$ или $S=C=N \cdot L^4 \cdot R^{16}$	$R_F$	Молекулярная формула	$MH^+$ (интенсивность)
 <p>Соединение DG</p>		0.46	C <sub>26</sub> H <sub>31</sub> FN <sub>6</sub> O <sub>3</sub> S	527 (100%)
 <p>Соединение DH</p>		0.46	C <sub>25</sub> H <sub>24</sub> FN <sub>5</sub> O <sub>3</sub> S	494 (100%)
 <p>Соединение DI</p>		0.32	C <sub>25</sub> H <sub>23</sub> FN <sub>6</sub> O <sub>2</sub> S	491 (100%)
 <p>Соединение DJ</p>		0.50	C <sub>28</sub> H <sub>26</sub> FN <sub>5</sub> O <sub>4</sub> S	548 (100%)
 <p>Соединение DK</p>		0.24	C <sub>27</sub> H <sub>24</sub> FN <sub>5</sub> O <sub>4</sub> S	534 (100%)
 <p>Соединение DL</p>		0.23	C <sub>26</sub> H <sub>25</sub> FN <sub>6</sub> O <sub>2</sub> S	505(100%)

 <p>Соединение DM</p>		0.16	C27H33FN6O3S	541 (100%)
 <p>Соединение DN</p>		0.37	C26H26FN5O3S	508 (100%)
 <p>Соединение DO</p>		0.40	C29H28FN5O4S	562 (100%)
 <p>Соединение DP</p>		0.48	C29H28FN5O4S	562 (100%)
 <p>Соединение DQ</p>		0.46	C26H26FN5O3S	508 (100%)
 <p>Соединение DR</p>		0.13	C28H26FN5O4S	548 (100%)
 <p>Соединение DS</p>		0.28	C26H25FN6O2S	505 (100%)

 <p>Соединение DT</p>		0.35	C27H33FN6O3S	541 (100%)
 <p>Соединение DU</p>		0.50	C28H26FN5O4S	548 (100%)

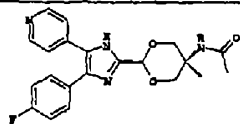

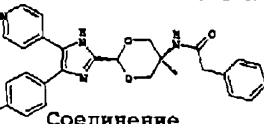
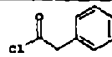
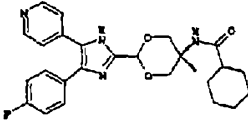

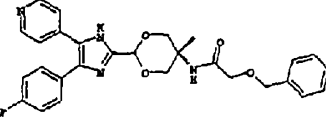
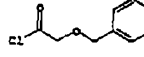
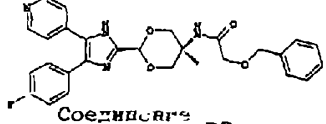
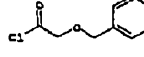
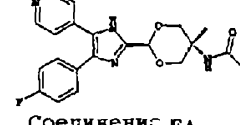

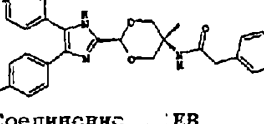
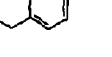
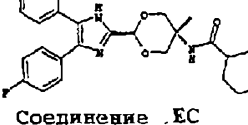

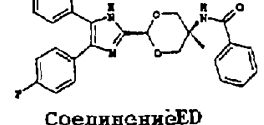

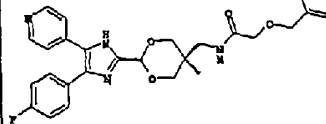
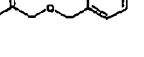
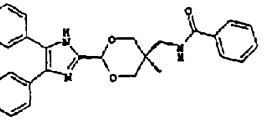
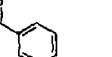
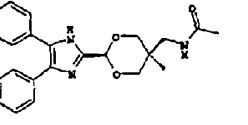

Пример 11

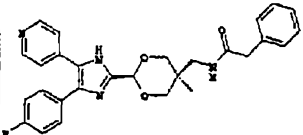
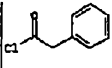
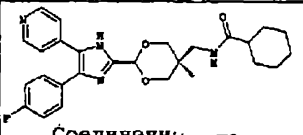
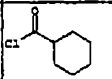
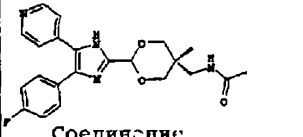
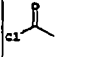
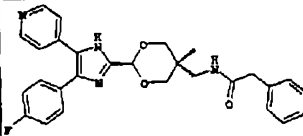
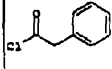
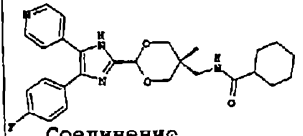
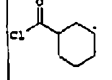
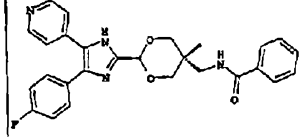
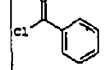
#### Соединения DV-EM

Перемешиваемый раствор 5-метил-2-{5-(4-фтор-фенил)-4-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил}-[1,3]диоксан-5-иламина, цис- или транс- изомера, (1 эквивалент, соединение AE или AF) и триэтиламина [1 эквивалент] в сухом тетрагидрофуране обрабатывают соответственно замещённым хлорангидридом формулы  $\text{Cl}-\text{C}(=\text{O})-\text{R}^{15}$  или  $\text{Cl}-\text{C}(=\text{O})-\text{L}^4-\text{R}^{16}$  [1 эквивалент, см. таблицу 4]. После перемешивания при комнатной температуре в течение 18 часов реакционную смесь упаривают, получая соединения DV-ED, изображённые в таблице 5. Приведенные значения  $R_f$  определены при использовании смеси дихлорметана и метанола (9:1, в отношении объёмов) в качестве элюента.

Проводя реакцию аналогичным способом, но используя соединение AA или AB, получают соединения EF-EM, изображённые в таблице 4. Приведенные значения  $R_f$  определены при использовании смеси дихлорметана и метанола (9:1, в отношении объёмов) в качестве элюента.

Таблица 5

Структура и номер соединения	Cl-C(=O)-R <sup>15</sup> или Cl-C(=O)-L <sup>4</sup> -R <sup>16</sup>	R <sub>F</sub>	Молекулярная формула	MH <sup>+</sup> и точная масса
 Соединение DV		0.41	C <sub>21</sub> H <sub>21</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	397 (100%)
 Соединение DW		0.42	C <sub>27</sub> H <sub>25</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	473 (100%)
 Соединение DX		0.46	C <sub>26</sub> H <sub>29</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	465 (100%)
 Соединение DY		0.58	C <sub>28</sub> H <sub>27</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>4</sub>	MH <sup>+</sup> 501 (100%)
 Соединение DZ		0.52	C <sub>28</sub> H <sub>27</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>4</sub>	503 (100%)
 Соединение EA		0.34	C <sub>21</sub> H <sub>21</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	397 (100%)
 Соединение EB		0.49	C <sub>27</sub> H <sub>25</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	473 (100%)
 Соединение EC		0.51	C <sub>26</sub> H <sub>29</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	465 (100%)
 Соединение ED		0.52	C <sub>26</sub> H <sub>23</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	459 (100%)
 Соединение EE		0.55	C <sub>29</sub> H <sub>29</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>4</sub>	517 (100%)
 Соединение EF		0.33	C <sub>27</sub> H <sub>25</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	473 (100%)
 Соединение EG		0.22	C <sub>22</sub> H <sub>23</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	411 (100%)

 <p>Соединение .EN</p>		0.30	C <sub>28</sub> H <sub>27</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	486 (100%)
 <p>Соединение .EI</p>		0.29	C <sub>27</sub> H <sub>31</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	479 (100%)
 <p>Соединение .EJ</p>		0.18	C <sub>22</sub> H <sub>23</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	411 (100%)
 <p>Соединение .EK</p>		0.45	C <sub>28</sub> H <sub>27</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	487 (100%)
 <p>Соединение .EL</p>		0.45	C <sub>27</sub> H <sub>31</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	479 (100%)
 <p>Соединение .EM</p>		0.45	C <sub>27</sub> H <sub>25</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	473 (100%)

## Пример 12

### Соединения EN-ER

Раствор 5-метил-2-{5-(4-фтор-фенил)-4-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил}-[1,3]диоксан-5-иламина, цис-изомера, (1 эквивалент, соединение AE), триэтиламина (1,2 эквивалента) и глутарового ангидрида (1 эквивалент) в сухом тетрагидро-

фуране нагревают до температуры кипения с обратным холодильником в течение 8 часов. Реакционную смесь упаривают, получая 4-(2-[5-(4-фтор-фенил)-4-пиридин-4-ил-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илкарбамоил)-масляную кислоту, цис-изомер, (соединение EN).  $MH^+$  469.  $R_F$  0,12 (определено при использовании смеси дихлорметана и метанола (9:1, в отношении объёмов) в качестве элюента}.

Проводя реакцию аналогичным способом, но используя соединение АВ и глутаровый ангидрид, получают 4-({2-[5-(4-фтор-фенил)-4-пиридин-4-ил-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-карбамоил)-масляную кислоту, цис-изомер, (соединение EO).  $MH^+$  483.  $R_F$  0,10 (определено при использовании смеси дихлорметана, пентана, метанола и аммиака (55:25:18:2, в отношении объёмов) в качестве элюента}.

Проводя реакцию аналогичным способом, но используя соединение АЕ и янтарный ангидрид, получают 4-{2-[5-(4-фтор-фенил)-4-пиридин-4-ил-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илкарбамоил}-пропионовую кислоту, цис-изомер, (соединение EP).  $MH^+$  455.  $R_F$  0,18 (определено при использовании смеси дихлорметана и метанола (9:1, в отношении объёмов) в качестве элюента}.

Проводя реакцию аналогичным способом, но используя соединение АВ и янтарный ангидрид, получают 4-({2-[5-(4-фтор-фенил)-4-пиридин-4-ил-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-карбамоил)-пропионовую кислоту, цис-изомер, (соединение EQ).  $MH^+$  469.  $R_F$  0,10 (определено при ис-

пользовании смеси дихлорметана, пентана, метанола и аммиака (55:25:18:2, в отношении объёмов) в качестве элюента}.

Проводя реакцию аналогичным способом, но используя соединение АА и янтарный ангидрид, получают 4-({2-[5-(4-фтор-фенил)-4-пиридин-4-ил-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]-диоксан-5-илметил}-карбамоил)-пропионовую кислоту, транс-изомер, (соединение ER).  $MH^+$  469.  $R_F$  0,11 (определено при использовании смеси дихлорметана, пентана, метанола и аммиака (55:25:18:2, в отношении объёмов) в качестве элюента).

#### Пример 13

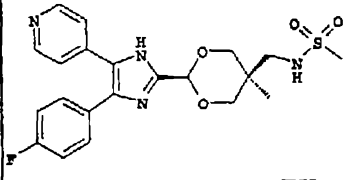

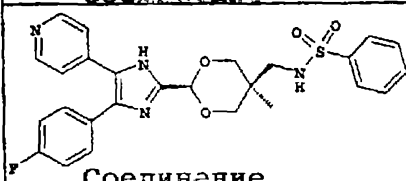
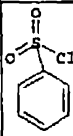
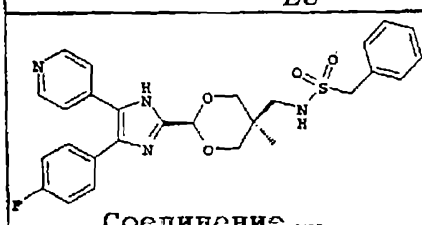
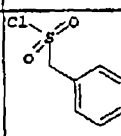
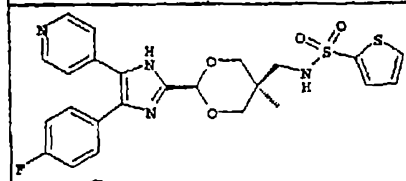
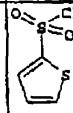
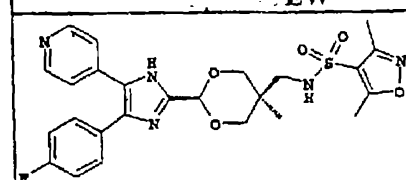
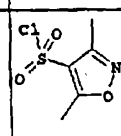
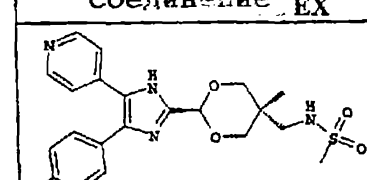

##### Соединения ES-FB

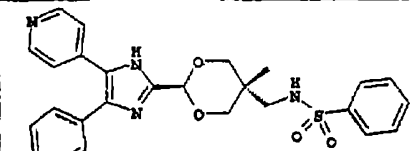
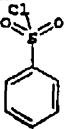
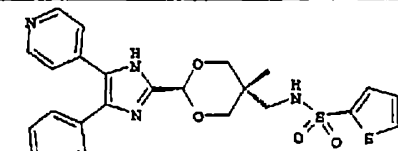
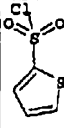
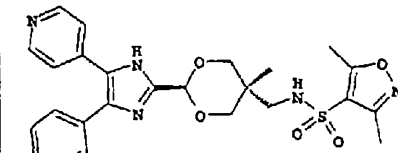
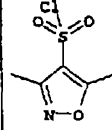
Раствор 5-метил-2-{5-(4-фтор-фенил)-4-пиридин-4-ил-1Н-имидазол-2-ил}-[1,3]диоксан-5-иламина, цис-изомера, [1 эквивалент, соединение AE], триэтиламина [1 эквивалент] в тетрагидрофуране обрабатывают метансульфонилхлоридом [1 эквивалент]. После перемешивания при комнатной температуре в течение 48 часов реакционную смесь упаривают и остаток подвергают препаративной хроматографии в больших объёмах, получая N-{2-[5-(4-фтор-фенил)-4-пиридин-4-ил-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-метансульфонамид, цис-изомер, (соединение ES).  $MH^+$  433.  $R_F$  0,42 (определено при использовании смеси дихлорметана и метанола (9:1, в отношении объёмов) в качестве элюента).

Проводя реакцию аналогичным способом, но используя соединение АА или соединение АВ и соответственно замещённый

хлористый сульфонил формулы  $\text{Cl-SO}_2\text{-R}^{15}$  или  $\text{Cl-SO}_2\text{-L}^4\text{-R}^{15}$ , получают соединения ET-FB, изображённые в таблице 6. Приведенные значения  $R_f$  определены при использовании смеси дихлорметана и метанола (9:1, в отношении объёмов) в качестве элюента.

Таблица 6

Структура и номер соединения	$\text{Cl-SO}_2\text{-R}^{15}$ или $\text{Cl-SO}_2\text{-L}^4\text{-R}^{15}$	$R_f$	Молекулярная формула	$MH^+$ (интенсивность)
 Соединение ET		0.21	$\text{C}_{21}\text{H}_{23}\text{FN}_4\text{O}_4\text{S}$	447 (100%)
 Соединение EU		0.28	$\text{C}_{26}\text{H}_{25}\text{FN}_4\text{O}_4\text{S}$	509 (100%)
 Соединение EV		0.29	$\text{C}_{27}\text{H}_{27}\text{FN}_4\text{O}_4\text{S}$	523 (100%)
 Соединение EW		0.30	$\text{C}_{24}\text{H}_{23}\text{FN}_4\text{O}_4\text{S}_2$	515 (100%)
 Соединение EX		0.30	$\text{C}_{25}\text{H}_{26}\text{FN}_5\text{O}_5\text{S}$	528 (100%)
 Соединение EY		0.32	$\text{C}_{21}\text{H}_{23}\text{FN}_4\text{O}_4\text{S}$	447 (100%)

 Соединение EZ		0.53	C26H25FN4O4S	509 (100%)
 Соединение FA		0.50	C24H23FN4O4S2	515 (100%)
 Соединение FB		0.50	C25H26FN5O5S	528 (100%)

## Пример 14

Соединения FC-FJ

Раствор бензилового эфира (3-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илкарбамоил}-этил)-карбаминовой кислоты, транс-изомера, (соединение FI) обрабатывают 5% палладием на активированном угле и перемешивают при комнатной температуре в атмосфере водорода в течение 8 часов. Реакционную смесь фильтруют через слой диатомовой земли и упаривают досуха.

Остаток подвергают препаративной тонкослойной хроматографии на силикагеле, элюируя дихлорметаном и метанолом (7:3, в отношении объёмов), что даёт 3-амино-N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-пропионамид, транс-изомер, (соединение FC).  $MH^+$  426.  $R_F$  0,04 определяют, используя смесь дихлорметана и метанола (7:3, в отношении объёмов) в качестве элюента.

Проводя реакцию аналогичным способом, но используя соединение FJ, получают 3-амино-N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-пропионамид, цис-изомер, (соединение FD).  $MH^+$  426.  $R_F$  0,04 определяют, используя смесь дихлорметана и метанола (7:3, в отношении объёмов) в качестве элюента.

Проводя реакцию аналогичным способом, но используя соединение FK, получают 4-амино-N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-бутирамид, транс-изомер, (соединение FE).  $MH^+$  440.  $R_F$  0,03 определяют, используя смесь дихлорметана и метанола (7:3, в отношении объёмов) в качестве элюента.

Проводя реакцию аналогичным способом, но используя соединение FL, получают 4-амино-N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-бутирамид, цис-изомер, (соединение FF).  $MH^+$  440.  $R_F$  0,03 определяют, используя смесь дихлорметана и метанола (7:3, в отношении объёмов) в качестве элюента.

Проводя реакцию аналогичным способом, но используя сое-

динение FM, получают 2-амино-N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-ацетамид, транс-изомер, (соединение FG). МН<sup>-</sup> 412. R<sub>F</sub> 0,01 определяют, используя смесь дихлорметана и метанола (9:1, в отношении объёмов) в качестве элюента, при двух проявлениях.

Проводя реакцию аналогичным способом, но используя соединение FN, получают 2-амино-N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-ацетамид, цис-изомер, (соединение FH). МН<sup>+</sup> 412. R<sub>F</sub> 0,03 определяют, используя смесь дихлорметана и метанола (9:1, в отношении объёмов) в качестве элюента, при двух проявлениях.

#### Пример 15

##### Соединения FI-FP

Раствор 5-метил-2-{5-(4-фтор-фенил)-4-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил}-[1,3]диоксан-5-иламина, цис- и транс- изомеров, [1 эквивалент, соединение AG], N-бензилоксикарбонил-β-аланина [1 эквивалент], 1-(3-диметиламинопропил)-3-этилкарбодиимид-гидрохлорида [1,1 эквивалента], N,N-диизопропилэтиламина [3 эквивалента] и 1-гидроксибензотриазол-гидрата [1,1 эквивалента] в сухом диметилформамиде нагревают до 90°C в течение 2,5 часов. Реакционную смесь охлаждают до комнатной температуры, затем упаривают. Остаток распределяют между этилацетатом (12 мл) и водой (12 мл). Органическую фазу отделяют и оставляют при комнатной температуре. Кристаллизующийся твёрдый продукт фильтруют, получая бензиловый эфир (3-{2-[4-(4-фтор-фенил)-

5-пиридин-4-ил-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илкарбамоил}-этил)-карбаминовой кислоты, транс-изомер, (соединение FI). Фильтрат подвергают препаративной хроматографии на силикагеле, элюируя смесью дихлорметана и пентана (9:1, в отношении объёмов), что даёт бензиловый эфир (3-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]-диоксан-5-илкарбамоил}-этил)-карбаминовой кислоты, цис-изомер, (соединение FJ).

Проводя реакцию аналогичным способом, но используя N-бензилоксикарбонил-4-аминомасляную кислоту, получают бензиловый эфир (3-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илкарбамоил}-пропил)-карбаминовой кислоты, транс-изомер, (соединение FK) и бензиловый эфир (3-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илкарбамоил}-пропил)-карбаминовой кислоты, цис-изомер, (соединение FL).

Проводя реакцию аналогичным способом, но используя N-бензилоксикарбонилглицин, получают бензиловый эфир (3-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илкарбамоил}-метил)-карбаминовой кислоты, транс-изомер, (соединение FM) и бензиловый эфир (3-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]-диоксан-5-илкарбамоил}-метил)-карбаминовой кислоты, цис-изомер, (соединение FN).

Проводя реакцию аналогичным способом, но используя 3-диметиламино-пропионовую кислоту, получают 4-диметиламино-N-

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-бутирамид, цис- и транс- изомеры,  
(соединение FO).  $MH^+$  468.  $R_f$  0,32 определяют, используя смесь дихлорметана и метанола (7:3, в отношении объёмов) в качестве элюента.

#### Пример 16

##### Соединение FP

Раствор {2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-метанона, транс-изомера (7,43 г, соединение AW) в горячем тетрагидрофуране (500 мл) обрабатывают раствором метансульфокислоты (1,578 г) в тетрагидрофуране. После выдерживания при комнатной температуре в течение 18 часов реакционную смесь фильтруют и твёрдый продукт перекристаллизовывают из ацетонитрила при горячем фильтровании через целит, что даёт {2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-метанон-метансульфокислоты-соль, транс-изомер (6,00 г, соединение FP) в виде светло-жёлтого твёрдого кристаллического соединения, т.пл. 242-246°C (с разложением). [Элементный анализ: C, 54,76; H, 5,25; N, 10,44; S, 5,89 %. Рассчитано для  $C_{24}H_{25}FN_4O_4 \cdot CH_3SO_3H$ : C, 54,73; H, 5,32; N, 10,21; S, 5,84 %;].

#### Пример 17

##### Соединение FQ

Раствор N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-бензамида, транс-изо-

мера (0,85 г, соединение FR) в тетрагидрофуране (100 мл) обрабатывают метансульфокислотой (0,178 г). Реакционную смесь перемешивают в течение 5 минут, затем упаривают досуха и сушат в глубоком вакууме. Оставшийся твёрдый продукт перекристаллизовывают из этилацетата, содержащего минимальный объём ацетонитрила, что даёт N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-бензамид-метансульфокислоты-соль, транс-изомер (1,20 г, соединение FQ) в виде жёлтого твёрдого кристаллического соединения, т.пл. 165-169°C. [Элементный анализ: C, 57,93; H, 5,41; N, 8,73 %. Рассчитано для  $C_{26}H_{23}FN_4O_3 \cdot CH_3SO_3H \cdot CH_3CO_2C_2H_5$ : C, 52,94; H, 5,123; N, 9,88 %].

#### Пример 18

##### Соединение FR

Перемешиваемую суспензию 5-метил-2-{5-(4-фтор-фенил)-4-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил}-[1,3]диоксан-5-иламина, транс-изомера (1,76 г, соединение AF), бензойной кислоты (0,67 г) и диизопропилэтиламина (1,39 мл) в сухом диметилформамиде (50 мл) обрабатывают {0-(7-азабензотриазол-1-ил)-1,1,3,3-тетраметилуроний-гексафторфосфатом} (1,88 г) в атмосфере азота. После перемешивания при комнатной температуре в течение 2 часов реакционную смесь упаривают досуха. Остаток распределяют между этилацетатом (70 мл) и насыщенным бикарбонатом натрия (50 мл). Органическую фазу дважды промывают водой (50 мл), затем рассолом (30 мл) и потом упаривают. Остаток подвергают флэш хроматографии на

силикагеле, элюируя этилацетатом, что даёт N-(2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-бензамид, транс-изомер, (0,85 г, соединение FR) в виде твёрдого вещества кремового цвета, т.пл. 235-236°C. R<sub>F</sub>: 0,42 определяют, используя смесь дихлорметана и метанола (9:1, в отношении объёмов) в качестве элюента. МН<sup>+</sup> 459.

#### Пример 19

##### Соединение AW

Способ А: 2-[5-(4-фтор-фенил)-4-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновую кислоту, транс-изомер (7,70 г, соединение AH) добавляют порциями к перемешиваемому тионилхлориду. Реакционную смесь перемешивают при комнатной температуре в течение 1,25 часа, затем упаривают. Остаток азеотропно перегоняют с сухим толуолом, получая сырой хлорангидрид. Полученный продукт обрабатывают сухим дихлорметаном (150 мл) и затем морфолином (30 мл) в атмосфере азота. Смесь перемешивают при комнатной температуре в течение 2,5 часа, затем упаривают. Остаток распределяют между этилацетатом (250 мл) и насыщенным бикарбонатом натрия (200 мл). Образующийся на границе раздела нерастворимый продукт фильтруют и промывают метанолом (10 мл), затем водой (20 мл) и и потом диэтиловым эфиром (20 мл), получая 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (7,63 г, соединение AW), т.пл. 288-291°C. МН<sup>+</sup> 453.

Способ В: 4-[2-диметоксиметил)-5(4-фторфенил)-1H-4-ими-

дазолил]-пиридин (62,7 г) и 3-гидрокси-2-(гидроксиметил)-2-метил-1-морфолино-1-пропанон (44,8 г, ссылочный пример 6) добавляют к толуолу (440 мл) в атмосфере азота. Смесь перемешивают и нагревают до температуры кипения, с обратным холодильником и расположенной под ним насадкой Дина-Старка, в течение 20 минут. Добавляют N,N-диметилформамид (160 мл) и метансульфокислоту (2 мл) и смесь нагревают до слабого обратного стока в течение 4 часов, в целом отгоняя 150 мл дистиллята при довольно постоянной скорости. Затем реакционную смесь упаривают в вакууме для удаления максимально возможного количества толуола. Полученную суспензию обрабатывают триэтиламиноом (8 мл) и затем добавляют по каплям в течение 1 часа воду (600 мл). Смесь фильтруют, и затем промывают водой и отсасывают плотный осадок на фильтре в течение 1 часа, что даёт влажную неочищенную смесь твёрдых цис- и транс- изомеров. Этот продукт размешивают в метаноле (350 мл), затем смесь нагревают до температуры кипения с обратным холодильником в течение 15 минут и потом охлаждают до 5°C. Твёрдый продукт фильтруют и затем промывают метанолом, получая {2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (46,4 г, соединение AW), т.пл. 214°C (с разложением). <sup>1</sup>H-ЯМР (δ, CDCl<sub>3</sub>): 8,52 (д, 0,6H); 8,39 (д, 1,4H); 7,32-7,49 (м, 4H); 7,29 (т, 1,4H); 7,13 (т, 0,6H); 5,59 (с, 1H); 4,07 (с, 4H); 3,51 (ушир д, 8H); 1,56 (с, 3H).

Пример 20

Соединение GE

Перемешиваемую суспензию {2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-метанона, транс-изомера (4,52 г, соединение AW) в смеси этанола и метанола (45 мл, 95:5, в отношении объемов) обрабатывают водной бромистоводородной кислотой (1,2 мл, 48%). Смесь нагревают до температуры кипения с обратным холодильником, затем добавляют воду (15 мл) и после этого смесь снова нагревают до температуры кипения с обратным холодильником. Образовавшемуся раствору дают охладиться до комнатной температуры и затем фильтруют. Твёрдый продукт трижды промывают смесью этанола и метанола (10 мл, 95:5, в отношении объемов), получая {2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-метанон-моногидробромид-дигидрат, транс-изомер (4,5 г, соединение GE) в виде не совсем белого твёрдого кристаллического вещества, т.пл. 276-277°C (с разложением). <sup>1</sup>H-ЯМР (CD<sub>3</sub>)<sub>2</sub>SO: δ 1,53 (с, 3H), 3,49 (ушир д, 8H), 4,08 (с, 4H), 5,64 (с, 1H), 7,36 (т, 2H), 7,53-7,58 (м, 2H), 7,84 (д, 2H), 8,63 (д, 2H).

Пример 21

Соединение GF

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер (25,2 г, соединение AW), размешанный в изопропанолe (300

мл), обрабатывают концентрированной соляной кислотой (5 мл) и водой (440 мл) и смесь нагревают до температуры кипения с обратным холодильником в течение 15 минут. Смесь охлаждают до комнатной температуры и затем фильтруют. Твёрдый продукт промывают изопропанолом, получая {2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-метанон-моногидрохлорид-дигидрат, транс-изомер (22,5 г, соединение GF) в виде не совсем белого твёрдого вещества, т.пл. 245-248°C (с разложением). <sup>1</sup>H-ЯМР (CD<sub>3</sub>)<sub>2</sub>SO: δ 1,58 (с, 3H), 3,55 (ушир д, 8H), 4,12 (с, 4H), 5,68 (с, 1H), 7,49 (т, 2H), 7,58-7,62 (м, 2H), 7,89 (д, 2H), 8,68 (д, 2H).

#### Пример 22

##### Соединение GG

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер (4,52 г, соединение AW), размешанный в смеси этанола и метанола (45 мл, 95:5, в отношении объёмов), обрабатывают d-10-камфорсульфокислотой (2,55 г). Смесь нагревают до температуры кипения с обратным холодильником и полученному раствору дают охладиться до комнатной температуры. Образовавшийся твёрдый продукт собирают фильтрованием и трижды промывают смесью этанола и метанола (10 мл, 95:5, в отношении объёмов), получая {2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-метанон-d-10-камфорсульфокислоты-соль, транс-изомер (6,0 г, соединение GG) в виде светло-жёлтых кристаллов,

т.пл. 265-267°C (с разложением).  $^1\text{H}$ -ЯМР  $(\text{CD}_3)_2\text{SO}$ :  $\delta$  0,74 (с, 3H), 1,05 (с, 3H), 1,33-1,43 (м, 2H), 1,58 (с, 3H), 1,80 (д, 1H), 1,81-1,89 (м, 1H), 1,94 (т, 1H), 2,24 (дт, 1H), 2,49 (д, 1H), 2,64-2,72 (м, 1H), 2,89 (д, 1H), 3,53 (д, 8H), 4,12 (с, 4H), 5,69 (с, 1H), 7,40 (т, 2H), 7,57-7,63 (м, 2H), 7,90 (д, 2H), 8,68 (д, 2H).

#### Пример 23

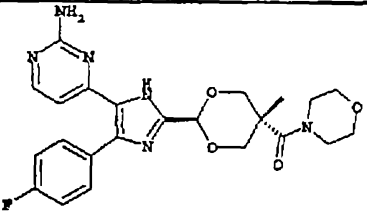

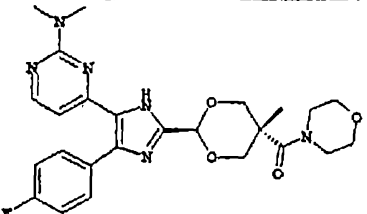

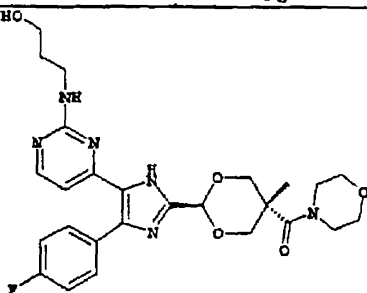

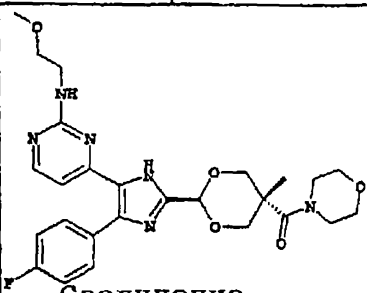
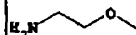
##### Соединения GH-NK

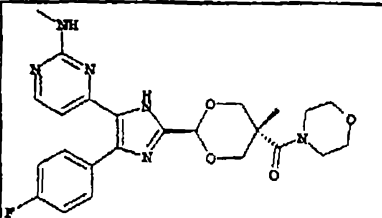
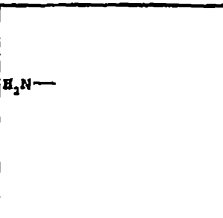
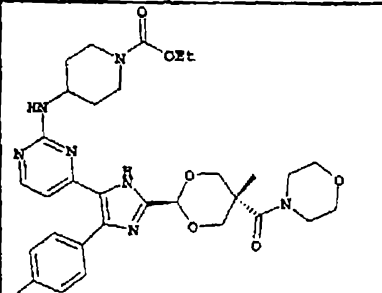
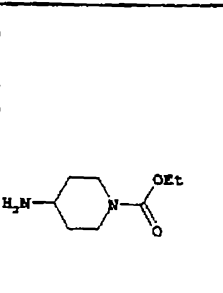
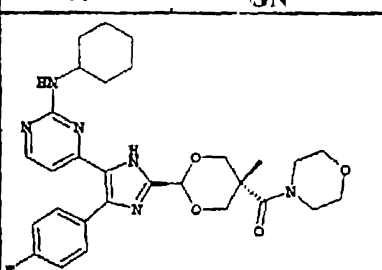
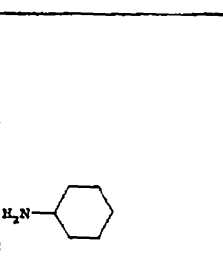
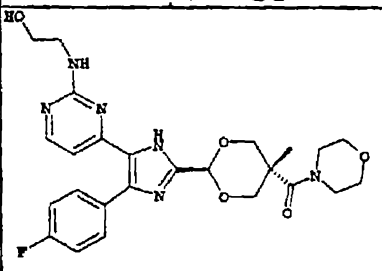
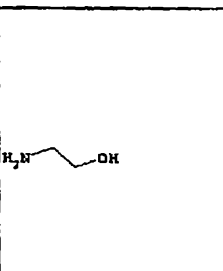
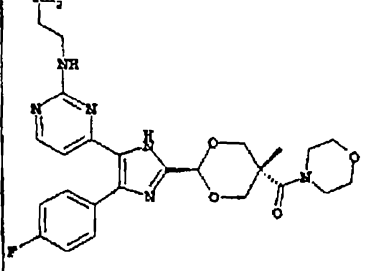
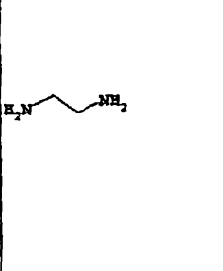
а) Раствор {2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метансульфонил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-метанона, транс-изомера, (1 эквивалент, соединение KN) и циклопропиламина (5 эквивалентов) в сухом диметилформамиде нагревают до 100°C в течение 16 часов. Растворитель упаривают и остаток подвергают жидкостной хроматографии высокого разрешения на колонке с C18 Dynаmax 60Å при градиенте элюирования смесью ацетонитрила и воды, в качестве подвижной фазы, (0-2 минут, 20%-ацетонитрил; 3-16 минут, линейное возрастание до 80%-ацетонитрила; 17 минут и до конца вытекания, 80%-ацетонитрил) и УФ-детектировании при 238 нм, что даёт {2-[5-(2-циклопропиламинопиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение GH), ЖХВР-время удерживания = 8,0 минут.  $\text{Mn}^+$  509.

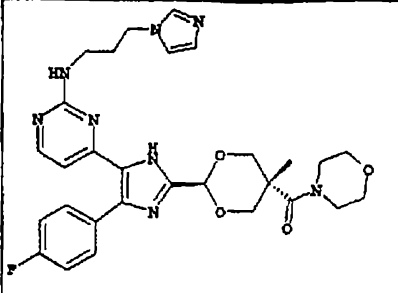
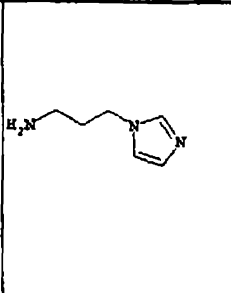
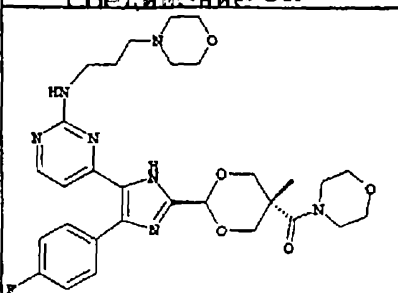
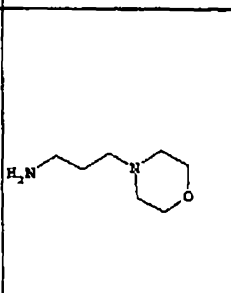
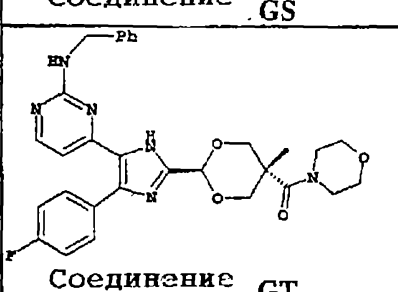
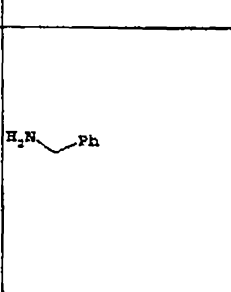
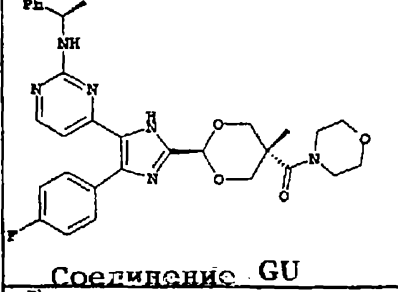
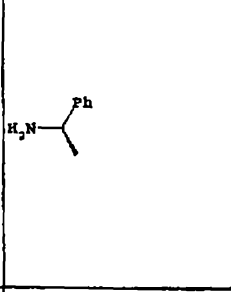
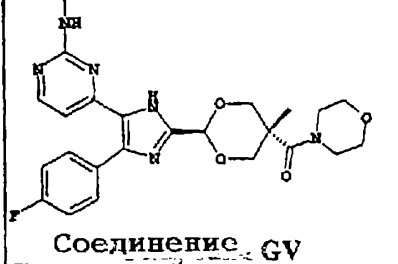
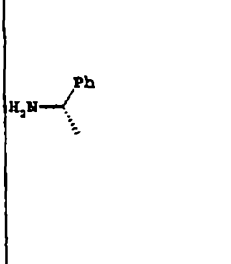
(б) Проводя реакцию способом, аналогичным примеру 23 (а), но заменяя циклопропиламин соответственно замещённым амином формулы  $\text{HNY}^4\text{Y}^5$  [5 эквивалентов, см. таблицу 7], полу-

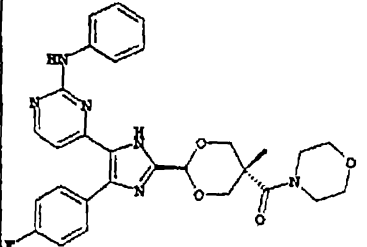
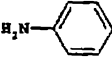
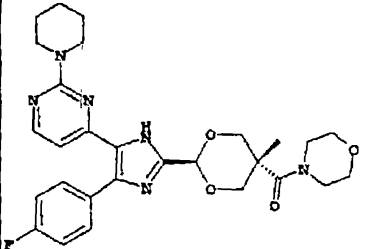

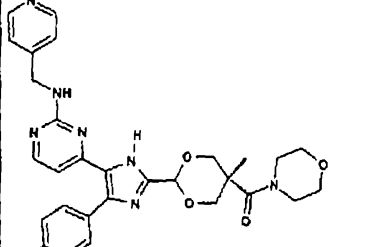
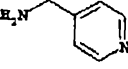
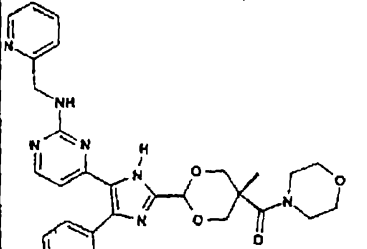
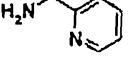
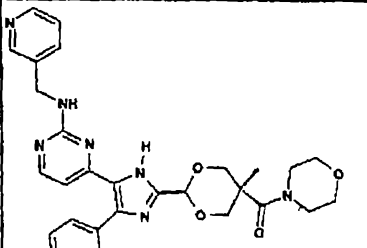
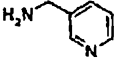
чают соединения GI-НК в таблице 7. Для соединения GI реакцию проводят в отсутствии диметилформамида в запаянном сосуде. Для соединения GW используют литио-анион анилина (генерируемый по реакции анилина с бутиллитием в тетрагидрофуране в стандартных условиях реакции) вместо циклопропиламина. Соединения GI-GL получают в виде твёрдых продуктов при обработке неочищенного продукта реакции ацетонитрилом. Приведенные в таблице 7 значения  $R_T$  означают время удерживания при жидкостной хроматографии высокого разрешения, определённое на колонке с C18 Dynamax 60Å при градиенте элюирования смесью ацетонитрила и воды, в качестве подвижной фазы, (0-12 минут, линейное возрастание от 5%-ацетонитрила до 80%-ацетонитрила; 12 минут и до конца вытекания, 80%-ацетонитрил). Приведенные в таблице 7 значения  $R_F$  определены при использовании смеси этилацетата и метанола (19:1, в отношении объёмов) [элюентом для соединений НJ и НК является смесь дихлорметана и метанола (9:1, в отношении объёмов)].

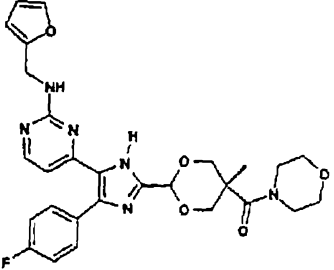

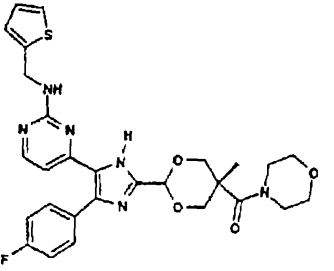

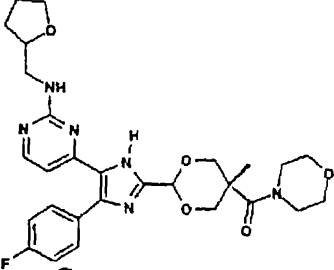
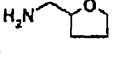
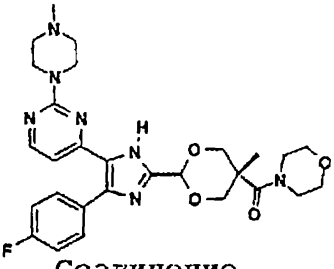
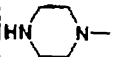
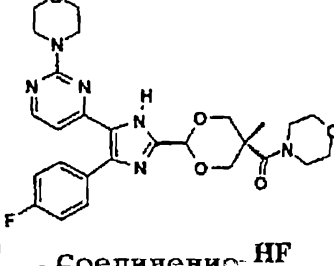

Таблица 7

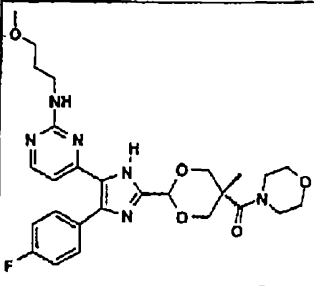
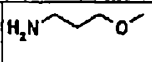
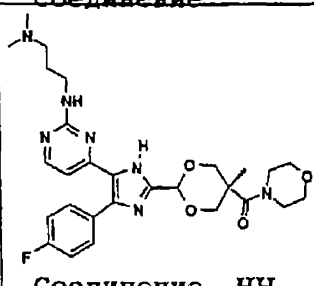

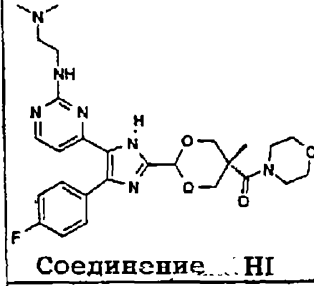
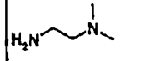
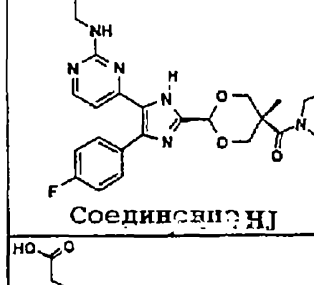
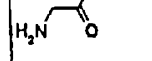
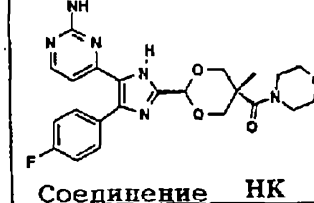
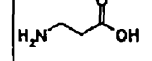
Структура и номер соединения	HNy <sup>4y5</sup>	R <sub>T</sub>	R <sub>F</sub>	Молекулярная формула	MH <sup>+</sup> (интенсивность)
 <p>Соединение GI</p>		9		C <sub>23</sub> H <sub>25</sub> FN <sub>6</sub> O <sub>4</sub>	469 (100%)
 <p>Соединение GJ</p>			0.5	C <sub>25</sub> H <sub>29</sub> FN <sub>6</sub> O <sub>4</sub>	497 (100%)
 <p>Соединение GK</p>			0.07	C <sub>26</sub> H <sub>31</sub> FN <sub>6</sub> O <sub>5</sub>	527 (100%)
 <p>Соединение GL</p>			0.19	C <sub>26</sub> H <sub>31</sub> FN <sub>6</sub> O <sub>5</sub>	527 (100%)

 <p>Соединение GM</p>		9		C24H27FN6O4	483 (100%)
 <p>Соединение GN</p>		10		C31H38FN7O6	624 (100%)
 <p>Соединение GO</p>		11		C29H35FN6O4	551 (100%)
 <p>Соединение GP</p>		8		C25H29FN6O5	513 (100%)
 <p>Соединение GQ</p>		6		C25H30FN7O4	512 (100%)

 <p>Соединение GR</p>		7		C29H33FN8O4	577 (100%)
 <p>Соединение GS</p>		7		C30H38FN7O5	596 (100%)
 <p>Соединение GT</p>		11		C30H31FN6O4	559 (100%)
 <p>Соединение GU</p>		11		C31H33FN6O4	573 (100%)
 <p>Соединение GV</p>		11		C31H33FN6O4	573 (100%)

 Соединение GW		11.5		C29H29FN6O4	545 (100%)
 Соединение GX		10		C28H33FN6O4	537 (100%)
 Соединение GY		7		C29H30FN7O4	560 (100%)
 Соединение GZ		7		C29H30FN7O4	560 (100%)
 Соединение HA		7		C29H30FN7O4	560 (100%)

 <p>Соединение HB</p>		10.5		C28H29FN6O5	549 (100%)
 <p>Соединение HC</p>		13		C28H29FN6O4S	565 (100%)
 <p>Соединение HD</p>		9		C28H33FN6O5	553 (100%)
 <p>Соединение HE</p>		7		C28H34FN7O4	552 (100%)
 <p>Соединение HF</p>		9		C27H31FN6O5	539 (100%)

 <p>Соединение HG</p>		8		C27H33FN6O5	541 (100%)
 <p>Соединение HH</p>		7		C28H36FN7O4	554 (100%)
 <p>Соединение HI</p>		7		C27H34FN7O4	540 (100%)
 <p>Соединение HJ</p>			0.22	C25H27FN6O6	527 (100%)
 <p>Соединение HK</p>			0.24	C26H29FN6O6	541 (100%)

(с) Проводя реакцию способом, аналогичным примеру 23 (b), но используя соответственно замещённый амин формулы  $\text{HNY}^4\text{Y}^5$ , получают соединения A1-A16.

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-изопропиламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1);

{2-[5-(2-аллиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A2);

{2-[5-(2-циклопропилметил-амино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A3);

{4-[5-(4-фтор-фенил)-2-[5-метил-5-(морфолин-4-карбонил)-[1,3]диоксан-2-ил]-3H-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино)-ацетонитрил, транс-изомер, (соединение A4);

3-(4-[5-(4-фтор-фенил)-2-[5-метил-5-(морфолин-4-карбонил)-[1,3]диоксан-2-ил]-3H-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино)-пропионитрил, транс-изомер, (соединение A5);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиридин-3-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A6);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиридин-4-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A7);

2-(4-[5-(4-фтор-фенил)-2-[5-метил-5-(морфолин-4-карбонил)-[1,3]диоксан-2-ил]-3H-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино)-ацетамид, транс-изомер, (соединение A8);

3-(4-[5-(4-фтор-фенил)-2-[5-метил-5-(морфолин-4-карбонил)-[1,3]диоксан-2-ил]-3H-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино)-пропионамид, транс-изомер, (соединение A9);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пропиламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-

метанон, транс-изомер, (соединение A10);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пирролидин-1-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A11);

2-[5-(2-(4-фторбензил)амино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A12);

2-[5-(2-(4-метоксибензил)амино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A13);

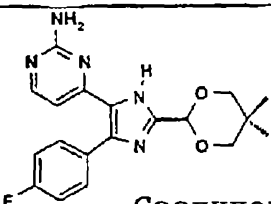
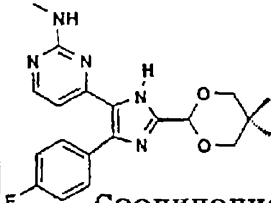
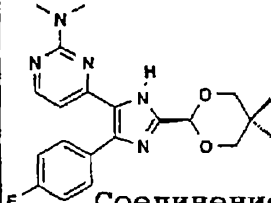
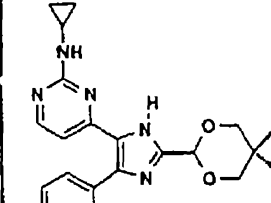

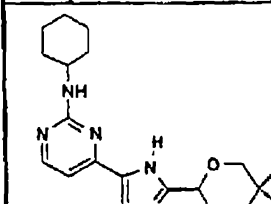
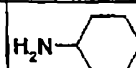
{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-(4-фторфенил)аминопиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A14);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-(3,4-дифторфенил)аминопиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A15);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-(3-метоксифенил)аминопиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A16);

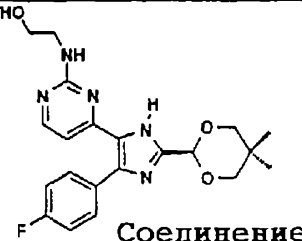

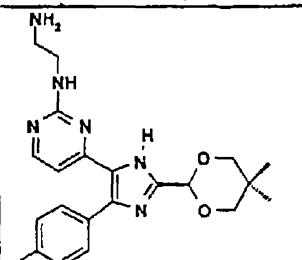

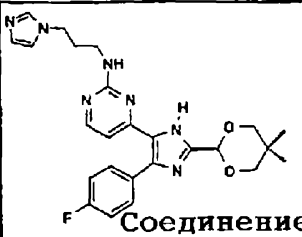

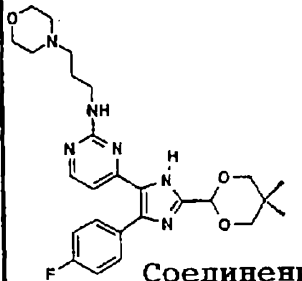

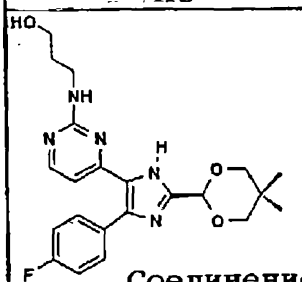

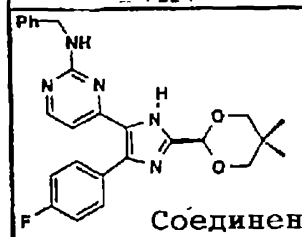

(d) Проводя реакцию способом, аналогичным примеру 23 (b), но используя 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфонил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5,5-диметил-[1,3]диоксан, (соединение KI), получают соединения HL-IN в таблице 7a.

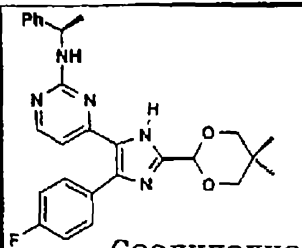
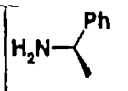
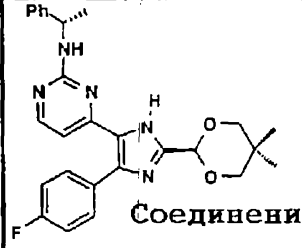
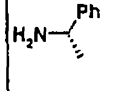
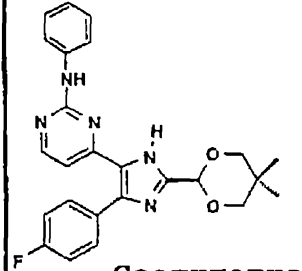
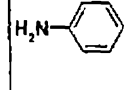

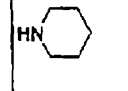
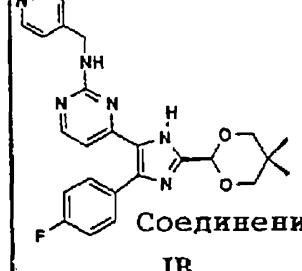
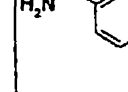
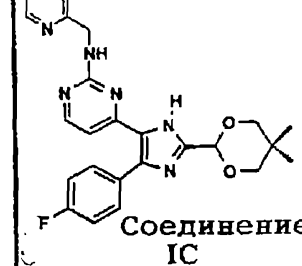
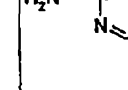
Таблица 7а

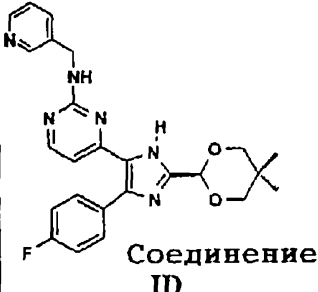
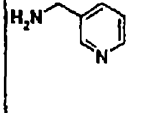

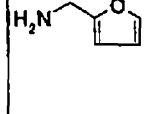
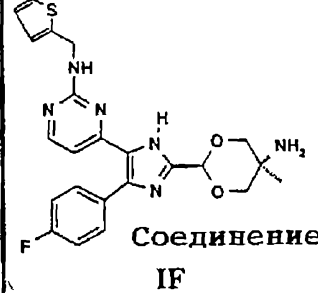
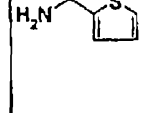
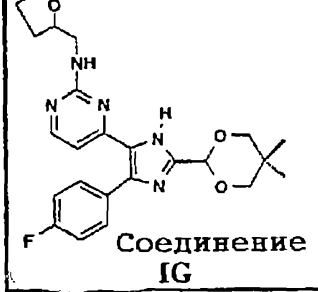

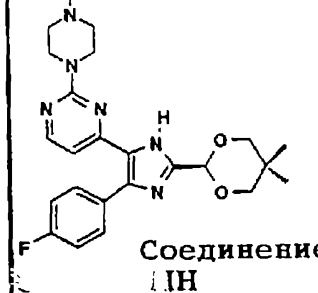
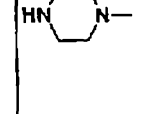
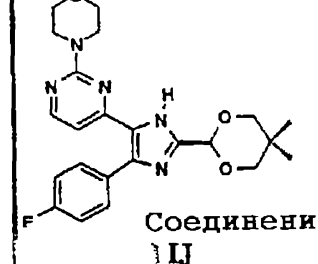
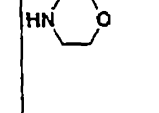
Структура и номер соединения	HN <sup>Y</sup> 4 <sup>Y</sup> 5	R <sub>T</sub>	Молекулярная формула	MH <sup>+</sup> (интенсивность)
 Соединение HL	NH <sub>2</sub>	10.31	C <sub>19</sub> H <sub>20</sub> FN <sub>5</sub> O <sub>2</sub>	370 (100%)
 Соединение HM	H <sub>2</sub> N <sup>-</sup>	10.58	C <sub>20</sub> H <sub>22</sub> FN <sub>5</sub> O <sub>2</sub>	384 (100%)
 Соединение HN	HN <sup>-</sup>	10.88	C <sub>21</sub> H <sub>24</sub> FN <sub>5</sub> O <sub>2</sub>	398 (100%)
 Соединение HO	H <sub>2</sub> N- 	11.05	C <sub>22</sub> H <sub>24</sub> FN <sub>5</sub> O <sub>2</sub>	410 (100%)
 Соединение HQ	H <sub>2</sub> N- 	12.7	C <sub>25</sub> H <sub>30</sub> FN <sub>5</sub> O <sub>2</sub>	452 (100%)



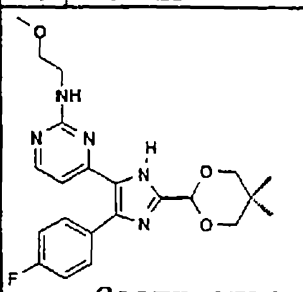
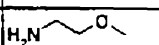



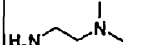
RU 2 221 795 C2

RU 2 221 795 C2

 <p>Соединение HR</p>		9.76	C21H24FN5O3	414 (100%)
 <p>Соединение HS</p>		8.85	C21H25FN6O2	413 (100%)
 <p>Соединение HT</p>		9.16	C25H25FN7O2	478 (100%)
 <p>Соединение HU</p>		9.15	C26H33FN6O3	497 (100%)
 <p>Соединение HV</p>		9.68	C22H26FN5O2	428 (100%)
 <p>Соединение HW</p>		12.4	C26H26FN5O2	446 (100%)

 <p>Соединение IX</p>		13.01	C27H28FN5O2	474 (100%)
 <p>Соединение IY</p>		13.01	C27H28FN5O2	474 (100%)
 <p>Соединение HZ</p>		12.53	C25H24FN5O2	446 (100%)
 <p>Соединение IA</p>		12.23	C24H28FN5O2	438 (100%)
 <p>Соединение IB</p>		8.97	C25H25FN6O2	461 (100%)
 <p>Соединение IC</p>		8.87	C25H25FN6O2	461 (100%)

 <p>Соединение ID</p>		8.94	C25H25FN6O2	461 (100%)
 <p>Соединение IE</p>		11.99	C24H24FN5O3	450 (100%)
 <p>Соединение IF</p>		12.3	C24H24FN5O2S	466 (100%)
 <p>Соединение IG</p>		11.29	C24H28FN5O3	454 (100%)
 <p>Соединение IH</p>		9.43	C24H29FN6O2	453 (100%)
 <p>Соединение IJ</p>		11.1	C23H26FN5O3	440 (100%)

 <p>Соединение IK</p>		11.1	C23H28FN5O3	442 (100%)
 <p>Соединение IL</p>		10.78	C22H26FN5O3	428 (100%)
 <p>Соединение IM</p>		9.07	C24H31FN6O2	455 (100%)
 <p>Соединение IN</p>		9.14	C23H29FN6O2	441 (100%)

(е) Проводя реакцию способом, аналогичным примеру 23 (d), но используя соответственно замещённый амин формулы  $\text{HNY}^4\text{Y}^5$ , получают соединения A17-A35.

{4-[2-(5,5-диметил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-уксусная кислота, (соединение A17);

3-{4-[2-(5,5-диметил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-пропионовая кислота, (соединение A18);

{4-[2-(5,5-диметил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-пиперидин-4-ил-амин, (соединение A19);

{4-[2-(5,5-диметил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-изопропил-амин, (соединение A20);

аллил-{4-[2-(5,5-диметил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-амин, (соединение A21);

циклопропилметил-{4-[2-(5,5-диметил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-амин, (соединение A22);

{4-[2-(5,5-диметил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-ацетонитрил, (соединение A23);

3-{4-[2-(5,5-диметил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-пропионитрил,

(соединение A24);

{4-[2-(5,5-диметил-[1,3] диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-пиридин-3-ил-амин, (соединение A25);

{4-[2-(5,5-диметил-[1,3] диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-пиридин-4-ил-амин, (соединение A26);

2-{4-[2-(5,5-диметил-[1,3] диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-ацетамид, (соединение A27);

3-{4-[2-(5,5-диметил-[1,3] диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-пропионамид, (соединение A28);

{4-[2-(5,5-диметил-[1,3] диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-пропил-амин, (соединение A29);

4-[2-(5,5-диметил-[1,3] диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-2-пирролидин-1-ил-пиримидин, (соединение A30);

4-фторбензил-{4-[2-(5,5-диметил-[1,3] диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-амин, (соединение A31);

4-метоксибензил-{4-[2-(5,5-диметил-[1,3] диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-амин, (соединение A32);

{4-[2-(5,5-диметил-[1,3] диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-

3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-4-фторфенил-амин, (соединение А33);

{4-[2-(5,5-диметил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-3,4-дифторфенил-амин, (соединение А34);

{4-[2-(5,5-диметил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-3-метоксифенил-амин, (соединение А35);

(f) Проводя реакцию способом, аналогичным примеру 23 (а), но используя {2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфонил-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, транс-изомер, (соединение KJ) и заменяя циклопропиламин жидким аммиаком, и проводя реакцию под давлением в течение 2 дней, получают с помощью препаративной тонкослойной хроматографии на силикагеле [элжирюя смесью дихлорметана, метанола и аммиака (90:10:2, в отношении объёмов] {2-[5-(2-амино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, транс-изомер, (соединение IO) в виде белого твёрдого вещества.  $MH^+$  386.  $R_F$ : 0,41 (растворитель такой, как указан непосредственно выше).

(g) Проводя реакцию способом, аналогичным примеру 23 (b), но используя {2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфонил-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, транс-изомер, (соединение KJ), получают соединения А36-А79.

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метиламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, транс-изомер, (соединение A36);

{2-[5-(2-диметиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, транс-изомер, (соединение A37);

{2-[5-(2-циклопропиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, транс-изомер, (соединение A38);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиперидин-4-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, транс-изомер, (соединение A39);

{2-[5-(2-циклогексиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, транс-изомер, (соединение A40);

2-{4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-гидроксиметил-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил)-3H-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-этанол, транс-изомер, (соединение A41);

{2-[5-[2-(2-амино-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, транс-изомер, (соединение A42);

[2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[3-(5H-имидазол-1-ил)-пропиламино]-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил]-метанол, транс-изомер, (соединение A43);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-морфолин-4-ил-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-

5-ил)-метанол, транс-изомер, (соединение A44);

3-{4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-гидроксиметил-5-метил-[1,3] диоксан-2-ил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-пропан-1-ол, транс-изомер, (соединение A45);

{2-[5-(2-бензиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3] диоксан-5-ил}-метанол, транс-изомер, (соединение A46);

{2-[5-(2-(4-фторбензил)амино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3] диоксан-5-ил}-метанол, транс-изомер, (соединение A47);

{2-[5-(2-(4-метоксибензил)амино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3] диоксан-5-ил}-метанол, транс-изомер (соединение A48);

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(1-фенил-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1Н-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3] диоксан-5-ил)-метанол, R-изомер, транс-изомер, (соединение A49);

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(1-фенил-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1Н-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3] диоксан-5-ил)-метанол, S-изомер, транс-изомер, (соединение A50);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-фениламино-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3] диоксан-5-ил}-метанол, транс-изомер, (соединение A51);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-(4-фторфенил)-аминопиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3] диоксан-5-ил}-метанол, транс-изомер, (соединение A52);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-(3,4-дифторфенил)-аминопиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3] диоксан-5-ил}-метанол, транс-изомер, (соединение A53);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-(3-метоксифенил)-аминопирими-

дин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-метанол, транс-изомер, (соединение A54);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пиперидин-1-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-метанол, транс-изомер, (соединение A55);

[2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиридин-4-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-метанол, транс-изомер, (соединение A56);

[2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиридин-3-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-метанол, транс-изомер, (соединение A57);

[2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиридин-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-метанол, транс-изомер, (соединение A58);

[2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(фуран-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-метанол, транс-изомер, (соединение A59);

[2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(тиофен-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-метанол, транс-изомер, (соединение A60);

[2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-метанол, транс-изомер, (соединение A61);

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-метил-пиперазин-1-ил)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-метанол, транс-изомер, (соединение A62);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-морфолин-4-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, транс-изомер, (соединение A63);

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-метокси-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-метанол, транс-изомер, (соединение A64);

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-метокси-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-метанол, транс-изомер, (соединение A65);

{2-[5-[2-(3-диметиламино-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, транс-изомер, (соединение A66);

{2-[5-[2-(2-диметиламино-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, транс-изомер, (соединение A67);

{4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-гидроксиметил-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил)-3H-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-уксусная кислота, транс-изомер, (соединение A68);

3-{4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-гидроксиметил-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил)-3H-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-пропионовая кислота, транс-изомер, (соединение A69);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-изопропиламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, транс-изомер, (соединение A70);

{2-[5-(2-аллиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, транс-

изомер, (соединение A71);

{2-[5-[2-(циклопропилметил-амино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, транс-изомер, (соединение A72);

{4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-гидроксиметил-5-метил-[1,3]-диоксан-2-ил)-3H-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-ацетонитрил, транс-изомер, (соединение A73);

3-{4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-гидроксиметил-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил)-3H-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-пропионитрил, транс-изомер, (соединение A74);

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиридин-3-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-метанол, транс-изомер, (соединение A75);

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиридин-4-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-метанол, транс-изомер, (соединение A76);

2-{4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-гидроксиметил-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил)-3H-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-ацетамид, транс-изомер, (соединение A77);

3-{4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-гидроксиметил-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил)-3H-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-пропионамид, транс-изомер, (соединение A78);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пропиламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, транс-изомер, (соединение A79);

(h) Проводя реакцию способом, аналогичным примеру 23

(g), но используя {2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфонил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, цис-изомер, (соединение KK), получают цис-изомеры соединений A36-A79.

(i) Проводя реакцию способом, аналогичным примеру 23 (b), но используя 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфонил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метилен-[1,3]диоксан, (соединение KL), получают соединения A80-A125:

4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-метилен-[1,3]диоксан-2-ил)-3H-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламин, (соединение A80);

{4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-метилен-[1,3]диоксан-2-ил)-3H-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-метил-амин, (соединение A81);

{4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-метилен-[1,3]диоксан-2-ил)-3H-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-диметил-амин, (соединение A82);

циклопропил-{4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-метилен-[1,3]диоксан-2-ил)-3H-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-амин, (соединение A83);

{4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-метилен-[1,3]диоксан-2-ил)-3H-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-пиперидин-4-ил-амин, (соединение A84);

циклотексил-{4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-метилен-[1,3]диоксан-2-ил)-3H-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-амин, (соединение A85);

2-{4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-метилен-[1,3]диоксан-2-ил)-

3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-этанол, (соединение А86);

N1-{4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-метилен-[1,3]диоксан-2-ил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-этан-1,2-диамин, (соединение А87);

{4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-метилен-[1,3]диоксан-2-ил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-[3-(5Н-имидазол-1-ил)-пропил]-амин, (соединение А88);

{4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-метилен-[1,3]диоксан-2-ил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-[3-морфолин-4-ил-пропил]-амин, (соединение А89);

3-{4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-метилен-[1,3]диоксан-2-ил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-пропан-1-ол, (соединение А90);

бензил-{4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-метилен-[1,3]диоксан-2-ил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-амин, (соединение А91);

4-фторбензил-{4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-метилен-[1,3]диоксан-2-ил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-амин, (соединение А92);

4-метоксибензил-{4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-метилен-[1,3]диоксан-2-ил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-амин, (соединение А93);

{4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-метилен-[1,3]диоксан-2-ил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-(1-фенил-этил)-амин, R-изомер, (соединение А94);

{4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-метилен-[1,3] диоксан-2-ил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-(1-фенил-этил)-амин, S-изомер, (соединение A95);

{4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-метилен-[1,3] диоксан-2-ил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-фенил-амин, (соединение A96);

{4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-метилен-[1,3] диоксан-2-ил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-4-фторфенил-амин, (соединение A97);

{4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-метилен-[1,3] диоксан-2-ил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-3,4-дифторфенил-амин, (соединение A98);

{4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-метилен-[1,3] диоксан-2-ил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-3-метоксифенил-амин, (соединение A99);

4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-метилен-[1,3] диоксан-2-ил)-3Н-имидазол-4-ил]-2-пиперидин-1-ил-пиримидин, (соединение A100);

{4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-метилен-[1,3] диоксан-2-ил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-пиридин-4-илметил-амин, (соединение A101);

{4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-метилен-[1,3] диоксан-2-ил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-пиридин-3-илметил-амин, (соединение A102);

{4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-метилен-[1,3] диоксан-2-ил)-

3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-пиридин-2-илметил-амин,  
(соединение А103);

{4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-метилен-[1,3]диоксан-2-ил)-  
3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-(фуран-2-илметил)-амин,  
(соединение А104);

{4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-метилен-[1,3]диоксан-2-ил)-  
3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-(тиофен-2-илметил)-амин,  
(соединение А105);

{4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-метилен-[1,3]диоксан-2-ил)-  
3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-(тетрагидро-фуран-2-ил-  
метил)-амин, (соединение А106);

4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-метилен-[1,3]диоксан-2-ил)-3Н-  
имидазол-4-ил]-2-(4-метил-пиперазин-1-ил)пиримидин,  
(соединение А107);

4-{4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-метилен-[1,3]диоксан-2-ил)-  
3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-морфолин, (соединение  
А108);

{4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-метилен-[1,3]диоксан-2-ил)-  
3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-(3-метокси-пропил)-амин,  
(соединение А109);

{4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-метилен-[1,3]диоксан-2-ил)-  
3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-(2-метокси-этил)-амин,  
(соединение А110);

N-{4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-метилен-[1,3]диоксан-2-ил)-  
3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-N',N'-диметил-пропан-1,3-  
диамин, (соединение А111);

N-{4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-метилен-[1,3]диоксан-2-ил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-N', N'-диметил-этан-1,2-диамин, (соединение A112);

{4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-метилен-[1,3]диоксан-2-ил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-уксусная кислота, (соединение A113);

3-{4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-метилен-[1,3]диоксан-2-ил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-пропионовая кислота, (соединение A114);

{4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-метилен-[1,3]диоксан-2-ил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-изопропил-амин, (соединение A115);

аллил-{4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-метилен-[1,3]диоксан-2-ил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-амин, (соединение A116);

циклопропилметил-{4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-метилен-[1,3]диоксан-2-ил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-амин, (соединение A117);

{4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-метилен-[1,3]диоксан-2-ил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-ацетонитрил, (соединение A118);

3-{4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-метилен-[1,3]диоксан-2-ил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-пропионитрил, (соединение A119);

{4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-метилен-[1,3]диоксан-2-ил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-пиридин-3-ил-амин, (соеди-

нение A120);

{4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-метилден-[1,3] диоксан-2-ил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-пиридин-4-ил-амин, (соединение A121);

2-{4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-метилден-[1,3] диоксан-2-ил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-ацетамид, (соединение A122);

3-{4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-метилден-[1,3] диоксан-2-ил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-пропионамид, (соединение A123);

{4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-метилден-[1,3] диоксан-2-ил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-пропил-амин, (соединение A124);

4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-метилден-[1,3] диоксан-2-ил)-3Н-имидазол-4-ил]-2-пирролидин-1-ил-пиримидин, (соединение A125);

(j) Проводя реакцию способом, аналогичным примеру 23 (b), но используя 4-[2-[1,3] диоксан-2-ил-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-2-метилсульфонил-пиримидин, (соединение KM), получают соединения A126-A170:

4-[2-[1,3] диоксан-2-ил-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламин, (соединение A126);

{4-[2-[1,3] диоксан-2-ил-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-метил-амин, (соединение A127);

{4-[2-[1,3] диоксан-2-ил-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-диметил-амин, (соединение A128);

циклопропил-{4-[2-[1,3] диоксан-2-ил-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-амин, (соединение A129);

{4-[2-[1,3] диоксан-2-ил-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-пиперидин-4-ил-амин, (соединение A130);

циклогексил-{4-[2-[1,3] диоксан-2-ил-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-амин, (соединение A131);

2-{4-[2-[1,3] диоксан-2-ил-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-этанол, (соединение A132);

N1-{4-[2-[1,3] диоксан-2-ил-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-этан-1,2-диамин, (соединение A133);

{4-[2-[1,3] диоксан-2-ил-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-[3-(5Н-имидазол-1-ил)-пропил]-амин, (соединение A134);

{4-[2-[1,3] диоксан-2-ил-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-(3-морфолин-4-ил-пропил)-амин, (соединение A135);

3-{4-[2-[1,3] диоксан-2-ил-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-пропан-1-ол, (соединение A136);

бензил-{4-[2-[1,3] диоксан-2-ил-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-амин, (соединение A137);

4-фторбензил-{4-[2-[1,3] диоксан-2-ил-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-амин, (соединение A138);

4-метоксибензил-{4-[2-[1,3] диоксан-2-ил-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-амин, (соединение A139);

{4-[2-[1,3] диоксан-2-ил-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-(1-фенил-этил)-амин, R-изомер, (соединение A140);

{4-[2-[1,3] диоксан-2-ил-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-(1-фенил-этил)-амин, S-изомер, (соединение A141);

{4-[2-[1,3] диоксан-2-ил-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-фенил-амин, (соединение A142);

{4-[2-[1,3] диоксан-2-ил-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-(4-фторфенил)-амин, (соединение A143);

{4-[2-[1,3] диоксан-2-ил-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-(3,4-дифторфенил)-амин, (соединение A144);

{4-[2-[1,3] диоксан-2-ил-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-(4-метоксифенил)-амин, (соединение A145);

{4-[2-[1,3] диоксан-2-ил-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-2-пиперидин-1-ил-пиримидин, (соединение A146);

{4-[2-[1,3] диоксан-2-ил-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-пиридин-4-илметил-амин, (соединение A147);

{4-[2-[1,3] диоксан-2-ил-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-пиридин-3-илметил-амин, (соединение A148);

{4-[2-[1,3] диоксан-2-ил-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-пиридин-2-илметил-амин, (соединение

A149);

{4-[2-[1,3]диоксан-2-ил-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-(фуран-2-илметил)-амин (соединение A150);

{4-[2-[1,3]диоксан-2-ил-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амин, (соединение A151);

4-[2-[1,3]диоксан-2-ил-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-2-(4-метил-пиперазин-1-ил)-пиримидин, (соединение A152);

4-{4-[2-[1,3]диоксан-2-ил-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-морфолин, (соединение A153);

{4-[2-[1,3]диоксан-2-ил-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-(3-метокси-пропил)-амин, (соединение A154);

{4-[2-[1,3]диоксан-2-ил-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-(2-метокси-этил)-амин, (соединение A155);

N-{4-[2-[1,3]диоксан-2-ил-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-N', N'-диметилпропан-1,3-диамин, (соединение A156);

N-{4-[2-[1,3]диоксан-2-ил-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-N', N'-диметилэтан-1,2-диамин, (соединение A157);

{4-[2-[1,3]диоксан-2-ил-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-уксусная кислота, (соединение A158);

3-{4-[2-[1,3]диоксан-2-ил-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-пропионовая кислота, (соединение A159);

{4-[2-[1,3]диоксан-2-ил-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-изопропил-амин, (соединение A160);

аллил-{4-[2-[1,3]диоксан-2-ил-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-амин, (соединение A161);

циклопропилметил-{4-[2-[1,3]диоксан-2-ил-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-амин, (соединение A162);

{4-[2-[1,3]диоксан-2-ил-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-ацетонитрил, (соединение A163);

3-{4-[2-[1,3]диоксан-2-ил-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-пропионитрил, (соединение A164);

{4-[2-[1,3]диоксан-2-ил-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-пиридин-3-ил-амин, (соединение A165);

{4-[2-[1,3]диоксан-2-ил-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-пиридин-4-ил-амин, (соединение A166);

2-{4-[2-[1,3]диоксан-2-ил-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-ацетамид, (соединение A167);

3-{4-[2-[1,3]диоксан-2-ил-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-пропионамид, (соединение A168);

{4-[2-[1,3]диоксан-2-ил-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-пропил-амин, (соединение A169);

4-[2-[1,3]диоксан-2-ил-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-2-гирролидин-1-ил-пиримидин, (соединение A170);

(k) Проводя реакцию способом, аналогичным примеру 23 (b), но используя {2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфонил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, транс-изомер, (соединение KN), получают соединения A171-A215:

{2-[5-(2-амино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, транс-изомер, (соединение A171);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метиламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, транс-изомер, (соединение A172);

{2-[5-(2-диметиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, транс-изомер, (соединение A173);

{2-[5-(2-циклопропиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, транс-изомер, (соединение A174);

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиперидин-4-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, транс-изомер, (соединение A175);

{2-[5-(2-циклогексиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, транс-изомер, (соединение A176);

2-{4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-гидроксиметил-[1,3]диоксан-2-ил)-3H-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-этанол, транс-изомер, (соединение A177);

{2-[5-[2-(2-амино-этиламино) пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, транс-изомер, (соединение A178);

[2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[3-(5Н-имидазол-1-ил)-пропил-амино]-пиримидин-4-ил}-1Н-имидазол-2-ил)-[1,3]диоксан-5-ил]-метанол, транс-изомер, (соединение A179);

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-морфолин-4-ил-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1Н-имидазол-2-ил}-[1,3]диоксан-5-ил)-метанол, транс-изомер, (соединение A180);

3-{4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-гидроксиметил-[1,3]диоксан-2-ил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-пропан-1-ол, транс-изомер, (соединение A181);

{2-[5-(2-бензиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, транс-изомер, (соединение A182);

{2-[5-(2-(4-фторбензил)амино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, транс-изомер, (соединение A183);

{2-[5-(2-(4-метоксибензил)амино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, транс-изомер, (соединение A184);

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(1-фенил-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1Н-имидазол-2-ил}-[1,3]диоксан-5-ил)-метанол, R-изомер, транс-изомер, (соединение A185);

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(1-фенил-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1Н-имидазол-2-ил}-[1,3]диоксан-5-ил)-метанол, S-

изомер, транс-изомер, (соединение A186);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-фениламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, транс-изомер, (соединение A187);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-(4-фторфенил)амино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, транс-изомер, (соединение A188);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-(3,4-дифторфенил)амино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, транс-изомер, (соединение A189);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-(4-метоксифенил)амино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, транс-изомер, (соединение A190);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пиперидин-1-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, транс-изомер, (соединение A191);

{2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиридин-4-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, транс-изомер, (соединение A192);

{2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиридин-3-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, транс-изомер, (соединение A193);

{2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиридин-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, транс-изомер, (соединение A194);

[2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(фуран-2-илметил)-амино]-пи-

римидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил)-[1,3]диоксан-5-ил]-метанол, транс-изомер, (соединение A195);

[2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(тиофен-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил)-[1,3]диоксан-5-ил]-метанол, транс-изомер, (соединение A196);

[2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил)-[1,3]диоксан-5-ил]-метанол, транс-изомер, (соединение A197);

[2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-метил-пиперазин-1-ил)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил)-[1,3]диоксан-5-ил]-метанол, транс-изомер, (соединение A198);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-морфолин-4-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-[1,3]диоксан-5-ил]-метанол, транс-изомер, (соединение A199);

{2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-метокси-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил)-[1,3]диоксан-5-ил]-метанол, транс-изомер, (соединение A200);

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-метокси-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил)-[1,3]диоксан-5-ил)-метанол, транс-изомер, (соединение A201);

{2-[5-[2-(3-диметиламино-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-[1,3]диоксан-5-ил]-метанол, транс-изомер, (соединение A202);

{2-[5-[2-(2-диметиламино-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-[1,3]диоксан-5-ил]-метанол, транс-изомер, (соединение A203);

{4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-гидроксиметил-[1,3]диоксан-2-ил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-уксусная кислота, транс-изомер, (соединение A204);

3-{4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-гидроксиметил-[1,3]диоксан-2-ил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-пропионовая кислота, транс-изомер, (соединение A205);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-изопропиламино-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, транс-изомер, (соединение A206);

{2-[5-(2-аллиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, транс-изомер, (соединение A207);

{2-[5-[2-(изопропилметил-амино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, транс-изомер, (соединение A208);

{4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-гидроксиметил-[1,3]диоксан-2-ил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-ацетонитрил, транс-изомер, (соединение A209);

3-{4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-гидроксиметил-[1,3]диоксан-2-ил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-пропионитрил, транс-изомер, (соединение A210);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиридин-3-иламино)-пиримидин-4-ил]-1Н-имидазол-2-ил]-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, транс-изомер, (соединение A211);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиридин-4-иламино)-пиримидин-4-ил]-1Н-имидазол-2-ил]-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол,

транс-изомер, (соединение A212);

2-{4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-гидроксиметил-[1,3]диоксан-2-ил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-ацетамид,

транс-изомер, (соединение A213);

3-{4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-гидроксиметил-[1,3]диоксан-2-ил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-пропионамид,

транс-изомер, (соединение A214);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пропиламино-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, транс-изомер, (соединение A215);

(I) Проводя реакцию способом, аналогичным примеру 23 (к), но используя {2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфонил-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, цис-изомер, (соединение KO), получают соответствующие цис-изомеры соединений A171-A215.



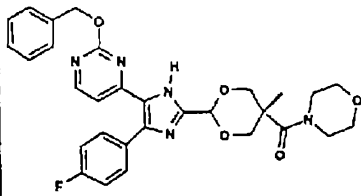
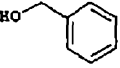
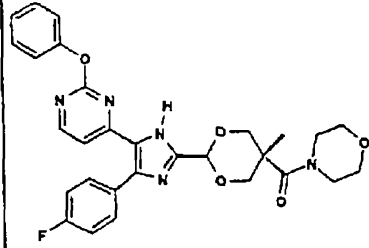
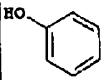
Пример 24

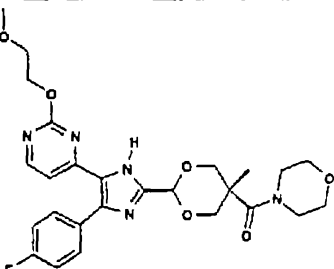
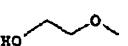
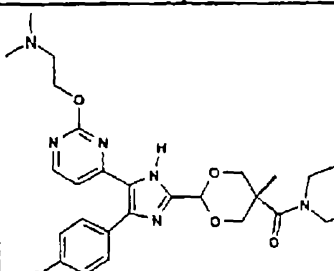
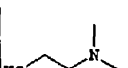
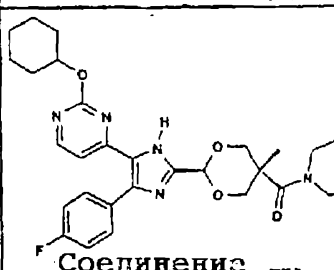
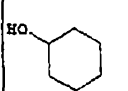
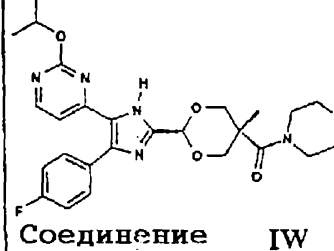
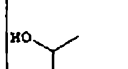
#### Соединения IP-IW

а) Перемешиваемый раствор 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-метилсульфонилпиримидин-4-ил]-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-метанона, транс-изомера, (1 эквивалент, соединение KN) и соответственно замещённого спирта или фенола [5 эквивалентов, см. таблицу 8] в сухом диметилформамиде при комнатной температуре обрабатывают гидридом натрия [6 эквивалентов]. После перемешивания в течение 16 часов реакционную смесь упаривают и остаток распределяют между водой и этилацетатом. Органическую фазу

упаривают, получая соединения IP-IW, изображённые в таблице 8. Приведенные в таблице 8 значения  $R_f$  определены при использовании смеси этилацетата и метанола (9:1, в отношении объёмов) в качестве элюента [элюентом для соединения IT является смесь этилацетата и метанола (1:1, в отношении объёмов)].

Таблица 8

Структура и номер соединения	R17OH	$R_f$	Молекулярная формула	$MH^+$ (интенсивность)
 Соединение IP		0.37	C <sub>24</sub> H <sub>26</sub> FN <sub>5</sub> O <sub>5</sub>	484 (100%)
 Соединение IQ		0.45	C <sub>30</sub> H <sub>30</sub> FN <sub>5</sub> O <sub>5</sub>	560 (100%)
 Соединение IR		0.41	C <sub>29</sub> H <sub>28</sub> FN <sub>5</sub> O <sub>5</sub>	546 (100%)

 Соединение IS		0.28	C <sub>26</sub> H <sub>30</sub> FN <sub>5</sub> O <sub>6</sub>	528 (100%)
 Соединение IT		0.19	C <sub>27</sub> H <sub>33</sub> FN <sub>6</sub> O <sub>5</sub>	541 (100%)
 Соединение IU		0.43	C <sub>29</sub> H <sub>34</sub> FN <sub>5</sub> O <sub>5</sub>	552 (100%)
 Соединение IW		0.43	C <sub>26</sub> H <sub>30</sub> FN <sub>5</sub> O <sub>5</sub>	512 (100%)

(b) Проводя реакцию способом, аналогичным примеру 24 (a), получают соединения A216-A219.

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-гидроксипиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]дисксан-5-ил}-морфолин-4-ил-метанол, транс-изомер, (соединение A216);

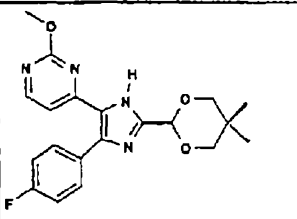
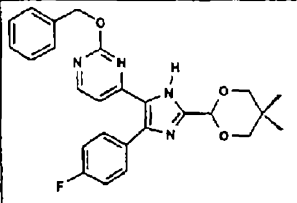

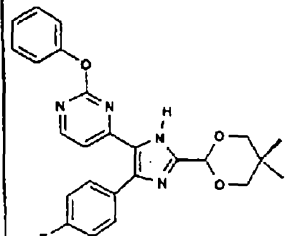

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пропокси-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A217);

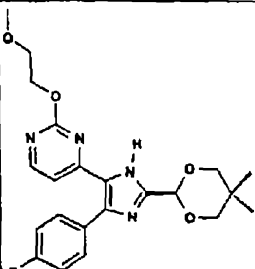

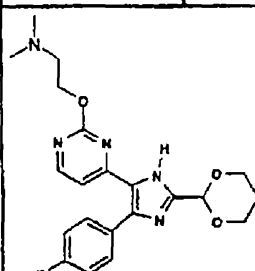
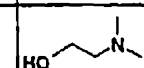
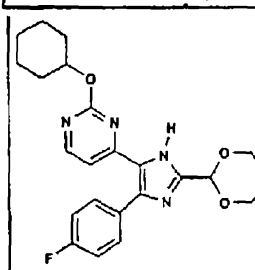
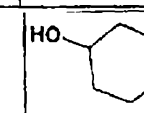
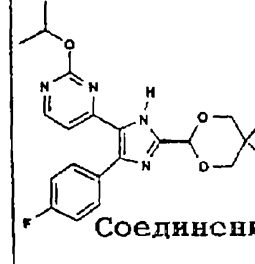
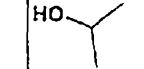
(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-гидрокси-этоксипиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A218);

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-гидрокси-пропокси)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A219);

(с) Проводя реакцию способом, аналогичным примеру 24 (а), но используя 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфонил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5,5-диметил-[1,3]диоксан, (соединение KI), получают соединения IY-JE в таблице 8а.

ТАБЛИЦА 8а

 <p>Соединение IY</p>	HO-	11.44	C <sub>20</sub> H <sub>21</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	386 (100%)
 <p>Соединение IZ</p>	HO- 	13.40	C <sub>26</sub> H <sub>25</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	461 (100%)
 <p>Соединение JA</p>	HO- 	13.15	C <sub>25</sub> H <sub>23</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	447 (100%)

 <p>Соединение JB</p>		11.08	C22H25FN4O4	429 (100%)
 <p>Соединение JC</p>		9.60	C23H28FN5O3	442 (100%)
 <p>Соединение JD</p>		13.52	C25H29FN4O3	453 (100%)
 <p>Соединение JE</p>		12.14	C22H25FN4O3	413 (100%)

(d) Проводя реакцию способом, аналогичным примеру 24 (с), получают соединения A220-A222.

4-[2-(5,5-диметил)-[1,3]диоксан-2-ил]-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пропокси-пиримидин, (соединение A220);

2-{4-[2-(5,5-диметил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-илокси}-этанол, (соединение A221);

3-{4-[2-(5,5-диметил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-илокси}-пропан-1-ол, (соединение A222);

(e) Проводя реакцию способом, аналогичным примеру 24 (а), но используя {2-[5-(2-метансульфонил-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, транс-изомер, (соединение KJ), получают соединения A223-A232:

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метокси-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, транс-изомер, (соединение A223);

{2-[5-(2-бензилокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, транс-изомер, (соединение A224);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-фенокси-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, транс-изомер, (соединение A225);

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-метокси-этокси)-пиримидин-4-ил]-1Н-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-метанол,

транс-изомер, (соединение A226);

{2-[5-[2-(2-диметиламино-этокси)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, транс-изомер, (соединение A227);

{2-[5-(2-циклогексилокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, транс-изомер, (соединение A228);

{2-[5-(2-изопропокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, транс-изомер, (соединение A229);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пропокси-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, транс-изомер, (соединение A230);

2-{4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-гидроксиметил-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил)-3H-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-илокси}-этанол, транс-изомер, (соединение A231);

3-{4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-гидроксиметил-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил)-3H-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-илокси}-пропан-1-ол, транс-изомер, (соединение A232);

(f) Проводя реакцию способом, аналогичным примеру 24 (e), но используя {2-[5-(2-метансульфонил-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, цис-изомер, (соединение KK), получают соответствующие цис-изомеры соединений A223-A232.

(g) Проводя реакцию способом, аналогичным примеру 24

(а), но используя {2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфонил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, транс-изомер, (соединение KN), получают соединения A233-A242:

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метокси-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, транс-изомер, (соединение A233);

{2-[5-(2-бензилокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, транс-изомер, (соединение A234);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-фенокси-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, транс-изомер, (соединение A235);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-метокси-этокси)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, транс-изомер, (соединение A236);

{2-[5-[2-(2-диметиламино-этокси)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, транс-изомер, (соединение A237);

{2-[5-(2-циклогексилокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, транс-изомер, (соединение A238);

{2-[5-(2-изопропокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, транс-изомер, (соединение A239);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пропокси-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, транс-изомер, (соединение A240);

2-{4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-гидроксиметил-[1,3]диоксан-2-ил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-илокси}-этанол, транс-изомер, (соединение A241);

3-{4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-гидроксиметил-[1,3]диоксан-2-ил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-илокси}-пропан-1-ол, транс-изомер, (соединение A242);

(h) Проводя реакцию способом, аналогичным примеру 24 (g), но используя {2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфонил-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, цис-изомер, (соединение KO), получают соответствующие цис-изомеры соединений A233-A242.

(i) Проводя реакцию способом, аналогичным примеру 24 (a), но используя {2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфонилпиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метилден-[1,3]диоксан, (соединение KL), получают соединения A243-A252:

4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-метилден-[1,3]диоксан-2-ил)-3Н-имидазол-4-ил]-2-метокси-пиримидин, (соединение A243);

2-бензилокси-4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-метилден-[1,3]диоксан-2-ил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин, (соединение A244);

4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-метилден-[1,3]диоксан-2-ил)-3Н-имидазол-4-ил]-2-фенокси-пиримидин, (соединение A245);

4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-метилден-[1,3]диоксан-2-ил)-3Н-имидазол-4-ил]-2-(2-метокси-этокси)-пиримидин, (соединение

A246);

(2-{4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-метилен-[1,3]диоксан-2-ил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-илокси}-этил)-диметил-амин, (соединение A247);

2-циклогексилокси-4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-метилен-[1,3]диоксан-2-ил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин, (соединение A248);

2-циклопропокси-4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-метилен-[1,3]диоксан-2-ил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин, (соединение A249);

4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-метилен-[1,3]диоксан-2-ил)-3Н-имидазол-4-ил]-2-пропокси-пиримидин, (соединение A250);

(2-{4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-метилен-[1,3]диоксан-2-ил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-илокси}-этанол, (соединение A251);

3-{4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-метилен-[1,3]диоксан-2-ил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-илокси}-пропан-1-ол, (соединение A252);

(j) Проводя реакцию способом, аналогичным примеру 24, (а), но используя 4-[2-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-2-метилсульфонил-пиримидин, (соединение КМ), получают соединения A253-A262:

4-[2-[1,3]диоксан-2-ил-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-2-метокси-пиримидин, (соединение A253);

2-бензилокси-4-[2-[1,3]диоксан-2-ил-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин, (соединение A254);

4-[2-[1,3]диоксан-2-ил-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-2-фенокси-пиримидин, (соединение A255);

4-[2-[1,3]диоксан-2-ил-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-2-(2-метокси-этокси)-пиримидин, (соединение A256);

(2-{4-[2-[1,3]диоксан-2-ил-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-илокси}-этил)-диметил-амин, (соединение A257);

2-циклогексилокси-4-[2-[1,3]диоксан-2-ил-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин, (соединение A258);

2-изопропилокси-4-[2-[1,3]диоксан-2-ил-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин, (соединение A259);

4-[2-[1,3]диоксан-2-ил-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-2-пропокси-пиримидин, (соединение A260);

2-{4-[2-[1,3]диоксан-2-ил-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-илокси}-этанол, (соединение A261);

3-{4-[2-[1,3]диоксан-2-ил-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-илокси}-пропан-1-ол, (соединение A262).

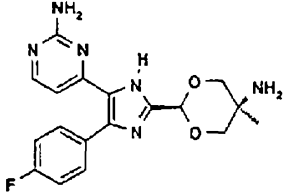
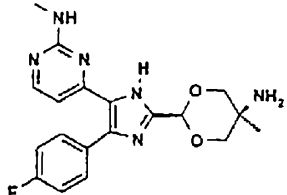
Пример 25

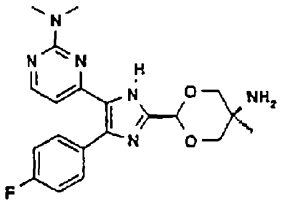

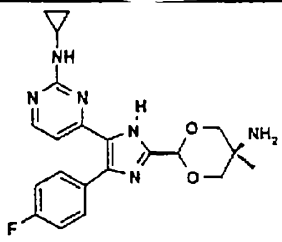

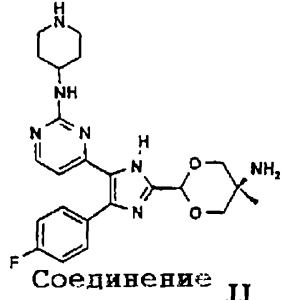
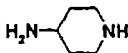
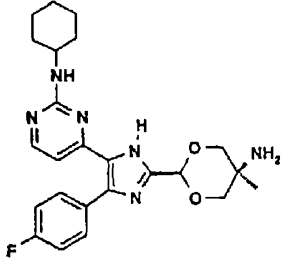
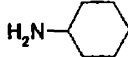
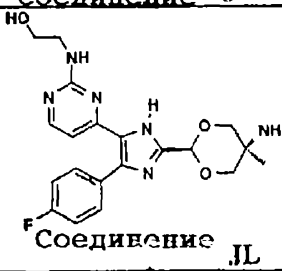
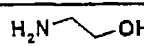
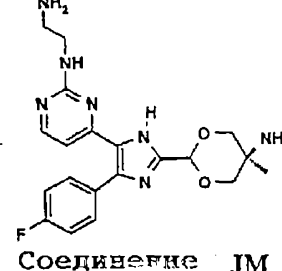

#### Соединения JF-KG

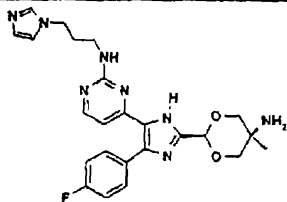
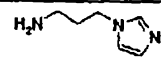
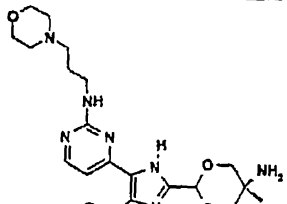
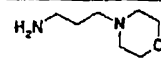
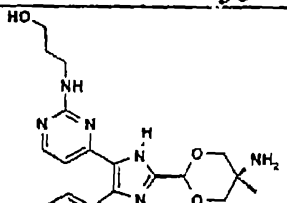
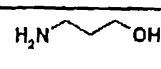
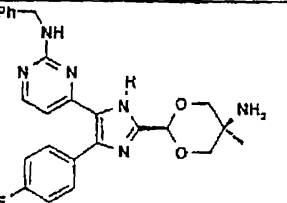
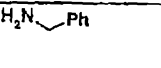
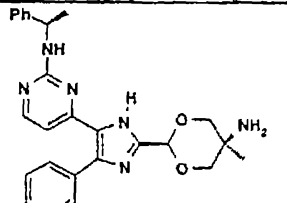
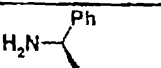
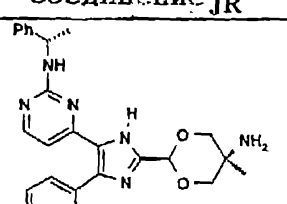
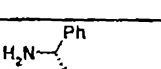
а) Раствор 2,2,2-трифтор-N-[2-{4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метансульфонилпиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил]-ацетамида, цис-изомера, (1 эквивалент, соединение KP) и соответственно замещённого амина формулы  $\text{HNY}^4\text{Y}^5$  [5 эквивалентов, см. таблицу 9] в сухом диметил-формамиде нагревают до 100°C в течение 8 часов (или в случае JF реакция идёт в отсутствие растворителя в сосуде под


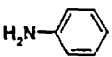
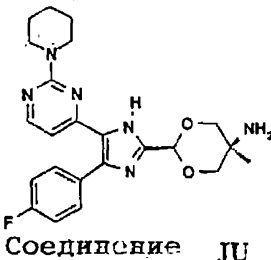

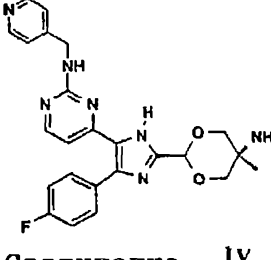
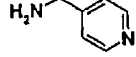
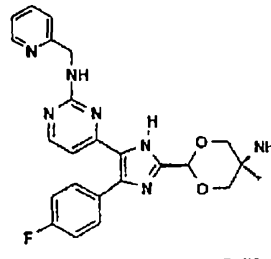
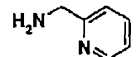
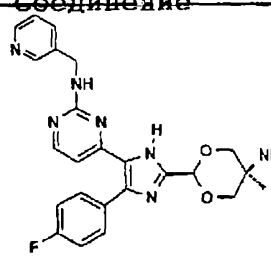
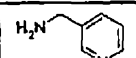
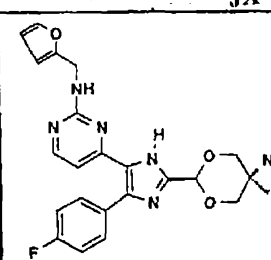
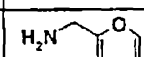
давлением. Затем реакционную смесь обрабатывают водным раствором карбоната калия (2 эквивалента) и после этого нагревают до 100°C 24 часа. Смесь распределяют между водой и дихлорметаном. Органическую фазу отделяют, упаривают и остаток подвергают жидкостной хроматографии высокого разрешения на колонке с C18 Dynamax 60Å при градиенте элюирования смесью ацетонитрила и воды, в качестве подвижной фазы, (0-3 минуты, 20%-ацетонитрил; 2-15 минут, линейное возрастание до 80%-ацетонитрила; 16 минут и до конца вытекания 80%-ацетонитрил) и УФ-детектировании при 254 нм, что даёт соединения JF-KG, изображённые в таблице 9. Приведенные в таблице 9 значения  $R_T$  означают время удерживания при жидкостной хроматографии высокого разрешения, определённое как указано выше.

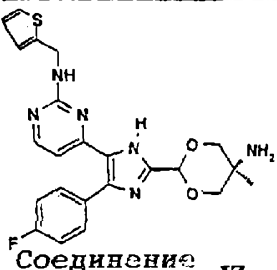
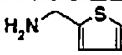


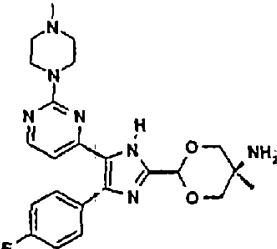
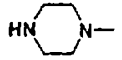
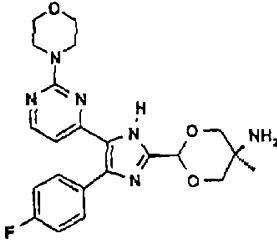

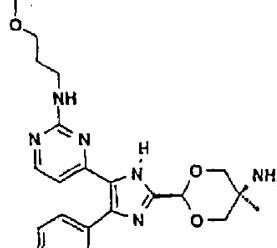

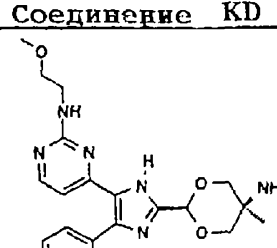
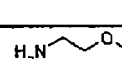
Таблица 9

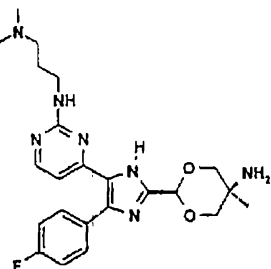

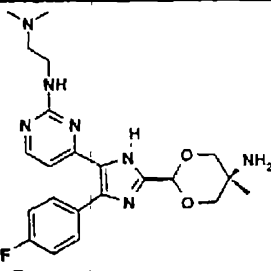

Структура и номер соединения	НУЧ4У5	$R_T$ минуты	Молекулярная формула	$MH^+$ (интенсивность)
 Соединение JF	$NH_3$	11.41	$C_{18}H_{19}FN_6O_2$	371 (100%)
 Соединение JG	$H_2N$	11.65	$C_{19}H_{21}FN_6O_2$	385 (100%)

 <p>Соединение JH</p>		11.85	C <sub>20</sub> H <sub>23</sub> FN <sub>6</sub> O <sub>2</sub>	399 (100%)
 <p>Соединение JI</p>		12.10	C <sub>21</sub> H <sub>23</sub> FN <sub>6</sub> O <sub>2</sub>	411 (100%)
 <p>Соединение JJ</p>		2.70	C <sub>23</sub> H <sub>28</sub> FN <sub>7</sub> O <sub>2</sub>	454 (100%)
 <p>Соединение JK</p>		10.91	C <sub>24</sub> H <sub>29</sub> FN <sub>6</sub> O <sub>2</sub>	453 (100%)
 <p>Соединение JL</p>		10.30	C <sub>20</sub> H <sub>23</sub> FN <sub>6</sub> O <sub>3</sub>	415 (100%)
 <p>Соединение JM</p>		1.96	C <sub>20</sub> H <sub>24</sub> FN <sub>7</sub> O <sub>2</sub>	414 (100%)

 <p>Соединение JN</p>		1.98	C <sub>24</sub> H <sub>27</sub> FN <sub>8</sub> O <sub>2</sub>	479 (100%)
 <p>Соединение JO</p>		2.02	C <sub>25</sub> H <sub>32</sub> FN <sub>7</sub> O <sub>3</sub>	498 (100%)
 <p>Соединение JP</p>		10.40	C <sub>21</sub> H <sub>25</sub> FN <sub>6</sub> O <sub>2</sub>	413 (100%)
 <p>Соединение JQ</p>		10.18	C <sub>25</sub> H <sub>25</sub> FN <sub>6</sub> O <sub>2</sub>	461 (100%)
 <p>Соединение JR</p>		10.91	C <sub>26</sub> H <sub>27</sub> FN <sub>6</sub> O <sub>2</sub>	475 (100%)
 <p>Соединение JS</p>		10.91	C <sub>26</sub> H <sub>27</sub> FN <sub>6</sub> O <sub>2</sub>	475 (100%)

 <p>Соединение JT</p>		11.01	C24H23FN6O2	447 (100%)
 <p>Соединение JU</p>		13.15	C23H27FN6O2	439 (100%)
 <p>Соединение JV</p>		3.95	C24H24FN7O2	462 (100%)
 <p>Соединение JW</p>		2.14	C24H24FN7O2	462 (100%)
 <p>Соединение JX</p>		1.96	C24H24FN7O2	462 (100%)
 <p>Соединение JY</p>		11.93	C23H23FN6O3	451 (100%)

 <p>Соединение JZ</p>		12.10	C23H23FN6O2S	467 (100%)
 <p>Соединение KA</p>		12.44	C23H27FN6O3	455 (100%)
 <p>Соединение KB</p>		2.10	C23H28FN7O2	454 (100%)
 <p>Соединение KC</p>		12.20	C22H25FN6O3	441 (100%)
 <p>Соединение KD</p>		11.10	C22H27FN6O3	443 (100%)
 <p>Соединение KE</p>		11.86	C21H25FN6O3	429 (100%)

 Соединение KF		2.02	C <sub>23</sub> H <sub>30</sub> N <sub>7</sub> O <sub>2</sub>	456 (100%)
 Соединение KG		2.04	C <sub>22</sub> H <sub>28</sub> N <sub>7</sub> O <sub>2</sub>	442 (100%)

(b) Проводя реакцию способом, аналогичным примеру 25 (a), получают соединения A263-A280.

{4-[2-(5-амино-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-уксусная кислота, цис-изомер, (соединение A263);

3-{4-[2-(5-амино-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-пропионовая кислота, цис-изомер, (соединение A264);

{4-[2-(5-амино-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-

фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-изопропил-амин,  
цис-изомер, (соединение А265);

аллил-{4-[2-(5-амино-5-метил-[1,3] диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-амин, цис-изомер, (соединение А266);

{4-[2-(5-амино-5-метил-[1,3] диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-циклопропилметил-амин, цис-изомер, (соединение А267);

{4-[2-(5-амино-5-метил-[1,3] диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-ацетонитрил, цис-изомер, (соединение А268);

3-{4-[2-(5-амино-5-метил-[1,3] диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-пропионитрил, цис-изомер, (соединение А269);

{4-[2-(5-амино-5-метил-[1,3] диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-пиридин-3-ил-амин, цис-изомер, (соединение А270);

{4-[2-(5-амино-5-метил-[1,3] диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-пиридин-4-ил-амин, цис-изомер, (соединение А271);

2-{4-[2-(5-амино-5-метил-[1,3] диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-ацетамид, цис-изомер, (соединение А272);

3-{4-[2-(5-амино-5-метил-[1,3] диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-пропионамид, цис-изомер, (соединение А273);

{4-[2-(5-амино-5-метил-[1,3] диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-пропил-амин, цис-изомер, (соединение А274);

2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пирролидин-1-ил-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3] диоксан-5-иламин, цис-изомер, (соединение А275);

{4-[2-(5-амино-5-метил-[1,3] диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-(4-фторбензил)-амин, цис-изомер, (соединение А276);

{4-[2-(5-амино-5-метил-[1,3] диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-(4-метоксибензил)-амин, цис-изомер, (соединение А277);

{4-[2-(5-амино-5-метил-[1,3] диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-(4-фторфенил)-амин, цис-изомер, (соединение А278);

{4-[2-(5-амино-5-метил-[1,3] диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-(3,4-дифторфенил)-амин, цис-изомер, (соединение А279);

{4-[2-(5-амино-5-метил-[1,3] диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-(4-метоксифенил)-амин, цис-изомер, (соединение А280);

(с) Проводя реакцию способом, аналогичным примеру 25 (а), но заменяя амин одним эквивалентом натриевой соли соответственно замещённого спирта или фенола, получают соединения А281-А290.

2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метокси-пиримидин-4-ил)-1Н-

имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-иламин, цис-изомер,  
(соединение A281);

2-[5-(2-бензилокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-иламин, цис-изомер,  
(соединение A282);

2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-фенокси-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-иламин, цис-изомер,  
(соединение A283);

2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-(2-метокси-этокси)-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-иламин, цис-изомер, (соединение A284);

2-[5-[2-(2-диметиламино-этокси)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-иламин, цис-изомер, (соединение A285);

2-[5-(2-циклогесилокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-иламин, цис-изомер, (соединение A286);

2-[5-(2-изопропокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-иламин, цис-изомер, (соединение A287);

2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пропокси-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-иламин, цис-изомер, (соединение A288);

2-[4-[2-(5-амино-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-илокси]-этанол, цис-изомер, (соединение A289);

3-{4-[2-(5-амино-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-илокси}-пропан-1-ол, цис-изомер, (соединение A290);

(d) Проводя реакцию способом, аналогичным примеру 25 (a), но используя 2,2,2-трифтор-N-{2-[5-(2-метилсульфонил-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-ацетамид, цис-изомер, (соединение LL), получают соединения A291-A337.

4-[2-(5-аминометил-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламин, транс-изомер, (соединение A291);

{4-[2-(5-аминометил-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-метил-амин, транс-изомер, (соединение A292);

{4-[2-(5-аминометил-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-диметил-амин, транс-изомер, (соединение A293);

{4-[2-(5-аминометил-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-циклопропил-амин, транс-изомер, (соединение A294);

{4-[2-(5-аминометил-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-пиперидин-4-ил-амин, транс-изомер, (соединение A295);

{4-[2-(5-аминометил-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-циклогексил-амин, транс-изомер, (соединение A296);

2-{4-[2-(5-аминометил-5-метил-[1,3] диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-этанол, транс-изомер, (соединение A297);

N1-{4-[2-(5-аминометил-5-метил-[1,3] диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-этан-1,2-диамин, транс-изомер, (соединение A298);

{4-[2-(5-аминометил-5-метил-[1,3] диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-[3-(5Н-имидазол-1-ил)-пропил]-амин, транс-изомер, (соединение A299);

{4-[2-(5-аминометил-5-метил-[1,3] диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-(3-морфолин-4-ил-пропил)-амин, транс-изомер, (соединение A300);

3-{4-[2-(5-аминометил-5-метил-[1,3] диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-пропан-1-ол, транс-изомер, (соединение A301);

{4-[2-(5-аминометил-5-метил-[1,3] диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-бензил-амин, транс-изомер, (соединение A302);

{4-[2-(5-аминометил-5-метил-[1,3] диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-(4-фторбензил)-амин, транс-изомер, (соединение A303);

{4-[2-(5-аминометил-5-метил-[1,3] диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-(4-метоксибензил)-амин, транс-изомер, (соединение A304);

{4-[2-(5-аминометил-5-метил-[1,3] диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-(1-фенил-

этил)-амин, R-изомер, транс-изомер, (соединение A305);

{4-[2-(5-аминометил-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3H-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-(1-фенил-этил)-амин, S-изомер, транс-изомер, (соединение A306);

{4-[2-(5-аминометил-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3H-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-фенил-амин, транс-изомер, (соединение A307);

{4-[2-(5-аминометил-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3H-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-(4-фторфенил)-амин, транс-изомер, (соединение A308);

{4-[2-(5-аминометил-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3H-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-(3,4-дифтор-фенил)-амин, транс-изомер, (соединение A309);

{4-[2-(5-аминометил-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3H-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-(3-метокси-фенил)-амин, транс-изомер, (соединение A310);

C-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пиперидин-1-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-метиламин, транс-изомер, (соединение A311);

{4-[2-(5-аминометил-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3H-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-пиридин-4-илметил-амин, транс-изомер, (соединение A312);

{4-[2-(5-аминометил-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3H-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-пиридин-3-илметил-амин, транс-изомер, (соединение A313);

{4-[2-(5-аминометил-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-

фтор-фенил)-3H-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-пиридин-2-илметил-амин, транс-изомер, (соединение A314);

{4-[2-(5-аминометил-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3H-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-(фуран-2-илметил)-амин, транс-изомер, (соединение A315);

{4-[2-(5-аминометил-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3H-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-(тиофен-2-илметил)-амин, транс-изомер, (соединение A316);

{4-[2-(5-аминометил-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3H-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-(тетрагидрофуран-2-илметил)-амин, транс-изомер, (соединение A317);

C-{2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-метил-пиперазин-1-ил)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-метиламин, транс-изомер, (соединение A318);

C-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-морфолин-4-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-метиламин, транс-изомер, (соединение A319);

{4-[2-(5-аминометил-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3H-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-(3-метоксипропил)-амин, транс-изомер, (соединение A320);

{4-[2-(5-аминометил-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3H-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-(2-метоксиэтил)-амин, транс-изомер, (соединение A321);

N-{4-[2-(5-аминометил-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3H-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-N',N'-диметилпропан-1,3-диамин, транс-изомер, (соединение A322);

N-{4-[2-(5-аминометил-5-метил-[1,3] диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-N', N'-диметилэтан-1,2-диамин, транс-изомер, (соединение А323);

{4-[2-(5-аминометил-5-метил-[1,3] диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-уксусная кислота, транс-изомер, (соединение А324);

3-{4-[2-(5-аминометил-5-метил-[1,3] диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-пропионовая кислота, транс-изомер, (соединение А325);

C-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфанил-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3] диоксан-5-ил}-метиламин, транс-изомер, (соединение А326);

{4-[2-(5-аминометил-5-метил-[1,3] диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-изопропил-амин, транс-изомер, (соединение А327);

аллил-{4-[2-(5-аминометил-5-метил-[1,3] диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-амин, транс-изомер, (соединение А328);

{4-[2-(5-аминометил-5-метил-[1,3] диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-циклопропил-метил-амин, транс-изомер, (соединение А329);

{4-[2-(5-аминометил-5-метил-[1,3] диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-ацетонитрил, транс-изомер, (соединение А330);

3-{4-[2-(5-аминометил-5-метил-[1,3] диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-пропио-

нитрил, транс-изомер, (соединение A331);

{4-[2-(5-аминометил-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-пиридин-3-ил-амин, транс-изомер, (соединение A332);

{4-[2-(5-аминометил-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-пиридин-4-ил-амин, транс-изомер, (соединение A333);

2-{4-[2-(5-аминометил-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-ацетамид, транс-изомер, (соединение A334);

3-{4-[2-(5-аминометил-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-пропион-амид, транс-изомер, (соединение A335);

{4-[2-(5-аминометил-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-ил}-пропил-амин, транс-изомер, (соединение A336);

C-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пирролидин-1-ил-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-метил-амин, транс-изомер, (соединение A337);

(e) Проводя реакцию способом, аналогичным примеру 25 (d), но используя 2,2,2-трифтор-N-{2-[5-(2-метилсульфонил-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-ацетамид, цис-изомер, (соединение LK), получают соответствующие цис-изомеры соединений A291-A337.

(f) Проводя реакцию способом, аналогичным примеру 25

(с), но используя 2,2,2-трифтор-N-{2-[5-(2-метилсульфонил-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-ацетамид, транс-изомер, (соединение LL), получают соединения A338-A347.

C-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метокси-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-метиламин, транс-изомер, (соединение A338);

C-{2-[5-(2-бензилокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-метиламин, транс-изомер, (соединение A339);

C-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-фенокси-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-метиламин, транс-изомер, (соединение A340);

C-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-метокси-этокси)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-метиламин, транс-изомер, (соединение A341);

(2-{4-[2-(5-аминометил-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3H-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-илокси}-этил)-диметил-амин, транс-изомер, (соединение A342);

C-{2-[5-(2-циклогексилокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-метиламин, транс-изомер, (соединение A343);

C-{2-[5-(2-изопропокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-метиламин, транс-изомер, (соединение A344);

C-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пропокси-пиримидин-4-ил)-

1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-метиламин,  
транс-изомер, (соединение A345);

2-{4-[2-(5-аминометил-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-  
фтор-фенил)-3H-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-илокси}-этанол,  
транс-изомер, (соединение A346);

3-{4-[2-(5-аминометил-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-  
фтор-фенил)-3H-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-илокси}-пропан-1-  
ол, транс-изомер, (соединение A347);

(g) Проводя реакцию способом, аналогичным примеру 25  
(f), но используя 2,2,2-трифтор-N-(2-[5-(2-метилсульфонил-  
пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-  
[1,3]диоксан-5-илметил)-ацетамид, цис-изомер, (соединение  
LK), получают соответствующие цис-изомеры соединений A338-  
A347.

#### Пример 26

##### Соединения A348-A575

(a) (i) обработка C-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метил-  
сульфанил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]ди-  
оксан-5-ил}-метиламина, цис-изомера, (соединение KZ) ацетил-  
хлоридом, либо бензоилхлоридом или фенилацетилхлоридом по  
способу, описанному в примере 11 или метансульфонилхлоридом  
по способу, описанному в примере 13;

(ii) обработка полученных на стадии (i) соединений м-  
хлорнадбензойной кислотой по способу, описанному в примере  
27;

(iii) обработка полученных на стадии (ii) соединений аминами формулы  $\text{HNY}^4\text{Y}^5$  или натриевыми солями соответственно замещенных спиртов или фенолов по способу, описанному в примерах 23 или 24; даёт соединения А348-А575:

N-{2-[5-(2-амино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-ацетамид, цис-изомер, (соединение А348);

N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метиламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-ацетамид, цис-изомер, (соединение А349);

N-{2-[5-(2-диметиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-ацетамид, цис-изомер, (соединение А350);

N-{2-[5-(2-циклопропиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-ацетамид, цис-изомер, (соединение А351);

N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиперидин-4-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-ацетамид, цис-изомер, (соединение А352);

N-{2-[5-(2-циклогексиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-ацетамид, цис-изомер, (соединение А353);

N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-гидрокси-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-ацетамид, цис-изомер, (соединение А354);

N-{2-[5-[2-(2-амино-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-

фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил)-ацетамид, цис-изомер, (соединение A355);

N-[2-(4-(4-фтор-фенил)-5-[2-[3-(5H-имидазол-1-ил)-пропиламино]-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил)-ацетамид, цис-изомер, (соединение A356);

N-(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-[3-морфолин-4-ил-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил)-ацетамид, цис-изомер, (соединение A357);

N-(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-[3-гидрокси-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил)-ацетамид, цис-изомер, (соединение A358);

N-{2-[5-(2-бензиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил)-ацетамид, цис-изомер, (соединение A359);

N-{2-[5-(2-(4-фторбензил)амино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил)-ацетамид, цис-изомер, (соединение A360);

N-{2-[5-(2-(4-метоксибензил)амино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил)-ацетамид, цис-изомер, (соединение A361);

N-(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(1-фенил-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил)-ацетамид, R-изомер, цис-изомер, (соединение A362);

N-(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(1-фенил-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил)-ацетамид, S-изомер, цис-изомер, (соединение A363);

N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-фениламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-ацетамид, цис-изомер, (соединение A364);

N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-(4-фторфенил)амино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-ацетамид, цис-изомер, (соединение A365);

N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-(3,4-дифторфенил)амино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-ацетамид, цис-изомер, (соединение A366);

N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-(3-метоксифенил)амино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-ацетамид, цис-изомер, (соединение A367);

N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пиперидин-1-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-ацетамид, цис-изомер, (соединение A368);

N-[2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиридин-4-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил})-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил]-ацетамид, цис-изомер, (соединение A369);

N-[2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиридин-3-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил})-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил]-ацетамид, цис-изомер, (соединение A370);

N-[2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиридин-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил})-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил]-ацетамид, цис-изомер, (соединение A371);

N-[2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(фуран-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил})-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил-

метил]-ацетамид, цис-изомер, (соединение A372);

N-[2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(тиофен-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил]-ацетамид, цис-изомер, (соединение A373);

N-[2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]-диоксан-5-илметил]-ацетамид, цис-изомер, (соединение A374);

N-(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-метил-пиперазин-1-ил)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил)-ацетамид, R-изомер, цис-изомер, (соединение A375);

N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-морфолин-4-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил]-ацетамид, цис-изомер, (соединение A376);

N-(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-метокси-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил)-ацетамид, цис-изомер, (соединение A377);

N-(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-метокси-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил)-ацетамид, цис-изомер, (соединение A378);

N-{2-[5-[2-(3-диметиламино-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-ацетамид, цис-изомер, (соединение A379);

N-{2-[5-[2-(2-диметиламино-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-ацетамид, цис-изомер, (соединение A380);

{4-[2-[5-(ацетиламино-метил)-5-метил-[1,3]диоксан-2-

ил]-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-уксусная кислота, цис-изомер, (соединение А381);

3-{4-[2-[5-(ацетиламино-метил)-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил]-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-пропионовая кислота, цис-изомер, (соединение А382);

N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфанил-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-ацетамид, цис-изомер, (соединение А383);

N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метокси-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-ацетамид, цис-изомер, (соединение А384);

N-{2-[5-(2-бензилокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-ацетамид, цис-изомер, (соединение А385);

N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-фенокси-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-ацетамид, цис-изомер, (соединение А386);

N-(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-метокси-этокси)-пиримидин-4-ил]-1Н-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил)-ацетамид, цис-изомер, (соединение А387);

N-{2-[5-[2-(2-диметиламино-этокси)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-ацетамид, цис-изомер, (соединение А388);

N-{2-[5-(2-циклотексилокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-ацетамид, цис-изомер, (соединение А389);

N-{2-[5-(2-изопропокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-ацетамид, цис-изомер, (соединение A390);

N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-изопропиламин-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-ацетамид, цис-изомер, (соединение A391);

N-{2-[5-(2-аллиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-ацетамид, цис-изомер, (соединение A392);

N-{2-[5-[2-(циклопропилметил-амино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-ацетамид, цис-изомер, (соединение A393);

N-{2-[5-[2-(цианометил-амино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-ацетамид, цис-изомер, (соединение A394);

N-{2-[5-[2-(2-циано-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-ацетамид, цис-изомер, (соединение A395);

N-(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиридин-3-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил)-ацетамид, цис-изомер, (соединение A396);

N-(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиридин-4-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил)-ацетамид, цис-изомер, (соединение A397);

2-{4-[2-[5-(ацетиламино-метил)-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил]-5-(4-фтор-фенил)-3H-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-

ацетамид, цис-изомер, (соединение A398);

3-{4-[2-[5-(ацетиламино-метил)-5-метил-[1,3] диоксан-2-ил]-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-пропионамид, цис-изомер, (соединение A399);

N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пропокси-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3] диоксан-5-илметил}-ацетамид, цис-изомер, (соединение A400);

N-(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-гидрокси-этокси)-пиримидин-4-ил]-1Н-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3] диоксан-5-илметил)-ацетамид, цис-изомер, (соединение A401);

N-(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-гидрокси-пропокси)-пиримидин-4-ил]-1Н-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3] диоксан-5-илметил)-ацетамид, цис-изомер, (соединение A402);

N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пропиламино-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3] диоксан-5-илметил}-ацетамид, цис-изомер, (соединение A403);

N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пирролидин-1-ил-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3] диоксан-5-илметил}-ацетамид, цис-изомер, (соединение A404);

N-{2-[5-(2-амино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3] диоксан-5-илметил}-метансульфонамид, цис-изомер, (соединение A405);

N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метиламино-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3] диоксан-5-илметил}-метансульфонамид, цис-изомер, (соединение A406);

N-{2-[5-(2-диметиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-

фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-метансульфонамид, цис-изомер, (соединение A407);

N-{2-[5-(2-циклопропиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-метансульфонамид, цис-изомер, (соединение A408);

N-(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиперидин-4-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил)-метансульфонамид, цис-изомер, (соединение A409);

N-{2-[5-(2-циклогексиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-метансульфонамид, цис-изомер, (соединение A410);

N-(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-гидрокси-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил)-метансульфонамид, цис-изомер, (соединение A411);

N-{2-[5-[2-(2-амино-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-метансульфонамид, цис-изомер, (соединение A412);

N-[2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[3-(5H-имидазол-1-ил)-пропиламино]-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил]-метансульфонамид, цис-изомер, (соединение A413);

N-(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-морфолин-4-ил-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил)-метансульфонамид, цис-изомер, (соединение A414);

N-(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-гидрокси-пропиламино)-

пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3] диоксан-5-илметил)-метансульфонамид, цис-изомер, (соединение A415);

N-{2-[5-(2-бензиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3] диоксан-5-илметил)-метансульфонамид, цис-изомер, (соединение A416);

N-{2-[5-(2-(4-фторбензил) амино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3] диоксан-5-илметил)-метансульфонамид, цис-изомер, (соединение A417);

N-{2-[5-(2-(4-метоксибензил) амино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3] диоксан-5-илметил)-метансульфонамид, цис-изомер, (соединение A418);

N-(2-(4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(1-фенил-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3] диоксан-5-илметил)-метансульфонамид, R-изомер, цис-изомер, (соединение A419);

N-(2-(4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(1-фенил-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3] диоксан-5-илметил)-метансульфонамид, S-изомер, цис-изомер, (соединение A420);

N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-фениламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3] диоксан-5-илметил)-метансульфонамид, цис-изомер, (соединение A421);

N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-(4-фторфенил) амино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3] диоксан-5-илметил)-метансульфонамид, цис-изомер, (соединение A422);

N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-(3,4-дифторфенил) амино-

пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-метансульфонамид, цис-изомер, (соединение A423);

N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-(3-метоксифенил)амино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-метансульфонамид, цис-изомер, (соединение A424);

N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пиперидин-1-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-метансульфонамид, цис-изомер, (соединение A425);

N-[2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиридин-4-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил]-метансульфонамид, цис-изомер, (соединение A426);

N-[2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиридин-3-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил]-метансульфонамид, цис-изомер, (соединение A427);

N-[2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиридин-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил]-метансульфонамид, цис-изомер, (соединение A428);

N-[2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(фуран-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил]-метансульфонамид, цис-изомер, (соединение A429);

N-[2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(тиофен-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил]-метансульфонамид, цис-изомер, (соединение A430);

N-[2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-

[1,3]диоксан-5-илметил]-метансульфонамид, цис-изомер, (соединение А431);

N-(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-метил-пиперазин-1-ил)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил)-метансульфонамид, цис-изомер, (соединение А432);

N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-морфолин-4-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-метансульфонамид, цис-изомер, (соединение А433);

N-(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-метокси-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил)-метансульфонамид, цис-изомер, (соединение А434);

N-(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-метокси-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил)-метансульфонамид, цис-изомер, (соединение А435);

N-{2-[5-[2-(3-диметиламино-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-метансульфонамид, цис-изомер, (соединение А436);

N-{2-[5-[2-(2-диметиламино-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-метансульфонамид, цис-изомер, (соединение А437);

(4-{5-(4-фтор-фенил)-2-[5-(метансульфониламино-метил)-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил]-3H-имидазол-4-ил}-пиримидин-2-иламино)-уксусная кислота, цис-изомер, (соединение А438);

3-(4-{5-(4-фтор-фенил)-2-[5-(метансульфониламино-метил)-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил]-3H-имидазол-4-ил}-пиримидин-2-иламино)-пропионовая кислота, цис-изомер, (соединение

А439);

N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфанил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-метансульфонамид, цис-изомер, (соединение А440);

N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метокси-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-метансульфонамид, цис-изомер, (соединение А441);

N-{2-[5-(2-бензилокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-метансульфонамид, цис-изомер, (соединение А442);

N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-фенокси-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-метансульфонамид, цис-изомер, (соединение А443);

N-(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-метокси-этокси)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил)-метансульфонамид, цис-изомер, (соединение А444);

N-{2-[5-[2-(2-диметиламино-этокси)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-метансульфонамид, цис-изомер, (соединение А445);

N-{2-[5-(2-циклопексилокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-метансульфонамид, цис-изомер, (соединение А446);

N-{2-[5-(2-изопропокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-метансульфонамид, цис-изомер, (соединение А447);

N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-изопропиламино-пиримидин-4-

ил) -1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-метансульфонамид, цис-изомер, (соединение A448);

N-{2-[5-(2-аллиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-метансульфонамид, цис-изомер, (соединение A449);

N-{2-[5-[2-(циклопропилметил-амино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-метансульфонамид, цис-изомер, (соединение A450);

N-{2-[5-[2-(цианометил-амино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-метансульфонамид, цис-изомер, (соединение A451);

N-{2-[5-[2-(2-циано-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-метансульфонамид, цис-изомер, (соединение A452);

N-(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиридин-3-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил)-метансульфонамид, цис-изомер, (соединение A453);

N-(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиридин-4-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил)-метансульфонамид, цис-изомер, (соединение A454);

2-(4-{5-(4-фтор-фенил)-2-[5-(метансульфониламино-метил)-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил]-3H-имидазол-4-ил}-пиримидин-2-иламино)-ацетамид, цис-изомер, (соединение A455);

3-(4-{5-(4-фтор-фенил)-2-[5-(метансульфониламино-метил)-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил]-3H-имидазол-4-ил}-

пиримидин-2-иламино)-пропионамид, цис-изомер, (соединение А456);

N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пропокси-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-метансульфонамид, цис-изомер, (соединение А457);

N-(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-гидрокси-этокси)-пиримидин-4-ил]-1Н-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил)-метансульфонамид, цис-изомер, (соединение А458);

N-(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-гидрокси-пропокси)-пиримидин-4-ил]-1Н-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил)-метансульфонамид, цис-изомер, (соединение А459);

N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пропиламино-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-метансульфонамид, цис-изомер, (соединение А460);

N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пирролидин-1-ил-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-метансульфонамид, цис-изомер, (соединение А461);

N-{2-[5-(2-амино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-бензамид, цис-изомер, (соединение А462);

N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метиламино-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-бензамид, цис-изомер, (соединение А463);

N-{2-[5-(2-диметиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-бензамид, цис-изомер, (соединение А464);

N-{2-[5-(2-циклопропиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-бензамид, цис-изомер, (соединение A465);

N-(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиперидин-4-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил)-бензамид, цис-изомер, (соединение A466);

N-{2-[5-(2-циклогексиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-бензамид, цис-изомер, (соединение A467);

N-(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-гидрокси-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил)-бензамид, цис-изомер, (соединение A468);

N-{2-[5-[2-(2-амино-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-бензамид, цис-изомер, (соединение A469);

N-[2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[3-(5H-имидазол-1-ил)-пропиламино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил]-бензамид, цис-изомер, (соединение A470);

N-(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-морфолин-4-ил-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил)-бензамид, цис-изомер, (соединение A471);

N-(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-гидрокси-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил)-бензамид, цис-изомер, (соединение A472);

N-{2-[5-(2-бензиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-бензамид, цис-изомер, (соединение A473);

N-{2-[5-(2-(4-фторбензил)амино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-бензамид, цис-изомер, (соединение A474);

N-{2-[5-(2-(4-метоксибензил)амино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-бензамид, цис-изомер, (соединение A475);

N-(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(1-фенил-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил)-бензамид, R-изомер, цис-изомер, (соединение A476);

N-(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(1-фенил-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил)-бензамид, S-изомер, цис-изомер, (соединение A477);

N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-фениламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-бензамид, цис-изомер, (соединение A478);

N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-(4-фторфенил)амино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-бензамид, цис-изомер, (соединение A479);

N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-(3,4-дифторфенил)амино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-бензамид, цис-изомер, (соединение A480);

N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-(3-метоксифенил)амино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илме-

тил}-бензамид, цис-изомер, (соединение A481);

N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пиперидин-1-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-бензамид, цис-изомер, (соединение A482);

N-[2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиридин-4-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил]-бензамид, цис-изомер, (соединение A483);

N-[2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиридин-3-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил]-бензамид, цис-изомер, (соединение A484);

N-[2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиридин-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил]-бензамид, цис-изомер, (соединение A485);

N-[2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(фуран-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил]-бензамид, цис-изомер, (соединение A486);

N-[2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(тиофен-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил]-бензамид, цис-изомер, (соединение A487);

N-[2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]-диоксан-5-илметил]-бензамид, цис-изомер, (соединение A488);

N-(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-метил-пиперазин-1-ил)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил)-бензамид, цис-изомер, (соединение A489);

N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-морфолин-4-ил-пиримидин-4-

ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3] диоксан-5-илметил}-бензамид, цис-изомер, (соединение A490);

N-(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-метокси-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3] диоксан-5-илметил}-бензамид, цис-изомер, (соединение A491);

N-(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-метокси-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3] диоксан-5-илметил}-бензамид, цис-изомер, (соединение A492);

N-{2-[5-[2-(3-диметиламино-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3] диоксан-5-илметил}-бензамид, цис-изомер, (соединение A493);

N-{2-[5-[2-(2-диметиламино-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3] диоксан-5-илметил}-бензамид, цис-изомер, (соединение A494);

{4-[2-[5-(бензоиламино-метил)-5-метил-[1,3] диоксан-2-ил]-5-(4-фтор-фенил)-3H-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-уксусная кислота, цис-изомер, (соединение A495);

3-{4-[2-[5-(бензоиламино-метил)-5-метил-[1,3] диоксан-2-ил]-5-(4-фтор-фенил)-3H-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-пропионовая кислота, цис-изомер, (соединение A496);

N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфанил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3] диоксан-5-илметил}-бензамид, цис-изомер, (соединение A497);

N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метокси-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3] диоксан-5-илметил}-бензамид, цис-изомер, (соединение A498);

N-{2-[5-(2-бензилокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-бензамид, цис-изомер, (соединение A499);

N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-фенокси-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-бензамид, цис-изомер, (соединение A500);

N-(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-метокси-этокси)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил)-метансульфонамид, цис-изомер, (соединение A501);

N-{2-[5-[2-(2-диметиламино-этокси)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-бензамид, цис-изомер, (соединение A502);

N-{2-[5-(2-циклогексилокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-бензамид, цис-изомер, (соединение A503);

N-{2-[5-(2-изопролокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-бензамид, цис-изомер, (соединение A504);

N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-изопропиламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-бензамид, цис-изомер, (соединение A505);

N-{2-[5-(2-аллиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-бензамид, цис-изомер, (соединение A506);

N-{2-[5-[2-(циклопропилметил-амино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил-

метил}-бензамид, цис-изомер, (соединение A507);

N-{2-[5-[2-(цианометил-амино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-бензамид, цис-изомер, (соединение A508);

N-{2-[5-[2-(2-циано-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-бензамид, цис-изомер, (соединение A509);

N-(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиридин-3-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил)-бензамид, цис-изомер, (соединение A510);

N-(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиридин-4-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил)-бензамид, цис-изомер, (соединение A511);

N-{2-[5-[2-(карбамоилметил-амино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-бензамид, цис-изомер, (соединение A512);

N-{2-[5-[2-(2-карбамоил-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-бензамид, цис-изомер, (соединение A513);

N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пропокси-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-бензамид, цис-изомер, (соединение A514);

N-(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-гидрокси-этокси)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил)-бензамид, цис-изомер, (соединение A515);

N-(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-гидрокси-пропокси)-  
пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3] диоксан-5-  
илметил)-бензамид, цис-изомер, (соединение A516);

N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пропиламино-пиримидин-4-  
ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3] диоксан-5-илметил}-  
бензамид, цис-изомер, (соединение A517);

N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пирролидин-1-ил-пиримидин-  
4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3] диоксан-5-илметил}-  
бензамид, цис-изомер, (соединение A518);

N-{2-[5-(2-амино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-  
имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3] диоксан-5-илметил}-2-фенил-  
ацетамид, цис-изомер, (соединение A519);

N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метиламино-пиримидин-4-ил)-  
1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3] диоксан-5-илметил}-2-фенил-  
ацетамид, цис-изомер, (соединение A520);

N-{2-[5-(2-диметиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-  
фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3] диоксан-5-илметил}-2-  
фенил-ацетамид, цис-изомер, (соединение A521);

N-{2-[5-(2-циклопропиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-  
фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3] диоксан-5-илметил}-2-  
фенил-ацетамид, цис-изомер, (соединение A522);

N-(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиперидин-4-иламино)-  
пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3] диоксан-5-  
илметил)-2-фенил-ацетамид, цис-изомер, (соединение A523);

N-{2-[5-(2-циклогексиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-  
фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3] диоксан-5-илметил}-2-

фенил-ацетамид, цис-изомер, (соединение A524);

N-(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-гидрокси-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил)-2-фенил-ацетамид, цис-изомер, (соединение A525);

N-{2-[5-[2-(2-амино-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-2-фенил-ацетамид, цис-изомер, (соединение A526);

N-[2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[3-(5H-имидазол-1-ил)-пропиламино]-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил]-2-фенил-ацетамид, цис-изомер, (соединение A527);

N-(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-морфолин-4-ил-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил)-2-фенил-ацетамид, цис-изомер, (соединение A528);

N-(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-гидрокси-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил)-2-фенил-ацетамид, цис-изомер, (соединение A529);

N-{2-[5-(2-бензиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-2-фенил-ацетамид, цис-изомер, (соединение A530);

N-{2-[5-(2-(4-фторбензил)амино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-2-фенил-ацетамид, цис-изомер, (соединение A531);

N-{2-[5-(2-(4-метоксибензил)амино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-

илметил}-2-фенил-ацетамид, цис-изомер, (соединение A532);

N-(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(1-фенил-этиламино)-  
пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-  
илметил)-2-фенил-ацетамид, R-изомер, цис-изомер, (соединение  
A533);

N-(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(1-фенил-этиламино)-  
пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-  
илметил)-2-фенил-ацетамид, S-изомер, цис-изомер, (соединение  
A534);

N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-фениламино-пиримидин-4-ил)-  
1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-2-фенил-  
ацетамид, цис-изомер, (соединение A535);

N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-(4-фторфенил)амино-  
пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-  
илметил}-2-фенил-ацетамид, цис-изомер, (соединение A536);

N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-(3,4-дифторфенил)амино-  
пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-  
илметил}-2-фенил-ацетамид, цис-изомер, (соединение A537);

N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-(3-метоксифенил)амино-  
пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-  
илметил}-2-фенил-ацетамид, цис-изомер, (соединение A538);

N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пиперидин-1-ил-пиримидин-4-  
ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-2-  
фенил-ацетамид, цис-изомер, (соединение A539);

N-[2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиридин-4-илметил)-  
амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-

[1,3]диоксан-5-илметил]-2-фенил-ацетамид, цис-изомер, (соединение А540);

N-[2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиридин-3-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-

[1,3]диоксан-5-илметил]-2-фенил-ацетамид, цис-изомер, (соединение А541);

N-[2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиридин-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-

[1,3]диоксан-5-илметил]-2-фенил-ацетамид, цис-изомер, (соединение А542);

N-[2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(фуран-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил]-2-фенил-ацетамид, цис-изомер, (соединение А543);

N-[2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(тиофен-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил]-2-фенил-ацетамид, цис-изомер, (соединение А544);

N-[2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил]-2-фенил-ацетамид, цис-изомер, (соединение А545);

N-(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-метил-пиперазин-1-ил)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил)-2-фенил-ацетамид, цис-изомер, (соединение А546);

N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-морфолин-4-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил]-2-фенил-ацетамид, цис-изомер, (соединение А547);

N-(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-метокси-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил)-2-фенил-ацетамид, цис-изомер, (соединение A548);

N-(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-метокси-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил)-2-фенил-ацетамид, цис-изомер, (соединение A549);

N-{2-[5-[2-(3-диметиламино-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-2-фенил-ацетамид, цис-изомер, (соединение A550);

N-{2-[5-[2-(2-диметиламино-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-2-фенил-ацетамид, цис-изомер, (соединение A551);

(4-{5-(4-фтор-фенил)-2-[5-метил-5-(фенилацетиламино-метил)-[1,3]диоксан-2-ил]-3H-имидазол-4-ил}-пиримидин-2-иламино)-уксусная кислота, цис-изомер, (соединение A552);

3-(4-{5-(4-фтор-фенил)-2-[5-метил-5-(фенилацетиламино-метил)-[1,3]диоксан-2-ил]-3H-имидазол-4-ил}-пиримидин-2-иламино)-пропионовая кислота, цис-изомер, (соединение A553);

N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфанил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-2-фенил-ацетамид, цис-изомер, (соединение A554);

N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метокси-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-2-фенил-ацетамид, цис-изомер, (соединение A555);

N-{2-[5-(2-бензилокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-2-фенил-

ацетамид, цис-изомер, (соединение A556);

N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-фенокси-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-2-фенил-ацетамид, цис-изомер, (соединение A557);

N-(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-метокси-этокси)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил)-2-фенил-ацетамид, цис-изомер, (соединение A558);

N-{2-[5-[2-(2-диметиламино-этокси)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-2-фенил-ацетамид, цис-изомер, (соединение A559);

N-{2-[5-(2-циклогексилокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-2-фенил-ацетамид, цис-изомер, (соединение A560);

N-{2-[5-(2-изопропокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-2-фенил-ацетамид, цис-изомер, (соединение A561);

N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-изопропиламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-2-фенил-ацетамид, цис-изомер, (соединение A562);

N-{2-[5-(2-аллиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-2-фенил-ацетамид, цис-изомер, (соединение A563);

N-{2-[5-[2-(циклопропилметил-амино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-2-фенил-ацетамид, цис-изомер, (соединение A564);

N-{2-[5-[2-(цианометил-амино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-

фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил)-2-фенил-ацетамид, цис-изомер, (соединение A565);

N-{2-[5-[2-(2-циано-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил)-2-фенил-ацетамид, цис-изомер, (соединение A566);

N-(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиридин-3-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил)-2-фенил-ацетамид, цис-изомер, (соединение A567);

N-(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиридин-4-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил)-2-фенил-ацетамид, цис-изомер, (соединение A568);

2-(4-{5-(4-фтор-фенил)-2-[5-метил-5-(фенилацетиламино-метил)-[1,3]диоксан-2-ил]-3H-имидазол-4-ил}-пиримидин-2-иламино)-ацетамид, цис-изомер, (соединение A569);

3-(4-{5-(4-фтор-фенил)-2-[5-метил-5-(фенилацетиламино-метил)-[1,3]диоксан-2-ил]-3H-имидазол-4-ил}-пиримидин-2-иламино)-пропионамид, цис-изомер, (соединение A570);

N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пропокси-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил)-2-фенил-ацетамид, цис-изомер, (соединение A571);

N-(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-гидрокси-этокси)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил)-2-фенил-ацетамид, цис-изомер, (соединение A572);

N-(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-гидрокси-пропокси)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил)-2-фенил-ацетамид, цис-изомер, (соединение A573);

N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пропиламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-2-фенил-ацетамид, цис-изомер, (соединение A574);

N-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пирролидин-1-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-2-фенил-ацетамид, цис-изомер, (соединение A575).

(b) Проводя реакцию способом, аналогичным примеру 26 (a), но используя C-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфанил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-метиламин, цис-изомер, (соединение KZ), получают соответствующие транс-изомеры соединений A348-A575.

Пример 27

Соединения КН-КР

Суспензию {2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфанил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-метанона, транс-изомера, (5,00 г, соединение KQ) в дихлорметане при 0°C обрабатывают метаклорнадбензойной кислотой (2 эквивалента) и смесь перемешивают при 0-5°C в течение 2 часов и затем дополнительно при комнатной температуре в течение 16 часов. Реакционную смесь обрабатывают насыщенным водным раствором бикарбоната натрия. Органический слой отделяют, затем упаривают. Остаток растирают с диэтиловым эфиром, получая {2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфонил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (4,9 г, соединение КН) в виде жёлтого твёрдого вещества,

т.пл. 264-266°C. мн<sup>+</sup> 532.

Проводя реакцию аналогичным способом, но используя 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфанилпиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5,5-диметил-[1,3]диоксан (соединение KR), получают 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфонилпиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5,5-диметил-[1,3]диоксан (соединение KI) в виде твёрдого вещества кремового цвета, т.пл. 204-206°C. мн<sup>+</sup> 433.

Проводя реакцию аналогичным способом, но используя {2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метил-сульфанил-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}метанол, транс-изомер (Соединение KU) получают {2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфонил-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, транс-изомер (Соединение KJ).

Проводя реакцию аналогичным способом, но используя {2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфанил-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, цис-изомер, (соединение KT), получают {2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфонил-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, цис-изомер (соединение KK).

Проводя реакцию аналогичным способом, но используя {2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфанилпиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан, (соединение KV), получают 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфонилпиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан (соединение KL).

Проводя реакцию аналогичным способом, но используя 4-[2-[1,3]диоксан-2-ил-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-2-метилсульфанил-пиримидин (соединение KW), получают 4-[2-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-2-метилсульфонил-пиримидин (соединение KM).

Проводя реакцию аналогичным способом, но используя {2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфанил-пиримидин-4-ил)-1Н

имидазол-2-ил]-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, транс-изомер (соединение КХ), получают {2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфонил-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, транс-изомер (соединение КN).

Проводя реакцию аналогичным способом, но используя {2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфанил-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, цис-изомер (соединение КУ), получают {2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфонил-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, цис-изомер (соединение КО).

Проводя реакцию аналогичным способом, но используя 2,2,2-трифтор-N-[2-{4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфанил-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил]-ацетамид, цис-изомер (соединение КQ), получают 2,2,2-трифтор-N-[2-{4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метансульфонилпиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил]-ацетамид, цис-изомер (соединение КS) в виде жёлтого твёрдого вещества, т.пл. 236-238°C. МН<sup>+</sup> 530.

Пример 28

#### Соединения КQ и КУ

Раствор 4-[2-диметоксиметил-5(4)-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-4(5)-ил]-2-метансульфанил-пиримидина (16,0 г, ссылочный пример 7), п-толуолсульфоокислоты (21,13 г) и 3-гидрокси-2-гидроксиметил-2-метил-1-морфолино-1-пропанона (10,82 г, ссылочный пример 6) в смеси сухого тетрагидрофурана и сухого диметилфлормамида нагревают до температуры

кипения с обратным холодильником, в нижней части которого находится экстрактор Сокслета, заполненный молекулярными ситами (3Å), в течение 26 часов. Реакционную смесь упаривают и остаток обрабатывают этилацетатом и насыщенным водным раствором бикарбоната натрия. Органическую фазу упаривают и остаток подвергают флэш хроматографии на двуокиси кремния, элюируя смесью этилацетата и метанола (9:1, в отношении объёмов), что даёт 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфанилпиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер (13,8 г, соединение KQ) в виде бесцветного твёрдого вещества, т.пл. 160°C (с разложением). МН<sup>+</sup> 500.

Проводя реакцию аналогичным способом, но используя 2,2-диметилпропан-1,3-диол, получают 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфанилпиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5,5-диметил-[1,3]диоксан (соединение KR) в виде бесцветного твёрдого вещества, т.пл. 163-165°C (с разложением). МН<sup>+</sup> 401.

Проводя реакцию аналогичным способом, но используя 2-метил-2-трифторацетамидо-1,3-пропандиол (ссылочный пример 4), получают 2,2,2-трифтор-N-[2-{4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфанил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил]-ацетамид, цис-изомер, (соединение KS) в виде бесцветного твёрдого вещества. МН<sup>+</sup> 498. R<sub>F</sub>: 0,55, определено на силикагелевых пластинках с использованием смеси этилацетата и метанола (19:1, в отношении объёмов).

Проводя реакцию аналогичным способом, но используя

1,1,1-трис(гидроксиметил)этан, получают {2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфанил-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, цис-изомер, (соединение КТ) в виде бесцветного твёрдого вещества ( $MH^+$  417.  $R_F = 0,32$ , определено на силикагелевых пластинках с использованием смеси этилацетата и метанола (19:1, в отношении объёмов) и {2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфанил-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, транс-изомер, (соединение КУ) в виде белого твёрдого вещества ( $MH^+$  417.  $R_F = 0,24$ , определено на силикагелевых пластинках с использованием смеси этилацетата и метанола (19:1, в отношении объёмов).

Проводя реакцию аналогичным способом, но используя 2-метил-1,3-пропандиол, получают 4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-метил-1,3-диоксан-2-ил)-3Н-имидазол-4-ил]-2-метилсульфанил-пиримидин (соединение КV).

Проводя реакцию аналогичным способом, но используя 1,3-пропандиол, получают 4-[2-[1,3]диоксан-2-ил-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-2-метилсульфанил-пиримидин (соединение КW).

Проводя реакцию аналогичным способом, но используя 2-(гидроксиметил)-1,3-пропандиол, получают {2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфанил-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, транс-изомер (соединение КХ) и {2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфанил-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, цис-изомер (соединение КУ).

Пример 29

Соединение KZ

Раствор амида 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфанил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, цис-изомера (0,5 г, соединение LA) в тетрагидрофуране обрабатывают литийалюмогидридом (0,18 г) и смесь нагревают до температуры кипения с обратным холодильником в течение 0,5 часа. К охлаждённому раствору добавляют воду (0,2 мл), затем водную гидроокись натрия (15%, 0,2 мл), потом воду (0,6 мл). После чего смесь фильтруют и фильтрат упаривают. Остаток подвергают флэш-хроматографии на двуокиси кремния, элюируя смесью метанола и этилацетата (3:7, в отношении объёмов), что даёт C-{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфанил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-метиламин, цис-изомер, (69 мг, соединение KZ) в виде смолы.  $MN^+$  416.  $R_F = 0,3$ , определено на силикагелевых пластинках с использованием метанола.

Пример 30

Соединение LA

К раствору 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфанил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, цис-изомера, (1,3 г, соединение LB), диэтилизопропиламина (0,85 г) и O-(7-азабензотриазол-1-ил)-1,1,3,3-тетраметилуронийгексафторфосфата (1,14 г) в диметилформамиде (безводном) добавляют аммиак (1,2 мл, 0,5 М

раствор в 1,4-диоксане). Раствор перемешивают при комнатной температуре в течение 3 часов и затем упаривают. Остаток перемешивают с водой и твёрдые продукты фильтруют, получая амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфанил-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, цис-изомер, (1,2 г, соединение LA) в виде белого твёрдого вещества.  $MN^+$  430.  $R_F = 0,27$ , [определено на силикагелевых пластинах с использованием смеси этилацетата и метанола (8:2, в отношении объёмов)].

#### Пример 31

##### Соединение LB

Раствор метилового эфира 2-[4-(4-фторфенил)-5-(2-метил-~~сульфанил~~-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, цис-изомера, (5,1 г, соединение LD) и водной гидроокиси натрия (34,4 мл, 1 н) в метаноле нагревают до температуры кипения с обратным холодильником в течение 6 часов. К охлаждённому раствору добавляют водную соляную кислоту (34,4 мл, 1 н) метанол упаривают. Водную часть декантируют и остаток растирают с ацетонитрилом, получая 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфанил-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновую кислоту, цис-изомер (4,43 г, соединение LB) в виде белого твёрдого вещества.  $MN^+$  431. ТСХ  $R_F = 0,22$ , [элкируя этилацетатом и метанолом (8:2, в отношении объёмов) на силикагеле].

### Пример 32

#### Соединение LC и LD

Раствор 2-диметоксиметил-4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфанилпиримидин-4-ил)-1Н-имидазола (4,5 г, ссылочный пример 7), метил-2,2-бис(гидроксиметил)пропионата (10 г) и метилортоформиата (11,9 мл) в диметилформамиде обрабатывают 4-толуолсульфокислотой (20,6 г) и затем нагревают до 80°C в течение 4 часов. Реакционную смесь упаривают, затем распределяют между этилацетатом и водным раствором бикарбоната натрия. Органическую фазу упаривают и остаток чистят, используя флэш хроматографию на силикагеле, элюируя этилацетатом, что даёт метиловый эфир 2-[4-(4-фторфенил)-5-(2-метилсульфанил-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер (4,95 г, соединение LC), [МН<sup>+</sup> 445, т.пл. 199-200°C] и метиловый эфир 2-[4-(4-фторфенил)-5-(2-метилсульфанилпиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, цис-изомер, (7,11 г, соединение LD), МН<sup>+</sup> 445, т.пл. 161-163°C).

### Пример 33

#### Соединение LE

К раствору {2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1Н-имидазол-2-ил]-5-нитро-[1,3]диоксан-5-ил}-метанола, цис-изомера (0,1 г, соединение LG) в этаноле добавляют палладий на углеороде (5%, 0,2 г) и смесь гидрируют при 1 атмосфере водорода, при 50°C в течение 6 часов. Раствор фильтруют

через целит, растворитель упаривают и остаток подвергают флэш хроматографии на силикагеле, элюируя смесью метанола и этилацетата (1:1, в отношении объёмов), что даёт {5-амино-2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1Н-имидазол-2-ил]-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, цис-изомер (77 мг, соединение LE) в виде смолы.  $MN^+$  371. ТСХ  $R_F=0,27$  (элюирование метанолом на силикагеле).

#### Пример 34

##### Соединение LF

К раствору {2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1Н-имидазол-2-ил]-5-нитро-[1,3]диоксан-5-ил}-метанола, транс-изомера (0,1 г, соединение LH) в этаноле добавляют палладий на углеороде (5%, 0,2 г) и смесь гидрируют при 1 атмосфере водорода, при 50°C в течение 8 часов. Раствор фильтруют через целит и растворитель упаривают, а остаток подвергают флэш хроматографии на силикагеле, элюируя смесью метанола и этилацетата (1:1, в отношении объёмов), что даёт {5-амино-2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1Н-имидазол-2-ил]-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, транс-изомер (75 мг, соединение LF) в виде смолы.  $MN^+$  371. ТСХ  $R_F=0,19$  (элюирование смесью этилацетата:метанола 1:1 на силикагеле).

#### Пример 35

##### Соединение LG и LH

Раствор 4-[2-диметоксиметил-5(4)-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-4(5)-ил]-лиридина (2,2 г, сылочный пример 3), п-толуолсульфоокислоты (1,74 г) и трис(гидроксиметил)-нитроме-

тана (4,24 г) в тетрагидрофуране (безводном) и диметил-формамиде (безводном) нагревают до температуры кипения с обратным холодильником, в нижней части которого находится экстрактор Сокслета, заполненный молекулярными ситами ( $3\text{\AA}$ ), в течение 48 часов. Растворитель упаривают и остаток распределяют между этилацетатом и насыщенным водным раствором бикарбоната натрия. Органический слой упаривают и остаток подвергают флэш хроматографии на силикагеле, элюируя смесью метанола и этилацетата (1:9, в отношении объёмов), что даёт {2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1Н-имидазол-2-ил]-5-нитро-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, цис-изомер (0,61 г, соединение LG) в виде белого твёрдого вещества ( $MH^+$  401, ТСХ  $R_F = 0,3$ , элюирование смесью этилацетата:метанола 8:2 на силикагеле) и {2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1Н-имидазол-2-ил]-5-нитро-[1,3]диоксан-5-ил}-метанол, транс-изомер (0,39 г, соединение LH) в виде жёлтой смолы ( $MH^+$  401, ТСХ  $R_F = 0,55$ , элюирование смесью этилацетата:метанола 8:2 на силикагеле).

#### Пример 36

##### Соединение LI

К раствору 4-[2-(5,5-диметил-4-нитрометил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиридина (115 мг, соединение LJ) в метаноле добавляют суспензию борида никеля, предварительно полученную ультразвуковой обработкой хлористого никеля и боргидрида натрия. Смесь перемешивают, добавляют порциями за 1 час боргидрид натрия (250 мг). Реак-

сионную смесь фильтруют через слой силикагеля и чистят, используя препаративную ТСХ, дважды элюируя смесью дихлорметана, пентана, метанола и аммиака (55:25:18:2, в отношении объёмов), что даёт С-(2-[4-(4-фтор-фенил)-5-пиридин-4-ил-1Н-имидазол-2-ил]-5,5-диметил-[1,3]диоксан-4-ил)-метиламин (57 мг, соединение LI).  $MH^+$  383,  $R_F = 0,54$ , двукратное элюирование смесью дихлорметана, пентана, метанола и аммиака (55:25:18:2, в отношении объёмов).

#### Пример 37

##### Соединение LJ

К раствору 4-[2-диметоксиметил-5(4)-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-4(5)-ил]-пиридина (115 г, ссылочный пример 3) в сухом тетрагидрофуране добавляют 2,2-диметил-4-нитробутан-1,3-диол (150 мг) и п-толуолсульфокислоту. Смесь нагревают до температуры кипения с обратным холодильником в течение 7 часов перед распределением между водой и этилацетатом, и очистка с использованием флэш хроматографии на силикагеле при элюировании этилацетатом:метанолом (9:1, в отношении объёмов), даёт 4-[2-(5,5-диметил-4-нитрометил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиридин (130 мг, соединение LJ).  $MH^+$  413, ТСХ  $R_F = 0,36$  (элюирование этилацетатом на силикагеле).

#### Пример 38

##### Соединение LK и LL

(i) Обработка С-(2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфанил-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-

5-ил}-метиламина, цис-изомера (соединение KZ) трифторуксусным ангидридом (по методике, описанной в примере 12) с последующей (ii) обработкой соединений, полученных на стадии (i) мета-хлорнадбензойной кислотой (по методике, описанной в примере 27), даёт 2,2,2-трифтор-N-(2-[5-(2-метилсульфонил-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-ацетамид, цис-изомер (соединение LK).

Проводя реакцию аналогичным способом, но используя транс изомер соединения KZ, получают 2,2,2-трифтор-N-(2-[5-(2-метилсульфонил-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-илметил}-ацетамид, транс-изомер, (соединение LL).

Пример 39

Соединение LM и LN

Раствор метилового эфира 2-[4-(4-фторфенил)-5-(2-метилсульфанил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомера (3,15 г, соединение LC) в смеси дихлорметана и метанола (9:1, в отношении объёмов) обрабатывают 3-хлорнадбензойной кислотой (2,2 эквивалента) и перемешивают при комнатной температуре в течение 16 часов. Раствор разбавляют диэтиловым эфиром и встряхивают с насыщенным водным раствором бикарбоната натрия. Органический раствор упаривают и остаток растирают со смесью этилацетата и диэтилового эфира, получая метилковый эфир 2-[4-(4-фторфенил)-5-(2-метилсульфонилпиримидин-4-ил)-

1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомера (2,95 г, соединение LM) в виде бесцветного кристаллического твёрдого вещества, т.пл. 186-187°C,  $MN^+$  477.

Проводя реакцию аналогичным способом, но используя метиловый эфир 2-[4-(4-фторфенил)-5-(2-метилсульфанил-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, цис-изомер (соединение LD), получают метиловый эфир 2-[4-(4-фторфенил)-5-(2-метиленсульфонил-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, цис-изомер (соединение LN).

#### Пример 40

##### Соединение GT и A557-A2062

(а) Стадия 1: суспензию смолы Merrifield'a (20 г, смола хлорметилполистирола, Novabiochem) в диметилформамиде (150 мл) обрабатывают тиацетатом калия (21 г). После перемешивания при комнатной температуре в течение 24 часов смесь фильтруют и модифицированную смолу промывают, последовательно, диметилформамидом, тетрагидрофураном, водой, тетрагидрофураном, дихлорметаном, и затем сушат в глубоком вакууме при 60°C, получая смолу А (20,5 г). ИК: 3024с, 2920с, 1691с, 1599м, 1493с, 1453с, 1130м, 758с, 700с.

Стадия 2: суспензию смолы А из стадии 1 (20,5 г) в тетрагидрофуране (150 мл) обрабатывают боргидридом лития (5 г). После перемешивания при комнатной температуре в течение 24 часов смесь фильтруют и модифицированную смолу промывают,

последовательно, тетрагидрофураном, смесью соляной кислоты (1 н) и тетрагидрофурана (3:7, в отношении объёмов), водой, тетрагидрофураном, метанолом, дихлорметаном, и затем сушат в глубоком вакууме при 60°C, получая смолу В (20 г). ИК: 3026с, 2924с, 1599w, 1493с, 1452с, 757с, 700с.

Стадия 3: суспензию смолы В из стадии 2 (0,1 г) в диметилформамиде (0,5 мл) обрабатывают гидридом натрия (5 мг, 60% дисперсия в минеральном масле), затем перемешивают при комнатной температуре в течение 15 минут, после чего обрабатывают метиловым эфиром 2-[4-(4-фторфенил)-5-(2-метилсульфонилпиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомером (60 мг, соединение LM) и затем нагревают при 80°C в течение 20 часов. Реакционную смесь фильтруют и модифицированную смолу промывают, последовательно, диметилформамидом, тетрагидрофураном, метанолом, дихлорметаном, и затем сушат в глубоком вакууме при 60°C, получая смолу С (0,11 г). ИК: 3021м, 2920м, 1732м, 1569м, 1487с, 1452с, 1091м, 835м, 757с, 699с.

Стадия 4: суспензию смолы С (0,09 г) в тетрагидрофуране обрабатывают водным раствором гидроокиси натрия (1 н, 0,3 мл) и затем перемешивают при 70°C в течение 8 часов. Реакционную смесь фильтруют и модифицированную смолу промывают, последовательно, тетрагидрофураном, смесью тетрагидрофурана и соляной кислоты (1 н), тетрагидрофураном, диметилформамидом, тетрагидрофураном, метанолом, дихлор-

метаном, и затем сушат в глубоком вакууме при 60°C, получая смолу D (0,09 г). ИК: 3060w, 3025m, 2923m, 2852w, 1720w, 1601m, 1571c, 1493c, 1452c, 1335c, 1235m, 1199m, 1183m, 1097c, 838m, 760c, 704c.

Стадия 5: суспензию смолы D (0,07 г) в дихлорметане обрабатывают раствором оксалилхлорида в дихлорметане (16%), затем перемешивают при комнатной температуре в течение 10 минут, после чего фильтруют. Эту процедуру повторяют трижды. Модифицированную смолу промывают дихлорметаном и затем обрабатывают раствором морфолина (0,1 г) в дихлорметане (0,8 мл). После перемешивания при комнатной температуре в течение 10 минут эту реакционную смесь фильтруют и дополнительно модифицированную смолу промывают, последовательно, дихлорметаном, тетрагидрофураном, метанолом, дихлорметаном, и затем сушат в глубоком вакууме при 60°C, получая смолу E (0,07 г). ИК: 3025c, 2922c, 1636w, 1600w, 1570w, 1493c, 1452c, 1329w, 1181w, 1115w, 759m, 704c.

Стадия 6: суспензию смолы E (0,06 г) в смеси дихлорметана (0,8 мл) и метанола (0,1 мл) обрабатывают м-хлорнадбензойной кислотой (0,24 г). После перемешивания при комнатной температуре в течение 96 часов реакционную смесь фильтруют и модифицированную смолу промывают, последовательно, дихлорметаном, тетрагидрофураном, метанолом, дихлорметаном, и затем сушат в глубоком вакууме при 60°C, получая смолу F (0,06 г). ИК: 3082m, 3026c, 2927c, 2851w, 1635w, 1602m, 1582m, 1493m, 1452c, 1350w, 1240m, 1180m,

1117м, 1032 м, 761с, 705с.

Стадия 7: суспензию смолы F (0,04 г) в диметоксиэтаноле (0,4 мл) обрабатывают бензиламином (0,01 мл) и затем нагревают при 70°C в течение 6 часов. Реакционную смесь фильтруют для удаления смолы и фильтрат упаривают. Остаток подвергают жидкостной хроматографии высокого разрешения (градиентное элюирование с применением следующих смесей: 0-2 минуты, 20% ацетонитрил, 2-16 минут, линейное возрастание до 80%-ацетонитрила), получая 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-бензиламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер (соединение GT).  $MH^+$  559. Время удерживания при жидкостной хроматографии высокого разрешения = 11 минут.

(b) Проводя реакцию аналогичным способом, но используя амины формулы  $HNu^4Y^5$  на стадии 5 и амины формулы  $HNu^4Y^5$  или натриевые соли соответственно замещенных спиртов или фенолов на стадии 7, получают соединения A557-A2062:

амид [5-(2-амино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A577);

амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метиламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A578);

амид 2-[5-(2-диметиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A579);

амид 2-[5-(2-циклопропиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A580);

амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиперидин-4-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A581);

амид 2-[5-(2-циклотексиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A582);

амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-гидрокси-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A583);

амид 2-[5-[2-(2-амино-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A584);

амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[3-(5H-имидазол-1-ил)-пропиламино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A585);

амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-морфолин-4-ил-пропил-амино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A586);

амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-[3-гидрокси-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A587);

амид 2-[5-(2-бензиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фе-

нил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3] диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A588);

амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(1-фенил-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3] диоксан-5-карбоновой кислоты, R-изомер, транс-изомер, (соединение A589);

амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(1-фенил-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3] диоксан-5-карбоновой кислоты, S-изомер, транс-изомер, (соединение A590);

амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-фениламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3] диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A591);

амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пиперидин-1-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3] диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A592);

амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиридин-4-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3] диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A593);

амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиридин-3-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3] диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A594);

амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиридин-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3] диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A595);

амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(фуран-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3] диок-

сан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A596);

амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(тиофен-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A597);

амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A598);

амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-метил-пиперазин-1-ил)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A599);

амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-морфолин-4-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A600);

амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-метокси-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A601);

амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-метокси-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A602);

амид 2-[5-[2-(3-диметиламино-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A603);

амид 2-[5-[2-(2-диметиламино-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A604);

{4-[2-(5-карбамоил-5-метил-[1,3] диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-уксусная кислота, транс-изомер, (соединение А605);

3-{4-[2-(5-карбамоил-5-метил-[1,3] диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-пропионовая кислота, транс-изомер, (соединение А606);

амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-изопропиламино-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3] диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А607);

амид 2-[5-(2-аллиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3] диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А608);

амид 2-[5-(2-циклопропилметил-амино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3] диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А609);

амид 2-[5-[2-(цианометил-амино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3] диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А610);

амид 2-[5-[2-(2-циано-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3] диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А611);

амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиридин-3-иламино)-пиримидин-4-ил]-1Н-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3] диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А612);

амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиридин-4-иламино)-пиримидин-4-ил]-1Н-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3] диоксан-5-

карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A613);

амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пропиламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A614);

амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пирролидин-1-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A615);

амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-фтор-фениламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A616);

амид 2-[5-[2-(3,4-дифтор-фениламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A617);

амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-метокси-фениламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A618);

амид 2-[5-[2-(4-фтор-бензиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A619);

амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-метокси-бензиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A620);

амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метокси-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A621);

амид 2-[5-(2-бензилокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фе-

нил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A622);

амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-фенокси-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A623);

амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-метокси-этокси)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A624);

амид 2-[5-[2-(2-диметиламино-этокси)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A625);

амид 2-[5-(2-циклогексилокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A626);

амид 2-[5-(2-изопропокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A627);

амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пропокси-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A628);

амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-гидрокси-этокси)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A629);

амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-гидрокси-пропокси)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A630);

амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфанил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A631);

метиламид 2-[5-(2-амино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A632);

метиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метиламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A633);

метиламид 2-[5-(2-диметиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A634);

метиламид 2-[5-(2-циклопропиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A635);

метиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиперидин-4-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A636);

метиламид 2-[5-(2-циклогексиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A637);

метиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-гидрокси-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A638);

метиламид 2-[5-[2-(2-амино-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A639);

метиламид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[3-(5H-имидазол-1-ил)-пропиламино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A640);

метиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-морфолин-4-ил-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A641);

метиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-гидрокси-пропил-амино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A642);

метиламид 2-[5-(2-бензиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A643);

метиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(1-фенил-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, R-изомер, транс-изомер, (соединение A644);

метиламид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(1-фенил-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, S-изомер, транс-изомер, (соединение A645);

метиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-фениламино-пирими-

дин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбо-  
новой кислоты, транс-изомер, (соединение А646);

метиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пиперидин-1-ил-  
пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-  
карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А647);

метиламид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиридин-4-  
илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-  
[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение  
А648);

метиламид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиридин-3-  
илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-  
[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение  
А649);

метиламид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиридин-2-  
илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-  
[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение  
А650);

метиламид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(фуран-2-илметил)-  
амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-  
[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение  
А651);

метиламид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(тиофен-2-илметил)-  
амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-  
[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение  
А652);

метиламид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(тетрагидро-фуран-

2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A653);

метиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-метил-пиперазин-1-ил)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A654);

метиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-морфолин-4-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A655);

метиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-метокси-пропил-амино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A656);

метиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-метокси-этил-амино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A657);

метиламид 2-[5-[2-(3-диметиламино-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]-диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A658)

метиламид 2-[5-[2-(2-диметиламино-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A659);

{4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-метил-5-метилкарбамоил-[1,3]диоксан-2-ил)-3H-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-уксусная кислота, транс-изомер, (соединение A660);

3-{4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-метил-5-метилкарбамоил-

[1,3] диоксан-2-ил)-3H-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино)-пропионовая кислота, транс-изомер, (соединение A661);

метиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-изопропиламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3] диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A662);

метиламид 2-[5-(2-аллиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3] диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A663);

метиламид 2-[5-(2-циклопропилметил-амино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3] диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A664);

метиламид 2-[5-[2-(цианометил-амино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3] диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A665);

метиламид 2-[5-[2-(2-циано-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3] диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A666);

метиламид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиридин-3-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3] диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A667);

метиламид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиридин-4-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3] диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A668);

метиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пропиламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3] диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A669);

метиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пирролидин-1-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A670);

метиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-фтор-фениламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A671);

метиламид 2-[5-[2-(3,4-дифтор-фениламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A672);

метиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-метоксифениламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A673);

метиламид 2-[5-[2-(4-фтор-бензиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A674);

метиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-метокси-бензиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A675);

метиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метокси-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A676);

метиламид 2-[5-(2-бензилокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A677);

метиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-фенокси-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кис-

лоты, транс-изомер, (соединение А678);

метиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-метокси-этокси)-  
пиримидин-4-ил]-1Н-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-  
карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А679);

метиламид 2-[5-[2-(2-диметиламино-этокси)-пиримидин-4-  
ил]-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-  
5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А680);

метиламид 2-[5-(2-циклотексилокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-  
фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбо-  
новой кислоты, транс-изомер, (соединение А681);

метиламид 2-[5-(2-изопропокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-  
фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-  
карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А682);

метиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пропокси-пиримидин-  
4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой  
кислоты, транс-изомер, (соединение А683);

метиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-гидрокси-этокси)-  
пиримидин-4-ил]-1Н-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-  
карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А684);

метиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-гидрокси-  
пропокси)-пиримидин-4-ил]-1Н-имидазол-2-ил}-5-метил-  
[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение  
А685);

метиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфанил-  
пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-  
карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А686);

диметиламид 2-[5-(2-амино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A687);

диметиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метиламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A688);

диметиламид 2-[5-(2-диметиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A689);

диметиламид 2-[5-(2-циклопропиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A690);

диметиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиперидин-4-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A691);

диметиламид 2-[5-(2-циклогексиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A692);

диметиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-гидрокси-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A693);

диметиламид 2-[5-[2-(2-амино-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A694);

диметиламид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[3-(5Н-имидазол-1-ил)-пропиламино]-пиримидин-4-ил}-1Н-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А695);

диметиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-морфолин-4-ил-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1Н-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А696);

диметиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-гидрокси-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А697);

диметиламид 2-[5-(2-бензиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А698);

диметиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(1-фенил-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1Н-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, R-изомер, транс-изомер, (соединение А699);

диметиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(1-фенил-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1Н-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, S-изомер, транс-изомер, (соединение А700);

диметиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-фениламино-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А701);

диметиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пиперидин-1-ил-

пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-  
карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A702);

диметиламид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиримидин-4-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]-  
диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение  
A703);

диметиламид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиримидин-3-  
илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-  
[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение  
A704);

диметиламид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиримидин-2-  
илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-  
[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение  
A705);

диметиламид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(фуран-2-  
илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-  
[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение  
A706);

диметиламид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(тиофен-2-  
илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-  
[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение  
A707);

диметиламид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(тетрагидро-  
фуран-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-  
метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер,  
(соединение A708);

диметиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-метил-пиперазин-1-ил)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A709);

диметиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-морфолин-4-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A710);

диметиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-метокси-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A711);

диметиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-метокси-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A712);

диметиламид 2-[5-[2-(3-диметиламино-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A713)

диметиламид 2-[5-[2-(2-диметиламино-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A714);

{4-[2-(5-диметилкарбамоил-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3H-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-уксус-

ная кислота, транс-изомер, (соединение А715);

3-{4-[2-(5-диметилкарбамоил-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-пропионовая кислота, транс-изомер, (соединение А716);

диметиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-изопропиламино-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А717);

диметиламид 2-[5-(2-аллиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А718);

диметиламид 2-[5-(2-циклопропилметил-амино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А719);

диметиламид 2-[5-[2-(цианометил-амино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А720);

диметиламид 2-[5-[2-(2-циано-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А721);

диметиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиридин-3-иламино)-пиримидин-4-ил]-1Н-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А722);

диметиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиридин-4-иламино)-пиримидин-4-ил]-1Н-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А723);

диметиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пропиламино-  
пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-  
карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A724);

диметиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пирролидин-1-ил-  
пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-  
карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A725);

диметиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-фтор-фенил-  
амино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диок-  
сан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A726);

диметиламид 2-[5-[2-(3,4-дифтор-фениламино)-пиримидин-  
4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диок-  
сан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A727);

диметиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-метокси-фенила-  
мино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диок-  
сан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A728);

диметиламид 2-[5-[2-(4-фтор-бензиламино)-пиримидин-4-  
ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-  
5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A729);

диметиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-метокси-  
бензиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-  
[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение  
A730);

диметиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метокси-пиримидин-  
4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой  
кислоты, транс-изомер, (соединение A731);

диметиламид 2-[5-(2-бензилокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-

фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A732);

диметиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-фенокси-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A733);

диметиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-метокси-этокси)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A734);

диметиламид 2-[5-[2-(2-диметиламино-этокси)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A735);

диметиламид 2-[5-(2-циклогексилокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A736);

диметиламид 2-[5-(2-изопропокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A737);

диметиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пропокси-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A738);

диметиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-гидрокси-этокси)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A739);

диметиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-гидрокси-пропокси)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A740);

диметиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфанил-  
пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-  
карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A741);

циклопропиламид 2-[5-(2-амино-пиримидин-4-ил)-4-(4-  
фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-  
карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A742);

циклопропиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метиламино-  
пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-  
карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A743);

циклопропиламид 2-[5-(2-диметиламино-пиримидин-4-ил)-4-  
(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-  
карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A744);

циклопропиламид 2-[5-(2-циклопропиламино-пиримидин-4-  
ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-  
5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A745);

циклопропиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиперидин-4-  
иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]ди-  
оксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A746);

циклопропиламид 2-[5-(2-циклогексиламино-пиримидин-4-  
ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-  
5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A747);

циклопропиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-гидрокси-  
этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]-  
диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение  
A748);

циклопропиламид 2-[5-[2-(2-амино-этиламино)-пиримидин-

4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A749);

циклопропиламид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[3-(5H-имидазол-1-ил)-пропиламино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A750);

циклопропиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-морфолин-4-ил-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A751);

циклопропиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-гидрокси-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A752);

циклопропиламид 2-[5-(2-бензиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A753);

циклопропиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(1-фенил-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, R-изомер, транс-изомер, (соединение A754);

циклопропиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(1-фенил-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, S-изомер, транс-изомер, (соединение A755);

циклопропиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-фениламино-пи-

римидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A756);

циклопропиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пиперидин-1-ил-пириимидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A757);

циклопропиламид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиридин-4-илметил)-амино]-пириимидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A758);

циклопропиламид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиридин-3-илметил)-амино]-пириимидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A759);

циклопропиламид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиридин-2-илметил)-амино]-пириимидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A760);

циклопропиламид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(фуран-2-илметил)-амино]-пириимидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A761);

циклопропиламид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(тиофен-2-илметил)-амино]-пириимидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A762);

циклопропиламид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(тетрагидро-

фуран-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A763);

циклопропиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-метил-пиперазин-1-ил)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A764);

циклопропиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-морфолин-4-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A765);

циклопропиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-метокси-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A766);

циклопропиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-метокси-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]-диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A767);

циклопропиламид 2-[5-[2-(3-диметиламино-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A768)

циклопропиламид 2-[5-[2-(2-диметиламино-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A769);

{4-[2-(5-циклопропилкарбамоил-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-уксусная кислота, транс-изомер, (соединение А770);

3-{4-[2-(5-циклопропилкарбамоил-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-пропионовая кислота, транс-изомер, (соединение А771);

циклопропиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-изопропил-амино-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А772);

циклопропиламид 2-[5-(2-аллиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А773);

циклопропиламид 2-[5-(2-циклопропилметил-амино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А774);

циклопропиламид 2-[5-[2-(цианометил-амино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А775);

циклопропиламид 2-[5-[2-(2-циано-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А776);

циклопропиламид 2-[5-[2-(2-циано-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А777);

циклопропиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиридин-3-

иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A778);

циклопропиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиримидин-4-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A779);

циклопропиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пропиламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A780);

циклопропиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пирролидин-1-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A781);

циклопропиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-фтор-фениламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A782);

циклопропиламид 2-[5-[2-(3,4-дифтор-фениламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A783);

циклопропиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-метокси-фениламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A784);

циклопропиламид 2-[5-[2-(4-фтор-бензиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A785);

циклопропиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-метокси-бензиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A786);

циклопропиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метокси-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A787);

циклопропиламид 2-[5-(2-бензилокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A788);

циклопропиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-фенокси-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A789);

циклопропиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-метокси-этокси)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A790);

циклопропиламид 2-[5-[2-(2-диметиламино-этокси)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A791);

циклопропиламид 2-[5-(2-циклогексилокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A792);

циклопропиламид 2-[5-(2-изопропокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A793);

циклопропиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пропокси-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A794);

циклопропиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-гидрокси-этокси)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A795);

циклопропиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-гидрокси-пропокси)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A796);

циклопропиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфанил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A797);

пропиламид 2-[5-(2-амино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A798);

пропиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метиламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A799);

пропиламид 2-[5-(2-диметиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-

фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбо-  
новой кислоты, транс-изомер, (соединение А800);

пропиламид 2-[5-(2-циклопропиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-  
карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А801);

пропиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиперидин-4-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]ди-  
оксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А802);

пропиламид 2-[5-(2-циклогексиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-  
карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А803);

пропиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-гидрокси-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]-  
диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А804);

пропиламид 2-[5-[2-(2-амино-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-  
карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А805);

пропиламид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[3-(5H-имидазол-1-ил)-пропиламино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-  
[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А806);

пропиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-морфолин-4-ил-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-  
[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А807);

пропиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-гидрокси-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A808);

пропиламид 2-[5-(2-бензиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A809);

пропиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(1-фенил-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, R-изомер, транс-изомер, (соединение A810);

пропиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(1-фенил-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, S-изомер, транс-изомер, (соединение A811);

пропиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-фениламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A812);

пропиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пиперидин-1-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A813);

пропиламид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиридин-4-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A814);

пропиламид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиридин-3-илме-

тил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A815);

пропиламид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиридин-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A816);

пропиламид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(фуран-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A817);

пропиламид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(тиофен-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A818);

пропиламид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A819);

пропиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-метил-пиперазин-1-ил)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A820);

пропиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-морфолин-4-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A821);

пропиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-метокси-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-

[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А822);

пропиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-метокси-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1Н-имидазол-2-ил}-5-метил-

[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А823);

пропиламид 2-[5-[2-(3-диметиламино-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-

[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А824)

пропиламид 2-[5-[2-(2-диметиламино-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-

[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А825);

{4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-метил-5-пропилкарбамоил-[1,3]диоксан-2-ил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-уксусная кислота, транс-изомер, (соединение А826);

3-{4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-метил-5-пропилкарбамоил-[1,3]диоксан-2-ил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-пропионовая кислота, транс-изомер, (соединение А827);

пропиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-изопропиламино-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А828);

пропиламид 2-[5-(2-аллиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А829);

пропиламид 2-[5-(2-циклопропилметил-амино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A830);

пропиламид 2-[5-[2-(цианометил-амино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A831);

пропиламид 2-[5-[2-(2-циано-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A832);

пропиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиридин-3-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A833);

пропиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиридин-4-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A834);

пропиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пропиламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A835);

пропиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пирролидин-1-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A836);

пропиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-фтор-фениламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]-диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение

А837);

пропиламид 2-[5-[2-(3,4-дифтор-фениламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А838);

пропиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-метокси-фениламино)-пиримидин-4-ил]-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А839);

пропиламид 2-[5-[2-(4-фтор-бензиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А840);

пропиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-метокси-бензиламино)-пиримидин-4-ил]-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А841);

пропиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метокси-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А842);

пропиламид 2-[5-(2-бензилокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А843);

пропиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-фенокси-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А844);

пропиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-метокси-этокси)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3] диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A845);

пропиламид 2-[5-[2-(2-диметиламино-этокси)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3] диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A846);

пропиламид 2-[5-(2-циклогексилокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3] диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A847);

пропиламид 2-[5-(2-изопропокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3] диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A848);

пропиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пропокси-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3] диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A849);

пропиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-гидрокси-этокси)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3] диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A850);

пропиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-гидрокси-пропокси)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3] диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A851);

пропиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфанил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3] диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A852);

циклогексиламид 2-[5-(2-амино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A853);

циклогексиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метиламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A854);

циклогексиламид 2-[5-(2-диметиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A855);

циклогексиламид 2-[5-(2-циклопропиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A856);

циклогексиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиперидин-4-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A857);

циклогексиламид 2-[5-(2-циклогексиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A858);

циклогексиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-гидрокси-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A859);

циклогексиламид 2-[5-[2-(2-амино-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение

А860);

циклогексиламид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[3-(5Н-имидазол-1-ил)-пропиламино]-пиримидин-4-ил}-1Н-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А861);

циклогексиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-морфолин-4-ил-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1Н-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А862);

циклогексиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-гидрокси-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1Н-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А863);

циклогексиламид 2-[5-(2-бензиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А864);

циклогексиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(1-фенил-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1Н-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, R-изомер, транс-изомер, (соединение А865);

циклогексиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(1-фенил-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1Н-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, S-изомер, транс-изомер, (соединение А866);

циклогексиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-фениламино-пи-

имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А867);

циклогексиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пиперидин-1-ил-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А868);

циклогексиламид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[ (пиридин-4-илметил)-амино]-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А869);

циклогексиламид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[ (пиридин-3-илметил)-амино]-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А870);

циклогексиламид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[ (пиридин-2-илметил)-амино]-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А871);

циклогексиламид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[ (фуран-2-илметил)-амино]-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А872);

циклогексиламид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[ (тиофен-2-илметил)-амино]-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А873);

циклогексиламид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[ (тетрагидро-

фуран-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A874);

циклогексиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-метил-пиперазин-1-ил)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A875);

циклогексиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-морфолин-4-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A876);

циклогексиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-метокси-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A877);

циклогексиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-метокси-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A878);

циклогексиламид 2-[5-[2-(3-диметиламино-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A879)

циклогексиламид 2-[5-[2-(2-диметиламино-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A880);

{4-[2-(5-циклогексилкарбамоил-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-уксусная кислота, транс-изомер, (соединение А881);

3-{4-[2-(5-циклогексилкарбамоил-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-пропионовая кислота, транс-изомер, (соединение А882);

циклогексиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-изопропиламино-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А883);

циклогексиламид 2-[5-(2-аллиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А884);

циклогексиламид 2-[5-(2-циклопропилметил-амино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А885);

циклогексиламид 2-[5-[2-(цианометил-амино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А886);

циклогексиламид 2-[5-[2-(2-циано-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А887);

циклогексиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиридин-3-иламино)-пиримидин-4-ил]-1Н-имидазол-2-ил}-5-метил-

[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А888);

циклогексиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиридин-4-иламино)-пиримидин-4-ил]-1Н-имидазол-2-ил}-5-метил-

[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А889);

циклогексиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пропиламино-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А890);

циклогексиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пирролидин-1-ил-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А891);

циклогексиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-фтор-фениламино)-пиримидин-4-ил]-1Н-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А892);

циклогексиламид 2-[5-[2-(3,4-дифтор-фениламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А893);

циклогексиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-метокси-фениламино)-пиримидин-4-ил]-1Н-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А894);

циклогексиламид 2-[5-[2-(4-фтор-бензиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-

[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А895);

циклогексиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-метокси-бензиламино)-пиримидин-4-ил]-1Н-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А896);

циклогексиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метокси-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А897);

циклогексиламид 2-[5-(2-бензилокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А898);

циклогексиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-фенокси-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А899);

циклогексиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-метокси-этокси)-пиримидин-4-ил]-1Н-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А900);

циклогексиламид 2-[5-[2-(2-диметиламино-этокси)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А901);

циклогексиламид 2-[5-(2-циклогексилокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А902);

циклогексиламид 2-[5-(2-изопропокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A903);

циклогексиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пропокси-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A904);

циклогексиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-гидрокси-этокси)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A905);

циклогексиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-гидрокси-пропокси)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A906);

циклогексиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфанил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A907);

(2-гидрокси-этил)-амид 2-[5-(2-амино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A908);

(2-гидрокси-этил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метиламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A909);

(2-гидрокси-этил)-амид 2-[5-(2-диметиламино-пиримидин-

4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-

[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A910);

(2-гидрокси-этил)-амид 2-[5-(2-циклопропиламино-  
пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-  
[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A911);

(2-гидрокси-этил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(  
пиперидин-4-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-  
метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер,  
(соединение A912);

(2-гидрокси-этил)-амид 2-[5-(2-циклотексиламино-  
пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-  
[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A913);

(2-гидрокси-этил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-  
гидрокси-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-  
метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер,  
(соединение A914);

(2-гидрокси-этил)-амид 2-[5-[2-(2-амино-этиламино)-  
пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-  
[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A915);

(2-гидрокси-этил)-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[3-(5H-  
имидазол-1-ил)-пропиламино]-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-

ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер,  
(соединение A916);

(2-гидрокси-этил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-  
морфолин-4-ил-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-  
ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер,  
(соединение A917);

(2-гидрокси-этил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-  
гидрокси-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-  
метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер,  
(соединение A918);

(2-гидрокси-этил)-амид 2-[5-(2-бензиламино-пиримидин-4-  
ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-  
5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A919);

(2-гидрокси-этил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(1-  
фенил-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-  
[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, R-изомер, транс-изомер,  
(соединение A920);

(2-гидрокси-этил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(1-  
фенил-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-  
[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, S-изомер, транс-изомер,  
(соединение A921);

(2-гидрокси-этил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-  
фениламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-  
[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение  
A922);

(2-гидрокси-этил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пипери-

дин-1-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-

[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A923);

(2-гидрокси-этил)-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-  
[(пиримидин-4-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-  
ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер,  
(соединение A924);

(2-гидрокси-этил)-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-  
[(пиримидин-3-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-  
ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер,  
(соединение A925);

(2-гидрокси-этил)-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-  
[(пиримидин-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-  
ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер,  
(соединение A926);

(2-гидрокси-этил)-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-  
[(фуран-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-  
5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер,  
(соединение A927);

(2-гидрокси-этил)-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-  
[(тиофен-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-  
ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер,  
(соединение A928);

(2-гидрокси-этил)-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-  
[(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-  
имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты,

транс-изомер, (соединение A929);

(2-гидрокси-этил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-метил-пиперазин-1-ил)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A930);

(2-гидрокси-этил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-морфолин-4-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A931);

(2-гидрокси-этил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-метокси-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A932);

(2-гидрокси-этил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-метокси-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A933);

(2-гидрокси-этил)-амид 2-[5-[2-(3-диметиламино-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A934)

(2-гидрокси-этил)-амид 2-[5-[2-(2-диметиламино-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A935);

(4-{5-(4-фтор-фенил)-2-[5-(2-гидрокси-этилкарбамоил)-5-

метил-[1,3]диоксан-2-ил)-3H-имидазол-4-ил}-пиримидин-2-иламино}-уксусная кислота, транс-изомер, (соединение A936);

3-(4-(5-(4-фтор-фенил)-2-[5-(2-гидрокси-этилкарбамоил)-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил)-3H-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино)-пропионовая кислота, транс-изомер, (соединение A937);

(2-гидрокси-этил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-изопропиламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A938);

(2-гидрокси-этил)-амид 2-[5-(2-аллиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A939);

(2-гидрокси-этил)-амид 2-[5-(2-циклопропилметил-амино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A940);

(2-гидрокси-этил)-амид 2-[5-[2-(цианометил-амино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A941);

(2-гидрокси-этил)-амид 2-[5-[2-(2-циано-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A942);

(2-гидрокси-этил)-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пири-

дин-3-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A943);

(2-гидрокси-этил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиридин-4-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A944);

(2-гидрокси-этил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пропиламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A945);

(2-гидрокси-этил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пирролидин-1-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A946);

(2-гидрокси-этил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-фтор-фениламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A947);

(2-гидрокси-этил)-амид 2-[5-[2-(3,4-дифтор-фениламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A948);

(2-гидрокси-этил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-метокси-фениламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соеди-

нение А949);

(2-гидрокси-этил)-амид 2-[5-[2-(4-фтор-бензиламино)-  
пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-  
[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение  
А950);

(2-гидрокси-этил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-  
метокси-бензиламино)-пиримидин-4-ил]-1Н-имидазол-2-ил}-5-  
метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер,  
(соединение А951);

(2-гидрокси-этил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-  
метокси-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-  
[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение  
А952);

(2-гидрокси-этил)-амид 2-[5-(2-бензилокси-пиримидин-4-  
ил)-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-  
5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А953);

(2-гидрокси-этил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-  
фенокси-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-  
[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение  
А954);

(2-гидрокси-этил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-  
метокси-этокси)-пиримидин-4-ил]-1Н-имидазол-2-ил}-5-метил-  
[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение  
А955);

(2-гидрокси-этил)-амид 2-[5-[2-(2-диметиламино-этокси)-  
пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-

[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А956);

(2-гидрокси-этил)-амид 2-[5-(2-циклогексилокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А957);

(2-гидрокси-этил)-амид 2-[5-(2-изопропокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А958);

(2-гидрокси-этил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пропокси-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А959);

(2-гидрокси-этил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-гидрокси-этокси)-пиримидин-4-ил]-1Н-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А960);

(2-гидрокси-этил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-гидрокси-пропокси)-пиримидин-4-ил]-1Н-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А961);

(2-гидрокси-этил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфанил-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А962);

(2-амино-этил)-амид 2-[5-(2-амино-пиримидин-4-ил)-4-(4-

фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A963);

(2-амино-этил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метиламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A964);

(2-амино-этил)-амид 2-[5-(2-диметиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A965);

(2-амино-этил)-амид 2-[5-(2-циклопропиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A966);

(2-амино-этил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиперидин-4-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A967);

(2-амино-этил)-амид 2-[5-(2-циклогексиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A968);

(2-амино-этил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-гидрокси-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A969);

(2-амино-этил)-амид 2-[5-[2-(2-амино-этиламино)-пирими-

дин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-  
[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение  
A970);

(2-амино-этил)-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[3-(5H-  
имидазол-1-ил)-пропиламино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-  
ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер,  
(соединение A971);

(2-амино-этил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-  
морфолин-4-ил-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-  
ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер,  
(соединение A972);

(2-амино-этил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-  
гидрокси-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-  
метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер,  
(соединение A973);

(2-амино-этил)-амид 2-[5-(2-бензиламино-пиримидин-4-  
ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-  
5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A974);

(2-амино-этил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(1-фенил-  
этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-  
[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, R-изомер, транс-изомер,  
(соединение A975);

(2-амино-этил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(1-фенил-  
этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-  
[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, S-изомер, транс-изомер,  
(соединение A976);

(2-амино-этил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-фениламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A977);

(2-амино-этил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пиперидин-1-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A978);

(2-амино-этил)-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиридин-4-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A979);

(2-амино-этил)-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиридин-3-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A980);

(2-амино-этил)-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиридин-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A981);

(2-амино-этил)-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(фуран-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A982);

(2-амино-этил)-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(тиофен-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение

А983);

(2-амино-этил)-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-  
[(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1Н-  
имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты,  
транс-изомер, (соединение А984);

(2-амино-этил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-метил-  
пиперазин-1-ил)-пиримидин-4-ил]-1Н-имидазол-2-ил}-5-метил-  
[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение  
А985);

(2-амино-этил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-морфолин-  
4-ил-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-  
5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А986);

(2-амино-этил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-  
метокси-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1Н-имидазол-2-ил}-5-  
метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер,  
(соединение А987);

(2-амино-этил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-  
метокси-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1Н-имидазол-2-ил}-5-  
метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер,  
(соединение А988);

(2-амино-этил)-амид 2-[5-[2-(3-диметиламино-  
пропиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-  
ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер,  
(соединение А989)

(2-амино-этил)-амид 2-[5-[2-(2-диметиламино-этиламино)-  
пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-

[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А990);

{4-[2-[5-(2-амино-этилкарбамоил)-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил]-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-уксусная кислота, транс-изомер, (соединение А991);

3-{4-[2-[5-(2-амино-этилкарбамоил)-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил]-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-пропионовая кислота, транс-изомер, (соединение А992);

(2-амино-этил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-изопропиламино-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А993);

(2-амино-этил)-амид 2-[5-(2-аллиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А994);

(2-амино-этил)-амид 2-[5-(2-циклопропилметил-амино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А995);

(2-амино-этил)-амид 2-[5-[2-(цианометил-амино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А996);

(2-амино-этил)-амид 2-[5-[2-(2-циано-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-

[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A997);

(2-амино-этил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиридин-3-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-

[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A998);

(2-амино-этил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиридин-4-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-

[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A999);

(2-амино-этил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пропиламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-

[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1000);

(2-амино-этил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пирролидин-1-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-

[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1001);

(2-амино-этил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-фтор-фениламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-

[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1002);

(2-амино-этил)-амид 2-[5-[2-(3,4-дифтор-фениламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-

[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1003);

(2-амино-этил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-метокси-фениламино)-пиримидин-4-ил]-1Н-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1004);

(2-амино-этил)-амид 2-[5-[2-(4-фтор-бензиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1005);

(2-амино-этил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-метокси-бензиламино)-пиримидин-4-ил]-1Н-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1006);

(2-амино-этил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метокси-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1007);

(2-амино-этил)-амид 2-[5-(2-бензилокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1008);

(2-амино-этил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-фенокси-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1009);

(2-амино-этил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-метокси-этокси)-пиримидин-4-ил]-1Н-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1010);

(2-амино-этил)-амид 2-[5-[2-(2-диметиламино-этокси)-пи-

римидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1011);

(2-амино-этил)-амид 2-[5-(2-циклогексилокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1012);

(2-амино-этил)-амид 2-[5-(2-изопропокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1013);

(2-амино-этил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пропокси-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1014);

(2-амино-этил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-гидрокси-этокси)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1015);

(2-амино-этил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-гидрокси-пропокси)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1016);

(2-амино-этил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфанил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1017);

(3-гидрокси-пропил)-амид 2-[5-(2-амино-пиримидин-4-ил)-

4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1018);

(3-гидрокси-пропил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метиламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1019);

(3-гидрокси-пропил)-амид 2-[5-(2-диметиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1020);

(3-гидрокси-пропил)-амид 2-[5-(2-циклопропиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1021);

(3-гидрокси-пропил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиперидин-4-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1022);

(3-гидрокси-пропил)-амид 2-[5-(2-циклогексиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1023);

(3-гидрокси-пропил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-гидрокси-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1024);

(3-гидрокси-пропил)-амид 2-[5-[2-(2-амино-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1025);

(3-гидрокси-пропил)-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[3-(5H-имидазол-1-ил)-пропиламино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1026);

(3-гидрокси-пропил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-морфолин-4-ил-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1027);

(3-гидрокси-пропил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-гидрокси-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1028);

(3-гидрокси-пропил)-амид 2-[5-(2-бензиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1029);

(3-гидрокси-пропил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(1-фенил-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, R-изомер, транс-изомер, (соединение A1030);

(3-гидрокси-пропил)-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(1-

фенил-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-  
[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, S-изомер, транс-изомер,  
(соединение A1031);

(3-гидрокси-пропил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-  
фениламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-  
[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение  
A1032);

(3-гидрокси-пропил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-  
пиперидин-1-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-  
[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение  
A1033);

(3-гидрокси-пропил)-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-  
[(пиридин-4-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-  
ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер,  
(соединение A1034);

(3-гидрокси-пропил)-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-  
[(пиридин-3-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-  
ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер,  
(соединение A1035);

(3-гидрокси-пропил)-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-  
[(пиридин-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-  
ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер,  
(соединение A1036);

(3-гидрокси-пропил)-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-  
[(фуран-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-  
5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер,

(соединение A1037);

(3-гидрокси-пропил)-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-  
[(тиофен-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-  
ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер,  
(соединение A1038);

(3-гидрокси-пропил)-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-  
[(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-  
имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты,  
транс-изомер, (соединение A1039);

(3-гидрокси-пропил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-  
метил-пиперазин-1-ил)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-  
метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер,  
(соединение A1040);

(3-гидрокси-пропил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-  
морфолин-4-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-  
[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение  
A1041);

(3-гидрокси-пропил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-  
метокси-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-  
метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер,  
(соединение A1042);

(3-гидрокси-пропил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-  
метокси-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-  
метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер,  
(соединение A1043);

(3-гидрокси-пропил)-амид 2-[5-[2-(3-диметиламино-про-

пиламино) -пиримидин-4-ил] -4- (4-фтор-фенил) -1H-имидазол-2-ил] -5-метил- [1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1044)

(3-гидрокси-пропил) -амид 2- [5- [2- (2-диметиламино-этиламино) -пиримидин-4-ил] -4- (4-фтор-фенил) -1H-имидазол-2-ил] -5-метил- [1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1045);

(4- {5- (4-фтор-фенил) -2- [5- (3-гидрокси-пропилкарбамоил) -5-метил- [1,3]диоксан-2-ил) -3H-имидазол-4-ил} -пиримидин-2-иламино} -уксусная кислота, транс-изомер, (соединение A1046);

3- (4- {5- (4-фтор-фенил) -2- [5- (3-гидрокси-пропилкарбамоил) -5-метил- [1,3]диоксан-2-ил) -3H-имидазол-4-ил} -пиримидин-2-иламино} -пропионовая кислота, транс-изомер, (соединение A1047);

(3-гидрокси-пропил) -амид 2- [4- (4-фтор-фенил) -5- (2-изопропиламино-пиримидин-4-ил) -1H-имидазол-2-ил] -5-метил- [1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1048);

(3-гидрокси-пропил) -амид 2- [5- (2-аллиламино-пиримидин-4-ил) -4- (4-фтор-фенил) -1H-имидазол-2-ил] -5-метил- [1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1049);

(3-гидрокси-пропил) -амид 2- [5- (2-циклопропилметиламино) -пиримидин-4-ил] -4- (4-фтор-фенил) -1H-имидазол-2-ил] -5-метил- [1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1050);

(3-гидрокси-пропил)-амид 2-[5-[2-(цианометил-амино)-  
пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-  
[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение  
A1051);

(3-гидрокси-пропил)-амид 2-[5-[2-(2-циано-этиламино)-  
пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-  
[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение  
A1052);

(3-гидрокси-пропил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-  
(пиридин-3-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-  
метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер,  
(соединение A1053);

(3-гидрокси-пропил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-  
(пиридин-4-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-  
метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер,  
(соединение A1054);

(3-гидрокси-пропил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-  
пропиламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-  
[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение  
A1055);

(3-гидрокси-пропил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-  
пирролидин-1-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-  
[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение  
A1056);

(3-гидрокси-пропил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-  
фтор-фениламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-

[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1057);

(3-гидрокси-пропил)-амид 2-[5-[2-(3,4-дифтор-фениламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1058);

(3-гидрокси-пропил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-метокси-фениламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1059);

(3-гидрокси-пропил)-амид 2-[5-[2-(4-фтор-бензиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1060);

(3-гидрокси-пропил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-метокси-бензиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1061);

(3-гидрокси-пропил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метокси-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1062);

(3-гидрокси-пропил)-амид 2-[5-(2-бензилокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1063);

(3-гидрокси-пропил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-фенокси-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1064);

(3-гидрокси-пропил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-метокси-этокси)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1065);

(3-гидрокси-пропил)-амид 2-[5-[2-(2-диметиламино-этокси)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1066);

(3-гидрокси-пропил)-амид 2-[5-(2-циклогексилокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1067);

(3-гидрокси-пропил)-амид 2-[5-(2-изопропокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1068);

(3-гидрокси-пропил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пропокси-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1069);

(3-гидрокси-пропил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-гидрокси-этокси)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-

[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1070);

(3-гидрокси-пропил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-гидрокси-пропокси)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1071);

(3-гидрокси-пропил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфанил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1072);

бензиламид 2-[5-(2-амино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1073);

бензиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метиламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1074);

бензиламид 2-[5-(2-диметиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1075);

бензиламид 2-[5-(2-циклопропиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1076);

бензиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиперидин-4-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1077);

бензиламид 2-[5-(2-циклогексиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1078);

бензиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-гидрокси-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1079);

бензиламид 2-[5-[2-(2-амино-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1080);

бензиламид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[3-(5H-имидазол-1-ил)-пропиламино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1081);

бензиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-морфолин-4-ил-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1082);

бензиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-гидрокси-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1083);

бензиламид 2-[5-(2-бензиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1084);

бензиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(1-фенил-этиламини-

но) -пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, R-изомер, транс-изомер, (соединение A1085);

бензиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(1-фенил-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, S-изомер, транс-изомер, (соединение A1086);

бензиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-фениламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1087);

бензиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пиперидин-1-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1088);

бензиламид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиридин-4-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1089);

бензиламид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиридин-3-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1090);

бензиламид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиридин-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1091);

бензиламид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(фуран-2-илметил)-

амино]-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-

[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1092);

бензиламид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(тиофен-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1093);

бензиламид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1094);

бензиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-метил-пиперазин-1-ил)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1095);

бензиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-морфолин-4-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1096);

бензиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-метокси-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1097);

бензиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-метокси-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1098);

бензиламид 2-[5-[2-(3-диметиламино-пропиламино)-  
пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-  
[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение  
A1099)

бензиламид 2-[5-[2-(2-диметиламино-этиламино)-  
пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-  
[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение  
A1100);

{4-[2-(5-бензилкарбамоил-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-  
(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-  
уксусная кислота, транс-изомер, (соединение A1101);

3-{4-[2-(5-бензилкарбамоил-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил)-  
5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-  
пропионовая кислота, транс-изомер, (соединение A1102);

бензиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-изопропиламино-  
пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-  
карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1103);

бензиламид 2-[5-(2-аллиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-  
фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-  
карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1104);

бензиламид 2-[5-(2-циклопропилметил-амино)-пиримидин-4-  
ил]-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-  
5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1105);

бензиламид 2-[5-[2-(цианометил-амино)-пиримидин-4-ил]-  
4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-  
карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1106);

бензиламид 2-[5-[2-(2-циано-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1107);

бензиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиридин-3-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1108);

бензиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиридин-4-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1109);

бензиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пропиламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1110);

бензиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пирролидин-1-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1111);

бензиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-фтор-фениламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1112);

бензиламид 2-[5-[2-(3,4-дифтор-фениламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1113);

бензиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-метокси-фениламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-

[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1114);

бензиламид 2-[5-[2-(4-фтор-бензиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1115);

бензиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-метокси-бензиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1116);

бензиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метокси-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1117);

бензиламид 2-[5-(2-бензилокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1118);

бензиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-фенокси-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1119);

бензиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-метокси-этокси)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1120);

бензиламид 2-[5-[2-(2-диметиламино-этокси)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1121);

бензиламид 2-[5-(2-циклогексилокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-кар-

боновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1122);

бензиламид 2-[5-(2-изопропокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1123);

бензиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пропокси-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1124);

бензиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-гидрокси-этокси)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1125);

бензиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-гидрокси-пропокси)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1126);

бензиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфанил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1127);

фениламид 2-[5-(2-амино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1128);

фениламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метиламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1129);

фениламид 2-[5-(2-диметиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбо-

новой кислоты, транс-изомер, (соединение A1130);

фениламид 2-[5-(2-циклопропиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1131);

фениламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиперидин-4-иламино)-пиримидин-4-ил]-1Н-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1132);

фениламид 2-[5-(2-циклогексиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1133);

фениламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-гидрокси-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1Н-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1134);

фениламид 2-[5-[2-(2-амино-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1135);

фениламид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[3-(5Н-имидазол-1-ил)-пропиламино]-пиримидин-4-ил}-1Н-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1136);

фениламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-морфолин-4-ил-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1Н-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1137);

фениламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-гидрокси-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1138);

фениламид 2-[5-(2-бензиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1139);

фениламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(1-фенил-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, R-изомер, транс-изомер, (соединение A1140);

фениламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(1-фенил-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, S-изомер, транс-изомер, (соединение A1141);

фениламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-фениламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1142);

фениламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пиперидин-1-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1143);

фениламид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиридин-4-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1144);

фениламид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[ (пиридин-3-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1145);

фениламид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[ (пиридин-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1146);

фениламид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[ (фуран-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1147);

фениламид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[ (тиофен-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1148);

фениламид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[ (тетрагидро-фуран-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1149);

фениламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-метил-пиперазин-1-ил)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1150);

фениламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-морфолин-4-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбо-

новой кислоты, транс-изомер, (соединение A1151);

фениламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-метокси-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1152);

фениламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-метокси-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1153);

фениламид 2-[5-[2-(3-диметиламино-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1154)

фениламид 2-[5-[2-(2-диметиламино-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1155);

{4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-метил-5-фенилкарбамоил-[1,3]диоксан-2-ил)-3H-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-уксусная кислота, транс-изомер, (соединение A1156);

3-{4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-метил-5-фенилкарбамоил-[1,3]диоксан-2-ил)-3H-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-пропионовая кислота, транс-изомер, (соединение A1157);

фениламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-изопропиламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1158);

фениламид 2-[5-(2-аллиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1159);

фениламид 2-[5-(2-циклопропилметил-амино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1160);

фениламид 2-[5-[2-(цианометил-амино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1161);

фениламид 2-[5-[2-(2-циано-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1162);

фениламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиридин-3-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1163);

фениламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиридин-4-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1164);

фениламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пропиламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1165);

фениламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пирролидин-1-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1166);

фениламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-фтор-фениламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-

карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1167);

фениламид 2-[5-[2-(3,4-дифтор-фениламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1168);

фениламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-метокси-фениламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1169);

фениламид 2-[5-[2-(4-фтор-бензиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1170);

фениламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-метокси-бензиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1171);

фениламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метокси-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1172);

фениламид 2-[5-(2-бензилокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1173);

фениламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-фенокси-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1174);

фениламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-метокси-этокси)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-

карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1175);

фениламид 2-[5-[2-(2-диметиламино-этокси)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1176);

фениламид 2-[5-(2-циклотексилокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1177);

фениламид 2-[5-(2-изопропокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1178);

фениламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пропокси-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1179);

фениламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-гидрокси-этокси)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1180);

фениламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-гидрокси-пропокси)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1181);

фениламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфанил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1182);

{2-[5-(2-амино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-пиперидин-1-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1183);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метиламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-пиперидин-1-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1184);

{2-[5-(2-диметиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-пиперидин-1-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1185);

{2-[5-(2-циклопропиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-пиперидин-1-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1186);

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиперидин-4-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-пиперидин-1-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1187);

{2-[5-(2-циклогексиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-пиперидин-1-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1188);

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-гидрокси-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-пиперидин-1-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1189);

{2-[5-[2-(2-амино-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-пиперидин-1-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1190);

[2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[3-(5H-имидазол-1-ил)-пропиламино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил]-пиперидин-1-ил-метанон, транс-изомер,

(соединение A1191);

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-морфолин-4-ил-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-пиперидин-1-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1192);

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-гидрокси-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-пиперидин-1-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1193);

{2-[5-(2-бензиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-пиперидин-1-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1194);

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(1-фенил-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-пиперидин-1-ил-метанон, R-изомер, транс-изомер, (соединение A1195);

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(1-фенил-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-пиперидин-1-ил-метанон, S-изомер, транс-изомер, (соединение A1196);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-фениламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-пиперидин-1-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1197);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пиперидин-1-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-пиперидин-1-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1198);

[2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиридин-4-илметил)-амино]}-

пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3] диоксан-5-ил]-пиперидин-1-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1199);

[2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиридин-3-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3] диоксан-5-ил]-пиперидин-1-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1200);

[2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиридин-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3] диоксан-5-ил]-пиперидин-1-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1201);

[2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(фуран-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3] диоксан-5-ил]-пиперидин-1-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1202);

[2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(тиофен-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3] диоксан-5-ил]-пиперидин-1-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1203);

[2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3] диоксан-5-ил]-пиперидин-1-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1204);

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-метил-пиперазин-1-ил)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3] диоксан-5-ил)-пиперидин-1-ил-метанон, транс-изомер, (соединение

A1205);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-морфолин-4-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-пиперидин-1-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1206);

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-метокси-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-пиперидин-1-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1207);

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-метокси-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-пиперидин-1-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1208);

{2-[5-[2-(3-диметиламино-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-пиперидин-1-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1209)

{2-[5-[2-(2-диметиламино-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-пиперидин-1-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1210);

(4-{5-(4-фтор-фенил)-2-[5-метил-5-(пиперидин-1-карбонил)-[1,3]диоксан-2-ил]-3H-имидазол-4-ил}-пиримидин-2-иламино)-уксусная кислота, транс-изомер, (соединение A1211);

3-(4-{5-(4-фтор-фенил)-2-[5-метил-5-(пиперидин-1-карбонил)-[1,3]диоксан-2-ил]-3H-имидазол-4-ил}-пиримидин-2-иламино)-пропионовая кислота, транс-изомер, (соединение A1212);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-изопропиламино-пиримидин-4-

ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-пиперидин-1-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1213);

{2-[5-(2-аллиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-пиперидин-1-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1214);

{2-[5-(2-циклопропилметил-амино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-пиперидин-1-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1215);

(4-{5-(4-фтор-фенил)-2-[5-метил-5-пиперидин-1-карбонил]-[1,3]диоксан-2-ил]-3H-имидазол-4-ил}-пиримидин-2-иламино)-ацетонитрил, транс-изомер, (соединение A1216);

3-(4-{5-(4-фтор-фенил)-2-[5-метил-5-(пиперидин-1-карбонил)-[1,3]диоксан-2-ил]-3H-имидазол-4-ил}-пиримидин-2-иламино)-пропионитрил, транс-изомер, (соединение A1217);

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиридин-3-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-пиперидин-1-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1218);

2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиридин-4-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-пиперидин-1-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1219);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пропиламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-пиперидин-1-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1220);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пирролидин-1-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-пиперидин-

1-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1221);

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-фтор-фениламино)-  
пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-  
ил)-пиперидин-1-ил-метанон, транс-изомер, (соединение  
A1222);

{2-[5-[2-(3,4-дифтор-фениламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-  
фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-  
пиперидин-1-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1223);

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-метокси-фениламино)-  
пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-  
ил)-пиперидин-1-ил-метанон, транс-изомер, (соединение  
A1224);

{2-[5-[2-(4-фтор-бензиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-  
фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-  
пиперидин-1-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1225);

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-метокси-бензиламино)-  
пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-  
ил)-пиперидин-1-ил-метанон, транс-изомер, (соединение  
A1226);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метокси-пиримидин-4-ил)-1H-  
имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-пиперидин-1-ил-  
метанон, транс-изомер, (соединение A1227);

{2-[5-(2-бензилокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-  
1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-пиперидин-1-ил-  
метанон, транс-изомер, (соединение A1228);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-фенокси-пиримидин-4-ил)-1H-

имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-пиперидин-1-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1229);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-метокси-этокси)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-пиперидин-1-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1230);

{2-[5-[2-(2-диметиламино-этокси)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-пиперидин-1-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1231);

{2-[5-(2-циклогексилокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-пиперидин-1-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1232);

{2-[5-(2-изопропокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-пиперидин-1-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1233);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пропокси-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-пиперидин-1-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1234);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-гидрокси-этокси)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-пиперидин-1-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1235);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-гидрокси-пропокси)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-пиперидин-1-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1236);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфанил-пиримидин-4-

ил) -1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-пиперидин-1-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1237);

(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амид 2-[5-(2-амино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1238);

(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метиламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1239);

(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амид 2-[5-(2-диметиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1240);

(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амид 2-[5-(2-циклопропиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1241);

(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиперидин-4-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1242);

(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амид 2-[5-(2-циклотексил-амино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1243);

(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-гидрокси-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1244);

(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амид 2-[5-[2-(2-амино-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1245);

(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[3-(5H-имидазол-1-ил)-пропиламино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1246);

(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-морфолин-4-ил-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1247);

(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-гидрокси-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1248);

(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амид 2-[5-(2-бензиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1249);

(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(1-фенил-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-

5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, R-изомер, транс-изомер, (соединение A1250);

(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(1-фенил-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, S-изомер, транс-изомер, (соединение A1251);

(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-фениламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1252);

(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пиперидин-1-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1253);

(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиридин-4-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1254);

(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиридин-3-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1255);

(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиридин-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1256);

(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(фуран-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1257);

(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(тиофен-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1258);

(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1259);

(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-метил-пиперазин-1-ил)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1260);

(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-морфолин-4-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1261);

(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-метокси-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1262);

(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-метокси-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-

ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер,  
(соединение A1263);

(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амид 2-[5-[2-(3-  
диметиламино-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-  
1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты,  
транс-изомер, (соединение A1264)

(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амид 2-[5-[2-(2-  
диметиламино-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-  
имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты,  
транс-изомер, (соединение A1265);

{4-[5-(4-фтор-фенил)-2-{5-метил-5-[(тетрагидро-фуран-2-  
илметил)-карбамоил]-[1,3]диоксан-2-ил}-3H-имидазол-4-ил)-  
пиримидин-2-иламино]-уксусная кислота, транс-изомер,  
(соединение A1266);

3-{4-[5-(4-фтор-фенил)-2-{5-метил-5-[(тетрагидро-фуран-  
2-илметил)-карбамоил]-[1,3]диоксан-2-ил}-3H-имидазол-4-ил)-  
пиримидин-2-иламино]-пропионовая кислота, транс-изомер,  
(соединение A1267);

(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-  
5-(2-изопропиламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-  
метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер,  
(соединение A1268);

(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амид 2-[5-(2-аллиламино-  
пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-  
[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение  
A1269);

(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амид 2-[5-(2-циклопропил-метил-амино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1270);

(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амид 2-[5-[2-(цианометил-амино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1271);

(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амид 2-[5-[2-(2-циано-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1272);

(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиридин-3-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1273);

(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиридин-4-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1274);

(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пропиламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1275);

(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пирролидин-1-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-

метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер,  
(соединение A1276);

(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-  
5-[2-(4-фтор-фениламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-  
5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер,  
(соединение A1277);

(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амид 2-[5-[2-(3,4-дифтор-  
фениламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-  
ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер,  
(соединение A1278);

(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-  
5-[2-(3-метокси-фениламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-  
ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер,  
(соединение A1279);

(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амид 2-[5-[2-(4-фтор-  
бензиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-  
ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер,  
(соединение A1280);

(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-  
5-[2-(4-метокси-бензиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-  
ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер,  
(соединение A1281);

(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-  
5-(2-метокси-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-  
[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение  
A1282);

(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амид 2-[5-(2-бензилокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1283);

(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-фенокси-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1284);

(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-метокси-этокси)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1285);

(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амид 2-[5-[2-(2-диметил-амино-этокси)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1286);

(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амид 2-[5-(2-циклогексил-окси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1287);

(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амид 2-[5-(2-изопропокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1288);

(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пропокси-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-

[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1289);

(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-гидрокси-этокси)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1290);

(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-гидрокси-пропокси)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1291);

(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфанил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1292);

{2-[5-(2-амино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-(4-метил-пиперазин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение A1293);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метиламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-(4-метил-пиперазин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение A1294);

{2-[5-(2-диметиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-(4-метил-пиперазин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение A1295);

{2-[5-(2-циклопропиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-(4-метил-пиперазин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение

A1296);

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиперидин-4-иламино)-  
пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-  
ил)-(4-метил-пиперазин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соеди-  
нение A1297);

{2-[5-(2-циклогексиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-  
фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-(4-  
метил-пиперазин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение  
A1298);

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-гидрокси-этиламино)-  
пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-  
ил)-(4-метил-пиперазин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соеди-  
нение A1299);

{2-[5-[2-(2-амино-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-  
фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-(4-  
метил-пиперазин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение  
A1300);

{2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[3-(5H-имидазол-1-ил)-  
пропиламино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-  
[1,3]диоксан-5-ил)-(4-метил-пиперазин-1-ил)-метанон, транс-  
изомер, (соединение A1301);

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-морфолин-4-ил-  
пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-  
[1,3]диоксан-5-ил)-(4-метил-пиперазин-1-ил)-метанон, транс-  
изомер, (соединение A1302);

RU 2 2 2 1 7 9 5 C 2

RU 2 2 2 1 7 9 5 C 2

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-гидрокси-пропиламино)-  
пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-  
(4-метил-пиперазин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение  
A1303);

{2-[5-(2-бензиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-  
1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-(4-метил-  
пиперазин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение A1304);

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(1-фенил-этиламино)-  
пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-  
ил)-(4-метил-пиперазин-1-ил)-метанон, R-изомер, транс-  
изомер, (соединение A1305);

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(1-фенил-этиламино)-  
пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-  
ил)-(4-метил-пиперазин-1-ил)-метанон, S-изомер, транс-  
изомер, (соединение A1306);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-фениламино-пиримидин-4-ил)-  
1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-(4-метил-  
пиперазин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение A1307);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пиперидин-1-ил-пиримидин-4-  
ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-(4-метил-  
пиперазин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение A1308);

[2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиридин-4-илметил)-амино]-  
пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-  
ил)-(4-метил-пиперазин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соеди-  
нение A1309);

[2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиридин-3-илметил)-амино]-

пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-(4-метил-пиперазин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение A1310);

[2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиридин-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-(4-метил-пиперазин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение A1311);

[2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(фуран-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-(4-метил-пиперазин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение A1312);

[2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(тиофен-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-(4-метил-пиперазин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение A1313);

[2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-(4-метил-пиперазин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение A1314);

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-метил-пиперазин-1-ил)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-(4-метил-пиперазин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение A1315);

(2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-морфолин-4-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-(4-метил-пиперазин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение A1316);

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-метокси-пропиламино)-  
пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-  
ил)-(4-метил-пиперазин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соеди-  
нение A1317);

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-метокси-этиламино)-  
пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-  
ил)-(4-метил-пиперазин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соеди-  
нение A1318);

{2-[5-[2-(3-диметиламино-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-  
4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-  
ил)-(4-метил-пиперазин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соеди-  
нение A1319)

{2-[5-[2-(2-диметиламино-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-  
(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил]-  
(4-метил-пиперазин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение  
A1320);

(4-{5-(4-фтор-фенил)-2-[5-метил-5-(4-метил-пиперазин-1-  
карбонил)-[1,3]диоксан-2-ил]-3H-имидазол-4-ил}-пиримидин-2-  
иламино)-уксусная кислота, транс-изомер, (соединение A1321);

3-(4-{5-(4-фтор-фенил)-2-[5-метил-5-(4-метил-пиперазин-  
1-карбонил)-[1,3]диоксан-2-ил]-3H-имидазол-4-ил}-пиримидин-  
2-иламино)-пропионовая кислота, транс-изомер, (соединение  
A1322);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-изопропиламино-пиримидин-4-  
ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-(4-метил-  
пиперазин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение A1323);

{2-[5-(2-аллиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-(4-метил-пиперазин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение A1324);

{2-[5-(2-циклопропилметил-амино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-(4-метил-пиперазин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение A1325);

(4-{5-(4-фтор-фенил)-2-[5-метил-5-(4-метил-пиперазин-1-карбонил)-[1,3]диоксан-2-ил]-3H-имидазол-4-ил}-пиримидин-2-иламино)-ацетонитрил, транс-изомер, (соединение A1326);

3-(4-{5-(4-фтор-фенил)-2-[5-метил-5-(4-метил-пиперазин-1-карбонил)-[1,3]диоксан-2-ил]-3H-имидазол-4-ил}-пиримидин-2-иламино)-пропионитрил, транс-изомер, (соединение A1327);

{2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиридин-3-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-(4-метил-пиперазин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение A1328);

2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиридин-4-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-(4-метил-пиперазин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение A1329);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пропиламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-(4-метил-пиперазин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение A1330);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пирролидин-1-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-(4-метил-пиперазин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение A1331);

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-фтор-фениламино)-  
пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-  
ил)-(4-метил-пиперазин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соеди-  
нение A1332);

{2-[5-[2-(3,4-дифтор-фениламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-  
фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-(4-  
метил-пиперазин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение  
A1333);

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-метокси-фениламино)-  
пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-  
ил)-(4-метил-пиперазин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соеди-  
нение A1334);

{2-[5-[2-(4-фтор-бензиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-  
фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-(4-  
метил-пиперазин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение  
A1335);

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-метокси-бензиламино)-  
пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-  
ил)-(4-метил-пиперазин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соеди-  
нение A1336);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метокси-пиримидин-4-ил)-1H-  
имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-(4-метил-  
пиперазин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение A1337);

{2-[5-(2-бензилокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-  
1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-(4-метил-  
пиперазин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение A1338);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-фенокси-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-(4-метил-пиперазин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение A1339);

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-метокси-этокси)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-(4-метил-пиперазин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение A1340);

{2-[5-[2-(2-диметиламино-этокси)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-(4-метил-пиперазин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение A1341);

{2-[5-(2-циклогексилокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-(4-метил-пиперазин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение A1342);

{2-[5-(2-изопропокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-(4-метил-пиперазин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение A1343);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пропокси-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-(4-метил-пиперазин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение A1344);

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-гидрокси-этокси)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-(4-метил-пиперазин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение A1345);

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-гидрокси-пропокси)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-

ил) - (4-метил-пиперазин-1-ил) -метанон, транс-изомер, (соединение A1346);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфанил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-(4-метил-пиперазин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение A1347);

{2-[5-(2-амино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1348);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метиламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-метанон, (соединение A1349);

{2-[5-(2-диметиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1350);

{2-[5-(2-циклопропиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1351);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиперидин-4-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1352);

{2-[5-(2-циклогексиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1353);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-гидрокси-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1354);

{2-[5-[2-(2-амино-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1355);

[2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[3-(5H-имидазол-1-ил)-пропиламино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил]-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1356);

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-морфолин-4-ил-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1357);

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-гидрокси-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1358);

{2-[5-(2-бензиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил]-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1359);

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(1-фенил-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-морфолин-4-ил-метанон, R-изомер, транс-изомер, (соединение A1360);

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(1-фенил-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-морфолин-4-ил-метанон, S-изомер, транс-изомер, (соединение A1361);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-фениламинс-пиримидин-4-ил)-

1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3] диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1362);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пиперидин-1-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3] диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1363);

[2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиридин-4-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3] диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1364);

[2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиридин-3-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3] диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1365);

[2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиридин-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3] диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1366);

[2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(фуран-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3] диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1367);

[2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(тиофен-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3] диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1368);

[2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3] диоксан-5-ил]-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1369);

{2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-метил-пиперазин-1-ил)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3] диоксан-5-

ил)-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1370);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-морфолин-4-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1371);

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-метокси-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1372);

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-метокси-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1373);

{2-[5-[2-(3-диметиламино-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1374)

{2-[5-[2-(2-диметиламино-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1375);

(4-{5-(4-фтор-фенил)-2-[5-метил-5-(морфолин-4-карбонил)-[1,3]диоксан-2-ил]-3H-имидазол-4-ил}-пиримидин-2-иламино)-уксусная кислота, транс-изомер, (соединение A1376);

3-(4-{5-(4-фтор-фенил)-2-[5-метил-5-(морфолин-4-карбонил)-[1,3]диоксан-2-ил]-3H-имидазол-4-ил}-пиримидин-2-иламино)-пропионовая кислота, транс-изомер, (соединение A1377);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-изопропиламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1378);

{2-[5-(2-аллиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1379);

{2-[5-(2-циклопропилметил-амино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1380);

(4-{5-(4-фтор-фенил)-2-[5-метил-5-(морфолин-4-карбонил)-[1,3]диоксан-2-ил]-3H-имидазол-4-ил}-пиримидин-2-иламино)-ацетонитрил, транс-изомер, (соединение A1381);

3-(4-{5-(4-фтор-фенил)-2-[5-метил-5-(морфолин-4-карбонил)-[1,3]диоксан-2-ил]-3H-имидазол-4-ил}-пиримидин-2-иламино)-пропионитрил, транс-изомер, (соединение A1382);

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиридин-3-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1383);

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиридин-4-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1384);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пропиламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1385);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пирролидин-1-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1386);

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-фтор-фениламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-

ил)-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1387);

{2-[5-[2-(3,4-дифтор-фениламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1388);

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-метокси-фениламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1389);

{2-[5-[2-(4-фтор-бензиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1390);

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-метокси-бензиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1391);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метокси-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (Соединение A1392);

{2-[5-(2-бензилокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1393);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-фенокси-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1394);

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-метокси-этокси)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1395);

{2-[5-[2-(2-диметиламино-этокси)-пиримидин-4-ил]-4-(4-

фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-  
морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1396);

{2-[5-(2-циклогексилокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-  
фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-  
морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1397);

{2-[5-(2-изопропокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-  
1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-  
метанон, транс-изомер, (соединение A1398);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пропокси-пиримидин-4-ил)-1H-  
имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-морфолин-4-ил-  
метанон, транс-изомер, (соединение A1399);

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-гидрокси-этокси)-  
пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-  
ил}-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1400);

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-гидрокси-пропокси)-  
пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-  
ил}-морфолин-4-ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1401);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфанил-пиримидин-4-  
ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-морфолин-4-  
ил-метанон, транс-изомер, (соединение A1402);

(3-метокси-пропил)-амид 2-[5-(2-амино-пиримидин-4-ил)-  
4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-  
карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1403);

(3-метокси-пропил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метил-  
амино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-  
[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение

A1404);

(3-метокси-пропил)-амид 2-[5-(2-диметиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1405);

(3-метокси-пропил)-амид 2-[5-(2-циклопропиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1406);

(3-метокси-пропил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиперидин-4-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1407);

(3-метокси-пропил)-амид 2-[5-(2-циклогексиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1408);

(3-метокси-пропил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-гидрокси-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1409);

(3-метокси-пропил)-амид 2-[5-[2-(2-амино-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1410);

(3-метокси-пропил)-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[3-

(5H-имидазол-1-ил)-пропиламино]-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1411);

(3-метокси-пропил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-морфолин-4-ил-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1412);

(3-метокси-пропил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-гидрокси-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1413);

(3-метокси-пропил)-амид 2-[5-(2-бензиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1414);

(3-метокси-пропил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(1-фенил-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, R-изомер, транс-изомер, (соединение A1415);

(3-метокси-пропил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(1-фенил-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, S-изомер, транс-изомер, (соединение A1416);

(3-метокси-пропил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-фениламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение

A1417);

(3-метокси-пропил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-  
пиперидин-1-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-  
[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение  
A1418);

(3-метокси-пропил)-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-  
[(пиридин-4-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-  
ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер,  
(соединение A1419);

(3-метокси-пропил)-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-  
[(пиридин-3-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-  
ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер,  
(соединение A1420);

(3-метокси-пропил)-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-  
[(пиридин-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-  
ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер,  
(соединение A1421);

(3-метокси-пропил)-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-  
[(фуран-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-  
5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер,  
(соединение A1422);

(3-метокси-пропил)-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-  
[(тиофен-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-  
ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер,  
(соединение A1423);

(3-метокси-пропил)-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-

[ (тетрагидро-фуран-2-илметил) -амино] -пиримидин-4-ил} -1Н-имидазол-2-ил) -5-метил- [1, 3] диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А1424);

(3-метокси-пропил) -амид 2-{4-(4-фтор-фенил) -5-[2-(4-метил-пиперазин-1-ил) -пиримидин-4-ил] -1Н-имидазол-2-ил} -5-метил- [1, 3] диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А1425);

(3-метокси-пропил) -амид 2-[4-(4-фтор-фенил) -5-(2-морфолин-4-ил-пиримидин-4-ил) -1Н-имидазол-2-ил] -5-метил- [1, 3] диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А1426);

(3-метокси-пропил) -амид 2-{4-(4-фтор-фенил) -5-[2-(3-метокси-пропиламино) -пиримидин-4-ил] -1Н-имидазол-2-ил} -5-метил- [1, 3] диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А1427);

(3-метокси-пропил) -амид 2-{4-(4-фтор-фенил) -5-[2-(2-метокси-этиламино) -пиримидин-4-ил] -1Н-имидазол-2-ил} -5-метил- [1, 3] диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А1428);

(3-метокси-пропил) -амид 2-[5-[2-(3-диметиламино-пропиламино) -пиримидин-4-ил] -4-(4-фтор-фенил) -1Н-имидазол-2-ил] -5-метил- [1, 3] диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение А1429)

(3-метокси-пропил) -амид 2-[5-[2-(2-диметиламино-этиламино) -пиримидин-4-ил] -4-(4-фтор-фенил) -1Н-имидазол-2-ил] -5-метил- [1, 3] диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер,

(соединение A1430);

(4-{5-(4-фтор-фенил)-2-[5-(3-метокси-пропилкарбамоил)-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил]-3H-имидазол-4-ил}-пиримидин-2-иламино)-уксусная кислота, транс-изомер, (соединение A1431);

3-(4-{5-(4-фтор-фенил)-2-[5-(3-метокси-пропилкарбамоил)-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил]-3H-имидазол-4-ил}-пиримидин-2-иламино)-пропионовая кислота, транс-изомер, (соединение A1432);

(3-метокси-пропил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-изо-пропиламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1433);

(3-метокси-пропил)-амид 2-[5-(2-аллиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1434);

(3-метокси-пропил)-амид 2-[5-(2-циклопропилметил-амино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1435);

(3-метокси-пропил)-амид 2-[5-[2-(цианометил-амино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1436);

(3-метокси-пропил)-амид 2-[5-[2-(2-циано-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение

A1437);

(3-метокси-пропил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиридин-3-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1438);

(3-метокси-пропил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиридин-4-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1439);

(3-метокси-пропил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пропиламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]-диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1440);

(3-метокси-пропил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пирролидин-1-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1441);

(3-метокси-пропил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-фтор-фениламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1442);

(3-метокси-пропил)-амид 2-[5-[2-(3,4-дифтор-фениламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1443);

RU 2 2 2 1 7 9 5 C 2

RU 2 2 2 1 7 9 5 C 2

(3-метокси-пропил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-метокси-фениламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1444);

(3-метокси-пропил)-амид 2-[5-[2-(4-фтор-бензиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1445);

(3-метокси-пропил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-метокси-бензиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1446);

(3-метокси-пропил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метокси-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1447);

(3-метокси-пропил)-амид 2-[5-(2-бензилокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1448);

(3-метокси-пропил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-феноксипиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1449);

(3-метокси-пропил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-метокси-этокси)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1450);

(3-метокси-пропил)-амид 2-[5-[2-(2-диметиламино-эток-

си) -пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1451);

(3-метокси-пропил)-амид 2-[5-(2-циклогексилокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]-диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1452);

(3-метокси-пропил)-амид 2-[5-(2-изопропокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1453);

(3-метокси-пропил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пропокси-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1454);

(3-метокси-пропил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-гидрокси-этокси)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1455);

(3-метокси-пропил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-гидрокси-пропокси)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1456);

(3-метокси-пропил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфанил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение

A1457);

(2-метокси-этил)-амид 2-[5-(2-амино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-измер, (соединение A1458);

(2-метокси-этил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метиламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1459);

(2-метокси-этил)-амид 2-[5-(2-диметиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1460);

(2-метокси-этил)-амид 2-[5-(2-циклопропиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1461);

(2-метокси-этил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиперидин-4-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1462);

(2-метокси-этил)-амид 2-[5-(2-циклогексиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1463);

(2-метокси-этил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-гидрокси-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (сое-

динение A1464);

(2-метокси-этил)-амид 2-[5-[2-(2-амино-этиламино)-  
пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-  
[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение  
A1465);

(2-метокси-этил)-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-(2-[3-(5H-  
имидазол-1-ил)-пропиламино]-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-  
ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер,  
(соединение A1466);

(2-метокси-этил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-  
морфолин-4-ил-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-  
ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер,  
(соединение A1467);

(2-метокси-этил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-гид-  
рокси-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-  
метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (сое-  
динение A1468);

(2-метокси-этил)-амид 2-[5-(2-бензиламино-пиримидин-4-  
ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-  
5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1469);

(2-метокси-этил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(1-  
фенил-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-  
[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, R-изомер, транс-изомер,  
(соединение A1470);

(2-метокси-этил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(1-  
фенил-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-

[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, S-изомер, транс-изомер, (соединение A1471);

(2-метокси-этил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-фенил-амино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1472);

(2-метокси-этил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пиперидин-1-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1473);

(2-метокси-этил)-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиримидин-4-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1474);

(2-метокси-этил)-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиримидин-3-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1475);

(2-метокси-этил)-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиримидин-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1476);

(2-метокси-этил)-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(фуран-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1477);

(2-метокси-этил)-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(тио-

RU 2 2 2 1 7 9 5 C 2

RU 2 2 2 1 7 9 5 C 2

фен-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1478);

(2-метокси-этил)-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1479);

(2-метокси-этил)-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-метил-пиперазин-1-ил)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1480);

(2-метокси-этил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-морфолин-4-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]-диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1481);

(2-метокси-этил)-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-метокси-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1482);

(2-метокси-этил)-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-метокси-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1483);

(2-метокси-этил)-амид 2-[5-[2-(3-диметиламино-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер,

(соединение A1484)

(2-метокси-этил)-амид 2-[5-[2-(2-диметиламино-этил-амино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1485);

(4-{5-(4-фтор-фенил)-2-[5-(2-метокси-этилкарбамоил)-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил]-3H-имидазол-4-ил}-пиримидин-2-иламино)-уксусная кислота, транс-изомер, (соединение A1486);

3-(4-{5-(4-фтор-фенил)-2-[5-(3-метокси-этилкарбамоил)-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил]-3H-имидазол-4-ил}-пиримидин-2-иламино)-пропионовая кислота, транс-изомер, (соединение A1487);

(2-метокси-этил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-изопропиламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]-диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1488);

(2-метокси-этил)-амид 2-[5-(2-аллиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1489);

(2-метокси-этил)-амид 2-[5-(2-циклопропилметил-амино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1490);

(2-метокси-этил)-амид 2-[5-[2-(цианометил-амино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение

A1491);

(2-метокси-этил)-амид 2-[5-[2-(2-циано-этиламино)-  
пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-  
[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение  
A1492);

(2-метокси-этил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-  
(пиридин-3-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-  
метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (сое-  
динение A1493);

(2-метокси-этил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-  
(пиридин-4-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-  
метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (сое-  
динение A1494);

(2-метокси-этил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-  
пропиламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-  
[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение  
A1495);

(2-метокси-этил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-  
пирролидин-1-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-  
[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение  
A1496);

(2-метокси-этил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-фтор-  
фениламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-  
[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение  
A1497);

(2-метокси-этил)-амид 2-[5-[2-(3,4-дифтор-фениламино)-

пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1498);

(2-метокси-этил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-метокси-фениламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1499);

(2-метокси-этил)-амид 2-[5-[2-(4-фтор-бензиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1500);

(2-метокси-этил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-метокси-бензиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1501);

(2-метокси-этил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метокси-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1502);

(2-метокси-этил)-амид 2-[5-(2-бензилокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1503);

(2-метокси-этил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-фенокси-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1504);

(2-метокси-этил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-метокси-этокси)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-

[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1505);

(2-метокси-этил)-амид 2-[5-[2-(2-диметиламино-этокси)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1506);

(2-метокси-этил)-амид 2-[5-(2-циклотексилокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1507);

(2-метокси-этил)-амид 2-[5-(2-изопропокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1508);

(2-метокси-этил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пропокси-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1509);

(2-метокси-этил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-гидрокси-этокси)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1510);

(2-метокси-этил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-гидрокси-пропокси)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1511);

(2-метокси-этил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метил-

сульфанил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]-диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1512);

(3-диметиламино-пропил)-амид 2-[5-(2-амино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1513);

(3-диметиламино-пропил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метиламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1514);

(3-диметиламино-пропил)-амид 2-[5-(2-диметиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1515);

(3-диметиламино-пропил)-амид 2-[5-(2-циклопропиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1516);

(3-диметиламино-пропил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиперидин-4-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1517);

(3-диметиламино-пропил)-амид 2-[5-(2-циклогексиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1518);

(3-диметиламино-пропил)-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-гидрокси-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1519);

(3-диметиламино-пропил)-амид 2-[5-[2-(2-амино-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1520);

(3-диметиламино-пропил)-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[3-(5H-имидазол-1-ил)-пропиламино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1521);

(3-диметиламино-пропил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-морфолин-4-ил-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1522);

(3-диметиламино-пропил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-гидрокси-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1523);

(3-диметиламино-пропил)-амид 2-[5-(2-бензиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1524);

(3-диметиламино-пропил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(1-фенил-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-

метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, R-изомер, транс-изомер, (соединение A1525);

(3-диметиламино-пропил)-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(1-фенил-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, S-изомер, транс-изомер, (соединение A1526);

(3-диметиламино-пропил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-фениламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1527);

(3-диметиламино-пропил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пиперидин-1-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1528);

(3-диметиламино-пропил)-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиридин-4-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1529);

(3-диметиламино-пропил)-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиридин-3-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1530);

(3-диметиламино-пропил)-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиридин-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1531);

(3-диметиламино-пропил)-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(фуран-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1532);

(3-диметиламино-пропил)-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(тиофен-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1533);

(3-диметиламино-пропил)-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1534);

(3-диметиламино-пропил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-метил-пиперазин-1-ил)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1535);

(3-диметиламино-пропил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-морфолин-4-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1536);

(3-диметиламино-пропил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-метокси-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1537);

(3-диметиламино-пропил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-метокси-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-

метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер,  
(соединение A1538);

(3-диметиламино-пропил)-амид 2-[5-[2-(3-диметиламино-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер,  
(соединение A1539)

(3-диметиламино-пропил)-амид 2-[5-[2-(2-диметиламино-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер,  
(соединение A1540);

{4-[2-[5-(3-диметиламино-пропилкарбамоил)-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил]-5-(4-фтор-фенил)-3H-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-уксусная кислота, транс-изомер,  
(соединение A1541);

3-{4-[2-[5-(3-диметиламино-пропилкарбамоил)-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил]-5-(4-фтор-фенил)-3H-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-пропионовая кислота, транс-изомер,  
(соединение A1542);

(3-диметиламино-пропил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-изопропиламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1543);

(3-диметиламино-пропил)-амид 2-[5-(2-аллиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1544);

RU 2 2 2 1 7 9 5 C 2

RU 2 2 2 1 7 9 5 C 2

(3-диметиламино-пропил)-амид 2-[5-(2-циклопропилметил-амино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1545);

(3-диметиламино-пропил)-амид 2-[5-[2-(цианометил-амино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1546);

(3-диметиламино-пропил)-амид 2-[5-[2-(2-циано-этила-мино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1547);

(3-диметиламино-пропил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиридин-3-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1548);

(3-диметиламино-пропил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиридин-4-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1549);

(3-диметиламино-пропил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пропиламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1550);

(3-диметиламино-пропил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пирролидин-1-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-

[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1551);

(3-диметиламино-пропил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-фтор-фениламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1552);

(3-диметиламино-пропил)-амид 2-[5-[2-(3,4-дифтор-фениламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1553);

(3-диметиламино-пропил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-метокси-фениламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1554);

(3-диметиламино-пропил)-амид 2-[5-[2-(4-фтор-бензил-амино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1555);

(3-диметиламино-пропил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-метокси-бензиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1556);

(3-диметиламино-пропил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метокси-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1557);

(3-диметиламино-пропил)-амид 2-[5-(2-бензилокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1558);

(3-диметиламино-пропил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-фенокси-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1559);

(3-диметиламино-пропил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-метокси-этокси)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1560);

(3-диметиламино-пропил)-амид 2-[5-[2-(2-диметиламино-этокси)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1561);

(3-диметиламино-пропил)-амид 2-[5-(2-циклогексилокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1562);

(3-диметиламино-пропил)-амид 2-[5-(2-изопропокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1563);

(3-диметиламино-пропил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пропокси-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-

[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1564);

(3-диметиламино-пропил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-гидрокси-этокси)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1565);

(3-диметиламино-пропил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-гидрокси-пропокси)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1566);

(3-диметиламино-пропил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфанил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1567);

(2-диметиламино-этил)-амид 2-[5-(2-амино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1568);

(2-диметиламино-этил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метиламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1569);

(2-диметиламино-этил)-амид 2-[5-(2-диметиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1570);

(2-диметиламино-этил)-амид 2-[5-(2-циклопропиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1571);

(2-диметиламино-этил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиперидин-4-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1572);

(2-диметиламино-этил)-амид 2-[5-(2-циклогексиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1573);

(2-диметиламино-этил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-гидрокси-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1574);

(2-диметиламино-этил)-амид 2-[5-[2-(2-амино-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1575);

(2-диметиламино-этил)-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[3-(5H-имидазол-1-ил)-пропиламино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1576);

(2-диметиламино-этил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-морфолин-4-ил-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-

ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1577);

(2-диметиламино-этил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-гидрокси-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1578);

(2-диметиламино-этил)-амид 2-[5-(2-бензиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1579);

(2-диметиламино-этил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(1-фенил-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, R-изомер, транс-изомер, (соединение A1580);

(2-диметиламино-этил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(1-фенил-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, S-изомер, транс-изомер, (соединение A1581);

(2-диметиламино-этил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-фениламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1582);

(2-диметиламино-этил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пиперидин-1-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1583);

(2-диметиламино-этил)-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-  
[(пиридин-4-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-  
ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер,  
(соединение A1584);

(2-диметиламино-этил)-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-  
[(пиридин-3-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-  
ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер,  
(соединение A1585);

(2-диметиламино-этил)-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-  
[(пиридин-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-  
ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер,  
(соединение A1586);

(2-диметиламино-этил)-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-  
[(фуран-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-  
5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер,  
(соединение A1587);

(2-диметиламино-этил)-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-  
[(тиофен-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-  
ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер,  
(соединение A1588);

(2-диметиламино-этил)-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-  
[(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-  
имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты,  
транс-изомер, (соединение A1589);

(2-диметиламино-этил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-  
метил-пиперазин-1-ил)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-

метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1590);

(2-диметиламино-этил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-морфолин-4-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1591);

(2-диметиламино-этил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-метокси-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1592);

(2-диметиламино-этил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-метокси-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1593);

(2-диметиламино-этил)-амид 2-[5-[2-(3-диметиламино-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1594)

(2-диметиламино-этил)-амид 2-[5-[2-(2-диметиламино-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1595);

{4-[2-[5-(2-диметиламино-этилкарбамоил)-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил]-5-(4-фтор-фенил)-3H-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-уксусная кислота, транс-изомер, (соединение A1596);

3-{4-[2-[5-(2-диметиламино-этилкарбамоил)-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил]-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-пропионовая кислота, транс-изомер, (соединение A1597);

(2-диметиламино-этил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-изопропиламино-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1598);

(2-диметиламино-этил)-амид 2-[5-(2-аллиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1599);

(2-диметиламино-этил)-амид 2-[5-(2-циклопропилметиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1600);

(2-диметиламино-этил)-амид 2-[5-[2-(цианометил-амино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1601);

(2-диметиламино-этил)-амид 2-[5-[2-(2-циано-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1602);

(2-диметиламино-этил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиридин-3-иламино)-пиримидин-4-ил]-1Н-имидазол-2-ил}-5-

метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1603);

(2-диметиламино-этил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиридин-4-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-

метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1604);

(2-диметиламино-этил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пропиламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1605);

(2-диметиламино-этил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пирролидин-1-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1606);

(2-диметиламино-этил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-фтор-фениламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1607);

(2-диметиламино-этил)-амид 2-[5-[2-(3,4-дифтор-фениламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1608);

(2-диметиламино-этил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-метокси-фениламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1609);

(2-диметиламино-этил)-амид 2-[5-[2-(4-фтор-бензил-амино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1610);

(2-диметиламино-этил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-метокси-бензиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1611);

(2-диметиламино-этил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метокси-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]-диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1612);

(2-диметиламино-этил)-амид 2-[5-(2-бензилокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1613);

(2-диметиламино-этил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-фенокси-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]-диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1614);

(2-диметиламино-этил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-метокси-этокси)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1615);

(2-диметиламино-этил)-амид 2-[5-[2-(2-диметиламино-этокси)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-

5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1616);

(2-диметиламино-этил)-амид 2-[5-(2-циклопексилокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1617);

(2-диметиламино-этил)-амид 2-[5-(2-изопропокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1618);

(2-диметиламино-этил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пропокси-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1619);

(2-диметиламино-этил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-гидрокси-этокси)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1620);

(2-диметиламино-этил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-гидрокси-пропокси)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1621);

(2-диметиламино-этил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфанил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1622);

{2-[5-(2-амино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-(3-гидрокси-пирролидин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение A1623);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метиламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-(3-гидрокси-пирролидин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение A1624);

{2-[5-(2-диметиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-(3-гидрокси-пирролидин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение A1625);

{2-[5-(2-циклопропиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-(3-гидрокси-пирролидин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение A1626);

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиперидин-4-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-(3-гидрокси-пирролидин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение A1627);

{2-[5-(2-циклогексиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-(3-гидрокси-пирролидин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение A1628);

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-гидрокси-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-(3-гидрокси-пирролидин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение A1629);

{2-[5-[2-(2-амино-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-(3-гидрокси-пирролидин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение А1630);

[2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[3-(5Н-имидазол-1-ил)-пропиламино]-пиримидин-4-ил}-1Н-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-(3-гидрокси-пирролидин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение А1631);

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-морфолин-4-ил-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1Н-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-(3-гидрокси-пирролидин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение А1632);

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-гидрокси-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1Н-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-(3-гидрокси-пирролидин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение А1633);

{2-[5-(2-бензиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-(3-гидрокси-пирролидин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение А1634);

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(1-фенил-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1Н-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-(3-гидрокси-пирролидин-1-ил)-метанон, R-изомер, транс-изомер, (соединение А1635);

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(1-фенил-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1Н-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-(3-гидрокси-пирролидин-1-ил)-метанон, S-изомер, транс-

изомер, (соединение A1636);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-фениламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-(3-гидрокси-пирролидин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение A1637);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пиперидин-1-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-(3-гидрокси-пирролидин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение A1638);

[2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиридин-4-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-(3-гидрокси-пирролидин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение A1639);

[2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиридин-3-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-(3-гидрокси-пирролидин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение A1640);

[2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиридин-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-(3-гидрокси-пирролидин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение A1641);

[2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(фуран-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-(3-гидрокси-пирролидин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение A1642);

[2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(тиофен-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-

ил] - (3-гидрокси-пирролидин-1-ил) -метанон, транс-изомер,  
(соединение A1643);

[2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил] - (3-гидрокси-пирролидин-1-ил) -метанон, транс-изомер, (соединение A1644);

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-метил-пиперазин-1-ил)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил) - (3-гидрокси-пирролидин-1-ил) -метанон, транс-изомер, (соединение A1645);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-морфолин-4-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил] - (3-гидрокси-пирролидин-1-ил) -метанон, транс-изомер, (соединение A1646);

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-метокси-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил) - (3-гидрокси-пирролидин-1-ил) -метанон, транс-изомер, (соединение A1647);

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-метокси-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил) - (3-гидрокси-пирролидин-1-ил) -метанон, транс-изомер, (соединение A1648);

{2-[5-[2-(3-диметиламино-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил] - (3-гидрокси-пирролидин-1-ил) -метанон, транс-изомер, (соединение A1649)

{2-[5-[2-(2-диметиламино-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-(3-гидрокси-пирролидин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение A1650);

(4-{5-(4-фтор-фенил)-2-[5-(3-гидрокси-пирролидин-1-карбонил)-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил]-3H-имидазол-4-ил}-пиримидин-2-иламино)-уксусная кислота, транс-изомер, (соединение A1651);

3-(4-{5-(4-фтор-фенил)-2-[5-(3-гидрокси-пирролидин-1-карбонил)-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил]-3H-имидазол-4-ил}-пиримидин-2-иламино)-пропионовая кислота, транс-изомер, (соединение A1652);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-изопропиламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил]-(3-гидрокси-пирролидин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение A1653);

{2-[5-(2-аллиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил]-(3-гидрокси-пирролидин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение A1654);

{2-[5-(2-циклопропилметил-амино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил]-(3-гидрокси-пирролидин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение A1655);

(4-{5-(4-фтор-фенил)-2-[5-(3-гидрокси-пирролидин-1-карбонил)-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил]-3H-имидазол-4-ил}-пиримидин-2-иламино)-ацетонитрил, транс-изомер, (соединение

A1656);

3-(4-{5-(4-фтор-фенил)-2-[5-(3-гидрокси-пирролидин-1-карбонил)-5-метил-[1,3] диоксан-2-ил]-3H-имидазол-4-ил}-пиримидин-2-иламино)-пропионитрил, транс-изомер, (соединение A1657);

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиридин-3-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3] диоксан-5-ил)-(3-гидрокси-пирролидин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение A1658);

2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиридин-4-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3] диоксан-5-ил)-(3-гидрокси-пирролидин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение A1659);

(2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пропиламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3] диоксан-5-ил)-(3-гидрокси-пирролидин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение A1660);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пирролидин-1-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3] диоксан-5-ил)-(3-гидрокси-пирролидин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение A1661);

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-фтор-фениламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3] диоксан-5-ил)-(3-гидрокси-пирролидин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение A1662);

{2-[5-[2-(3,4-дифтор-фениламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3] диоксан-5-ил)-(3-

гидрокси-пирролидин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение A1663);

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-метокси-фениламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-(3-гидрокси-пирролидин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение A1664);

{2-[5-[2-(4-фтор-бензиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-(3-гидрокси-пирролидин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение A1665);

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-метокси-бензиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-(3-гидрокси-пирролидин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение A1666);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метокси-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-(3-гидрокси-пирролидин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение A1667);

{2-[5-(2-бензилокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-(3-гидрокси-пирролидин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение A1668);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-фенокси-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-(3-гидрокси-пирролидин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение A1669);

(2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-метокси-этокси)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил)-(3-

гидрокси-пирролидин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение A1670);

{2-[5-[2-(2-диметиламино-этокси)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-(3-гидрокси-пирролидин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение A1671);

{2-[5-(2-циклогексилокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-(3-гидрокси-пирролидин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение A1672);

{2-[5-(2-изопропокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-(3-гидрокси-пирролидин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение A1673);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пропокси-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-(3-гидрокси-пирролидин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение A1674);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-гидрокси-этокси)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-(3-гидрокси-пирролидин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение A1675);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-гидрокси-пропокси)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-(3-гидрокси-пирролидин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение A1676);

{2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфанил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-ил}-(3-

гидрокси-пирролидин-1-ил)-метанон, транс-изомер, (соединение A1677);

изопропил-амид 2-[5-(2-аминс-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1678);

изопропил-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метиламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1679);

изопропил-амид 2-[5-(2-диметиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1680);

изопропил-амид 2-[5-(2-циклопропиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1681);

изопропил-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиперидин-4-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1682);

изопропил-амид 2-[5-(2-циклогексиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1683);

изопропил-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-гидрокси-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1684);

изопропил-амид 2-[5-[2-(2-амино-этиламино)-пиримидин-4-

ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1685);

изопропил-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[3-(5H-имидазол-1-ил)-пропиламино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1686);

изопропил-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-морфолин-4-ил-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1687);

изопропил-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-гидрокси-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1688);

изопропил-амид 2-[5-(2-бензиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1689);

изопропил-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(1-фенил-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, R-изомер, транс-изомер, (соединение A1690);

изопропил-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(1-фенил-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, S-изомер, транс-изомер, (соединение A1691);

изопропил-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-фениламино-пи-

имидазин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1692);

изопропил-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пиперидин-1-ил-имидазин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1693);

изопропил-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиридин-4-илметил)-амино]-имидазин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1694);

изопропил-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиридин-3-илметил)-амино]-имидазин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1695);

изопропил-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиридин-2-илметил)-амино]-имидазин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1696);

изопропил-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(фуран-2-илметил)-амино]-имидазин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1697);

изопропил-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(тиофен-2-илметил)-амино]-имидазин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1698);

изопропил-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(тетрагидрофуран-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1699);

изопропил-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-метил-пиперазин-1-ил)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1700);

изопропил-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-морфолин-4-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1701);

изопропил-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-метокси-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1702);

изопропил-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-метокси-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1703);

изопропил-амид 2-[5-[2-(3-диметиламино-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1704)

изопропил-амид 2-[5-[2-(2-диметиламино-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-

[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1705);

{4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-изопропилкарбамоил-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-уксусная кислота, транс-изомер, (соединение A1706);

3-{4-[5-(4-фтор-фенил)-2-(5-изопропилкарбамоил-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-пропионовая кислота, транс-изомер, (соединение A1707);

изопропил-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-изопропиламино-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1708);

изопропил-амид 2-[5-(2-аллиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1709);

изопропил-амид 2-[5-(2-циклопропилметил-амино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1710);

изопропил-амид 2-[5-[2-(цианометил-амино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1711);

изопропил-амид 2-[5-[2-(2-циано-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1712);

изопропил-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиридин-3-иламино)-пиримидин-4-ил]-1Н-имидазол-2-ил}-5-метил-

[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1713);

изопропил-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиридин-4-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-

[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1714);

изопропил-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пропиламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1715);

изопропил-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пирролидин-1-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1716);

изопропил-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-фтор-фениламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1717);

изопропил-амид 2-[5-[2-(3,4-дифтор-фениламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1718);

изопропил-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-метокси-фениламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1719);

изопропил-амид 2-[5-[2-(4-фтор-бензиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-

RU 2 2 2 1 7 9 5 C 2

RU 2 2 2 1 7 9 5 C 2

[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1720);

изопропил-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-метокси-бензиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1721);

изопропил-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метокси-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1722);

изопропил-амид 2-[5-(2-бензилокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1723);

изопропил-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-фенокси-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1724);

изопропил-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-метокси-этокси)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1725);

изопропил-амид 2-[5-[2-(2-диметиламино-этокси)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1726);

изопропил-амид 2-[5-(2-циклогексилокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1727);

изопропил-амид 2-[5-(2-изопропокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1728);

изопропил-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пропокси-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1729);

изопропил-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-гидрокси-этоксипиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1730);

изопропил-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-гидрокси-пропокси)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1731);

изопропил-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфанил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1732);

аллиламид 2-[5-(2-амино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1733);

аллиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метиламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1734);

аллиламид 2-[5-(2-диметиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1735);

аллиламид 2-[5-(2-циклопропиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1736);

аллиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиперидин-4-иламино)-пиримидин-4-ил]-1Н-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1737);

аллиламид 2-[5-(2-циклогексиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1738);

аллиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-гидрокси-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1Н-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1739);

аллиламид 2-[5-[2-(2-амино-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1740);

аллиламид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[3-(5Н-имидазол-1-ил)-пропиламино]-пиримидин-4-ил}-1Н-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1741);

аллиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-морфолин-4-ил-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1Н-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1742);

аллиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-гидрокси-про-

пиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1743);

аллиламид 2-[5-(2-бензиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1744);

аллиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(1-фенил-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, R-изомер, транс-изомер, (соединение A1745);

аллиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(1-фенил-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, S-изомер, транс-изомер, (соединение A1746);

аллиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-фениламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1747);

аллиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пиперидин-1-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1748);

аллиламид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиридин-4-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1749);

аллиламид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиридин-3-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-

[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1750);

аллиламид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиридин-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1751);

аллиламид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(фуран-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1752);

аллиламид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(тиофен-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1753);

аллиламид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1754);

аллиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-метил-пиперазин-1-ил)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1755);

аллиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-морфолин-4-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1756);

аллиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-метокси-пропил-

амино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1757);

аллиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-метокси-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1758);

аллиламид 2-[5-[2-(3-диметиламино-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1759)

аллиламид 2-[5-[2-(2-диметиламино-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1760);

{4-[2-(5-аллилкарбамоил-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3H-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-уксусная кислота, транс-изомер, (соединение A1761);

3-{4-[2-(5-аллилкарбамоил-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил)-5-(4-фтор-фенил)-3H-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-пропионовая кислота, транс-изомер, (соединение A1762);

аллиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-изопропиламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1763);

аллиламид 2-[5-(2-аллиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой

кислоты, транс-изомер, (соединение A1764);

аллиламид 2-[5-(2-циклопропилметил-амино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1765);

аллиламид 2-[5-[2-(цианометил-амино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1766);

аллиламид 2-[5-[2-(2-циано-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1767);

аллиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиридин-3-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1768);

аллиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиридин-4-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1769);

аллиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пропиламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1770);

аллиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пирролидин-1-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1771);

аллиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-фтор-фениламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1772);

аллиламид 2-[5-[2-(3,4-дифтор-фениламинс)-пиримидин-4-

ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1773);

аллиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-метокси-фениламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1774);

аллиламид 2-[5-[2-(4-фтор-бензиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1775);

аллиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-метокси-бензиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1776);

аллиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метокси-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1777);

аллиламид 2-[5-(2-бензилокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1778);

аллиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-фенокси-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1779);

аллиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-метокси-этокси)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1780);

аллиламид 2-[5-[2-(2-диметиламино-этокси)-пиримидин-4-

ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1781);

аллиламид 2-[5-(2-циклогексилокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1782);

аллиламид 2-[5-(2-изопропокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1783);

аллиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пропокси-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1784);

аллиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-гидрокси-этокси)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1785);

аллиламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-гидрокси-пропокси)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1786);

аллиламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфанил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1787);

циклопропилметил-амид 2-[5-(2-амино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1788);

циклопропилметил-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метиламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-

[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1789);

циклопропилметил-амид 2-[5-(2-диметиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1790);

циклопропилметил-амид 2-[5-(2-циклопропиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1791);

циклопропилметил-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиперидин-4-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1792);

циклопропилметил-амид 2-[5-(2-циклогексиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1793);

циклопропилметил-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-гидрокси-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1794);

циклопропилметил-амид 2-[5-[2-(2-амино-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1795);

циклопропилметил-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[3-(5H-

RU 2 2 2 1 7 9 5 C 2

RU 2 2 2 1 7 9 5 C 2

имидазол-1-ил)-пропиламино]-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1796);

циклопропилметил-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-морфолин-4-ил-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1797);

циклопропилметил-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-гидрокси-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1798);

циклопропилметил-амид 2-[5-(2-бензиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1799);

циклопропилметил-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(1-фенил-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, R-изомер, транс-изомер, (соединение A1800);

циклопропилметил-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(1-фенил-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, S-изомер, транс-изомер, (соединение A1801);

циклопропилметил-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-фениламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1802);

RU 2 2 2 1 7 9 5 C 2

RU 2 2 2 1 7 9 5 C 2

циклопропилметил-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-  
пиперидин-1-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-  
[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение  
A1803);

циклопропилметил-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-  
[(пиридин-4-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-  
ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер,  
(соединение A1804);

циклопропилметил-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-  
[(пиридин-3-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-  
ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер,  
(соединение A1805);

циклопропилметил-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-  
[(пиридин-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-  
ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер,  
(соединение A1806);

циклопропилметил-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(фуран-  
2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-  
[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение  
A1807);

циклопропилметил-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-  
[(тиофен-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-  
ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер,  
(соединение A1808);

циклопропилметил-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-  
[(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-

имидазол-2-ил) -5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1809);

циклопропилметил-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-метил-пиперазин-1-ил)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1810);

циклопропилметил-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-морфолин-4-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1811);

циклопропилметил-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-метокси-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1812);

циклопропилметил-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-метокси-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1813);

циклопропилметил-амид 2-[5-[2-(3-диметиламино-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1814)

циклопропилметил-амид 2-[5-[2-(2-диметиламино-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1815);

{4-[2-[5-(циклопропилметил-карбамоил)-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил]-5-(4-фтор-фенил)-3H-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-уксусная кислота, транс-изомер, (соединение A1816);

3-{4-[2-[5-(циклопропилметил-карбамоил)-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил]-5-(4-фтор-фенил)-3H-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-пропионовая кислота, транс-изомер, (соединение A1817);

циклопропилметил-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-изопропиламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1818);

циклопропилметил-амид 2-[5-(2-аллиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1819);

циклопропилметил-амид 2-[5-(2-циклопропилметил-амино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1820);

циклопропилметил-амид 2-[5-[2-(цианометил-амино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1821);

циклопропилметил-амид 2-[5-[2-(2-циано-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение

A1822);

циклопропилметил-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиридин-3-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1823);

циклопропилметил-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиридин-4-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1824);

циклопропилметил-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пропиламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1825);

циклопропилметил-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пирролидин-1-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1826);

циклопропилметил-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-фтор-фениламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1827);

циклопропилметил-амид 2-[5-[2-(3,4-дифтор-фениламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1828);

циклопропилметил-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-

метокси-фениламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1829);

циклопропилметил-амид 2-[5-[2-(4-фтор-бензиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1830);

циклопропилметил-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-метокси-бензиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1831);

циклопропилметил-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метокси-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1832);

циклопропилметил-амид 2-[5-(2-бензилокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1833);

циклопропилметил-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-фенокси-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1834);

циклопропилметил-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-метокси-этокси)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1835);

циклопропилметил-амид 2-[5-[2-(2-диметиламино-этокси)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-

[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1836);

циклопропилметил-амид 2-[5-(2-циклогексилокси-  
пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-  
[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1837);

циклопропилметил-амид 2-[5-(2-изопропокси-пиримидин-4-  
ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-  
5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1838);

циклопропилметил-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-  
пропокси-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-  
[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1839);

циклопропилметил-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-  
гидрокси-этокси)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-  
[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1840);

циклопропилметил-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-  
гидрокси-пропокси)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-  
метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер,  
(соединение A1841);

циклопропилметил-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-  
метилсульфанил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-  
[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1842);

цианометил-амид 2-[5-(2-амино-пиримидин-4-ил)-4-(4-

фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-  
карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1843);

    цианометил-амид      2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метиламино-  
пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-  
карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1844);

    цианометил-амид      2-[5-(2-диметиламино-пиримидин-4-ил)-4-  
(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-  
карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1845);

    цианометил-амид      2-[5-(2-циклопропиламино-пиримидин-4-  
ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-  
5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1846);

    цианометил-амид      2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиперидин-4-  
иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-  
[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение  
A1847);

    цианометил-амид      2-[5-(2-циклогексиламино-пиримидин-4-  
ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-  
5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1848);

    цианометил-амид      2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-гидрокси-  
этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-  
[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение  
A1849);

    цианометил-амид      2-[5-[2-(2-амино-этиламино)-пиримидин-  
4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-  
[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение  
A1850);

цианометил-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[3-(5H-имидазол-1-ил)-пропиламино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1851);

цианометил-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-морфолин-4-ил-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1852);

цианометил-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-гидрокси-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1853);

цианометил-амид 2-[5-(2-бензиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1854);

цианометил-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(1-фенил-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, R-изомер, транс-изомер, (соединение A1855);

цианометил-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(1-фенил-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, S-изомер, транс-изомер, (соединение A1856);

цианометил-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-фениламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1857);

цианометил-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-гиперидин-1-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1858);

цианометил-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиридин-4-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1859);

цианометил-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиридин-3-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1860);

цианометил-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиридин-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1861);

цианометил-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(фуран-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1862);

цианометил-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(тиофен-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1863);

цианометил-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (сое-

динение A1864);

цианометил-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-метил-пиперазин-1-ил)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1865);

цианометил-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-морфолин-4-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1866);

цианометил-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-метокси-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1867);

цианометил-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-метокси-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1868);

цианометил-амид 2-[5-[2-(3-диметиламино-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1869)

цианометил-амид 2-[5-[2-(2-диметиламино-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1870);

{4-[2-[5-(цианометил-карбамоил)-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил]-5-(4-фтор-фенил)-3H-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-

уксусная кислота, транс-изомер, (соединение A1871);

3-{4-[2-[5-(цианометил-карбамоил)-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил]-5-(4-фтор-фенил)-3Н-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-пропионовая кислота, транс-изомер, (соединение A1872);

цианометил-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-изопропил-амино-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1873);

цианометил-амид 2-[5-(2-аллиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1874);

цианометил-амид 2-[5-(2-циклопропилметил-амино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1875);

цианометил-амид 2-[5-[2-(цианометил-амино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1876);

цианометил-амид 2-[5-[2-(2-циано-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1877);

цианометил-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиридин-3-иламино)-пиримидин-4-ил]-1Н-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1878);

цианометил-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиридин-4-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1879);

цианометил-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пропиламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1880);

цианометил-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пирролидин-1-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1881);

цианометил-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-фтор-фениламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1882);

цианометил-амид 2-[5-[2-(3,4-дифтор-фениламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1883);

цианометил-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-метокси-фениламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1884);

цианометил-амид 2-[5-[2-(4-фтор-бензиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1885);

цианометил-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-метокси-бензиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1886);

цианометил-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метокси-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1887);

цианометил-амид 2-[5-(2-бензилокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1888);

цианометил-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-фенокси-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1889);

цианометил-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-метокси-этокси)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1890);

цианометил-амид 2-[5-[2-(2-диметиламино-этокси)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1891);

цианометил-амид 2-[5-(2-циклогексилокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1892);

цианометил-амид 2-[5-(2-изопропокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-

карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1893);

цианометил-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пропокси-  
пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-  
карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1894);

цианометил-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-гидрокси-  
этокси)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-  
[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение  
A1895);

цианометил-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-гидрокси-  
пропокси)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-  
[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение  
A1896);

цианометил-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсуль-  
фанил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диок-  
сан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1897);

(2-циано-этил)-амид 2-[5-(2-амино-пиримидин-4-ил)-4-(4-  
фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-  
карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1898);

(2-циано-этил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метила-  
мино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-  
5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1899);

(2-циано-этил)-амид 2-[5-(2-диметиламино-пиримидин-4-  
ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-  
5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1900);

(2-циано-этил)-амид 2-[5-(2-циклопропиламино-пиримидин-

4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]-диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1901);

(2-циано-этил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиперидин-4-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1902);

(2-циано-этил)-амид 2-[5-(2-циклогексиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1903);

(2-циано-этил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-гидрокси-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1904);

(2-циано-этил)-амид 2-[5-[2-(2-амино-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1905);

(2-циано-этил)-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[3-(5H-имидазол-1-ил)-пропиламино]-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1906);

(2-циано-этил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-морфолин-4-ил-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (сое-

динение A1907);

(2-циано-этил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-гидрокси-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1908);

(2-циано-этил)-амид 2-[5-(2-бензиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1909);

(2-циано-этил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(1-фенил-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, R-изомер, транс-изомер, (соединение A1910);

(2-циано-этил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(1-фенил-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, S-изомер, транс-изомер, (соединение A1911);

(2-циано-этил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-фениламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1912);

(2-циано-этил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пиперидин-1-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1913);

(2-циано-этил)-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиримидин-4-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение

A1914);

(2-циано-этил)-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиридин-3-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1915);

(2-циано-этил)-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиридин-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1916);

(2-циано-этил)-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(фуран-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1917);

(2-циано-этил)-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(тиофен-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1918);

(2-циано-этил)-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(тетрагидро-фуран-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1919);

(2-циано-этил)-амид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-метил-пиперазин-1-ил)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1920);

(2-циано-этил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-морфолин-

4-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1921);

(2-циано-этил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-метокси-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1922);

(2-циано-этил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-метокси-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1923);

(2-циано-этил)-амид 2-[5-[2-(3-диметиламино-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1924)

(2-циано-этил)-амид 2-[5-[2-(2-диметиламино-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1925);

{4-[2-[5-(2-циано-этилкарбамоил)-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил]-5-(4-фтор-фенил)-3H-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-уксусная кислота, транс-изомер, (соединение A1926);

3-{4-[2-[5-(2-циано-этилкарбамоил)-5-метил-[1,3]диоксан-2-ил]-5-(4-фтор-фенил)-3H-имидазол-4-ил]-пиримидин-2-иламино}-пропионовая кислота, транс-изомер, (соединение A1927);

(2-циано-этил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-изопропил-

амино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]ди-  
оксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение  
A1928);

(2-циано-этил)-амид 2-[5-(2-аллиламино-пиримидин-4-ил)-  
4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-  
карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1929);

(2-циано-этил)-амид 2-[5-(2-циклопропилметил-амино)-  
пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-  
[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение  
A1930);

(2-циано-этил)-амид 2-[5-[2-(цианометил-амино)-пири-  
мидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-  
[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение  
A1931);

(2-циано-этил)-амид 2-[5-[2-(2-циано-этиламино)-пири-  
мидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-  
[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение  
A1932);

(2-циано-этил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиридин-  
3-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-  
[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение  
A1933);

(2-циано-этил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиридин-  
4-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-  
[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение  
A1934);

RU 2 2 2 1 7 9 5 C 2

RU 2 2 2 1 7 9 5 C 2

(2-циано-этил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пропил-амино-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1935);

(2-циано-этил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пирролидин-1-ил-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]-диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1936);

(2-циано-этил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-фтор-фениламино)-пиримидин-4-ил]-1Н-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1937);

(2-циано-этил)-амид 2-[5-[2-(3,4-дифтор-фениламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1938);

(2-циано-этил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-метокси-фениламино)-пиримидин-4-ил]-1Н-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1939);

(2-циано-этил)-амид 2-[5-[2-(4-фтор-бензиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1940);

(2-циано-этил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-метокси-бензиламино)-пиримидин-4-ил]-1Н-имидазол-2-ил}-5-

метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1941);

(2-циано-этил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метокси-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1942);

(2-циано-этил)-амид 2-[5-(2-бензилокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1943);

(2-циано-этил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-фенокси-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1944);

(2-циано-этил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-метокси-этокси)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1945);

(2-циано-этил)-амид 2-[5-[2-(2-диметиламино-этокси)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1946);

(2-циано-этил)-амид 2-[5-(2-циклогексилокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1947);

(2-циано-этил)-амид 2-[5-(2-изопропокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1948);

(2-циано-этил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пропокси-  
пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-  
карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1949);

(2-циано-этил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-гид-  
рокси-этокси)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-  
[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение  
A1950);

(2-циано-этил)-амид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-гид-  
рокси-пропокси)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-  
[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение  
A1951);

(2-циано-этил)-амид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метил-  
сульфанил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]-  
диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение  
A1952);

пиридин-3-иламид 2-[5-(2-амино-пиримидин-4-ил)-4-(4-  
фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-  
карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1953);

пиридин-3-иламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метиламино-  
пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-  
карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1954);

пиридин-3-иламид 2-[5-(2-диметиламино-пиримидин-4-ил)-  
4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-  
карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1955);

пиридин-3-иламид 2-[5-(2-циклопропиламино-пиримидин-4-  
ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-

5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1956);

пиридин-3-иламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиперидин-4-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-

[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1957);

пиридин-3-иламид 2-[5-(2-циклогексиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1958);

пиридин-3-иламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-гидрокси-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-

[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1959);

пиридин-3-иламид 2-[5-[2-(2-амино-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-

[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1960);

пиридин-3-иламид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[3-(5H-имидазол-1-ил)-пропиламино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1961);

пиридин-3-иламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-морфолин-4-ил-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1962);

пиридин-3-иламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-гидрокси-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-

[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1963);

пиридин-3-иламид 2-[5-(2-бензиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1964);

пиридин-3-иламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(1-фенил-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1Н-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, R-изомер, транс-изомер, (соединение A1965);

пиридин-3-иламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(1-фенил-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1Н-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, S-изомер, транс-изомер, (соединение A1966);

пиридин-3-иламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-фениламино-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1967);

пиридин-3-иламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пиперидин-1-ил-пиримидин-4-ил)-1Н-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1968);

пиридин-3-иламид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиридин-4-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1Н-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1969);

пиридин-3-иламид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиридин-3-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1Н-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение

RU 2 2 2 1 7 9 5 C 2

RU 2 2 2 1 7 9 5 C 2

A1970);

пиридин-3-иламид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиридин-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1971);

пиридин-3-иламид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(фуран-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1972);

пиридин-3-иламид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(тиофен-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1973);

пиридин-3-иламид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(тетрагидрофуран-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1974);

пиридин-3-иламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-метилпиперазин-1-ил)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1975);

пиридин-3-иламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-морфолин-4-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1976);

пиридин-3-иламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-метоксипропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-

[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1977);

пиридин-3-иламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-метокси-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]-диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1978);

пиридин-3-иламид 2-[5-[2-(3-диметиламино-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1979)

пиридин-3-иламид 2-[5-[2-(2-диметиламино-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1980);

(4-{5-(4-фтор-фенил)-2-[5-метил-5-(пиридин-3-илкарбамоил)-[1,3]диоксан-2-ил]-3H-имидазол-4-ил}-пиримидин-2-иламино)-уксусная кислота, транс-изомер, (соединение A1981);

3-(4-{5-(4-фтор-фенил)-2-[5-метил-5-(пиридин-3-илкарбамоил)-[1,3]диоксан-2-ил]-3H-имидазол-4-ил}-пиримидин-2-иламино)-пропионовая кислота, транс-изомер, (соединение A1982);

пиридин-3-иламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-изопропил-амино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1983);

пиридин-3-иламид 2-[5-(2-аллиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1984);

пиридин-3-иламид 2-[5-(2-циклопропилметил-амино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1985);

пиридин-3-иламид 2-[5-[2-(цианометил-амино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1986);

пиридин-3-иламид 2-[5-[2-(2-циано-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1987);

пиридин-3-иламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиридин-3-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1988);

пиридин-3-иламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиридин-4-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1989);

пиридин-3-иламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пропиламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1990);

пиридин-3-иламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пирролидин-1-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1991);

пиридин-3-иламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-фтор-фениламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1992);

пиридин-3-иламид 2-[5-[2-(3,4-дифтор-фениламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1993);

пиридин-3-иламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-метокси-фениламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1994);

пиридин-3-иламид 2-[5-[2-(4-фтор-бензиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]-диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1995);

пиридин-3-иламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-метокси-бензиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1996);

пиридин-3-иламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метокси-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1997);

пиридин-3-иламид 2-[5-(2-бензилокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1998);

пиридин-3-иламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-фенокси-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A1999);

пиридин-3-иламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-метокси-этокси)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]-диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A2000);

пиридин-3-иламид 2-[5-[2-(2-диметиламино-этокси)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A2001);

пиридин-3-иламид 2-[5-(2-циклогексилокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A2002);

пиридин-3-иламид 2-[5-(2-изопропокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A2003);

пиридин-3-иламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пропокси-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A2004);

пиридин-3-иламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-гидрокси-этокси)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение

A2005);

пиридин-3-иламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-гидрокси-пропокси)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A2006);

пиридин-3-иламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфанил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A2007);

пиридин-4-иламид 2-[5-(2-амино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A2008);

пиридин-4-иламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метиламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A2009);

пиридин-4-иламид 2-[5-(2-диметиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A2010);

пиридин-4-иламид 2-[5-(2-циклопропиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A2011);

пиридин-4-иламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиперидин-4-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A2012);

пиридин-4-иламид 2-[5-(2-циклогексиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-

RU 2 2 2 1 7 9 5 C 2

RU 2 2 2 1 7 9 5 C 2

5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A2013);

пиридин-4-иламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-гидрокси-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]-диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A2014);

пиридин-4-иламид 2-[5-[2-(2-амино-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A2015);

пиридин-4-иламид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-(2-[3-(5H-имидазол-1-ил)-пропиламино]-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A2016);

пиридин-4-иламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-морфолин-4-ил-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A2017);

пиридин-4-иламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-гидрокси-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A2018);

пиридин-4-иламид 2-[5-(2-бензиламино-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A2019);

пиридин-4-иламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(1-фенил-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-

[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, R-изомер, транс-изомер, (соединение A2020);

пиридин-4-иламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(1-фенил-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-

[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, S-изомер, транс-изомер, (соединение A2021);

пиридин-4-иламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-фениламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, R-изомер, транс-изомер (соединение A2022);

пиридин-4-иламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пиперидин-1-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, S-изомер, транс-изомер (соединение A2023);

пиридин-4-иламид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиридин-4-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A2024);

пиридин-4-иламид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиридин-3-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A2025);

пиридин-4-иламид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(пиридин-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A2026);

пиридин-4-иламид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(фуран-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-

[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A2027);

пиридин-4-иламид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(тиофен-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A2028);

пиридин-4-иламид 2-(4-(4-фтор-фенил)-5-{2-[(тетрагидрофуран-2-илметил)-амино]-пиримидин-4-ил}-1H-имидазол-2-ил)-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A2029);

пиридин-4-иламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-метил-пиперазин-1-ил)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A2030);

пиридин-4-иламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-морфолин-4-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A2031);

пиридин-4-иламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-метокси-пропиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A2032);

пиридин-4-иламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-метокси-этиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A2033);

пиридин-4-иламид 2-[5-[2-(3-диметиламино-пропиламино)-  
пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-  
[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение  
A2034)

пиридин-4-иламид 2-[5-[2-(2-диметиламино-этиламино)-  
пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-  
[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение  
A2035);

(4-{5-(4-фтор-фенил)-2-[5-метил-5-(пиридин-4-  
илкарбамоил)-[1,3]диоксан-2-ил]-3H-имидазол-4-ил}-пиримидин-  
2-иламино)-уксусная кислота, транс-изомер, (соединение  
A2036);

3-(4-{5-(4-фтор-фенил)-2-[5-метил-5-(пиридин-4-  
илкарбамоил)-[1,3]диоксан-2-ил]-3H-имидазол-4-ил}-пиримидин-  
2-иламино)-пропионовая кислота, транс-изомер, (соединение  
A2037);

пиридин-4-иламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-изопропил-  
амино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диок-  
сан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A2038);

пиридин-4-иламид 2-[5-(2-аллиламино-пиримидин-4-ил)-4-  
(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-  
карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A2039);

пиридин-4-иламид 2-[5-(2-циклопропилметил-амино)-пи-  
римидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-  
[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение  
A2040);

пиридин-4-иламид 2-[5-[2-(цианометил-амино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A2041);

пиридин-4-иламид 2-[5-[2-(2-циано-этиламино)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A2042);

пиридин-4-иламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиридин-3-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A2043);

пиридин-4-иламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(пиридин-4-иламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A2044);

пиридин-4-иламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пропиламино-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A2045);

пиридин-4-иламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пирролидин-1-ил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A2046);

пиридин-4-иламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-фтор-фениламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A2047);

пиридин-4-иламид 2-[5-[2-(3,4-дифтор-фениламино)-пи-  
римидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-  
[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение  
A2048);

пиридин-4-иламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-метокси-  
фениламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-  
[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение  
A2049);

пиридин-4-иламид 2-[5-[2-(4-фтор-бензиламино)-пири-  
мидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-  
[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение  
A2050);

пиридин-4-иламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(4-метокси-  
бензиламино)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-  
[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение  
A2051);

пиридин-4-иламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метокси-  
пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-  
карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A2052);

пиридин-4-иламид 2-[5-(2-бензилокси-пиримидин-4-ил)-4-  
(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-  
карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A2053);

пиридин-4-иламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-фенокси-  
пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-  
карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A2054);

пиридин-4-иламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-метокси-этокси)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]-диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A2055);

пиридин-4-иламид 2-[5-[2-(2-диметиламино-этокси)-пиримидин-4-ил]-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A2056);

пиридин-4-иламид 2-[5-(2-циклогексилокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A2057);

пиридин-4-иламид 2-[5-(2-изопропокси-пиримидин-4-ил)-4-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A2058);

пиридин-4-иламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-пропокси-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A2059);

пиридин-4-иламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(2-гидрокси-этокси)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A2060);

пиридин-4-иламид 2-{4-(4-фтор-фенил)-5-[2-(3-гидрокси-пропокси)-пиримидин-4-ил]-1H-имидазол-2-ил}-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A2061);

пиридин-4-иламид 2-[4-(4-фтор-фенил)-5-(2-метилсульфа-

нил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, транс-изомер, (соединение A2062);

(с) Проводя реакцию способом, аналогичным примеру 40 (b), но используя метиловый эфир 2-[4-(4-фторфенил)-5-(2-метилилсульфонил-пиримидин-4-ил)-1H-имидазол-2-ил]-5-метил-[1,3]диоксан-5-карбоновой кислоты, цис-изомер, (соединение LN), получают соответствующие цис-изомеры соединения GT и соединений A557-A2062.

Ссылочный пример 1

4-[5(4)-(4-Фтор-фенил)-2-формил-1-[(2-(триметилсилил)этокси)метил]-1H-имидазол-4-ил]-пиридин

Раствор 4-[5-(4-фтор-фенил)-1-[(2-(триметилсилил)-этокси)метил]-1H-имидазол-4-ил]-пиридина (8,15 г, ссылочный пример 2) в тетрагидрофуране (100 мл) обрабатывают раствором н-бутиллития в гексане (10,6 мл, 2,1 М), что даёт тёмно-зелёный раствор. Раствор перемешивают при -78°C в течение 15 минут, затем обрабатывают раствором N-формил-морфолина (2,45 мл) в тетрагидрофуране (10 мл). После перемешивания в течение 15 минут при -78°C смеси дают нагреться до комнатной температуры, затем перемешивают при этой температуре дополнительно 1 час. Реакционную смесь гасят водой (50 мл) и затем экстрагируют четыре раза этилацетатом (50 мл). Объединённые экстракты сушат над сульфатом магния и упаривают. Оставшееся масло подвергают флэш хроматографии на двуокиси кремния, элюируя этилацетатом, что даёт указанное в заглавии соединение (7,86 г) в виде жёлтого масла.

Ссылочный пример 2

4-[5-(4-Фтор-фенил)-1-[(2-(триметилсилил)-этокси)метил]-1H-имидазол-4-ил]-пиридин

Перемешиваемый раствор 5-(4-Фтор-фенил)-4-(4-пиридил)-имидазола [ВОЕНМ ET AL., ] (12,86 г, полученный по методике Boehm et al., J. Med. Chem., 1996, 39, page 3829-3937) в сухом диметилформамиде (150 мл) обрабатывают, добавляя порциями гидрид натрия (2,58 г, 60% дисперсия в минеральном масле). Смесь перемешивают при комнатной температуре до прекращения выделения водорода, затем добавляют по каплям 2-(триметилсилил)этоксиметилхлорид (10,66 мл). После перемешивания при комнатной температуре в течение 1,5 час реакционную смесь обрабатывают водой (10 мл), затем упаривают. После чего оставшееся масло распределяют между этилацетатом и водой (100 мл). Водную фазу трижды экстрагируют этилацетатом (100 мл). Объединённые органические фазы промывают рассолом (50 мл), затем сушат над сульфатом магния и упаривают. Оставшееся жёлтое масло подвергают флэш хроматографии на двуокиси кремния, элюируя смесью метанола и дихлорметана (98:2, в отношении объёмов), что даёт указанное в заглавии соединение.

Ссылочный пример 3

4-[2-Диметоксиметил-5-(4-фтор-фенил)-1H-имидазол-4-ил]-пиридин

Способ А: раствор 4-[5 (4-фтор-фенил)-2-формил-1-[(2-(триметилсилил)этокси)метил]-1H-имидазол-4 -ил]-

пиридина (0,525 г, ссылочный пример 1) в метаноле (10 мл) обрабатывают триметилортоформиатом (5 мл), затем 4-толуолсульфокислотой (0,39 г). Реакционную смесь нагревают до температуры кипения с обратным холодильником в течение 5 часов, затем охлаждают до комнатной температуры и упаривают. Остаток распределяют между этилацетатом и насыщенным водным раствором бикарбоната натрия (30 мл). Водную фазу экстрагируют четыре раза этилацетатом (20 мл). Объединённые органические фазы промывают водой (15 мл), рссолом (15 мл), затем сушат над сульфатом магния и упаривают. Оставшееся масло подвергают флэш хроматографии на двуокиси кремния, элюируя смесью дихлорметана и метанола (8:1, в отношении объёмов), что даёт указанное в заглавии соединение (0,344 г) в виде белого твёрдого вещества, т.пл. 186-189°C.

Способ В: перемешиваемую суспензию 1-(4-фторфенил)-2-(4-пиридил)-1,2-этандиона (162,74 г, ссылочный пример 10) в трет-бутилметилом эфире (735 мл), при 20-25°C, обрабатывают раствором глиоксаль-1,1-диметилацетала в трет-бутилметилом эфире (244,4 мл, 45%) и впоследствии раствором ацетата аммония (140,75 г) в метаноле (260 мл) за период времени 30 минут, в течение которого суспензия растворяется, образуя оранжевый раствор. После перемешивания в течение 1 часа при 20-25°C, полученную суспензию охлаждают до 5-10°C, после чего перемешивают дополнительно 1 час и затем фильтруют. Влажный осадок на фильтре, представляющий собой суспензию, трижды промывают водой (350 мл) и затем

отжатый фильтровальный осадок дважды промывают трет-бутилметиловым эфиром (350 мл). Высушенный на воздухе фильтровальный осадок сушат затем в вакууме при 60-65°C в течение 16 часов, что даёт указанное в заглавии соединение в виде сыпучего твёрдого вещества кремового цвета, т.пл. 204-206°C. <sup>1</sup>H-ЯМР [δ, (CD<sub>3</sub>)<sub>2</sub>SO]: 8,35 (д, 2H); 7,43 (дт, 2H); 7,36 (д, 2H); 7,19 (дт, 2H); 5,39 (с, 1H); 3,34 (с, 6H).

Ссылочный пример 4

2-Метил-2-трифторацетамидо-1,3-пропандиол

Перемешиваемый раствор 2-амино-2-метил-1,3-пропандиола (1,05 г) в сухом диметилформамиде (20 мл), при комнатной температуре, обрабатывают карбонатом калия (1,52 г). После перемешивания при комнатной температуре в течение 15 минут смесь обрабатывают, добавляя по каплям трифторуксусный ангидрид (1,55 мл), и затем перемешивание продолжают дополнительно в течение 18 часов. Реакционную смесь упаривают и остаток подвергают флэш хроматографии на диоксида кремния, элюируя смесью дихлорметана и метанола (95:5, в отношении объёмов), что даёт указанное в заглавии соединение (1 г) в виде белого твёрдого вещества.

Ссылочный пример 5

2-Азидометил-2-метил-1,3-пропандиол

Смесь 5-азидометил-2-диметил-5-метил-1,3-диоксана [1,48 г, полученного по методике в J.Org. Chem., 1992, page 6080], концентрированной соляной кислоты (0,3 мл), воды (0,8 мл) и тетрагидрофурана (10 мл) нагревают до температуры кипения с

обратным холодильником в течение 1 часа. После охлаждения до комнатной температуры реакционную смесь упаривают. Остаток сушат в вакууме, получая указанное в заглавии соединение (1,3 г) в виде бесцветного масла.

Ссылочный пример 6

3-Гидрокси-2-(гидроксиметил)-2-метил-1-морфолино-1-пропанон

Перемешиваемую смесь диизопропилэтиламина (339,67 мл) и морфолина (141,71 мл) в ацетонитриле (500 мл), при 20-25°C, обрабатывают 2,2-бис-(гидроксиметил)пропионовой кислотой (87,18 г) и 1-гидроксибензотриазолом (43,92 г). Полученную суспензию нагревают до 55-60°C, затем обрабатывают добавляемым по каплям в течение 30 минут раствором 1,3-дициклогексилкарбодиимида (147,62 г) в ацетонитриле (232,2 мл). Полученный раствор перемешивают затем при 55-60°C в течение ещё 2 часов, после чего фильтруют для удаления побочного продукта - дициклогексилмочевины (131,88 г). Осадок на фильтре дважды промывают ацетонитрилом (250 мл). Фильтрат упаривают и остаток обрабатывают тёплым этилацетатом (500 мл). Полученный раствор оставляют охлаждаться на 16 часов, после чего кристаллизующийся 1-гидроксибензотриазол (42,04 г) удаляют фильтрованием. Дополнительное охлаждение фильтрата в течение 5 часов и фильтрование дают указанное в заглавии соединение (44,82 г), т.пл. 95-97°C. <sup>1</sup>H-ЯМР (d, CDCl<sub>3</sub>): 4.02 (д, 2H); 3.70 (м, 10H); 3,30 (ушир.с, 2H); 1,08 (с, 3H).

Дополнительное количество указанного в заглавии соеди-

нения (41,33 г) получают последующим упариванием фильтрата после первого сбора продукта, обработкой остатка этилацетатом (1000 мл), пропусканием раствора через слой силикагеля (4 см высота x 11 см диаметр), упариванием фильтрата и кристаллизацией остатка из н-бутилацетата (1000 мл) в течение 16 часов.

Ссылочный пример 7

4-[2-Диметоксиметил-5(4)-(4-фтор-фенил)-1Н-имидазол-4(5)-ил]-2-метансульфанил-пиримидин

Раствор 1-(4-фторфенил)-2-(2-метилсульфанилпиримидин-4-ил)-1,2-этандиона (18,7 г, ссылочный пример 8) в трет-бутил-метилом эфире (75 мл) и глиоксаль-диметилацетала в трет-бутил-метилом эфире (36 мл, 40%), при комнатной температуре, обрабатывают, добавляя по каплям в течение 30 минут раствор ацетата аммония (21,7 г) в метаноле (40 мл), что даёт оранжевый раствор. После перемешивания в течение 2 часов при комнатной температуре полученную суспензию фильтруют, что даёт указанное в заглавии соединение (15,6 г) в виде бесцветного твёрдого вещества, т.пл. 180-182°C.  $MN^+$  361.

Ссылочный пример 8

1-(4-Фторфенил)-2-(2-метилсульфанилпиримидин-4-ил)-1,2-этандион

Раствор 1-(4-фторфенил)-2-(2-метилсульфанилпиримидин-4-ил)-1-этанона (65,5 г, ссылочный пример 9) в диметилсульфоксиде, при 55-70°C, обрабатывают, добавляя по каплям водный раствор бромистого водорода (48%). После пере-

мешивания при 60°C в течение 3 часов реакционную смесь охлаждают до комнатной температуры, затем выливают в воду и доводят pH смеси до pH8, добавляя бикарбонат натрия. Реакционную смесь экстрагируют этилацетатом и экстракты упаривают, получая указанное в заглавии соединение (40,87 г), т.пл. 74-76°C. МН<sup>+</sup> 277.

Ссылочный пример 9

1-(4-Фторфенил)-2-(2-метилсульфанилпиримидин-4-ил)-1-этанол

Раствор литий-гексаметилдисилазана в тетрагидрофуране (1,22 л, 1М) при -40°C обрабатывают раствором 4-метил-2-метилсульфанилпиримидина (76,03 г) в тетрагидрофуране (100 мл). Раствор нагревают до 0°C, затем перемешивают в течение 15 минут, после чего охлаждают до -40°C и обрабатывают раствором этил-4-фторбензоата (91,32 г) в тетрагидрофуране (200 мл).

После перемешивания при -40°C в течение 15 минут реакционной смеси дают нагреться до комнатной температуры в течение 2 часов и затем обрабатывают раствором хлористого аммония. Органическую фазу отделяют и водную фазу экстрагируют этилацетатом. Объединённые органические фазы упаривают, получая указанное в заглавии соединение (136,19 г), т.пл. 212-214°C. МН<sup>+</sup> 263.

Ссылочный пример 10

1-(4-Фторфенил)-2-(4-пиридил)-1,2-этанол

Смесь 1-(4-Фторфенил)-2-(4-пиридил)-1-этанола (247,69 г, ссылочный пример 11) смешивают с диметилсульфоксидом

(500 мл), затем нагревают на роторном испарителе (без вакуума). Полученный раствор переносят в реакционный сосуд, применяя двойное ополаскивание диметилсульфоксидом (500 мл и 240 мл), используемое для уверенности в полноте переноса. Затем полученный раствор нагревают до 55-65°C и добавляют бромистый водород (581,47 г) с такой скоростью, чтобы температура раствора сохранялась в интервале 55-65°C без какого-либо внешнего нагревания. Раствор дополнительно перемешивают при 55-65°C в течение 2 часов, к этому моменту тонкослойная хроматография на двуокиси кремния свидетельствует о завершении реакции. Реакционную смесь добавляют к воде (4000 мл) в отдельном сосуде, при внешнем охлаждении, чтобы поддерживать температуру раствора в интервале 15-25°C. Оставшееся содержимое реакционной колбы переносят, используя дополнительную аликвоту воды (2000 мл). Затем водный раствор обрабатывают раствором ацетата натрия (600 г) в воде (2000 мл) в течение 15 минут, полученную суспензию перемешивают 2 часа при температуре окружающей среды, после чего фильтруют. Осадок на фильтре трижды промывают водой (500 мл), затем сушат на воздухе в течение 1 часа, после чего сушат в вакууме в течение 16 часов при 15-25°C, получая указанное в заглавии соединение (296,93 г) в виде сыпучего жёлто-оранжевого порошка, т.пл. 84-86°C. <sup>1</sup>H-ЯМР (CDCl<sub>3</sub>): δ 8,81 (д, 2H); 7,98 (дд, 2H); 7,74 (д, 2H); 7,18 (т, 2H).

Ссылочный пример 11

1-(4-Фторфенил)-2-(4-пиридил)-1-этанон

Перемешиваемый раствор натрий-бис(триметилсилил)амида в тетрагидрофуране (720 мл, 2М), в атмосфере азота, обрабатывают 4-пиколином (64,7 мл). Спустя 5 минут добавляют раствор этил-4-фторбензоата (111,7 г) за период 30 минут, поддерживая при этом температуру 18-20°C путём периодического охлаждения. После перемешивания при 20-21°C в течение 30 минут полученную суспензию охлаждают на ледяной бане, затем обрабатывают толуолом (500 мл). Когда температура достигает 15°C, добавляют за 15 минут раствор уксусной кислоты (82 мл) в воде (300 мл), поддерживая температуру ниже 25°C. После дополнительного перемешивания в течение 30 минут при 20-25°C органическую фазу отделяют и потом упаривают. Маслянистый остаток растирают с гептаном, получая указанное в заглавии соединение (133 г) в виде жёлтого твёрдого вещества, т.пл. 80-84°C. <sup>1</sup>H-ЯМР (δ, CDCl<sub>3</sub>): 8,42 (д, 2H); 7,88 (дд, 2H); 7,06 (д, 2H); 7,01 (т, 2H); 4,12 (с, 2H).

#### Методики испытаний in vitro и in vivo

##### 1. Ингибирующие воздействия *in vitro* на высвобождение TNF-альфа моноцитами человека.

Воздействия соединений на продуцирование TNF-альфа моноцитами периферической крови человека (PBMs) исследуют следующим образом.

##### 1.1 Получение моноцитов периферической крови человека (PBMs)

Свеже-взятую кровь нормально-здоровых доноров смешивают

(4:1, в отношении объёмов) с цитратом натрия (3,8%, в отношении веса к объёму). Мононуклеарные клетки получают центрифугированием крови на Histopaque-1077 (Sigma Diagnostics) согласно заводской инструкции. Обогащённую мононуклеарными клетками фракцию промывают и ресуспендируют в сбалансированном солевом растворе Hank'a (HBSS), дополненном деоксирибонуклеазой (37,5 ед/мл) и белком сыворотки человека (0,3%). Подсчёты дифференциальных (цитоспин-) клеток показывают, что фракция мононуклеарных клеток регулярно содержит 70-80% моноцитов.

Клетки мононуклеарной фракции лейкоцитов центрифугируют (200 г, 10 мин, 20°C), ресуспендируют, при плотности  $10^6$  клетки/мл, в RPMI 1640, содержащем околплодную сыворотку телёнка (FCS) (1%), пеницилин (50 ед/мл) и стрептомицин (50 мкг/мл), и оставляют для адгезии в 96-ячеечных пластинах. После инкубирования (5% CO<sub>2</sub>, 37°C) в течение 90 мин содержащие среду не-адгезированные клетки удаляют, клетки однократно промывают свежей средой и добавляют свежую среду.

#### 1.2 Измерение высвобождения TNF-альфа моноцитами

Адгезированные клетки в среде для выращивания культур инкубируют в течение 1 часа (5% CO<sub>2</sub>, 37°C) со свежей средой, содержащей соединения или растворитель (0,1 % диметилсульфоксид). Соединения испытывают при интервале концентраций  $3 \times 10^{-9}$ М -  $3 \times 10^{-6}$ М. Затем к клеткам добавляют LPS (10 нг/мл) и инкубацию продолжают ещё в течение 18 часов. Клеточные супернатанты переносят в 96-ячеечные, 0,22 мкм-

фильтровальные пластины для хранения при  $-20^{\circ}\text{C}$ .

Концентрации TNF-альфа в клеточных супернатантах измеряют количественно с помощью сэндвич-ELISA. Вкратце, ELISA-пластины покрывают на одну ночь  $2\text{ мкг/мл}$  антитела из мыши анти-человеческого TNF-альфа в бикарбонатном буфере (pH 9,9). После промывания ячеек промывочным буфером (0,055 (в отношении объемов) Tween в PBS) и блокирования незанятых сайтов (1% BSA в PBS), образцы супернатанта моноцитов или рекомбинантных стандартов TNF-альфа человека фильтруют в вакууме в соответствующих ячейках ELISA-пластины. Биотинилированное поликлональное антитело кролика к человеческому TNF-альфа ( $3\text{ мкг/мл}$ ) используют в качестве второго антитела, а стрептавидин-пероксидазу хрена используют в качестве детектирующего антитела. Субстратом пероксидазы является 3,3', 5,5'-тетраметилбензидин (TMB) в присутствии перекиси водорода.

Концентрации TNF- $\alpha$  в супернатантах из контроля и инкубаций LPS-стимулированных моноцитов рассчитывают интерполяцией стандартной (log/log) кривой (0,125-16 нг/мл), адекватно описываемой линейной регрессией, используя Multicalc программное обеспечение (Wallac U.K., Ltd).

### 1.3 Результаты

Соединения, входящие в объем изобретения, обеспечивают 50% ингибирование высвобождения LPS-индуцируемого моноцитами человека TNF-альфа в интервале концентраций от  $10^{-9}$  до  $10^{-4}$  М, предпочтительно, в пределах от  $10^{-9}$  до  $10^{-7}$  М.

## 2. Ингибирующие действия соединений на уровне TNF-альфа в сыворотке крови LPS-провоцированных мышей.

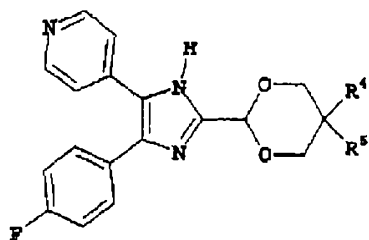
### 2.1. Обработка животных и измерение мышиноного TNF-альфа

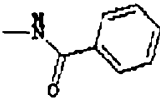

Самкам Balb/c мышей (возраст 6-8 недель, вес 20-22 г, от Charles River, U.K.) в группах из пяти или большего числа животных перорально (р.о.) вводят дозами (1 до 100 мг/кг) соединения, суспендированные в 1,5% (в отношении веса к объёму) карбоксиметилцеллюлозы, затем провоцируют, после минимального периода в 30 минут, 30 мг LPS, (i.p.) внутрибрюшинно. Через 90 минут животных забивают, используя асфиксию от двуокиси углерода, и спускают кровь путём сердечной пункции. Крови дают свернуться при 4°C, центрифугируют (12000 g за 5 минут) и отбирают сыворотку для анализов на TNF-альфа. Уровни TNF-альфа измеряют, используя выпускаемый промышленностью ELISA-набор TNF-альфа крыс, приобретаемый от Genzyme (Кат. № 1509.00), как рекомендуется производителями. Значения TNF-альфа рассчитывают из рекомбинантной кривой стандартных TNF-альфа крыс как указано выше.


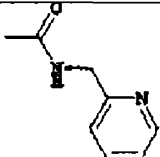
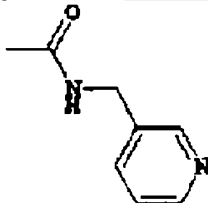
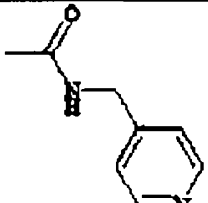
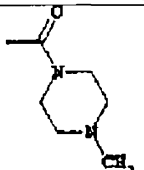
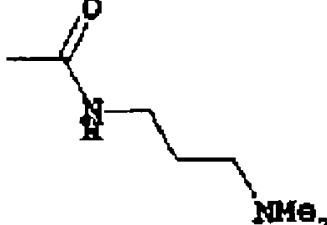
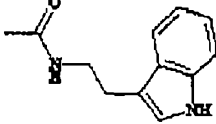
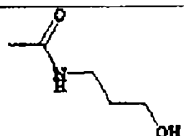
### 2.2. Результаты


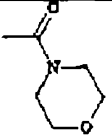
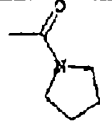
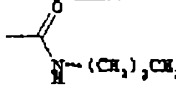
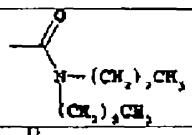
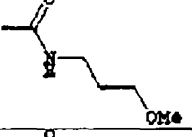
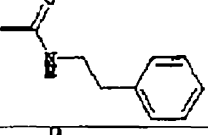
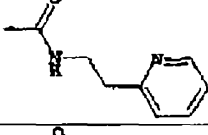
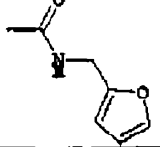
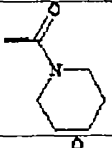
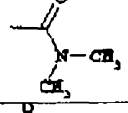
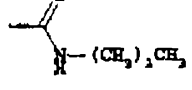
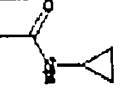
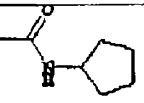
Соединения, входящие в объём изобретения, ингибируют высвобождение TNF-альфа у LPS-провоцированных мышей до 50% при дозах от 0,1 мг/кг до 100 мг/кг.

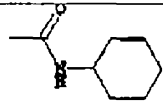
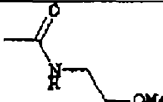




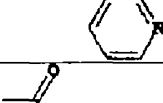

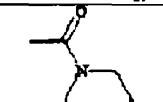
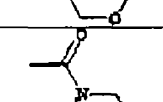
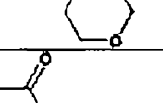
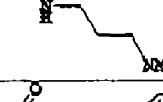
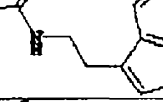
ТАБЛИЦА 10  
ПИРИДИЛ-ЗАМЕЩЕННЫЕ ИМИДАЗОЛИЛ-ЦИКЛИЧЕСКИЕ АЦЕТАЛИ

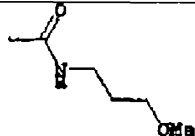
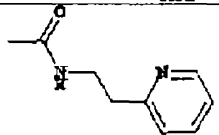
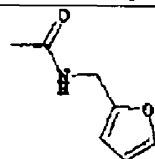
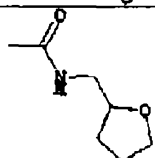
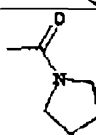
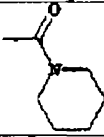
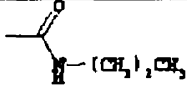

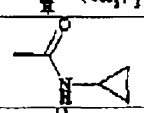
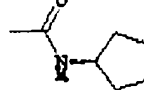
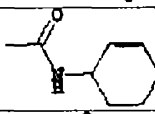
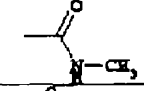
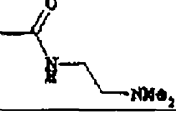
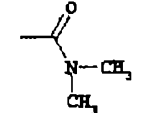
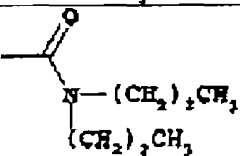


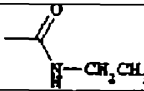
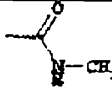
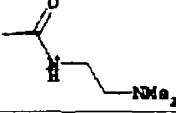
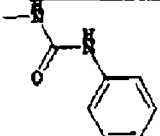
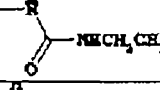
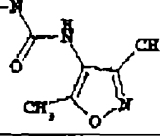
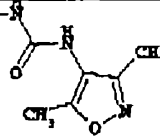
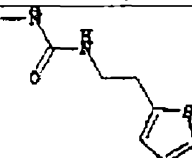
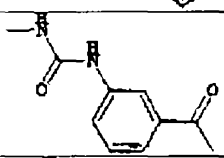
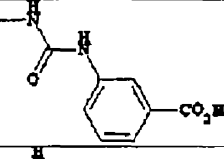

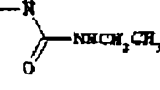
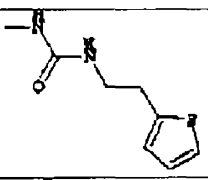
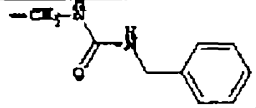
TNF IC <sub>50</sub> , нМ	Соединение №	RPR №	-R <sup>4</sup>	-R <sup>5</sup>
390	А цис изомер	132529	-CH <sub>2</sub> OH	-CH <sub>3</sub>
811	В транс изомер	132528	-CH <sub>2</sub> OH	-CH <sub>3</sub>
672	С	132331	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>
73	Д цис и транс изомеры		-CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	-CH <sub>3</sub>
191	Е цис и транс изомеры	200873	-CH <sub>2</sub> Ph	-CH <sub>3</sub>
133	Ж цис и транс изомеры		-CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>
235	М цис и транс изомеры		-CH <sub>3</sub>	-H
3000	С цис и транс изомеры		-Ph	-H
223	У		-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
126	W цис и транс изомеры			-CH <sub>3</sub>
351	Z цис и транс изомеры			-CH <sub>3</sub>
38	АА транс из.	20606	-CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	-CH <sub>3</sub>

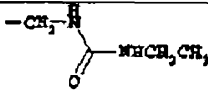
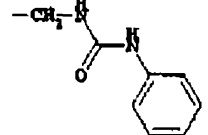
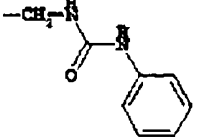
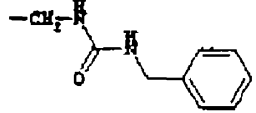
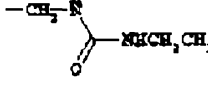
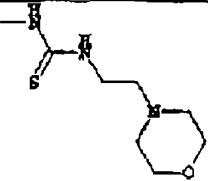
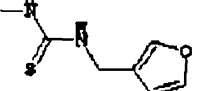
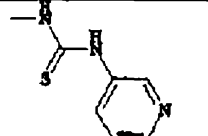

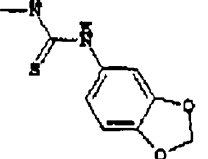
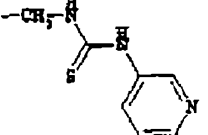
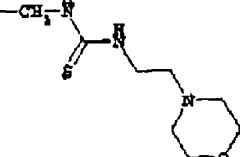
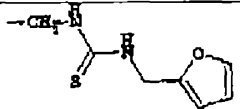
33	AB цис изомер	200603	$-\text{CH}_2\text{NH}_2$	$-\text{CH}_3$
55	AE цис изомер	200516	$-\text{NH}_2$	$-\text{CH}_3$
3000	AN транс изом.		$-\text{CO}_2\text{H}$	$-\text{CH}_3$
10000	AI цис изомер		$-\text{CO}_2\text{H}$	$-\text{CH}_3$
905	AN транс изомер	200762		$-\text{CH}_3$
1777	AO транс изомер			$-\text{CH}_3$
1600	AP транс изомер			$-\text{CH}_3$
55060	AQ транс изомер			$-\text{CH}_3$
6630	AR транс изомер			$-\text{CH}_3$
922	AS транс изомер			$-\text{CH}_3$
964	AT транс изомер	200933		$-\text{CH}_3$
2487	AU транс изомер			$-\text{CH}_3$

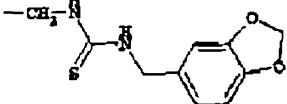
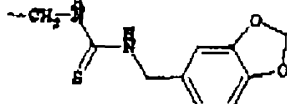

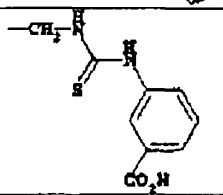
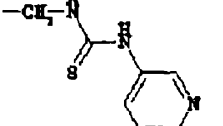
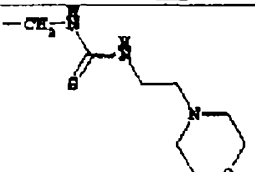
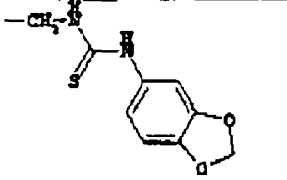
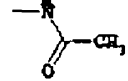
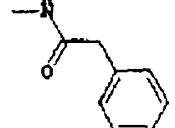
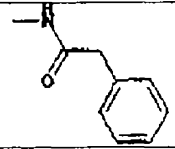
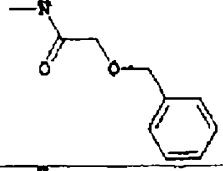
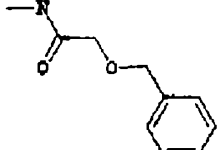
1725	AV транс изомер			-CH <sub>3</sub>
697	AW транс изомер	200765		-CH <sub>3</sub>
2825	AX транс изомер			-CH <sub>3</sub>
4805	AU транс изомер			-CH <sub>3</sub>
2772	AZ транс изомер			-CH <sub>3</sub>
13690	BA транс изомер			-CH <sub>3</sub>
8969	BB транс изомер			-CH <sub>3</sub>
2653	BC транс изомер			-CH <sub>3</sub>
3143	BD транс изомер			-CH <sub>3</sub>
1013	BE транс изомер			-CH <sub>3</sub>
3032	BF транс изомер			-CH <sub>3</sub>
1914	BG транс изомер			-CH <sub>3</sub>
2381	BH транс изомер			-CH <sub>3</sub>
10290	BI транс изомер			-CH <sub>3</sub>


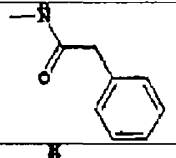
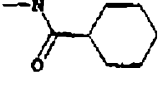
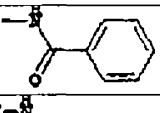
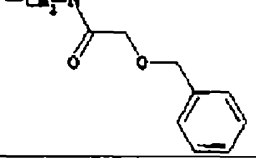
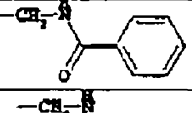
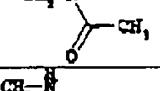
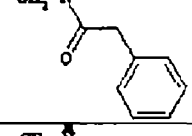
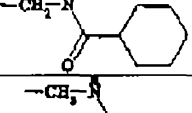

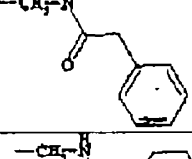
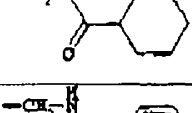
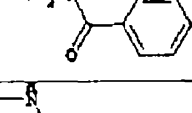

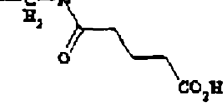
7358	BJ транс изомер			-CH <sub>3</sub>
11710	BK цис изомер			-CH <sub>3</sub>
2934	BL цис изомер			-CH <sub>3</sub>
2559	BM цис изомер			-CH <sub>3</sub>
566	BN цис изомер			-CH <sub>3</sub>
1819	BO цис изомер			-CH <sub>3</sub>
904	BP цис изомер			-CH <sub>3</sub>
8084	BQ цис изомер			-CH <sub>3</sub>
10330	BR цис изомер			-CH <sub>3</sub>
39210	BS цис изомер			-CH <sub>3</sub>
522	BT цис изомер			-CH <sub>3</sub>
11160	BU цис изомер			-CH <sub>3</sub>
2547	BV цис изомер			-CH <sub>3</sub>

5409	BW цис изомер			-CH <sub>3</sub>
9580	BX цис изомер			-CH <sub>3</sub>
2045	BY цис изомер			-CH <sub>3</sub>
2658	BZ цис изомер			-CH <sub>3</sub>
13450	CA цис изомер			-CH <sub>3</sub>
7200	CB цис изомер			-CH <sub>3</sub>
5419	CC цис изомер			-CH <sub>3</sub>
15560	CD цис изомер			-CH <sub>3</sub>
12830	CE цис изомер			-CH <sub>3</sub>
38730	CF цис изомер			-CH <sub>3</sub>
12020	CG цис изомер			-CH <sub>3</sub>
13380	CH цис изомер			-CH <sub>3</sub>
4139	CI цис изомер			-CH <sub>3</sub>
3137	CJ цис изомер			-CH <sub>3</sub>
10790	CK цис изомер			-CH <sub>3</sub>

10390	CL цис изомер			-CH <sub>3</sub>
1051	CM транс изомер			-CH <sub>3</sub>
5483	CN транс изомер			-CH <sub>3</sub>
1597	CP цис изомер			-CH <sub>3</sub>
2299	CQ цис изомер			-CH <sub>3</sub>
2021	CR цис изомер			-CH <sub>3</sub>
806	CS цис изомер			-CH <sub>3</sub>
2030	CT цис изомер			-CH <sub>3</sub>
5196	CU цис изомер			-CH <sub>3</sub>
1742	CW транс изомер			-CH <sub>3</sub>
6002	CX транс изомер			-CH <sub>3</sub>
9506	CY транс изомер			-CH <sub>3</sub>
8829	CZ транс изомер			-CH <sub>3</sub>
367	DA цис изомер			-CH <sub>3</sub>

874	DB цис изомер			-CH <sub>3</sub>
422	DC цис изомер	200993		-CH <sub>3</sub>
884	DD транс изомер			-CH <sub>3</sub>
673	DE транс изомер			-CH <sub>3</sub>
612	DF транс изомер			-CH <sub>3</sub>
1019	DG цис изомер			-CH <sub>3</sub>
1223	DH цис изомер			-CH <sub>3</sub>
2597	DI цис изомер			-CH <sub>3</sub>
180	DJ цис изомер			-CH <sub>3</sub>
1092	DK цис изомер			-CH <sub>3</sub>
509	DL транс изомер			-CH <sub>3</sub>
1106	DM транс изомер			-CH <sub>3</sub>
409	DN транс изомер			-CH <sub>3</sub>

484	DO транс изомер			-CH <sub>3</sub>
1142	DP цис изомер			-CH <sub>3</sub>
772	DQ цис изомер			-CH <sub>3</sub>
5719	DR цис изомер			-CH <sub>3</sub>
530	DS цис изомер			-CH <sub>3</sub>
1848	DT цис изомер			-CH <sub>3</sub>
674	DU цис изомер			-CH <sub>3</sub>
831	DV цис изомер			-CH <sub>3</sub>
1605	DW цис изомер			-CH <sub>3</sub>
1312	DX цис изомер			-CH <sub>3</sub>
596	DY транс изомер			-CH <sub>3</sub>
410	DZ цис изомер			-CH <sub>3</sub>

1166	EA транс изомер			-CH <sub>3</sub>
451	EB транс изомер			-CH <sub>3</sub>
1583	EC транс изомер			-CH <sub>3</sub>
324	ED цис изомер			-CH <sub>3</sub>
1621	EE цис изомер			-CH <sub>3</sub>
672	EF цис изомер			-CH <sub>3</sub>
2616	EG цис изомер			-CH <sub>3</sub>
662	EH цис изомер	200915		-CH <sub>3</sub>
1164	EI цис изомер			-CH <sub>3</sub>
362	EJ транс изомер	201014		-CH <sub>3</sub>
780	EK транс изомер			-CH <sub>3</sub>
1079	EL транс изомер			-CH <sub>3</sub>
833	EM транс изомер	201017		-CH <sub>3</sub>
1186	EN цис изомер			-CH <sub>3</sub>
46970	EO цис изомер			-CH <sub>3</sub>

10420	EP цис изомер			-CH <sub>3</sub>
100000	EQ цис изомер			-CH <sub>3</sub>
1638	ER транс изомер			-CH <sub>3</sub>
4426	ES цис изомер			-CH <sub>3</sub>
3130	ET цис изомер			-CH <sub>3</sub>
1070	EU цис изомер			-CH <sub>3</sub>
557	EV цис изомер	200912		-CH <sub>3</sub>
467	EW цис изомер			-CH <sub>3</sub>
949	EX цис изомер			-CH <sub>3</sub>
140	EY транс изомер	200771		-CH <sub>3</sub>
778	EZ транс изомер	200990		-CH <sub>3</sub>
383	FA транс изомер	200987		-CH <sub>3</sub>
462	FB транс изомер			-CH <sub>3</sub>
905	FC транс изомер			-CH <sub>3</sub>
439	FD цис изомер			-CH <sub>3</sub>
2382	FF цис изомер			-CH <sub>3</sub>
981	FG транс изомер			-CH <sub>3</sub>
120	FN цис изомер			-CH <sub>3</sub>

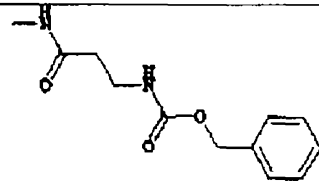
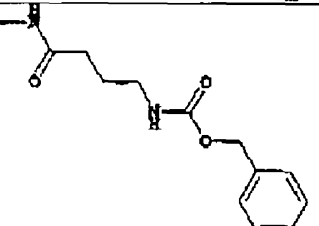
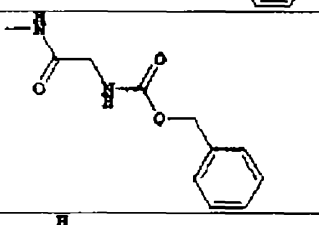
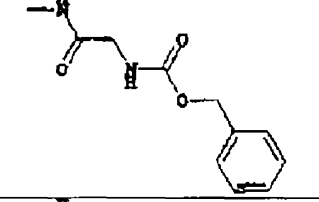
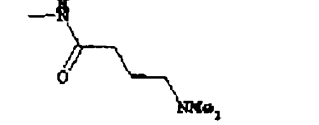
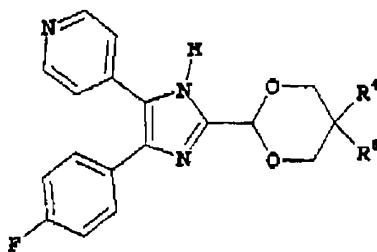
588	FJ цис изомер			-CH <sub>3</sub>
943	FL цис изомер			-CH <sub>3</sub>
805	FM транс изомер			-CH <sub>3</sub>
349	FN цис изомер			-CH <sub>3</sub>
4371	FO цис и транс изомеры			-CH <sub>3</sub>

ТАБЛИЦА 10а




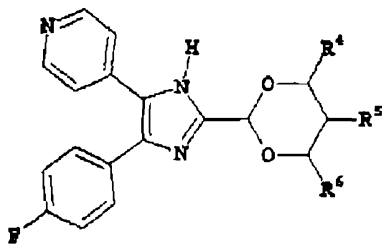
TNF IC <sub>50</sub> , нМ	Соединение №	RPR №	
218	K		
226	L		
117	N	200774	C=CH <sub>2</sub>

ТАБЛИЦА 10б



TNF IC <sub>50</sub> , нМ	Соединение №	RPR №	-R <sup>4</sup>	-R <sup>5</sup>	-R <sup>6</sup>
757	P	200831	-CH <sub>3</sub>	-H	-H
1561	Q		-CH <sub>3</sub>	-H	-CH <sub>3</sub>

RU 2221795 C2

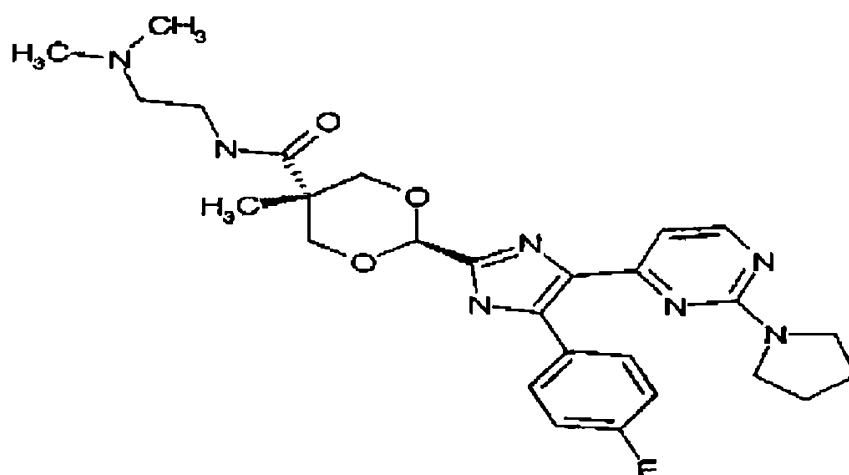
RU 2221795 C2

ТАБЛИЦА 11  
ПИРИМИДИЛ-ЗАМЕЩЕННЫЕ ИМИДАЗОЛИЛ-ЦИКЛИЧЕСКИЕ АЦЕТАЛИ

RPR №	TNF- $\alpha$ IC <sub>50</sub> (нМ) клетки THP 1
RPR249905	4,07
RPR249906	2,09
RPR250104	1,55
RPR249904	8
RPR250084	3,56
RPR239638	0,05
RPR238617	0,37
RPR239097	0,21
RPR237638	1
RPR238658	2,72
RPR238700	2
RPR238677	1,93
RPR238778	8,6
RPR239457	1,52
RPR235356	8
RPR237897	0,2
RPR239938	3,24
RPR239939	3,46
RPR235155	5
RPR237576	1
RPR238697	3,19
RPR238698	14
RPR238538	1,78
RPR239437	1,22
RPR239941	0,64
RPR239499	
RPR239497	1,89
RPR239940	10,43
RPR235235	22
RPR239477	1,17
RPR239277	5,6
RPR239318	43
RPR235455	72,05
RPR235315	73
RPR235175	121
RPR239297	101
RPR235316	71
RPR235215	91
RPR235775	1213

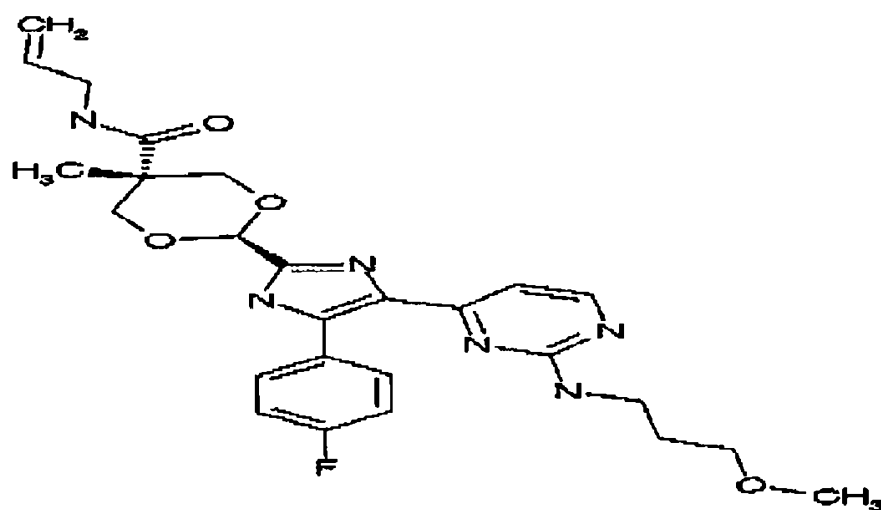
СТРУКТУРЫ ПИРИМИДИЛ-ЗАМЕЩЕННЫХ ИМИДАЗОЛИЛ-ЦИКЛИЧЕСКИХ  
АЦЕТАЛЕЙ, УКАЗАННЫХ В ТАБЛИЦЕ 11

**RPR249905**



Хиральный

**RPR249906**

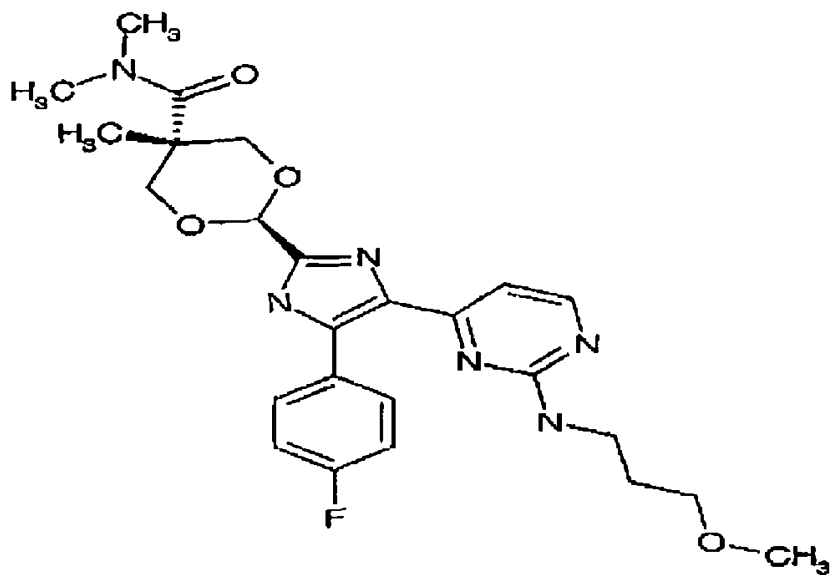


Хиральный

RU 2 2 2 1 7 9 5 C 2

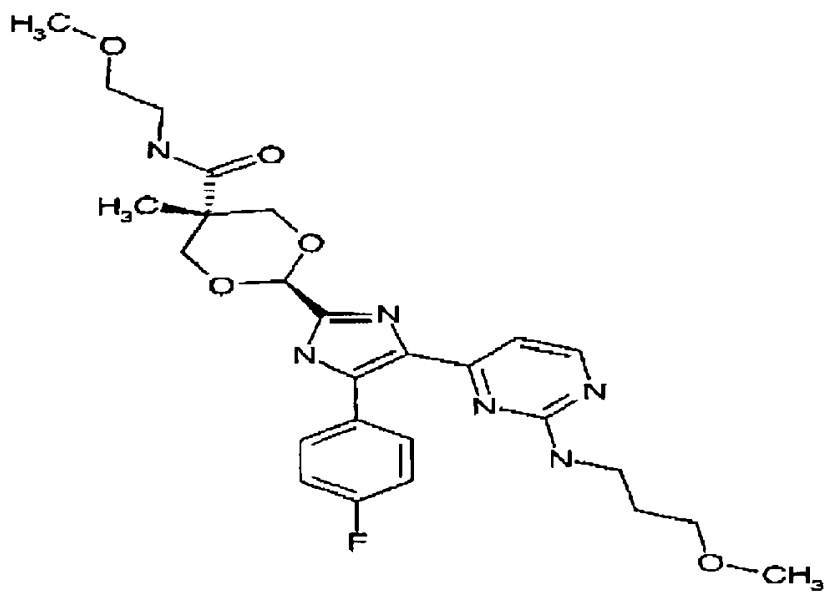
RU 2 2 2 1 7 9 5 C 2

RPR250104



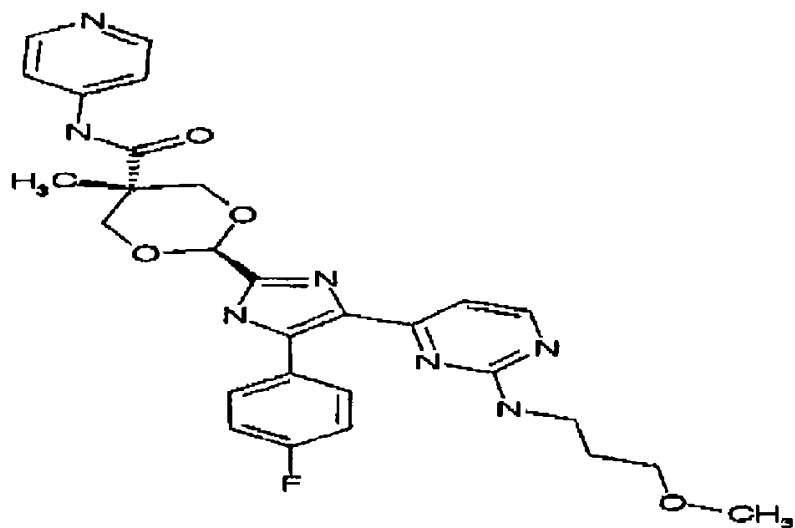
Хиральный

RPR249904



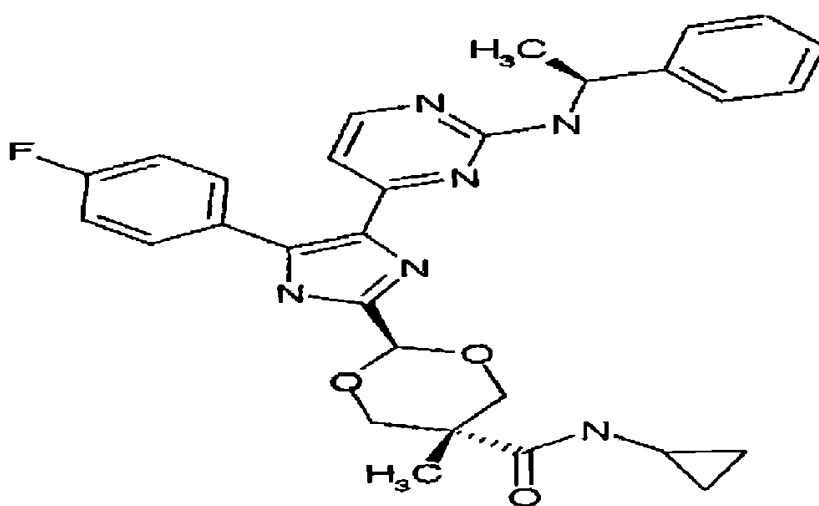
Хиральный

**RPR250084**



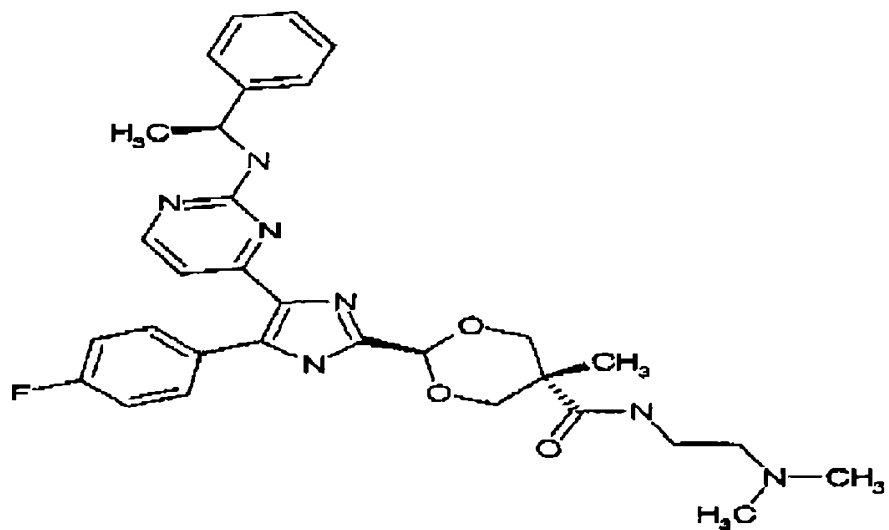
Хиральный

**RPR239638**



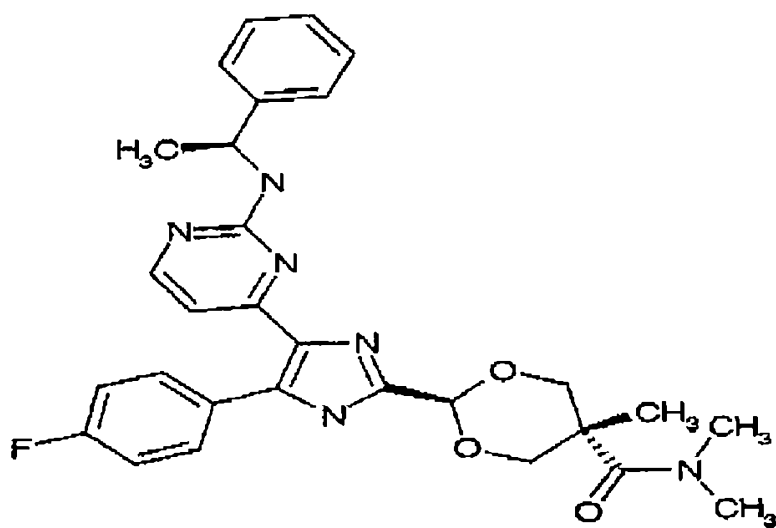
Хиральный

RPR238617



Хиральный

RPR239097

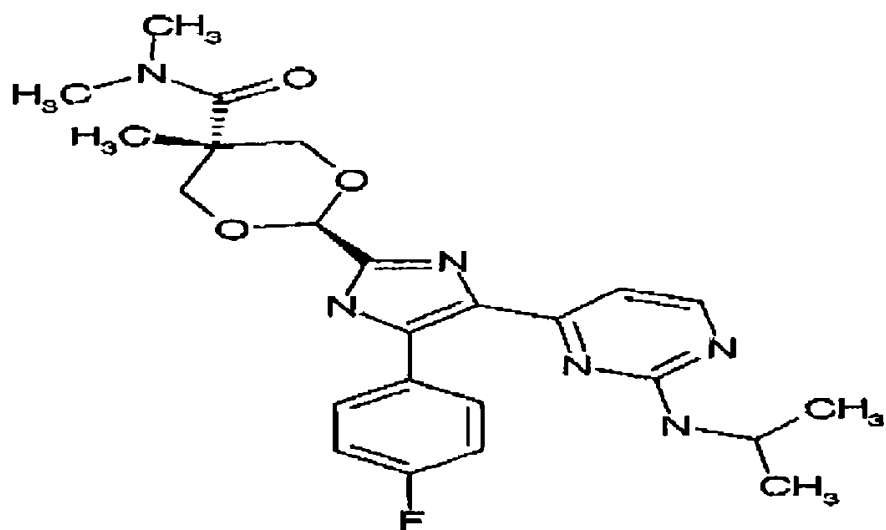


Хиральный

RU 2221795 C2

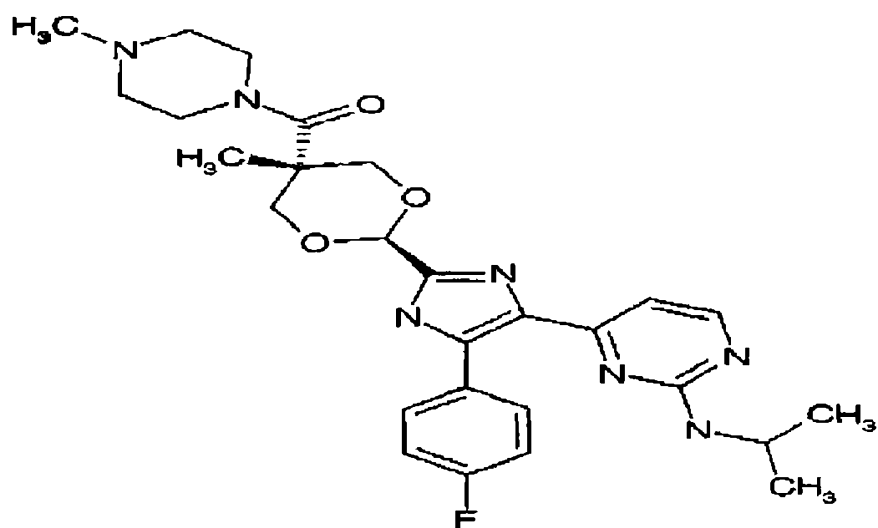
RU 2221795 C2

RPR237638



Хиральный

RPR238658

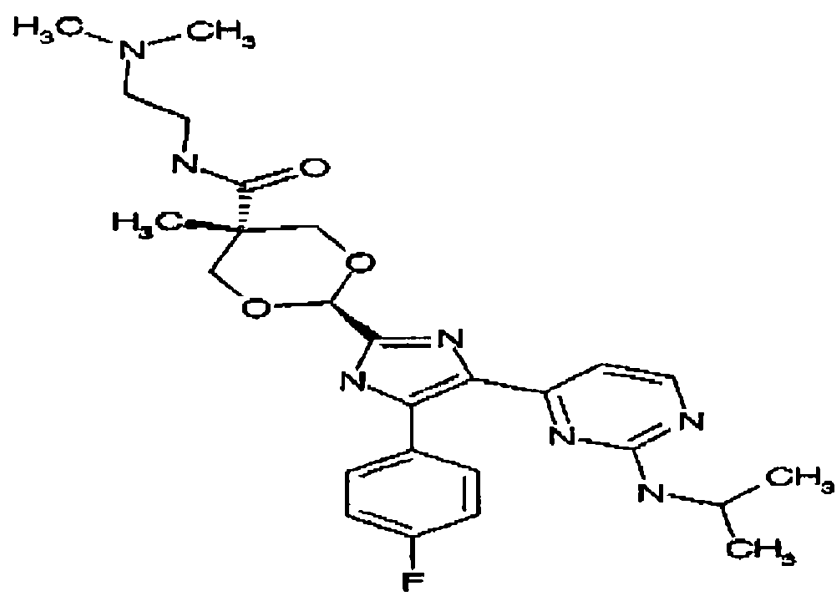


Хиральный

RU 2221795 C2

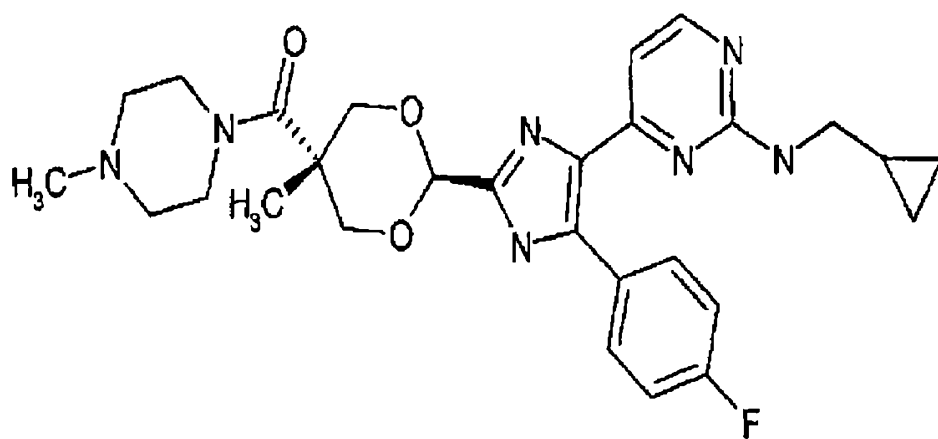
RU 2221795 C2

**RPR238700**



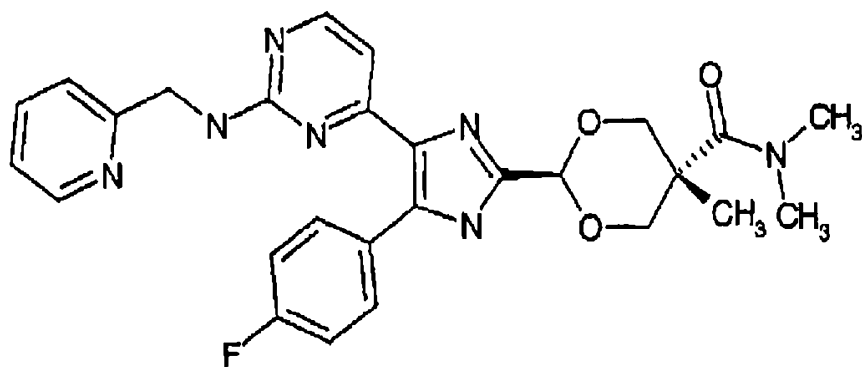
Хиральный

**RPR238677**

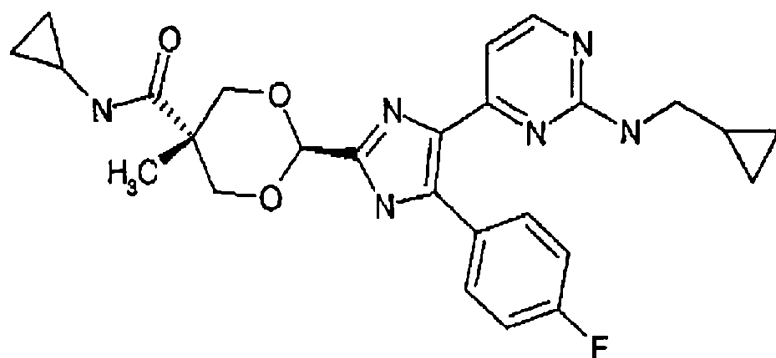


Хиральный

RPR238778

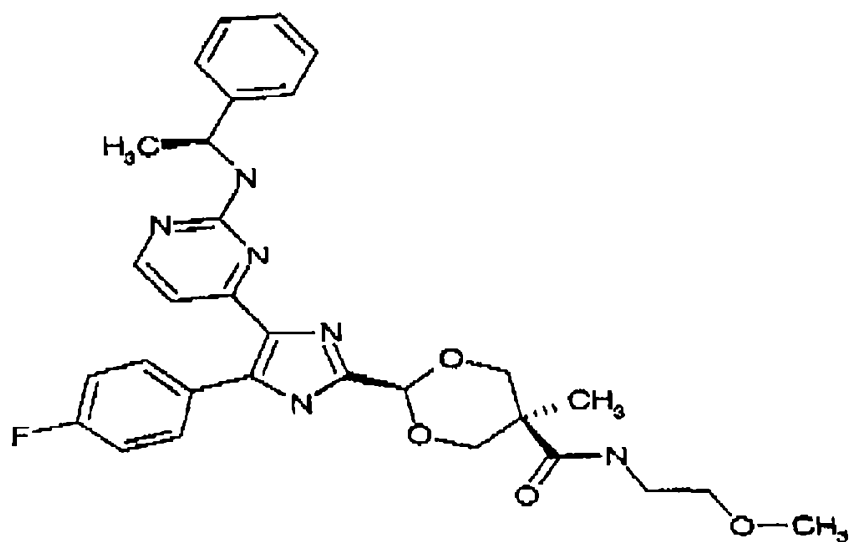


RPR239457



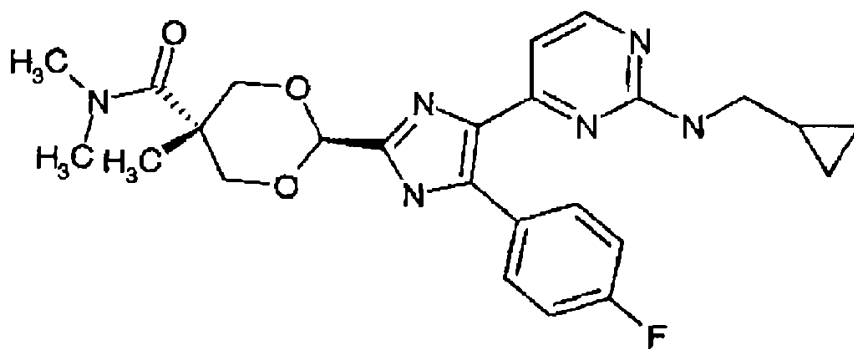
Хиральный

RPR235356



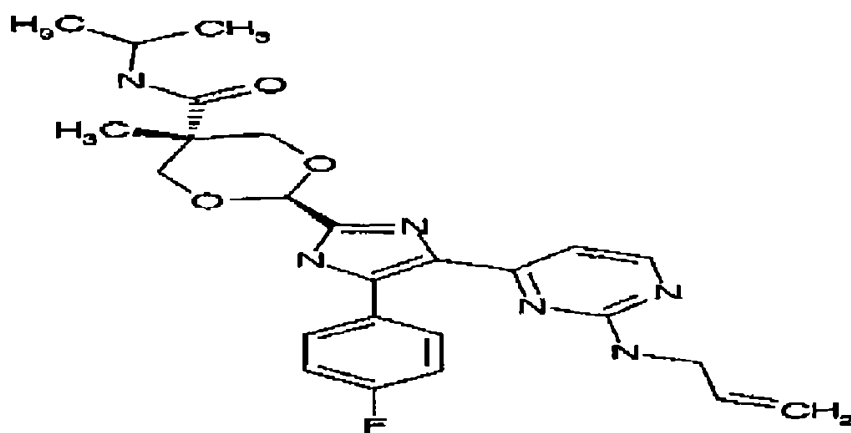
Хиральный

**RPR237897**



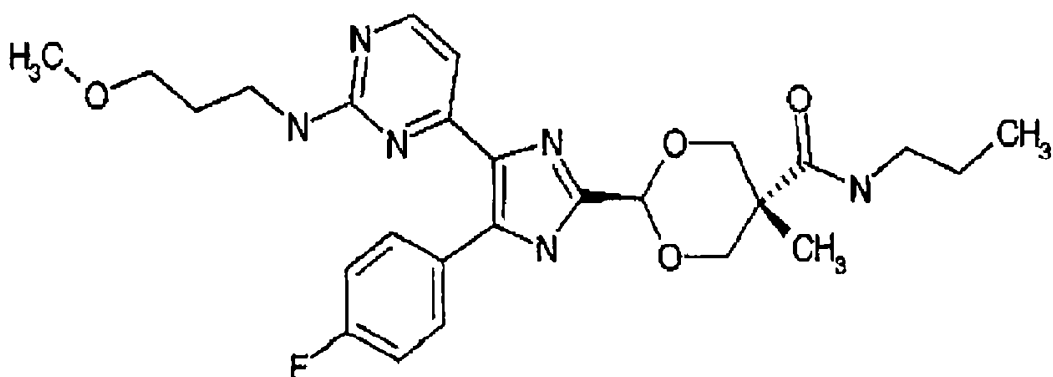
Хиральный

**RPR239938**



Хиральный

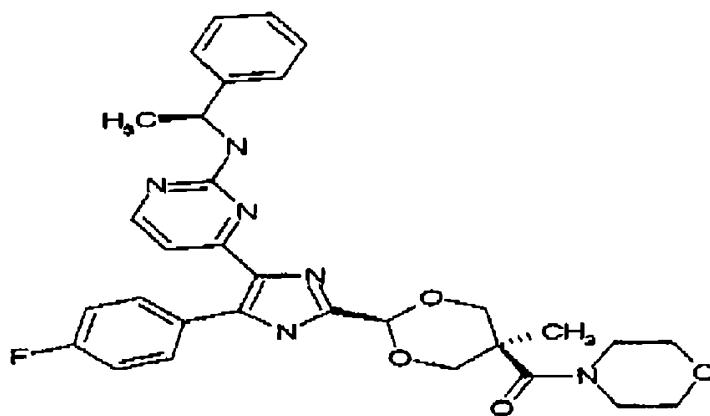
**RPR239939**



RU 2221795 C2

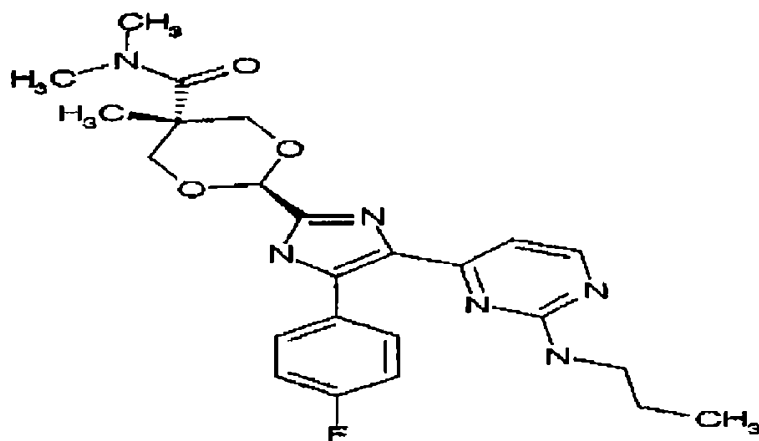
RU 2221795 C2

RPR235155



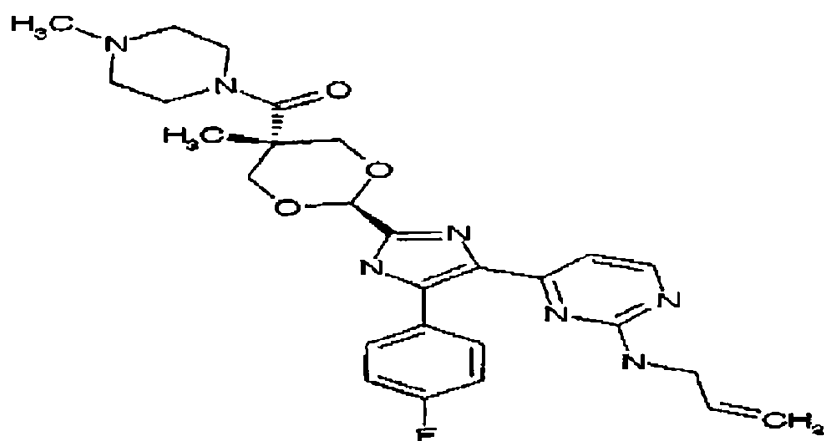
Хиральный

RPR237576



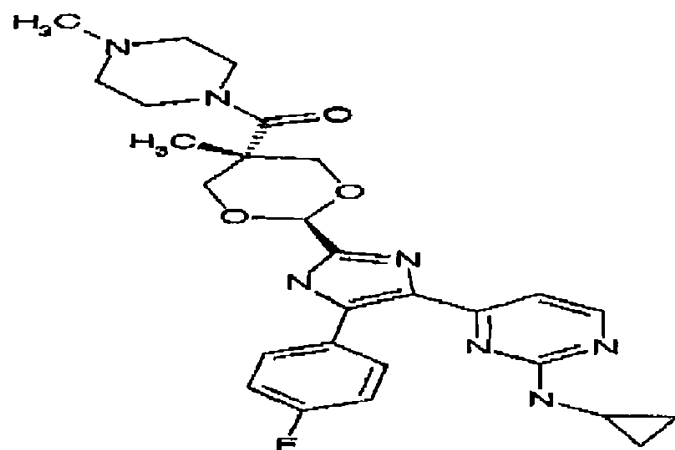
Хиральный

RPR238697



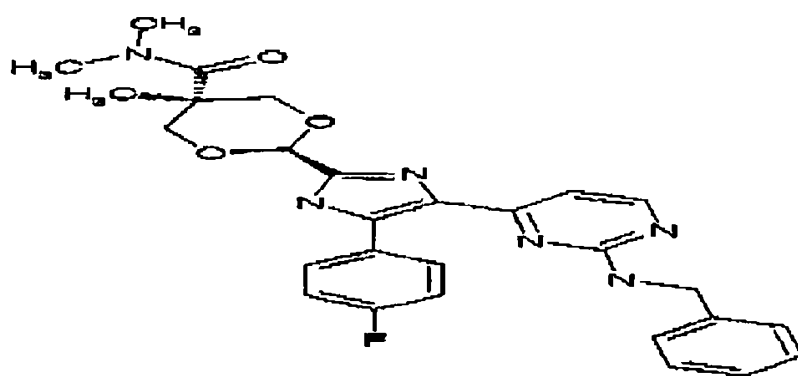
Хиральный

**RPR238698**



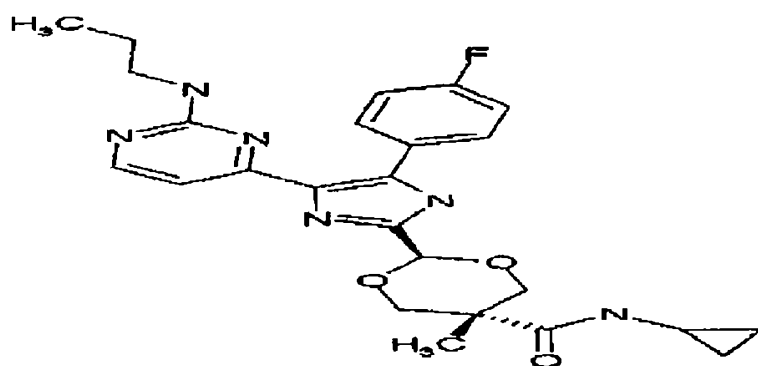
Хиральный

**RPR238538**



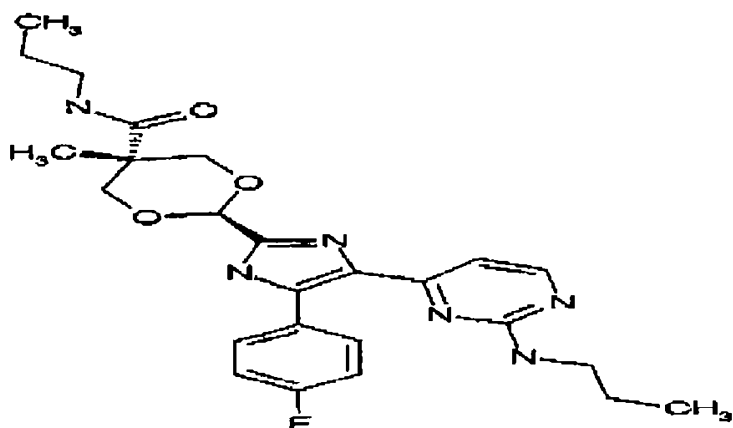
Хиральный

**RPR239437**



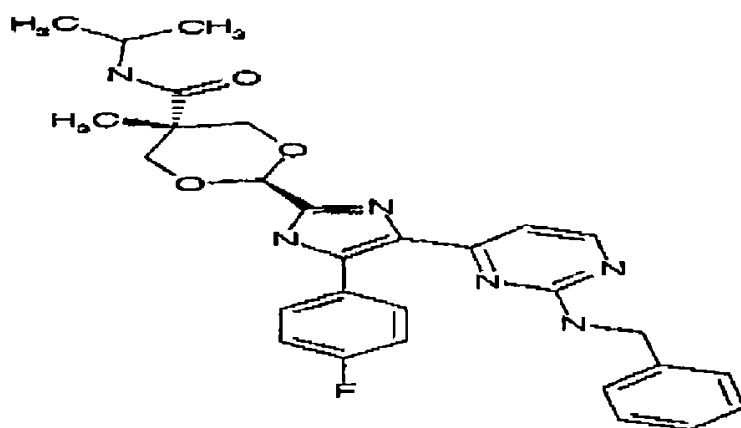
Хиральный

RPR239941



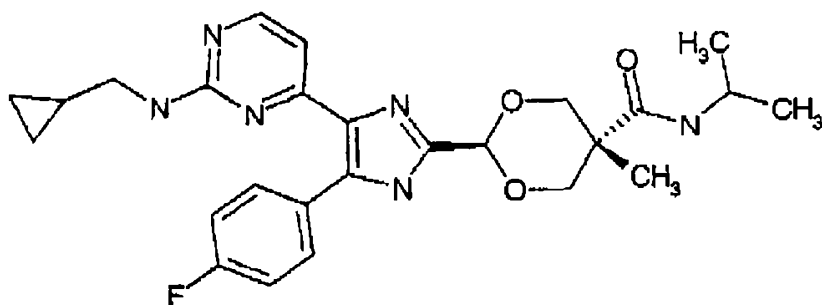
Хиральный

RPR239499

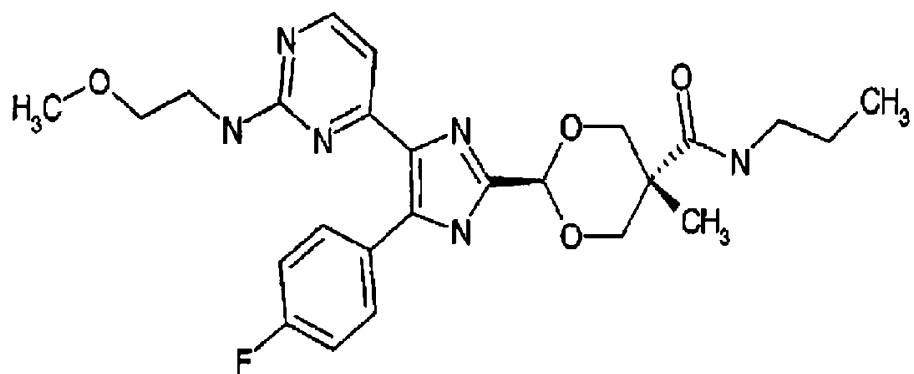


Хиральный

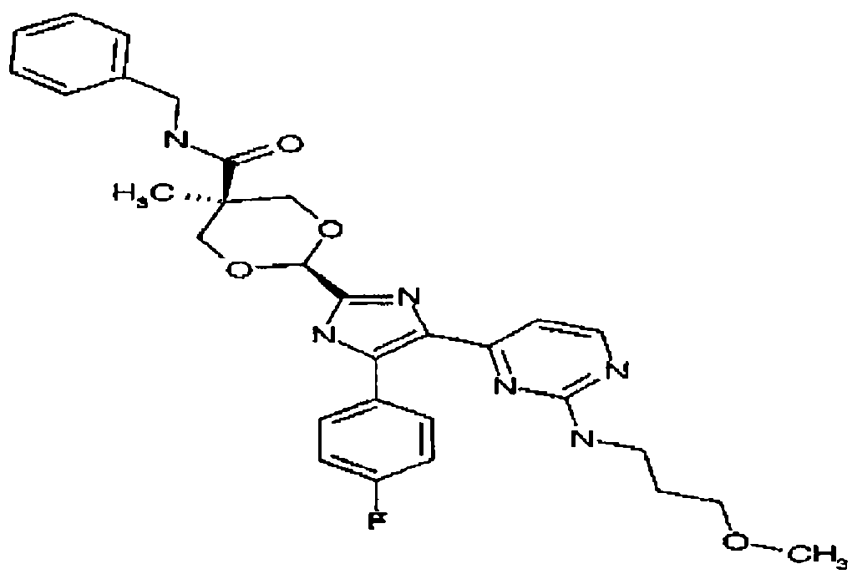
RPR239497



RPR239940

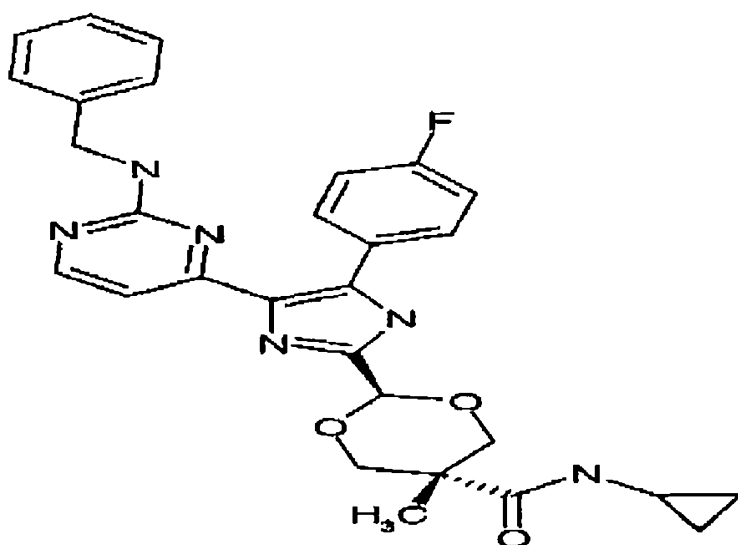


RPR235235



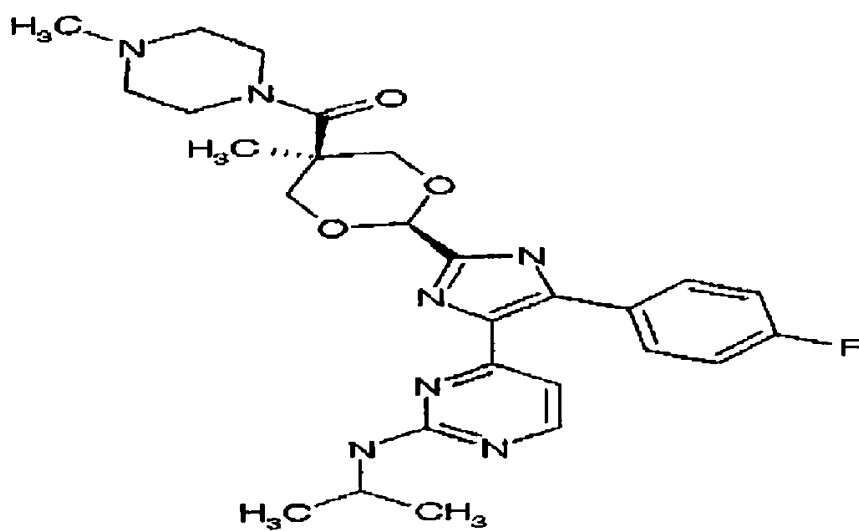
Хиральный

**RPR239477**



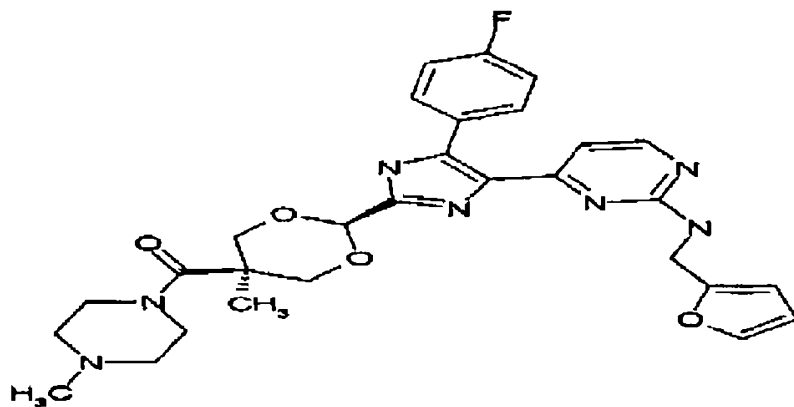
Хиральный

**RPR239277**



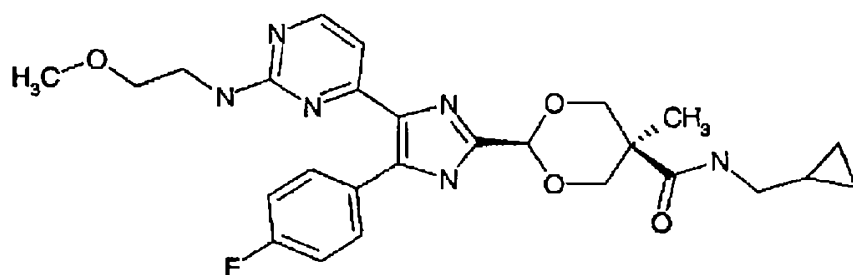
Хиральный

**RPR239318**

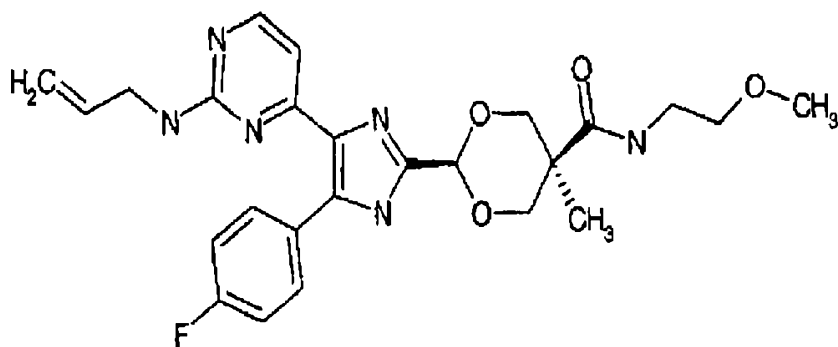


Хиральный

**RPR235455**



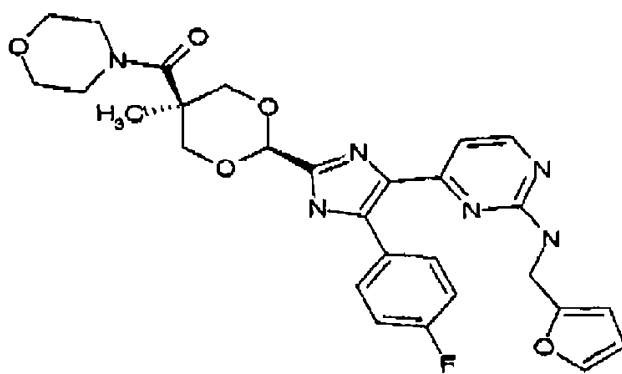
**RPR235315**



RU 2 2 2 1 7 9 5 C 2

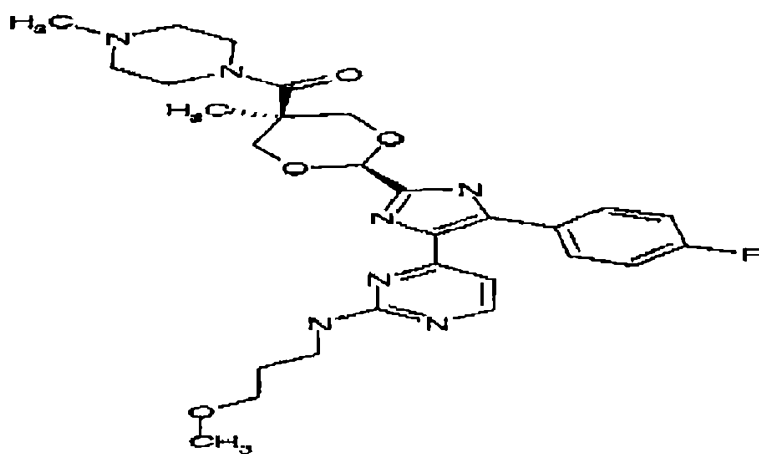
RU 2 2 2 1 7 9 5 C 2

**RPR235175**



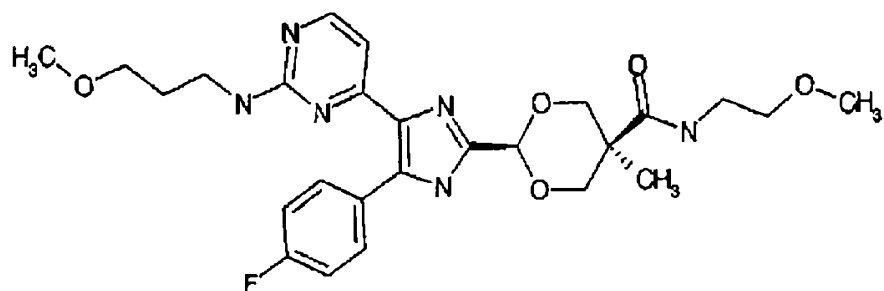
Хиральный

**RPR239297**

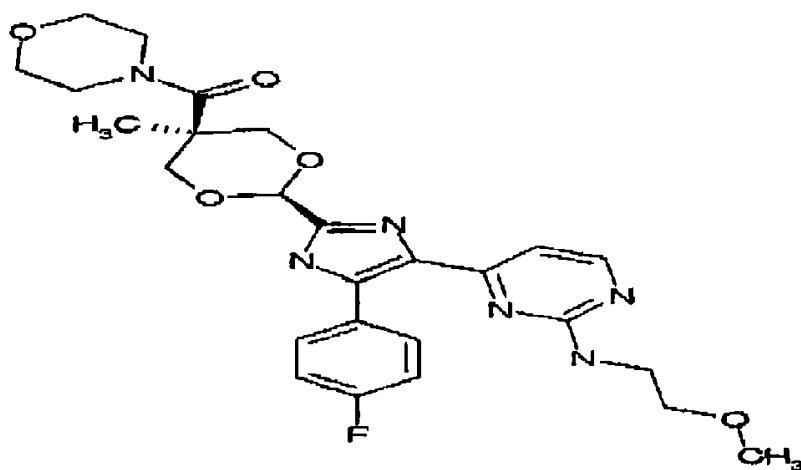


Хиральный

**RPR235316**

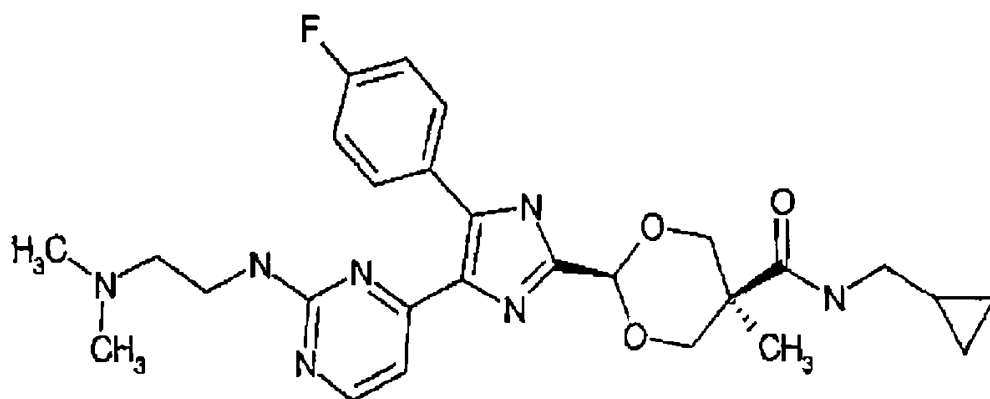


**RPR235215**



Хиральный

**RPR235775**



Хиральный

RU 2221795 C2

RU 2221795 C2