



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ,
ПАТЕНТАМ И ТОВАРНЫМ ЗНАКАМ

(12) **ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ**

(21), (22) Заявка: 2006111093/04, 07.09.2004

(30) Конвенционный приоритет:
06.09.2003 US 60/500,444

(43) Дата публикации заявки: 27.10.2007 Бюл. № 30

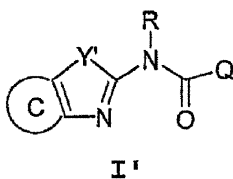
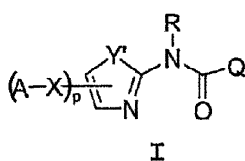
(85) Дата перевода заявки РСТ на национальную фазу:
06.04.2006(86) Заявка РСТ:
US 2004/029206 (07.09.2004)(87) Публикация РСТ:
WO 2005/026137 (24.03.2005)

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

(71) Заявитель(и):
**ВЕРТЕКС ФАРМАСЬЮТИКАЛЗ
ИНКОРПОРЕЙТЕД (US)**(72) Автор(ы):
**МИЛЛЕР Марк Т. (US),
АДИДА РУА Сара С. (US),
СИНГХ Ашавини К. (US),
КЛИВЛЕНД Томас (US),
МЕЙКИНГС Льюис Р. (US),
ХЭМИЛТОН Мэттью (US),
ГРОТЕНХЕЙС Петер Д. Й. (US)**(54) **МОДУЛЯТОРЫ АТР-СВЯЗЫВАЮЩИХ КАССЕТНЫХ ТРАНСПОРТЕРОВ**

(57) Формула изобретения

1. Способ модулирования активности ABC транспортера, включающий стадию контактирования указанного ABC транспортера с соединением формулы I или формулы I'



или его фармацевтически приемлемой солью;

где Y' представляет собой O, S или NR;

p равно 0-2;

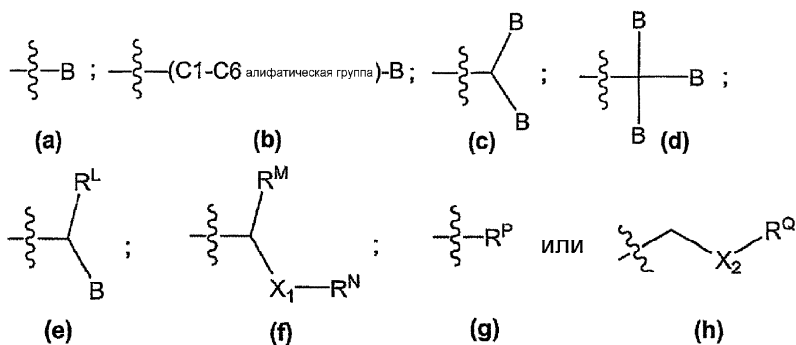
X представляет собой связь, O, S, S(O), S(O)₂, CF₂, CH₂, -CHOR-, -C(O)-, -O-C(O)-, -C(O)-O-, -C(O)-NR-, -NR-C(O)-, -NR-C(O)-O-, -O-C(O)-NR-, -NR-C(O)-NR- или NR;

R представляет собой H, R² или R⁶;

A представляет собой алифатическую, арильную, гетероарильную, гетероциклическую или циклоалкильную группу;

C представляет собой фенил или 5-8-членное циклоалифатическое кольцо;

Q выбирают из



каждый В независимо выбирают из 3-7-членного моноциклического или 8-14-членного бициклического или трициклического, насыщенного, ненасыщенного или ароматического кольца, содержащего 0-4 гетероатома в каждом кольце, где каждый указанный гетероатом независимо выбирают из N, NH, S или O;

где каждый из А, В и С независимо и необязательно замещен до 4 заместителями, независимо выбранными из R^1 , R^2 , R^3 , R^4 или R^5 ;

R^L представляет собой $-OR^A$, $-SR^A$ или $-N(R^{AB})_2$;

каждый R^A независимо представляет собой водород, C_1 - C_6 алифатическую группу, или 3-7-членное карбоциклическое или гетероциклическое, насыщенное или ненасыщенное кольцо, содержащее до 3 гетероатомов, выбранных из O, N или S, где каждый R^A необязательно замещен до 3 заместителями, независимо выбранными из R^1 , R^4 или R^7 ,

каждый R^{AB} независимо представляет собой водород или C_1 - C_6 алифатическую группу, необязательно замещенную до 3 заместителями, независимо выбранными из R^1 , R^4 или R^7 ;

где до двух метиленовых звеньев в R^A или R^{AB} необязательно заменены $-CO-$, $-CS-$, $-COCO-$, $-CONR-$, $-CO_2-$, $-OCO-$, $-NRCO_2-$, $-O-$, $-NRCONR-$, $-OCONR-$, $-NRCO-$, $-S-$, $-SO-$, $-SO_2-$, $-NR-$, $-SO_2NR-$, $NRSO_2-$ или $-NRSO_2NR$; или

два R^{AB} , взятые вместе с атомом азота, представляют собой 3-7-членное гетероциклическое или гетероарильное кольцо, содержащее до 4 гетероатомов, выбранных из O, N или S, где указанное кольцо необязательно замещено до 2 заместителями, выбранными из оксо или $(C_{1-4} \text{ алифатическая группа})_p-Y$;

R^M представляет собой C_1 - C_6 алифатическую группу, необязательно замещенную до двух заместителями, выбранными из R^1 , R^2 , R^3 или R^4 ;

каждый из X_1 и X_2 независимо выбирают из O, S или NR;

R^N представляет собой C_1 - C_6 алифатическую группу или фенил, где R^N необязательно замещен до двух заместителями, выбранными из R^1 , R^2 , R^3 или R^4 ;

R^P представляет собой C_1 - C_6 алифатическую группу, необязательно замещенную до двух заместителями, выбранными из R^1 , R^2 , R^3 или R^4 ;

R^Q представляет собой C_1 - C_6 алифатическую группу или арил, где R^Q необязательно замещен до двух заместителями, выбранными из R^1 , R^2 , R^3 или R^4 ;

R^1 представляет собой оксо, R^6 или $((C_1-C_4) \text{ алифатическая группа})_n-Y$;

n равно 0 или 1;

Y представляет собой галоген, CN, NO_2 , CF_3 , OCF_3 , OH, SR^6 , $S(O)R^6$, SO_2R^6 , NH_2 , NHR^6 , $N(R^6)_2$, NR^6R^8 , $N(R^8)_2$, COOH, $COOR^6$ или OR^6 ;

или два R^1 на соседних атомах кольца, взятые вместе, образуют 1,2-метилендиокси или 1,2-этилендиокси;

R^2 представляет собой алифатическую группу, где каждый R^2 необязательно содержит до 2 заместителей, независимо выбранных из R^1 , R^4 или R^5 ;

R^3 представляет собой циклоалифатическое, арильное, гетероциклическое или гетероарильное кольцо, необязательно содержащие до 3 заместителей, независимо выбранных из R^1 , R^2 , R^4 или R^5 ;

R^4 представляет собой OR^5 , OR^6 , $OC(O)R^6$, $OC(O)R^5$, $OC(O)OR^6$, $OC(O)OR^5$, $OC(O)N(R^6)_2$, $OC(O)N(R^5)_2$, $OC(O)N(R^6R^5)$, SR^6 , SR^5 , $S(O)R^6$, $S(O)R^5$, SO_2R^6 , SO_2R^5 ,

$\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^6)_2$, $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^5)_2$, $\text{SO}_2\text{NR}^5\text{R}^6$, SO_3R^6 , SO_3R^5 , $\text{C}(\text{O})\text{R}^5$, $\text{C}(\text{O})\text{OR}^5$, $\text{C}(\text{O})\text{R}^6$, $\text{C}(\text{O})\text{OR}^6$, $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^6)_2$, $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^5)_2$, $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^5\text{R}^6)$, $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{OR}^6)\text{R}^6$, $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{OR}^5)\text{R}^6$, $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{OR}^6)\text{R}^5$, $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{OR}^5)\text{R}^5$, $\text{C}(\text{NOR}^6)\text{R}^6$, $\text{C}(\text{NOR}^6)\text{R}^5$, $\text{C}(\text{NOR}^5)\text{R}^6$, $\text{C}(\text{NOR}^5)\text{R}^5$, $\text{N}(\text{R}^6)_2$, $\text{N}(\text{R}^5)_2$, $\text{N}(\text{R}^5\text{R}^6)$, $\text{NR}^5\text{C}(\text{O})\text{R}^5$, $\text{NR}^6\text{C}(\text{O})\text{R}^6$, $\text{NR}^6\text{C}(\text{O})\text{R}^5$, $\text{NR}^5\text{C}(\text{O})\text{R}^6$, $\text{NR}^6\text{C}(\text{O})\text{OR}^6$, $\text{NR}^5\text{C}(\text{O})\text{OR}^6$, $\text{NR}^6\text{C}(\text{O})\text{OR}^5$, $\text{NR}^5\text{C}(\text{O})\text{OR}^5$, $\text{NR}^6\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^6)_2$, $\text{NR}^6\text{C}(\text{O})\text{NR}^5\text{R}^6$, $\text{NR}^6\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^5)_2$, $\text{NR}^5\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^6)_2$, $\text{NR}^5\text{C}(\text{O})\text{NR}^5\text{R}^6$, $\text{NR}^5\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^5)_2$, $\text{NR}^6\text{SO}_2\text{R}^6$, $\text{NR}^6\text{SO}_2\text{R}^5$, $\text{NR}^5\text{SO}_2\text{R}^5$, $\text{NR}^5\text{SO}_2\text{R}^6$, $\text{NR}^6\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^6)_2$, $\text{NR}^6\text{SO}_2\text{NR}^5\text{R}^6$, $\text{NR}^6\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^5)_2$, $\text{NR}^5\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^6)_2$, $\text{NR}^5\text{SO}_2\text{NR}^5\text{R}^6$, $\text{NR}^5\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^5)_2$, $\text{N}(\text{OR}^6)\text{R}^6$, $\text{N}(\text{OR}^6)\text{R}^5$, $\text{N}(\text{OR}^5)\text{R}^5$ или $\text{N}(\text{OR}^5)\text{R}^6$;

R^5 представляет собой циклоалифатическое, арильное, гетероциклическое или гетероарильное кольцо, необязательно содержащие до 3 заместителей R^1 ;

R^6 представляет собой H или алифатическую группу, где R^6 необязательно содержит заместитель R^7 ;

R^7 представляет собой циклоалифатическое, арильное, гетероциклическое или гетероарильное кольцо, и каждый R^7 необязательно содержит до 2 заместителей, независимо выбранных из H, прямого или разветвленного (C_1 - C_6)алкила, прямого или разветвленного (C_2 - C_6)алкенила или алкинила, 1,2-метилендиокси, 1,2-этилендиокси или $(\text{CH}_2)_n\text{-Z}$;

Z выбирают из галогена, CN, NO_2 , CF_3 , OCF_3 , OH, S-алифатической группы, S(O)-алифатической группы, SO_2 -алифатической группы, NH_2 , NH-алифатической группы, N(алифатическая группа) $_2$, N(алифатическая группа) R^8 , NHR^8 , $\text{N}(\text{R}^8)_2$, COOH, C(O)O-алифатической группы или O-алифатической группы; и

R^8 представляет собой аминокзащитную группу.

2. Способ по п.1, где Y' представляет собой S или O.

3. Способ по п.2, где r равно 1 и X присоединен к атому углерода, соседнему с атомом Y' .

4. Способ по п.2, где r равно 1 и X присоединен к атому углерода, соседнему с атомом азота кольца.

5. Способ по п.2, где r равно 2.

6. Способ по п.1, где X представляет собой связь, O, S, CH_2 , CF_2 , CHOR, C(O)NR, C(O)O, NRC(O) или NR.

7. Способ по п.6, где X представляет собой связь, CH_2 , CHOH, C(O) или C(O)O.

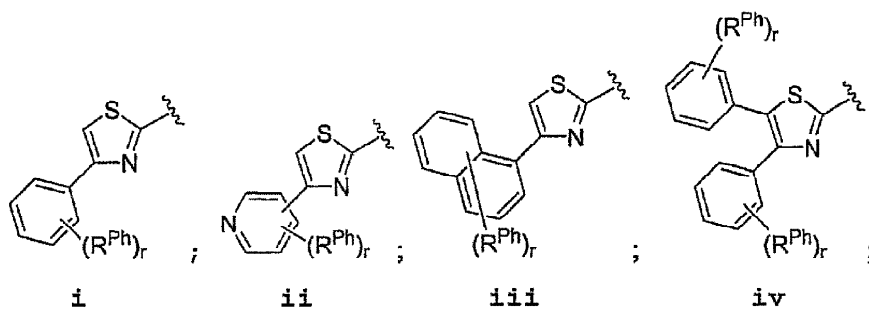
8. Способ по п.1, где A представляет собой необязательно замещенную (C_1 - C_{10})алифатическую группу.

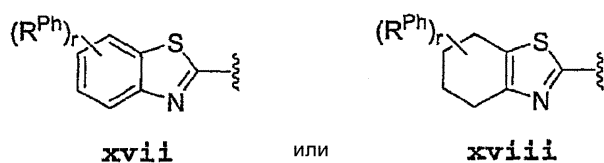
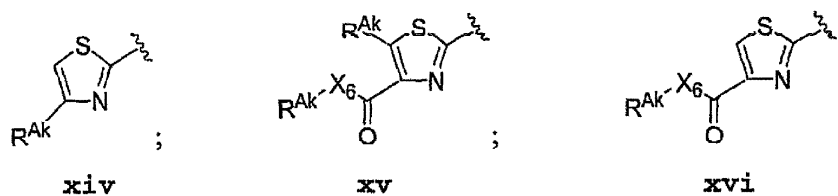
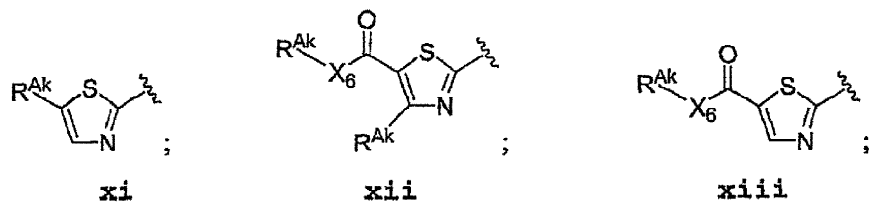
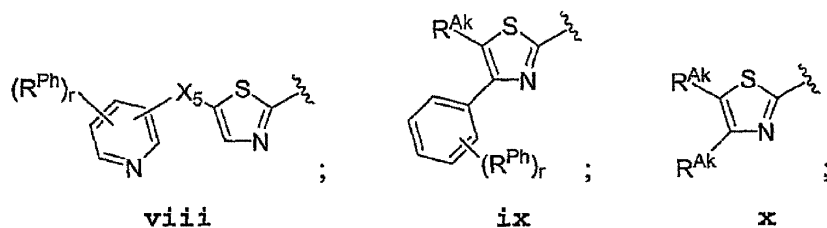
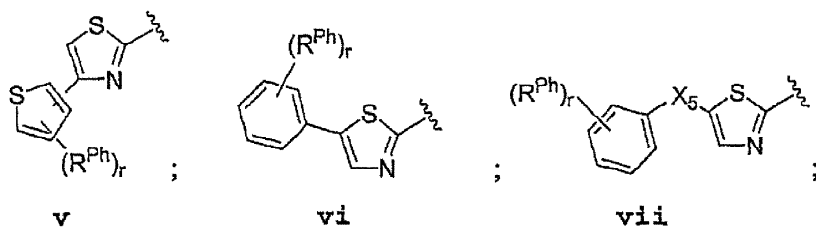
9. Способ по п.8, где A представляет собой необязательно замещенный метил, этил, пропил, бутил, пентил или гексил.

10. Способ по п.1, где A представляет собой необязательно замещенное C_6 - C_{10} арильное кольцо.

11. Способ по п.10, где A представляет собой необязательно замещенный фенил или нафтил.

12. Способ по п.1, где A, X и присоединенное к ним кольцо, взятые вместе, выбирают из





где R^{Ph} независимо представляет собой R^1 , R^2 или R^3 ; и r равно 0-3.

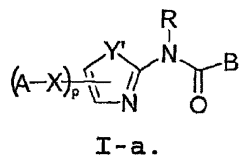
X_5 представляет собой CH_2 , $C(O)$ или $CHOR$;

X_6 представляет собой O или NR^2 ; и

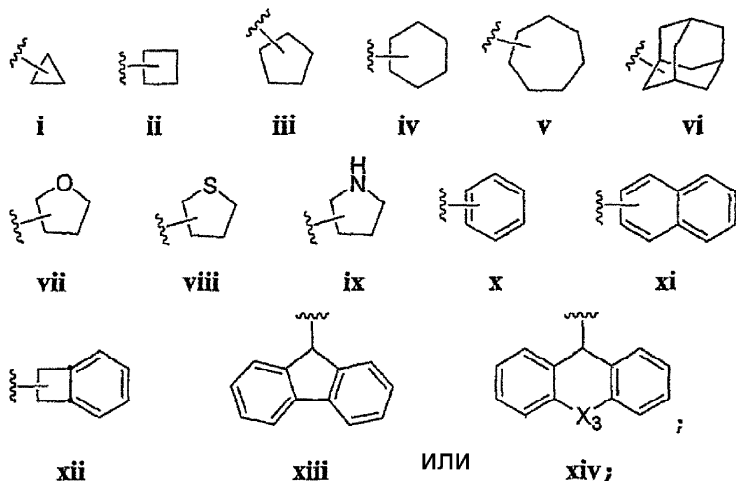
R^{Ak} представляет собой C_1 - C_6 алифатическую группу, необязательно замещенную R^1 , R^2 или R^3 .

13. Способ по п.12, где каждый B независимо представляет собой необязательно замещенный фенил или нафтил.

14. Способ по п.1, где указанное соединение имеет формулу I-a



15. Способ по п.14, где указанный B выбирают из



где X_3 представляет собой O, S или NR.

16. Способ по п.15, где В замещен до двух заместителями R^1 .

17. Способ по п.16, где указанный заместитель выбирают из C1-C4алкила, -O-C1-C4алкила, CN, галогена, COOH, -C(O)NH₂, -C(O)O(C1-C4алкила), -C(O)NH(C1-C4алкила), -C(O)N(C1-C4алкила)₂ или фенила, необязательно замещенного до двух заместителями, выбранными из C1-C4алкила, -O-C1-C4алкила, CN, галогена, COOH, -C(O)NH₂, -C(O)O(C1-C4алкила), -C(O)NH(C1-C4алкила), -C(O)N(C1-C4алкила)₂.

18. Способ по п.15, где указанный В выбирают из колец i, iii, iv, v, vi или vii.

19. Способ по п.15, где указанный В представляет собой кольцо x.

20. Способ по п.15, где указанный В выбирают из колец xi, xii, xiii или xiv.

21. Способ по п.15, где X представляет собой связь и А представляет собой необязательно замещенный фенил, и А присоединен к атому углерода, соседнему с атомом азота кольца.

22. Способ по п.21, где А представляет собой фенил, необязательно замещенный до двух заместителями, выбранными из C1-C4алкила, C1-C4алкокси, циано, галогена, N-пирролидинила, N-пиперидинила или метилendiокси.

23. Способ по п.22, где А представляет собой фенил, 3-метоксифенил, 2-метоксифенил, 4-цианофенил, 4-хлорфенил, 4-(N-пирролидинил)фенил, 4-толил, 3,4-метилendiоксифенил, 3-хлорфенил, 2,4-диметоксифенил, 2-хлорфенил, 4-бромфенил, 2,5-диметилфенил или 2,4-диметилфенил.

24. Способ по п.15, где А выбирают из циклопропила, цикlopентила, циклогексила, циклогептила или адамантила.

25. Способ по п.15, где соединения обладают одним или более из следующих признаков:

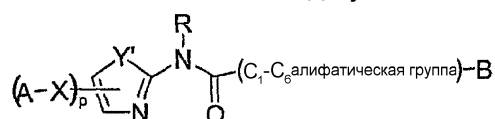
a) R представляет собой водород;

b) Y' представляет собой S;

c) А представляет собой фенил, необязательно замещенный до двух заместителями, выбранными из C1-C4алкила, C1-C4алкокси, циано, галогена, N-пирролидинила, N-пиперидинила или метилendiокси; и

d) В представляет собой фенил, необязательно замещенный до двух заместителями, выбранными из C1-C4алкила, -O-C1-C4алкила, CN, галогена, COOH, -C(O)NH₂, -C(O)O(C1-C4алкила), -C(O)NH(C1-C4алкила), -C(O)N(C1-C4алкила)₂ или фенила, необязательно замещенного до двух заместителями, выбранными из C1-C4алкила, -O-C1-C4алкила, CN, галогена, COOH, -C(O)NH₂, -C(O)O(C1-C4алкила), -C(O)NH(C1-C4алкила), -C(O)N(C1-C4алкила)₂.

26. Способ по п.1, где указанные соединения имеют формулу I-b



I-b.

27. Способ по п.26, где p равно 1, X представляет собой связь, и А представляет

собой необязательно замещенное фенильное кольцо.

28. Способ по п.26, где r равно 2, каждый X представляет собой связь, и каждый A представляет собой необязательно замещенный фенил.

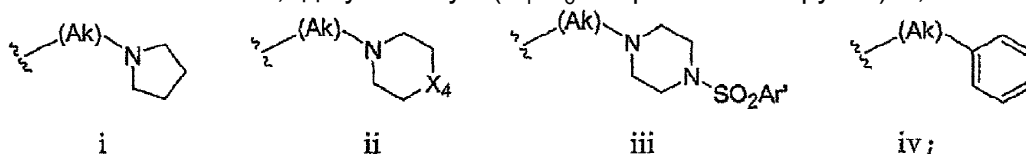
29. Способ по п.26, где X представляет собой CH_2 , CHOH или C(O) , и A представляет собой необязательно замещенный фенил.

30. Способ по п.26, где указанная $\text{C}_1\text{-C}_6$ алифатическая группа представляет собой прямой или разветвленный $\text{C}_1\text{-C}_4$ алкилиден.

31. Способ по п.30, где указанный алкилиден выбирают из $-\text{CH}_2-$, $-\text{CH}(\text{Me})-$, $-\text{C}(\text{Me})_2-$, $-\text{CH}(\text{Et})-$, $-\text{C}(\text{Et})_2-$ или $-\text{CH}_2\text{-CH}(\text{Me})-$.

32. Способ по п.26, где B выбирают из $\text{C}_3\text{-C}_8$ циклоалкила, фенила, пиперидила или пирролидинила, необязательно замещенных до двух заместителями R^1 .

33. Способ по п.26, где указанную ($\text{C}_1\text{-C}_6$ алифатическая группа)-B, вместе, выбирают из



где Ak представляет собой прямой или разветвленный $\text{C}_1\text{-C}_6$ алкилиден;

X_4 представляет собой CH_2 , O или S;

Ar' представляет собой фенил, необязательно замещенный до двух R^1 ; и

B необязательно замещен до двух R^1 .

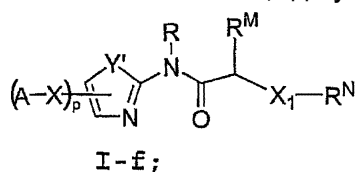
34. Способ по п.33, где Ak выбирают из групп CH_2 , $\text{CH}(\text{CH}_3)$, $\text{C}(\text{CH}_3)_2$, $\text{CH}(\text{Et})$, $\text{C}(\text{Et})_2$, $\text{CH}(\text{n-пропил})$, $\text{CH}(\text{изо-Pr})$, $\text{CH}(\text{n-бутил})$, $\text{CH}(\text{бут-2-ил})$ или $\text{CH}(\text{трет-бутил})$.

35. Способ по п.33, где Ar' представляет собой фенил, необязательно замещенный галогеном, $\text{C}_1\text{-C}_4$ алкилом или O-($\text{C}_1\text{-C}_4$ алкилом).

36. Способ по п.33, где X_4 представляет собой S или O.

37. Способ по п.26 или 33, где R представляет собой водород.

38. Способ по п.1, где указанное соединение имеет формулу I-f



где Y' представляет собой O или S;

X_1 представляет собой O, S или NR ;

R^M представляет собой $\text{C}_1\text{-C}_6$ алифатическую группу или фенил, где R^M необязательно замещен до двух заместителями, независимо выбранными из R^1 , R^2 или R^3 ;

R^N представляет собой $\text{C}_1\text{-C}_6$ алифатическую группу или 3-7-членное моноциклическое, насыщенное, ненасыщенное или ароматическое кольцо, содержащее 0-4 гетероатома в каждом кольце, где каждый указанный гетероатом независимо выбирают из N, NH, S или O;

где R^N необязательно замещен до 4 заместителями, независимо выбранными из R^1 , R^2 , R^3 , R^4 или R^5 .

39. Способ по п.38, где r равно 1.

40. Способ по п.38, где X представляет собой CH_2 , CHOH или C(O) .

41. Способ по п.38, где X представляет собой связь, и A представляет собой необязательно замещенный фенил.

42. Способ по п.38, где r равно 2, каждый X представляет собой связь, и каждый A представляет собой необязательно замещенный фенил.

43. Способ по п.38, где X_1 представляет собой NH или N($\text{C}_1\text{-C}_4$ алкил).

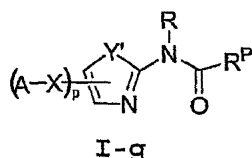
44. Способ по п.38, где X_1 представляет собой O.

45. Способ по п.38, где R^M представляет собой необязательно замещенный фенил.

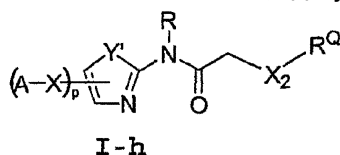
46. Способ по п.38, где R^M представляет собой $\text{C}_1\text{-C}_4$ алкил.

47. Способ по п.38, где R^N представляет собой необязательно замещенную $\text{C}_3\text{-C}_7$ циклоалифатическую группу, фенил или бензил.

48. Способ по п.38, где R^N представляет собой C_1 - C_6 алифатическую группу.
 49. Способ по п.38, R представляет собой водород.
 50. Способ по п.38, где Y' представляет собой S.
 51. Способ по п.1, где указанное соединение имеет формулу I-g



- где Y' представляет собой O или S;
 R^P представляет собой C_1 - C_8 алифатическую группу, необязательно замещенную до двух заместителями, независимо выбранными из R^1 , R^2 или R^3 .
 52. Способ по п.51, где p равно 1 и X представляет собой связь.
 53. Способ по п.51, где p равно 1, X представляет собой CH_2 , $CHON$ или $C(O)$.
 54. Способ по п.51, где X представляет собой связь и A представляет собой необязательно замещенный фенил.
 55. Способ по п.51, где p равно 2, каждый X представляет собой связь, и каждый A представляет собой необязательно замещенный фенил.
 56. Способ по п.51, где R^P представляет собой C_1 - C_4 алкил, необязательно замещенный до двух R^1 .
 57. Способ по п.56, где R^P выбирают из этила, н-пропила, изопропила, н-бутила, бут-2-ила, изоамила или трет-бутила, необязательно замещенных галогеном, CN, $COOH$ или $CONH_2$.
 58. Способ по п.51, где R представляет собой водород.
 59. Способ по п.51, где указанные соединения обладают одним или более из следующих признаков:
 а) Y' представляет собой S;
 б) R представляет собой водород;
 с) p равно 2 и каждый A представляет собой фенил;
 д) R^P представляет собой изоамил, трет-бутил, этил, изопропил, н-пропил, 1-карбоксипроп-3-ил или 1-карбокси-2-метилпроп-3-ил.
 60. Способ по п.1, где указанное соединение имеет формулу 1-h

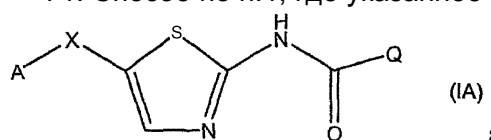


- где Y' представляет собой O или S;
 X^2 представляет собой O, S или NR;
 R^Q представляет собой C_1 - C_6 алифатическую группу или фенил, необязательно замещенные до двух заместителями, независимо выбранными из R^1 , R^2 или R^3 .
 61. Способ по п.60, где p равно 1 и X представляет собой связь.
 62. Способ по п.60, где X представляет собой CH_2 , $CHON$ или $C(O)$.
 63. Способ по п.60, где X представляет собой связь, и A представляет собой необязательно замещенный фенил.
 64. Способ по п.60, где p равно 2, каждый X представляет собой связь, и каждый A представляет собой необязательно замещенный фенил.
 65. Способ по п.60, где X_2 представляет собой S.
 66. Способ по п.60, где X_2 представляет собой O.
 67. Способ по п.60, где R^Q представляет собой C_1 - C_4 алкил, необязательно замещенный до трех R^1 .
 68. Способ по п.60, где R^Q представляет собой C_1 - C_4 алкил, необязательно замещенный одним R^1 .
 69. Способ по п.60, где R^Q представляет собой фенил, необязательно замещенный C_1 -

C4алкилом, или R¹.

70. Способ по п.60, где R представляет собой водород.

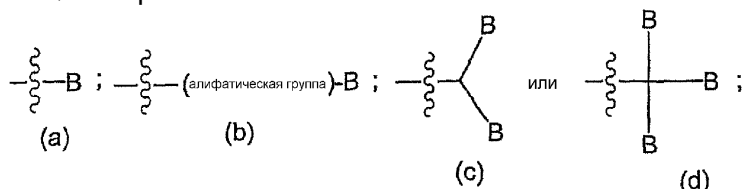
71. Способ по п.1, где указанное соединение имеет формулу (IA)



где X представляет собой связь, CH₂, CHOR, C(O), NR или O;

A представляет собой алифатическую группу, арильную, гетероарильную, гетероциклическую или циклоалифатическую группу;

Q выбирают из



каждый В независимо выбирают из 3-7-членного моноциклического или 8-14-членного бициклического или трициклического, насыщенного, ненасыщенного или ароматического кольца, содержащего 0-4 гетероатома в каждом кольце, где каждый указанный гетероатом независимо выбирают из N, NH, S или O;

R представляет собой H, R² или R⁶;

где каждый из A и B независимо и необязательно замещен до 4 заместителями, независимо выбранными из R¹, R², R³, R⁴ или R⁵; и

R¹, R², R³, R⁴ или R⁵ имеют значения, указанные в п.1.

72. Способ по п.71, где X представляет собой CH₂.

73. Способ по п.71, где X представляет собой связь.

74. Способ по п.71, где A представляет собой фенил или 5-6-членный гетероарил, где A необязательно замещен до 3 заместителями, выбранными из R¹, R², R³ или R⁴.

75. Способ по п.71, где A представляет собой необязательно замещенный фенил.

76. Способ по п.71, где Q представляет собой В.

77. Способ по п.71, где Q представляет собой -(C₁-C₆алифатическая группа)-В.

78. Способ по п.71, где Q представляет собой CH(B)₂.

79. Способ по п.71, где Q представляет собой C(B)₃.

80. Способ по п.71, где В представляет собой фенил.

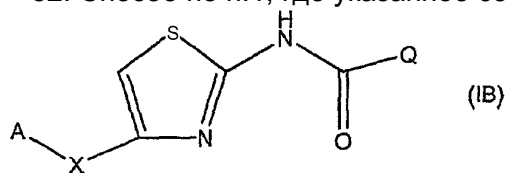
81. Способ по п.71, где

(i) X представляет собой связь, CHON, C(O), CH₂ или O;

(ii) A представляет собой необязательно замещенный фенил; и

(iii) Q представляет собой дифенилметил.

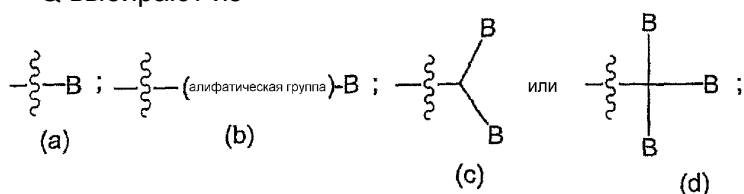
82. Способ по п.1, где указанное соединение имеет формулу (IB)



где X представляет собой связь, CH₂, CHOR, C(O), NR или O;

A представляет собой алифатическую группу, арильную, гетероарильную, гетероциклическую или циклоалифатическую группу;

Q выбирают из



каждый В независимо выбирают из 3-7-членного моноциклического или 8-14-членного

бициклического или трициклического, насыщенного, ненасыщенного или ароматического кольца, содержащего 0-4 гетероатома в каждом кольце, где каждый указанный гетероатом независимо выбирают из N, NH, S или O;

R представляет собой H, R² или R⁶;

где каждый из A и B независимо и необязательно замещен до 4 заместителями, независимо выбранными из R¹, R², R³, R⁴ или R⁵.

83. Способ по п.82, где X представляет собой связь или CH₂.

84. Способ по п.82, где X представляет собой связь.

85. Способ по п.82, где A представляет собой фенил или 5-6-членный гетероарил, где A необязательно замещен до 3 заместителями, выбранными из R¹, R², R³ или R⁴.

86. Способ по п.82, где Q представляет собой B.

87. Способ по п.82, где Q представляет собой -(C₁-C₆алифатическая группа)-B.

88. Способ по п.82, где Q представляет собой CH(B)₂.

89. Способ по п.82, где Q представляет собой C(B)₃.

90. Способ по п.82, где B представляет собой фенил.

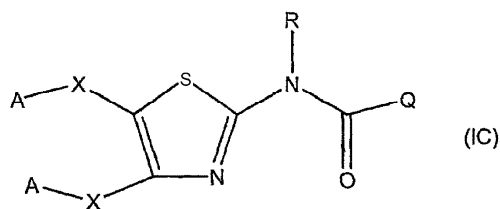
91. Способ по п.82, где

(i) X представляет собой связь, CHON, C(O), CH₂ или O;

(ii) A представляет собой необязательно замещенный фенил; и

(iii) Q представляет собой дифенилметил.

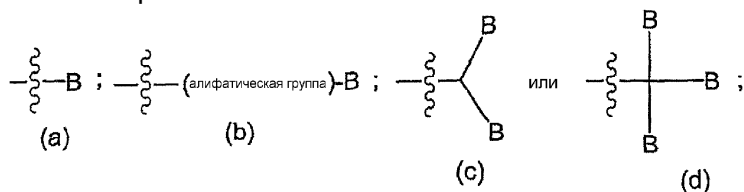
92. Способ по п.1, где указанное соединение имеет формулу (IC)



где каждый X независимо представляет собой связь, CH₂, CHOR, C(O), NR или O;

A представляет собой алифатическую группу, арильную, гетероарильную, гетероциклическую или циклоалифатическую группу;

Q выбирают из



каждый B независимо выбирают из 3-7-членного моноциклического или 8-14-членного бициклического или трициклического, насыщенного, ненасыщенного или ароматического кольца, содержащего 0-4 гетероатома в каждом кольце, где каждый указанный гетероатом независимо выбирают из N, NH, S или O;

R представляет собой H, R² или R⁶;

где каждый из A и B независимо и необязательно замещен до 4 заместителями, независимо выбранными из R¹, R², R³, R⁴ или R⁵.

93. Способ по п.92, где X представляет собой связь или CH₂.

94. Способ по п.92, где X представляет собой CH₂.

95. Способ по п.92, где X представляет собой связь.

96. Способ по п.92, где A представляет собой фенил или 5-6-членный гетероарил, где A необязательно замещен до 3 заместителями, выбранными из R¹, R², R³ или R⁴.

97. Способ по п.92, где Q представляет собой B.

98. Способ по п.92, где Q представляет собой -(C₁-C₆алифатическая группа)-B.

99. Способ по п.92, где Q представляет собой CH(B)₂.

100. Способ по п.92, где Q представляет собой C(B)₃.

101. Способ по п.92, где B представляет собой фенил.

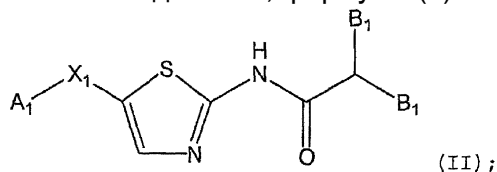
102. Способ по п.92, где

(i) каждый X представляет собой связь или CH₂;

- (ii) каждый А представляет собой необязательно замещенный фенил, (C₁-C₆)алифатическую группу или CF₃; и
 (iii) Q представляет собой необязательно замещенный фенил, (C₁-C₆)алифатическую группу или дифенилметил.

103. Способ по п.102, где X представляет собой CH₂.

104. Соединение, формулы (II)



или его фармацевтически приемлемая соль;

где X₁ представляет собой связь, O, S, CF₂, CHOR, C(O), C(O)O, CH₂ или NR;

R представляет собой H или R²;

A₁ представляет собой (C₂-C₁₀)алифатическую группу, арил, гетероарил, гетероцикл или циклоалкил;

каждый B₁ независимо выбирают из 3-7-членного моноциклического, насыщенного, ненасыщенного или ароматического кольца, содержащего 0-4 гетероатома, выбранных из N, NH, S или O;

где каждый A₁ необязательно замещен до 4 заместителями, независимо выбранными из R¹, R², R³, R⁴ или R⁵;

R¹ представляет собой R⁶ или ((C₁-C₄)алифатическая группа)_n-Y;

n равно 0 или 1;

Y представляет собой галоген, CN, NO₂, CF₃, OCF₃, OH, SR⁶, S(O)R⁶, SO₂R⁶, NH₂, NHR⁶, N(R⁶)₂, NR⁶R⁸, COOH, COOR⁶ или OR⁶; или

два R¹ на соседних атомах кольца, взятые вместе, образуют 1,2-метилендиокси или 1,2-этилендиокси;

R² представляет собой алифатическую группу, где каждый R² необязательно содержит до 2 заместителей, независимо выбранных из R¹, R⁴ или R⁵;

R³ представляет собой циклоалифатическое, арильное, гетероциклическое или гетероарильное кольцо, необязательно содержащие до 3 заместителей, независимо выбранных из R¹, R², R⁴ или R⁵;

R⁴ представляет собой OR⁵, OR⁶, OC(O)R⁶, OC(O)R⁵, OC(O)OR⁶, OC(O)OR⁵, OC(O)N(R⁶)₂, OC(O)N(R⁵)₂, OC(O)N(R⁶R⁵), SR⁶, SR⁵, S(O)R⁶, S(O)R⁵, SO₂R⁶, SO₂R⁵, SO₂N(R⁶)₂, SO₂N(R⁵)₂, SO₂NR⁵R⁶, SO₃R⁶, SO₃R⁵, C(O)R⁵, C(O)OR⁵, C(O)R⁶, C(O)OR⁶, C(O)N(R⁶)₂, C(O)N(R⁵)₂, C(O)N(R⁵R⁶), C(O)N(OR⁶)R⁶, C(O)N(OR⁵)R⁶, C(O)N(OR⁶)R⁵, C(O)N(OR⁵)R⁵, C(NOR⁶)R⁶, C(NOR⁶)R⁵, C(NOR⁵)R⁶, C(NOR⁵)R⁵, N(R⁶)₂, N(R⁵)₂, N(R⁵R⁶), NR⁵C(O)R⁵, NR⁶C(O)R⁶, NR⁶C(O)R⁵, NR⁵C(O)R⁶, NR⁶C(O)OR⁶, NR⁵C(O)OR⁶, NR⁶C(O)OR⁵, NR⁵C(O)OR⁵, NR⁶C(O)N(R⁶)₂, NR⁶C(O)NR⁵R⁶, NR⁶C(O)N(R⁵)₂, NR⁵C(O)N(R⁶)₂, NR⁵C(O)NR⁵R⁶, NR⁵C(O)N(R⁵)₂, NR⁶SO₂R⁶, NR⁶SO₂R⁵, NR⁵SO₂R⁵, NR⁵SO₂R⁶, NR⁶SO₂N(R⁶)₂, NR⁶SO₂NR⁵R⁶, NR⁶SO₂N(R⁵)₂, NR⁵SO₂N(R⁶)₂, NR⁵SO₂NR⁵R⁶, NR⁵SO₂N(R⁵)₂, N(OR⁶)R⁶, N(OR⁶)R⁵, N(OR⁵)R⁵ или N(OR⁵)R⁶;

R⁵ представляет собой циклоалифатическое, арильное, гетероциклическое или гетероарильное кольцо, необязательно содержащие до 3 заместителей R¹;

R⁶ представляет собой H или алифатическую группу, где R⁶ необязательно содержит заместитель R⁷;

R⁷ представляет собой циклоалифатическое, арильное, гетероциклическое или гетероарильное кольцо, и каждый R⁷ необязательно содержит до 2 заместителей, независимо выбранных из H, прямого или разветвленного (C₁-C₆)алкила, прямого или разветвленного (C₂-C₆)алкенила или алкинила, 1,2-метилендиокси, 1,2-этилендиокси или (CH₂)_n-Z;

Z выбирают из галогена, CN, NO₂, CF₃, OCF₃, OH, S-алифатической группы, S(O)-

алифатической группы, SO₂-алифатической группы, NH₂, N-алифатической группы, N(алифатическая группа)₂, N(алифатическая группа)R⁸, COOH, C(O)O-алифатической группы или O-алифатической группы; и

R⁸ представляет собой аминокзащитную группу;

при условии, что

(i) когда оба B₁ представляют собой одновременно фенил и X₁ представляет собой CH₂, тогда A не является 4-фторфенилом, 4-фенилпиперидилом, фенилом, 2,4-дихлорфенилом, 4-метоксифенилом, 3,4-дихлорфенилом, 2,5-дихлорфенилом, 4-нитрофенилом, 4-бромфенилом, 4-метилфенилом, 2-хлорфенилом, 1-нафтилом, 3-трифторметилфенилом, 2,3-дихлорфенилом, N-морфолинилом, 4-хлорфенилом, 3-хлорфенилом или 3-нитрофенилом;

(ii) когда X₁ представляет собой связь или CH₂, один B₁ представляет собой замещенный фенил и другой B₁ представляет собой циклоалифатическую группу, тогда A₁ не является (C2-C8)алифатической группой; и

(iii) когда X₁ представляет собой связь, тогда A₁ не является необязательно замещенным 6-членным гетероарильным кольцом с 1-3 кольцевыми атомами азота.

105. Соединение по п.104, где X₁ представляет собой CH₂, CHOR, C(O), C(O)O, CF₂ или O.

106. Соединение по п.104, где X₁ представляет собой CH₂, CHOR, C(O), C(O)O.

107. Соединение по п.104, где X₁ представляет собой CH₂.

108. Соединение по п.104, где A выбирают из фенила, триазила, пиразина, пиримидина, пиридазина, пиридина, тиадизола, триазола, оксадизола, изотиазола, пиразола, имидазола, тиазола, оксазола, пиррола, тиена, фурана, индолина, индола, изоиндола, бензофурана, бензо[b]тиена, 1H-индазола, бензимидазола, бензотиазола, пурина, хинолина, изохинолина, циннолина, фтазина, хиназолина, хиноксалина, 1,8-нафтиридина, птеридина, карбазола, акридина, феназина, фенотиазина, феноксазина, индена, нафта, азулина или антрацена.

109. Соединение по п.104, где каждый B₁ независимо выбирают из необязательно замещенного C6-C10арила.

110. Соединение по п.104, где каждый B₁ независимо представляет собой необязательно замещенный фенил или нафтил.

111. Соединение по п.104, где каждый B₁ представляет собой незамещенный фенил.

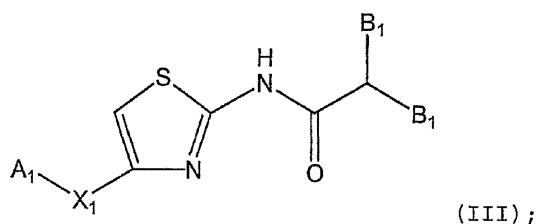
112. Соединение по п.104, где каждый B₁ независимо выбирают из необязательно замещенного C5-C12гетероарила.

113. Соединение по п.112, где каждый B₁ представляет собой независимо и необязательно замещенный C5-C7гетероарил.

114. Соединение по п.113, где каждый B₁ независимо выбирают из необязательно замещенного пиразола или имидазола.

115. Соединение по п.104, где B₁ выбирают из необязательно замещенного азиридина, оксирана, трирана, пирролидина, тетрагидрофурана, тетрагидротииена, диоксалина, пирролина, пирана, пиразолина, пиразолидина, пиперидина, 1,4-диоксалина, морфолина, 1,4-дитиана, тиоморфолина, пиперазина, 3H-индола или индолина.

116. Соединение формулы (III)



или его фармацевтически приемлемая соль;

где X₁ представляет собой связь, O, S, CF₂, CHOR, C(O), C(O)O, CH₂ или NR;

R представляет собой H или R²;

A_1 представляет собой (C2-C10)алифатическую группу, арил, гетероарил, гетероциклил или циклоалкил;

каждый B_1 независимо выбирают из 3-7-членного моноциклического, насыщенного, ненасыщенного или ароматического кольца, содержащего 0-4 гетероатома, выбранных из N, NH, S или O;

где каждый A_1 необязательно замещен до 4 заместителями, независимо выбранными из R^1 , R^2 , R^3 , R^4 или R^5 ;

R^1 представляет собой R^6 или ((C1-C4)алифатическая группа) $_n$ -Y;

n равно 0 или 1;

Y представляет собой галоген, CN, NO₂, CF₃, OCF₃, OH, SR⁶, S(O)R⁶, SO₂R⁶, NH₂, NHR⁶, N(R⁶)₂, NR⁶R⁸, N(R⁸)₂, COOH, COOR⁶ или OR⁶;

или два R^1 на соседних атомах кольца, взятые вместе, образуют 1,2-метилендиокси или 1,2-этилендиокси;

R^2 представляет собой алифатическую группу, где каждый R^2 необязательно содержит до 2 заместителей, независимо выбранных из R^1 , R^4 или R^5 ;

R^3 представляет собой циклоалифатическое, арильное, гетероциклическое или гетероарильное кольцо, необязательно содержащие до 3 заместителей, независимо выбранных из R^1 , R^2 , R^4 или R^5 ;

R^4 представляет собой OR⁵, OR⁶, OC(O)R⁶, OC(O)R⁵, OC(O)OR⁶, OC(O)OR⁵, OC(O)N(R⁶)₂, OC(O)N(R⁵)₂, OC(O)N(R⁶R⁵), SR⁶, SR⁵, S(O)R⁶, S(O)R⁵, SO₂R⁶, SO₂R⁵, SO₂N(R⁶)₂, SO₂N(R⁵)₂, SO₂NR⁵R⁶, SO₃R⁶, SO₃R⁵, C(O)R⁵, C(O)OR⁵, C(O)R⁶, C(O)OR⁶, C(O)N(R⁶)₂, C(O)N(R⁵)₂, C(O)N(R⁵R⁶), C(O)N(OR⁶)R⁶, C(O)N(OR⁵)R⁶, C(O)N(OR⁶)R⁵, C(O)N(OR⁵)R⁵, C(NOR⁶)R⁶, C(NOR⁶)R⁵, C(NOR⁵)R⁶, C(NOR⁵)R⁵, N(R⁶)₂, N(R⁵)₂, N(R⁵R⁶), NR⁵C(O)R⁵, NR⁶C(O)R⁶, NR⁶C(O)R⁵, NR⁵C(O)R⁶, NR⁶C(O)OR⁶, NR⁵C(O)OR⁶, NR⁶C(O)OR⁵, NR⁵C(O)OR⁵, NR⁶C(O)N(R⁶)₂, NR⁶C(O)NR⁵R⁶, NR⁶C(O)N(R⁵)₂, NR⁵C(O)N(R⁶)₂, NR⁵C(O)NR⁵R⁶, NR⁵C(O)N(R⁵)₂, NR⁶SO₂R⁶, NR⁶SO₂R⁵, NR⁵SO₂R⁵, NR⁵SO₂R⁶, NR⁶SO₂N(R⁶)₂, NR⁶SO₂NR⁵R⁶, NR⁶SO₂N(R⁵)₂, NR⁵SO₂N(R⁶)₂, NR⁵SO₂NR⁵R⁶, NR⁵SO₂N(R⁵)₂, N(OR⁶)R⁶, N(OR⁶)R⁵, N(OR⁵)R⁵ или N(OR⁵)R⁶;

R^5 представляет собой циклоалифатическое, арильное, гетероциклическое или гетероарильное кольцо, необязательно содержащие до 3 заместителей R^1 ;

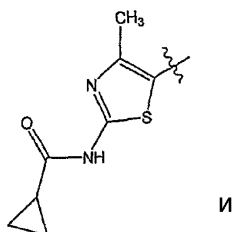
R^6 представляет собой H или алифатическую группу, где R^6 необязательно содержит заместитель R^7 ;

R^7 представляет собой циклоалифатическое, арильное, гетероциклическое или гетероарильное кольцо, и каждый R^7 необязательно содержит до 2 заместителей, независимо выбранных из H, прямого или разветвленного (C₁-C₆)алкила, прямого или разветвленного (C₂-C₆)алкенила или алкинила, 1,2-метилендиокси, 1,2-этилендиокси или (CH₂)_n-Z;

Z выбирают из галогена, CN, NO₂, CF₃, OCF₃, OH, S-алифатической группы, S(O)-алифатической группы, SO₂-алифатической группы, NH₂, NH-алифатической группы, N(алифатическая группа)₂, N(алифатическая группа)R⁸, NHR⁸, N(R⁸)₂, COOH, C(O)O-алифатической группы или O-алифатической группы; и

R^8 представляет собой аминозащитную группу, при условии, что

(i) когда X_1 представляет собой связь, один B_1 представляет собой фенил и другой B_1 представляет собой N-пиперидил, тогда A не является



ii) когда X_1 представляет собой связь, тогда A_1 не является обязательно замещенным 6-членным гетероарильным кольцом с 1-3 кольцевыми атомами азота.

117. Соединение по п.116, где X_1 представляет собой связь, CH_2 , $CHOR$, $C(O)$, $C(O)O$, CF_2 или O .

118. Соединение по п.116, где X_1 представляет собой связь, CH_2 , $CHOR$, $C(O)$, $C(O)O$.

119. Соединение по п.116, где A_1 представляет собой обязательно замещенную (C1-C10)алифатическую группу.

120. Соединение по п.119, где A_1 представляет собой обязательно замещенный метил, этил, пропил, бутил, пентил или гексил.

121. Соединение по п.116, где A_1 представляет собой обязательно замещенное C6-C10арильное кольцо.

122. Соединение по п.121, где A_1 представляет собой обязательно замещенный фенил или нафтил.

123. Соединение по п.116, где A_1 представляет собой обязательно замещенное C5-C12гетероарильное кольцо.

124. Соединение по п.123, где A_1 представляет собой пиридинил.

125. Соединение по п.116, где каждый B_1 независимо выбирают из обязательно замещенного C6-C10арила.

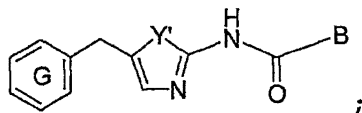
126. Соединение по п.125, где каждый B_1 независимо представляет собой обязательно замещенный фенил или нафтил.

127. Соединение по п.126, где каждый B_1 представляет собой незамещенный фенил.

128. Соединение по п.116, где каждый B_1 независимо представляет собой обязательно замещенное 3-12-членное гетероциклическое кольцо, содержащее до 4 гетероатомов, выбранных из O , S или NR .

129. Соединение по п.128, где каждый B_1 независимо выбирают из обязательно замещенного азиридина, оксирана, трирана, пирролидинила, тетрагидрофуранила, тетрагидротиенила, диоксаланила, пирролинила, пиранила, пиразолинила, пиразолидинила, пиперидинила, 1,4-диоксанила, морфолинила, 1,4-дитианила, тиоморфолинила, пиперазинила, 3H-индолила или индолинила.

130. Соединение формулы IIA



IIA

или его фармацевтически приемлемая соль;

где Y' представляет собой O или S ;

B представляет собой 3-8-членное, насыщенное, моноциклическое, кольцо, содержащее 0-4 гетероатома, выбранных из O , S или N ; и

кольца G и B обязательно замещены до четырех заместителями, независимо выбранными из R^1 , R^2 , R^3 , R^4 или R^5 ;

R^1 представляет собой оксо, R^6 или ((C1-C4)алифатическая группа) $_n$ - Y ;

n равно 0 или 1;

Y представляет собой галоген, CN , NO_2 , CF_3 , OCF_3 , OH , SR^6 , $S(O)R^6$, SO_2R^6 , NH_2 , NHR^6 , $N(R^6)_2$, NR^6R^8 , $N(R^8)_2$, $COOH$, $COOR^6$ или OR^6 ;

или два R^1 на соседних атомах кольца, взятые вместе, образуют 1,2-метилендиокси или 1,2-этилендиокси;

R^2 представляет собой алифатическую группу, где каждый R^2 обязательно содержит до 2 заместителей, независимо выбранных из R^1 , R^4 или R^5 ;

R^3 представляет собой циклоалифатическое, арильное, гетероциклическое или гетероарильное кольцо, обязательно содержащие до 3 заместителей, независимо выбранных из R^1 , R^2 , R^4 или R^5 ;

R^4 представляет собой OR^5 , OR^6 , $OC(O)R^6$, $OC(O)R^5$, $OC(O)OR^6$, $OC(O)OR^5$, $OC(O)N(R^6)_2$, $OC(O)N(R^5)_2$, $OC(O)N(R^6R^5)$, SR^6 , SR^5 , $S(O)R^6$, $S(O)R^5$, SO_2R^6 , SO_2R^5 ,

$\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^6)_2$, $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^5)_2$, $\text{SO}_2\text{NR}^5\text{R}^6$, SO_3R^6 , SO_3R^5 , $\text{C}(\text{O})\text{R}^5$, $\text{C}(\text{O})\text{OR}^5$, $\text{C}(\text{O})\text{R}^6$, $\text{C}(\text{O})\text{OR}^6$, $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^6)_2$, $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^5)_2$, $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^5\text{R}^6)$, $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{OR}^6)\text{R}^6$, $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{OR}^5)\text{R}^6$, $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{OR}^6)\text{R}^5$, $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{OR}^5)\text{R}^5$, $\text{C}(\text{NOR}^6)\text{R}^6$, $\text{C}(\text{NOR}^6)\text{R}^5$, $\text{C}(\text{NOR}^5)\text{R}^6$, $\text{C}(\text{NOR}^5)\text{R}^5$, $\text{N}(\text{R}^6)_2$, $\text{N}(\text{R}^5)_2$, $\text{N}(\text{R}^5\text{R}^6)$, $\text{NR}^5\text{C}(\text{O})\text{R}^5$, $\text{NR}^6\text{C}(\text{O})\text{R}^6$, $\text{NR}^6\text{C}(\text{O})\text{R}^5$, $\text{NR}^5\text{C}(\text{O})\text{R}^6$, $\text{NR}^6\text{C}(\text{O})\text{OR}^6$, $\text{NR}^5\text{C}(\text{O})\text{OR}^6$, $\text{NR}^6\text{C}(\text{O})\text{OR}^5$, $\text{NR}^5\text{C}(\text{O})\text{OR}^5$, $\text{NR}^6\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^6)_2$, $\text{NR}^6\text{C}(\text{O})\text{NR}^5\text{R}^6$, $\text{NR}^6\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^5)_2$, $\text{NR}^5\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^6)_2$, $\text{NR}^5\text{C}(\text{O})\text{NR}^5\text{R}^6$, $\text{NR}^5\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^5)_2$, $\text{NR}^6\text{SO}_2\text{R}^6$, $\text{NR}^6\text{SO}_2\text{R}^5$, $\text{NR}^5\text{SO}_2\text{R}^5$, $\text{NR}^5\text{SO}_2\text{R}^6$, $\text{NR}^6\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^6)_2$, $\text{NR}^6\text{SO}_2\text{NR}^5\text{R}^6$, $\text{NR}^6\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^5)_2$, $\text{NR}^5\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^6)_2$, $\text{NR}^5\text{SO}_2\text{NR}^5\text{R}^6$, $\text{NR}^5\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^5)_2$, $\text{N}(\text{OR}^6)\text{R}^6$, $\text{N}(\text{OR}^6)\text{R}^5$, $\text{N}(\text{OR}^5)\text{R}^5$ или $\text{N}(\text{OR}^5)\text{R}^6$;

R^5 представляет собой циклоалифатическое, арильное, гетероциклическое или гетероарильное кольцо, необязательно содержащие до 3 заместителей R^1 ;

R^6 представляет собой H или алифатическую группу, где R^6 необязательно содержит заместитель R^7 ;

R^7 представляет собой циклоалифатическое, арильное, гетероциклическое или гетероарильное кольцо, и каждый R^7 необязательно содержит до 2 заместителей, независимо выбранных из H, прямого или разветвленного (C_1 - C_6)алкила, прямого или разветвленного (C_2 - C_6)алкенила или алкинила, 1,2-метилендиокси, 1,2-этилендиокси или $(\text{CH}_2)_n\text{-Z}$;

Z выбирают из галогена, CN, NO_2 , CF_3 , OCF_3 , OH, S-алифатической группы, S(O)-алифатической группы, SO_2 -алифатической группы, NH_2 , NH-алифатической группы, N(алифатическая группа) $_2$, N(алифатическая группа) R^8 , NHR^8 , $\text{N}(\text{R}^8)_2$, COOH, C(O)O-алифатической группы или O-алифатической группы; и

R^8 представляет собой амино блокирующую группу;

при условии, что, когда Y' представляет собой S и

а) когда В представляет собой циклогексил, тетрагидрофуран-2-ил или циклопропил, и кольцо G содержит 1-3 галогеновых заместителя, тогда кольцо G содержит по меньшей мере один дополнительный заместитель, отличающийся от галогена; и

б) когда В представляет собой тетрагидрофуран-2-ил, тогда кольцо G не является фенилом, трифторметилфенилом, метоксифенилом или толилом;

с) когда В представляет собой циклогексил, тогда кольцо G не является фенилом или трифторметилфенилом.

131. Соединение по п.130, где В представляет собой тетрагидрофуранил, пиперидил, морфолинил или тиоморфолинил.

132. Соединение по п.130, где В представляет собой C3-C8 насыщенное, карбоциклическое, моноциклическое кольцо.

133. Соединение по п.130, где В выбирают из циклопропила, цикlopентила, циклогексила или циклогептила.

134. Соединение по п.130, где кольцо G представляет собой фенил, необязательно замещенный до двух R^1 .

135. Соединение по п.134, где кольцо G необязательно замещено до двух заместителями, выбранными из галогена, циано, C1-C4алкила или O-(C1-C4алкила).

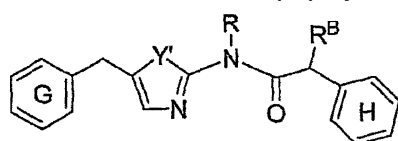
136. Соединение по п.135, где указанное соединение обладает одним или более из следующих признаков:

а) Y' представляет собой S;

б) кольцо G представляет собой галогензамещенный фенил;

с) В представляет собой фенил, необязательно замещенный галогеном, циано, C1-C4алкилом или O-(C1-C4алкилом).

137. Соединение формулы IIB



IIB;

или его фармацевтически приемлемая соль;

где Y' представляет собой S или O;

R представляет собой H, R² или R⁶;

R^B представляет собой C₁-C₆алифатическую группу или 3-7-членное моноциклическое или 8-14-членное бициклическое или трициклическое, насыщенное, ненасыщенное или ароматическое кольцо, содержащее 0-4 гетероатома в каждом кольце, где каждый указанный гетероатом независимо выбирают из N, NH, S или O;

где каждое кольцо G, кольцо H и R^B независимо и необязательно замещены до 4 заместителями, выбранными из R¹, R², R³, R⁴ или R⁵;

R¹ представляет собой оксо, R⁶ или ((C1-C4)алифатическая группа)_n-Y;

n равно 0 или 1;

Y представляет собой галоген, CN, NO₂, CF₃, OCF₃, OH, SR⁶, S(O)R⁶, SO₂R⁶, NH₂, NHR⁶, N(R⁶)₂, NR⁶R⁸, N(R⁸)₂, COOH, COOR⁶ или OR⁶;

или два R¹ на соседних атомах кольца, взятые вместе, образуют 1,2-метилендиокси или 1,2-этилендиокси;

R² представляет собой алифатическую группу, где каждый R² необязательно содержит до 2 заместителей, независимо выбранных из R¹, R⁴ или R⁵;

R³ представляет собой циклоалифатическое, арильное, гетероциклическое или гетероарильное кольцо, необязательно содержащее до 3 заместителей, независимо выбранных из R¹, R², R⁴ или R⁵;

R⁴ представляет собой OR⁵, OR⁶, OC(O)R⁶, OC(O)R⁵, OC(O)OR⁶, OC(O)OR⁵, OC(O)N(R⁶)₂, OC(O)N(R⁵)₂, OC(O)N(R⁶R⁵), SR⁶, SR⁵, S(O)R⁶, S(O)R⁵, SO₂R⁶, SO₂R⁵, SO₂N(R⁶)₂, SO₂N(R⁵)₂, SO₂NR⁵R⁶, SO₃R⁶, SO₃R⁵, C(O)R⁵, C(O)OR⁵, C(O)R⁶, C(O)OR⁶, C(O)N(R⁶)₂, C(O)N(R⁵)₂, C(O)N(R⁵R⁶), C(O)N(OR⁶)R⁶, C(O)N(OR⁵)R⁶, C(O)N(OR⁶)R⁵, C(O)N(OR⁵)R⁵, C(NOR⁶)R⁶, C(NOR⁶)R⁵, C(NOR⁵)R⁶, C(NOR⁵)R⁵, N(R⁶)₂, N(R⁵)₂, N(R⁵R⁶), NR⁵C(O)R⁵, NR⁶C(O)R⁶, NR⁶C(O)R⁵, NR⁵C(O)R⁶, NR⁶C(O)OR⁶, NR⁵C(O)OR⁶, NR⁶C(O)OR⁵, NR⁵C(O)OR⁵, NR⁶C(O)N(R⁶)₂, NR⁶C(O)NR⁵R⁶, NR⁶C(O)N(R⁵)₂, NR⁵C(O)N(R⁶)₂, NR⁵C(O)NR⁵R⁶, NR⁵C(O)N(R⁵)₂, NR⁶SO₂R⁶, NR⁶SO₂R⁵, NR⁵SO₂R⁵, NR⁵SO₂R⁶, NR⁶SO₂N(R⁶)₂, NR⁶SO₂NR⁵R⁶, NR⁶SO₂N(R⁵)₂, NR⁵SO₂N(R⁶)₂, NR⁵SO₂NR⁵R⁶, NR⁵SO₂N(R⁵)₂, N(OR⁶)R⁶, N(OR⁶)R⁵, N(OR⁵)R⁵ или N(OR⁵)R⁶;

R⁵ представляет собой циклоалифатическое, арильное, гетероциклическое или гетероарильное кольцо, необязательно содержащее до 3 заместителей R¹;

R⁶ представляет собой H или алифатическую группу, где R⁶ необязательно содержит заместитель R⁷;

R⁷ представляет собой циклоалифатическое, арильное, гетероциклическое или гетероарильное кольцо, и каждый R⁷ необязательно содержит до 2 заместителей, независимо выбранных из H, прямого или разветвленного (C₁-C₆)алкила, прямого или разветвленного (C₂-C₆)алкенила или алкинила, 1,2-метилендиокси, 1,2-этилендиокси или (CH₂)_n-Z;

Z выбирают из галогена, CN, NO₂, CF₃, OCF₃, OH, S-алифатической группы, S(O)-алифатической группы, SO₂-алифатической группы, NH₂, NH-алифатической группы, N(алифатическая группа)₂, N(алифатическая группа)R⁸, NHR⁸, N(R⁸)₂, COOH, C(O)O-алифатической группы или O-алифатической группы; и

R⁸ представляет собой амино блокирующую группу;

при условии, что, когда Y представляет собой S, и

а) когда R^B представляет собой водород, и кольцо G и кольцо H оба содержат 1-3 галоген заместителя, тогда по меньшей мере одно из колец G и кольцо H содержат дополнительный заместитель, отличающийся от галогена;

б) когда R^B представляет собой водород, и кольцо H представляет собой незамещенный фенил, тогда кольцо G не является фенилом или фенилом, замещенным метилом, CF₃, -OMe, NO₂ или 1-3 галогенами;

с) когда R^B представляет собой водород, и кольцо H представляет собой фенил, замещенный метилом, 1-2 метокси или 1-2 галогеновыми заместителями, тогда кольцо G

не является фенилом, замещенным CF₃ или 1-2 галогенами;

д) когда R^B представляет собой метил, и кольцо H фенил, замещенный бутилом, тогда кольцо G не является фенилом, замещенным метилом или 1-2 галогенами; и

е) когда R^B и кольцо H метил, оба представляют собой незамещенный фенил, тогда кольцо G не представляет незамещенный фенил или фенил, замещенный метилом, CF₃, OMe, NO₂ или 1-2 галогенами.

138. Соединение по п.137, где кольцо G представляет собой фенил, необязательно замещенный до двух R¹.

139. Соединение по п.138, где R¹ выбирают из C1-C4алкила, O-(C1-C4алкила), галогена или циано.

140. Соединение по п.137, R^B представляет собой C1-балифатическую группу, необязательно замещенную до 4 заместителями, выбранными из R¹, R², R³, R⁴ или R⁵.

141. Соединение по п.140, R^B представляет собой C1-C4алкил, необязательно замещенный до 2 заместителями, выбранными из R¹.

142. Соединение по п.141, где R^B выбирают из метила, этила, н-пропила, изопропила, втор-бутила, н-бутила или трет-бутила.

143. Соединение по п.137, где R^B представляет собой 3-7-членное моноциклическое насыщенное, ненасыщенное или ароматическое кольцо, содержащее 0-4 гетероатома, необязательно замещенное до 4 заместителями, выбранными из R¹, R², R³, R⁴ или R⁵.

144. Соединение по п.143, где R^B представляет собой 3-7-членное моноциклическое насыщенное, карбоциклическое кольцо, необязательно замещенное до 2 заместителями, выбранными из R¹.

145. Соединение по п.144, где R^B выбирают из циклопропила, цикlopентила, циклогексила или циклогептила.

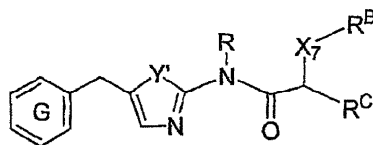
146. Соединение по п.143, где R^B представляет собой 3-7-членное моноциклическое насыщенное, ненасыщенное или ароматическое кольцо, содержащее 1-3 гетероатома, необязательно замещенное до 4 заместителями, выбранными из R¹, R², R³, R⁴ или R⁵.

147. Соединение по п.143, где R^B представляет собой 3-7-членное моноциклическое насыщенное кольцо, содержащее 1-3 гетероатома, необязательно замещенное до 2 заместителями, выбранными из R¹.

148. Соединение по п.147, где R^B выбирают из пиперидинила, морфолинила или тиоморфолинила.

149. Соединение по п.137, где R^B представляет собой 8-14-членное бициклическое или трициклическое, насыщенное, ненасыщенное или ароматическое кольцо, содержащее 0-4 гетероатома в каждом кольце, где каждый указанный гетероатом независимо выбирают из N, NH, S или O, необязательно замещенное до 4 заместителями, выбранными из R¹, R², R³, R⁴ или R⁵.

150. Соединение формулы IIC



IIC;

где Y' представляет собой O или S;

X₇ представляет собой O, S или NR';

R' представляет собой водород, R² или R⁶;

R представляет собой водород, R² или R⁶;

R^B представляет собой C1-балифатическую группу или 3-7-членное моноциклическое или 8-14-членное бициклическое или трициклическое, насыщенное, ненасыщенное или ароматическое кольцо, содержащее 0-4 гетероатома в каждом кольце, где каждый указанный гетероатом независимо выбирают из N, NH, S или O;

R^C представляет собой C1-C6алифатическую группу;

где каждое из колец G , R^B и R^C независимо и необязательно замещено до 4 заместителями, выбранными из R^1 , R^2 , R^3 , R^4 или R^5 ;

R^1 представляет собой оксо, R^6 или $((C1-C4)\text{алифатическая группа})_n-Y$;

n равно 0 или 1;

Y представляет собой галоген, CN , NO_2 , CF_3 , OCF_3 , OH , SR^6 , $S(O)R^6$, SO_2R^6 , NH_2 , NHR^6 , $N(R^6)_2$, NR^6R^8 , $N(R^8)_2$, $COOH$, $COOR^6$ или OR^6 ;

или два R^1 на соседних атомах кольца, взятые вместе, образуют 1,2-метилендиокси или 1,2-этилендиокси;

R^2 представляет собой алифатическую группу, где каждый R^2 необязательно содержит до 2 заместителей, независимо выбранных из R^1 , R^4 или R^5 ;

R^3 представляет собой циклоалифатическое, арильное, гетероциклическое или гетероарильное кольцо, необязательно содержащие до 3 заместителей, независимо выбранных из R^1 , R^2 , R^4 или R^5 ;

R^4 представляет собой OR^5 , OR^6 , $OC(O)R^6$, $OC(O)R^5$, $OC(O)OR^6$, $OC(O)OR^5$, $OC(O)N(R^6)_2$, $OC(O)N(R^5)_2$, $OC(O)N(R^6R^5)$, SR^6 , SR^5 , $S(O)R^6$, $S(O)R^5$, SO_2R^6 , SO_2R^5 , $SO_2N(R^6)_2$, $SO_2N(R^5)_2$, $SO_2NR^5R^6$, SO_3R^6 , SO_3R^5 , $C(O)R^5$, $C(O)OR^5$, $C(O)R^6$, $C(O)OR^6$, $C(O)N(R^6)_2$, $C(O)N(R^5)_2$, $C(O)N(R^5R^6)$, $C(O)N(OR^6)R^6$, $C(O)N(OR^5)R^6$, $C(O)N(OR^6)R^5$, $C(O)N(OR^5)R^5$, $C(NOR^6)R^6$, $C(NOR^6)R^5$, $C(NOR^5)R^6$, $C(NOR^5)R^5$, $N(R^6)_2$, $N(R^5)_2$, $N(R^5R^6)$, $NR^5C(O)R^5$, $NR^6C(O)R^6$, $NR^6C(O)R^5$, $NR^5C(O)R^6$, $NR^6C(O)OR^6$, $NR^5C(O)OR^6$, $NR^6C(O)OR^5$, $NR^5C(O)OR^5$, $NR^6C(O)N(R^6)_2$, $NR^6C(O)NR^5R^6$, $NR^6C(O)N(R^5)_2$, $NR^5C(O)N(R^6)_2$, $NR^5C(O)NR^5R^6$, $NR^5C(O)N(R^5)_2$, $NR^6SO_2R^6$, $NR^6SO_2R^5$, $NR^5SO_2R^5$, $NR^5SO_2R^6$, $NR^6SO_2N(R^6)_2$, $NR^6SO_2NR^5R^6$, $NR^6SO_2N(R^5)_2$, $NR^5SO_2N(R^6)_2$, $NR^5SO_2NR^5R^6$, $NR^5SO_2N(R^5)_2$, $N(OR^6)R^6$, $N(OR^6)R^5$, $N(OR^5)R^5$ или $N(OR^5)R^6$;

R^5 представляет собой циклоалифатическое, арильное, гетероциклическое или гетероарильное кольцо, необязательно содержащие до 3 заместителей R^1 ;

R^6 представляет собой H или алифатическую группу, где R^6 необязательно содержит заместитель R^7 ;

R^7 представляет собой циклоалифатическое, арильное, гетероциклическое или гетероарильное кольцо, и каждый R^7 необязательно содержит до 2 заместителей, независимо выбранных из H , прямого или разветвленного (C_1-C_6)алкила, прямого или разветвленного (C_2-C_6)алкенила или алкинила, 1,2-метилендиокси, 1,2-этилендиокси или $(CH_2)_n-Z$;

Z выбирают из галогена, CN , NO_2 , CF_3 , OCF_3 , OH , S -алифатической группы, $S(O)$ -алифатической группы, SO_2 -алифатической группы, NH_2 , NH -алифатической группы, $N(\text{алифатическая группа})_2$, $N(\text{алифатическая группа})R^8$, NHR^8 , $N(R^8)_2$, $COOH$, $C(O)$ -алифатической группы или O -алифатической группы; и

R^8 представляет собой амино блокирующую группу.

151. Соединение по п.150, где X_7 представляет собой O .

152. Соединение по п.150, где X_7 представляет собой S .

153. Соединение по п.150, где X_7 представляет собой NR^1 .

154. Соединение по п.150, где R^C представляет собой $C1$ - $C6$ алкил, необязательно замещенный до двух заместителями, выбранными из R^1 , R^2 , R^3 , R^4 или R^5 .

155. Соединение по п.154, где R^C представляет собой $C1$ - $C6$ алкил.

156. Соединение по п.155, где R^C выбирают из метила, этила, изопропила, n -пропила, n -бутила, втор-бутила или трет-бутила.

157. Соединение по п.150, где R^B представляет собой фенил, необязательно замещенный до двух заместителями R^1 .

158. Соединение по п.157, где R^B представляет собой фенил.

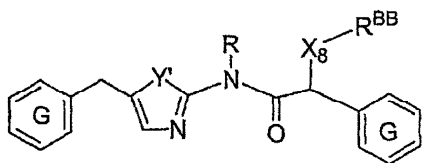
159. Соединение по п.150, где R^B выбирают из метила, этила, изопропила, n -пропила, n -бутила, втор-бутила или трет-бутила.

160. Соединение по п.150, где указанное соединение обладает одним или более из

следующих признаков:

- а) кольцо G необязательно замещено одним заместителем;
- б) Y' представляет собой S и R представляет собой водород;
- с) R^C представляет собой C1-C4алкил;
- д) X₇ представляет собой NH или NR', где R' представляет собой C1-C4алкил; и
- е) R^B представляет собой C1-C4алкил.

161. Соединение формулы IID



IID;

где Y' представляет собой O или S;

R представляет собой водород или R²;

X₈ представляет собой O, S или NR';

R' представляет собой водород, R² или R⁶;

R^{BB} представляет собой C1-балифатическую группу или 3-7-членное моноциклическое или 8-14-членное бициклическое или трициклическое, насыщенное, ненасыщенное или ароматическое кольцо, содержащее 0-4 гетероатома в каждом кольце, где каждый указанный гетероатом независимо выбирают из N, S или O;

где каждое из колец G и R^{BB} независимо и необязательно замещено до 4 заместителями, выбранными из R¹, R², R³, R⁴ или R⁵;

R¹ представляет собой оксо, R⁶ или ((C1-C4)алифатическая группа)_n-Y;

n равно 0 или 1;

Y представляет собой галоген, CN, NO₂, CF₃, OCF₃, OH, SR⁶, S(O)R⁶, SO₂R⁶, NH₂, NHR⁶, N(R⁶)₂, NR⁶R⁸, N(R⁸)₂, COOH, COOR⁶ или OR⁶;

или два R¹ на соседних атомах кольца, взятые вместе, образуют 1,2-метилендиокси или 1,2-этилендиокси;

R² представляет собой алифатическую группу, где каждый R² необязательно содержит до 2 заместителей, независимо выбранных из R¹, R⁴ или R⁵;

R³ представляет собой циклоалифатическое, арильное, гетероциклическое или гетероарильное кольцо, необязательно содержащие до 3 заместителей, независимо выбранных из R¹, R², R⁴ или R⁵;

R⁴ представляет собой OR⁵, OR⁶, OC(O)R⁶, OC(O)R⁵, OC(O)OR⁶, OC(O)OR⁵, OC(O)N(R⁶)₂, OC(O)N(R⁵)₂, OC(O)N(R⁶R⁵), SR⁶, SR⁵, S(O)R⁶, S(O)R⁵, SO₂R⁶, SO₂R⁵, SO₂N(R⁶)₂, SO₂N(R⁵)₂, SO₂NR⁵R⁶, SO₃R⁶, SO₃R⁵, C(O)R⁵, C(O)OR⁵, C(O)R⁶, C(O)OR⁶, C(O)N(R⁶)₂, C(O)N(R⁵)₂, C(O)N(R⁵R⁶), C(O)N(OR⁶)R⁶, C(O)N(OR⁵)R⁶, C(O)N(OR⁶)R⁵, C(O)N(OR⁵)R⁵, C(NOR⁶)R⁶, C(NOR⁶)R⁵, C(NOR⁵)R⁶, C(NOR⁵)R⁵, N(R⁶)₂, N(R⁵)₂, N(R⁵R⁶), NR⁵C(O)R⁵, NR⁶C(O)R⁶, NR⁶C(O)R⁵, NR⁵C(O)R⁶, NR⁶C(O)OR⁶, NR⁵C(O)OR⁶, NR⁶C(O)OR⁵, NR⁵C(O)OR⁵, NR⁶C(O)N(R⁶)₂, NR⁶C(O)NR⁵R⁶, NR⁶C(O)N(R⁵)₂, NR⁵C(O)N(R⁶)₂, NR⁵C(O)NR⁵R⁶, NR⁵C(O)N(R⁵)₂, NR⁶SO₂R⁶, NR⁶SO₂R⁵, NR⁵SO₂R⁵, NR⁵SO₂R⁶, NR⁶SO₂N(R⁶)₂, NR⁶SO₂NR⁵R⁶, NR⁶SO₂N(R⁵)₂, NR⁵SO₂N(R⁶)₂, NR⁵SO₂NR⁵R⁶, NR⁵SO₂N(R⁵)₂, N(OR⁶)R⁶, N(OR⁶)R⁵, N(OR⁵)R⁵ или N(OR⁵)R⁶;

R⁵ представляет собой циклоалифатическое, арильное, гетероциклическое или гетероарильное кольцо, необязательно содержащие до 3 заместителей R¹;

R⁶ представляет собой H или алифатическую группу, где R⁶ необязательно содержит заместитель R⁷;

R⁷ представляет собой циклоалифатическое, арильное, гетероциклическое или гетероарильное кольцо, и каждый R⁷ необязательно содержит до 2 заместителей, независимо выбранных из H, прямого или разветвленного (C₁-C₆)алкила, прямого или

разветвленного (C₂-C₆)алкенила или алкинила, 1,2-метилендиокси, 1,2-этилендиокси или (CH₂)_n-Z;

Z выбирают из галогена CN, O₂, CF₃, OCF₃, OH, S-алифатической группы, S(O)-алифатической группы, SO₂-алифатической группы, NH₂, NH-(алифатическая группа), N(алифатическая группа)₂, N(алифатическая группа)R⁸, NHR⁸, N(R⁸)₂, COOH, C(O)O-алифатической группы или O-алифатической группы; и

R⁸ представляет собой амино блокирующую группу.

162. Соединение по п.161, где X₈ представляет собой O.

163. Соединение по п.161, где X₈ представляет собой S.

164. Соединение по п.161, где X₈ представляет собой NR'.

165. Соединение по п.161, где R^{BB} представляет собой фенил, необязательно замещенный до двух заместителями R¹.

166. Соединение по п.161, где R^{BB} представляет собой фенил.

167. Соединение по п.161, где R^{BB} выбирают из метила, этила, изопропила, н-пропила, н-бутила, втор-бутила или трет-бутила.

168. Соединение по п.161, где R^{BB} представляет собой необязательно замещенный C3-C8циклоалкил.

169. Соединение по п.168, где R^{BB} выбирают из циклопропила, цикlopентила или циклогексила.

170. Соединение по п.161, где R^{BB} представляет собой необязательно замещенный бензил.

171. Соединение по п.161, где указанное соединение обладает одним или более из следующих признаков:

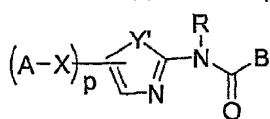
a) Y' представляет собой S и R представляет собой водород;

b) каждое кольцо G представляет собой незамещенный фенил;

d) X₈ представляет собой NR', и R' представляет собой водород или C1-C4алкил; и

e) R^{BB} представляет собой C1-C4алкил, бензил, цикlopентил или циклогексил.

172. Соединение формулы IV



IV;

или его фармацевтически приемлемая соль;

где Y' представляет собой O, S или NR;

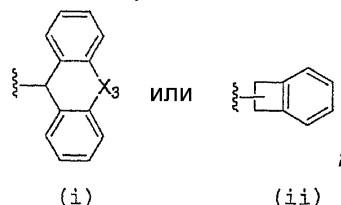
p равно 0-2;

X представляет собой связь, O, S, S(O), S(O)₂, CF₂, CH₂, -CHOR-, -C(O)-, -O-C(O)-, -C(O)-O-, -C(O)-NR-, -NR-C(O)-, -NR-C(O)-O-, -O-C(O)-NR-, -NR-C(O)-NR- или NR;

R представляет собой H, R² или R⁶;

A представляет собой алифатическую группу, арил, гетероарил, гетероцикл или циклоалкил;

B выбирают из



где X₃ представляет собой O или S;

где A и B каждый независимо и необязательно замещен до 4 заместителями выбранными из R¹, R², R³, R⁴ или R⁵;

R¹ представляет собой оксо, R⁶ или ((C1-C4)алифатическая группа)_n-Y;

n равно 0 или 1;

Y представляет собой галоген, CN, NO₂, CF₃, OCF₃, OH, SR⁶, S(O)R⁶, SO₂R⁶, NH₂,

NHR^6 , $\text{N(R}^6)_2$, NR^6R^8 , $\text{N(R}^8)_2$, COOH , COOR^6 или OR^6 ;

или два R^1 на соседних атомах кольца, взятые вместе, образуют 1,2-метилендиокси или 1,2-этилендиокси;

R^2 представляет собой алифатическую группу, где каждый R^2 необязательно содержит до 2 заместителей, независимо выбранных из R^1 , R^4 или R^5 ;

R^3 представляет собой циклоалифатическое, арильное, гетероциклическое или гетероарильное кольцо, необязательно содержащие до 3 заместителей, независимо выбранных из R^1 , R^2 , R^4 или R^5 ;

R^4 представляет собой OR^5 , OR^6 , OC(O)R^6 , OC(O)R^5 , OC(O)OR^6 , OC(O)OR^5 , $\text{OC(O)N(R}^6)_2$, $\text{OC(O)N(R}^5)_2$, $\text{OC(O)N(R}^6\text{R}^5)$, SR^6 , SR^5 , S(O)R^6 , S(O)R^5 , SO_2R^6 , SO_2R^5 , $\text{SO}_2\text{N(R}^6)_2$, $\text{SO}_2\text{N(R}^5)_2$, $\text{SO}_2\text{NR}^5\text{R}^6$, SO_3R^6 , SO_3R^5 , C(O)R^5 , C(O)OR^5 , C(O)R^6 , C(O)OR^6 , $\text{C(O)N(R}^6)_2$, $\text{C(O)N(R}^5)_2$, $\text{C(O)N(R}^5\text{R}^6)$, $\text{C(O)N(OR}^6)_2$, $\text{C(O)N(OR}^5)_2$, $\text{C(O)N(OR}^6)_2$, $\text{C(O)N(OR}^5)_2$, $\text{C(O)N(OR}^6)_2$, $\text{C(O)N(OR}^5)_2$, $\text{C(NOR}^6)_2$, $\text{C(NOR}^5)_2$, $\text{C(NOR}^6)_2$, $\text{C(NOR}^5)_2$, $\text{N(R}^6)_2$, $\text{N(R}^5)_2$, $\text{N(R}^5\text{R}^6)$, $\text{NR}^5\text{C(O)R}^5$, $\text{NR}^6\text{C(O)R}^6$, $\text{NR}^6\text{C(O)R}^5$, $\text{NR}^5\text{C(O)R}^6$, $\text{NR}^6\text{C(O)OR}^6$, $\text{NR}^5\text{C(O)OR}^6$, $\text{NR}^6\text{C(O)OR}^5$, $\text{NR}^5\text{C(O)OR}^5$, $\text{NR}^6\text{C(O)N(R}^6)_2$, $\text{NR}^6\text{C(O)NR}^5\text{R}^6$, $\text{NR}^6\text{C(O)N(R}^5)_2$, $\text{NR}^5\text{C(O)N(R}^6)_2$, $\text{NR}^5\text{C(O)NR}^5\text{R}^6$, $\text{NR}^5\text{C(O)N(R}^5)_2$, $\text{NR}^6\text{SO}_2\text{R}^6$, $\text{NR}^6\text{SO}_2\text{R}^5$, $\text{NR}^5\text{SO}_2\text{R}^5$, $\text{NR}^5\text{SO}_2\text{R}^6$, $\text{NR}^6\text{SO}_2\text{N(R}^6)_2$, $\text{NR}^6\text{SO}_2\text{NR}^5\text{R}^6$, $\text{NR}^6\text{SO}_2\text{N(R}^5)_2$, $\text{NR}^5\text{SO}_2\text{N(R}^6)_2$, $\text{NR}^5\text{SO}_2\text{NR}^5\text{R}^6$, $\text{NR}^5\text{SO}_2\text{N(R}^5)_2$, $\text{N(OR}^6)_2$, $\text{N(OR}^6)_2$, $\text{N(OR}^5)_2$ или $\text{N(OR}^5)_2$;

R^5 представляет собой циклоалифатическое, арильное, гетероциклическое или гетероарильное кольцо, необязательно содержащие до 3 заместителей R^1 ;

R^6 представляет собой H или алифатическую группу, где R^6 необязательно содержит заместитель R^7 ;

R^7 представляет собой циклоалифатическое, арильное, гетероциклическое или гетероарильное кольцо, и каждый R^7 необязательно содержит до 2 заместителей, независимо выбранных из H , прямого или разветвленного ($\text{C}_1\text{-C}_6$) алкила, прямого или разветвленного ($\text{C}_2\text{-C}_6$) алкенила или алкинила, 1,2-метилендиокси, 1,2-этилендиокси или $(\text{CH}_2)_n\text{-Z}$;

Z выбирают из галогена, CN , NO_2 , CF_3 , OCF_3 , OH , S -алифатической группы, S(O) -алифатической группы, SO_2 -алифатической группы, NH_2 , NH -алифатической группы, $\text{N(алифатическая группа)}_2$, $\text{N(алифатическая группа)R}^8$, NHR^8 , $\text{N(R}^8)_2$, COOH , C(O)O -алифатической группы или O -алифатической группы; и

R^8 представляет собой амино блокирующую группу.

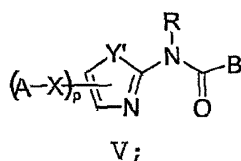
173. Соединение по п.172, где X_3 представляет собой O .

174. Соединение по п.172, где R представляет собой водород.

175. Соединение по п.172, где Y' представляет собой S .

176. Соединение по п.172, где Y' представляет собой O .

177. Соединение формулы V



или его фармацевтически приемлемая соль;

где Y' представляет собой O или S ;

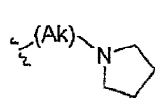
p равно 0-2;

X представляет собой связь, O , S , S(O) , S(O)_2 , CF_2 , CH_2 , -CHOR- , -C(O)- , -O-C(O)- , -C(O)-O- , -C(O)-NR- , -NR-C(O)- , -NR-C(O)-O- , -O-C(O)-NR- , -NR-C(O)-NR- или NR ;

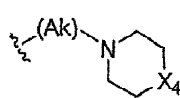
R представляет собой H , R^2 или R^6 ;

A представляет собой алифатическую группу, арил, гетероарил, гетероцикл или циклоалкил;

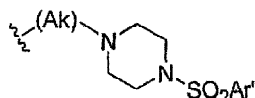
B выбирают из



(i)



(ii)



(iii);

где Ak представляет собой C1-С6алкилиден;

X₄ представляет собой CH₂, O или S;

Ar' представляет собой фенил, необязательно замещенный до двух R¹;

В необязательно замещен до двух R¹;

где A независимо и необязательно замещен до 4 заместителями, выбранными из R¹, R², R³, R⁴ или R⁵;

R¹ представляет собой оксо, R⁶ или ((C1-C4)алифатическая группа)_n-Y;

n равно 0 или 1;

Y представляет собой галоген, CN, NO₂, CF₃, OCF₃, OH, SR⁶, S(O)R⁶, SO₂R⁶, NH₂, NHR⁶, N(R⁶)₂, NR⁶R⁸, N(R⁸)₂, COOH, COOR⁶ или OR⁶;

или два R¹ на соседних атомах кольца, взятые вместе, образуют 1,2-метилендиокси или 1,2-этилендиокси;

R² представляет собой алифатическую группу, где каждый R² необязательно содержит до 2 заместителей, независимо выбранных из R¹, R⁴ или R⁵;

R³ представляет собой циклоалифатическое, арильное, гетероциклическое или гетероарильное кольцо, необязательно содержащие до 3 заместителей, независимо выбранных из R¹, R², R⁴ или R⁵;

R⁴ представляет собой OR⁵, OR⁶, OC(O)R⁶, OC(O)R⁵, OC(O)OR⁶, OC(O)OR⁵, OC(O)N(R⁶)₂, OC(O)N(R⁵)₂, OC(O)N(R⁶R⁵), SR⁶, SR⁵, S(O)R⁶, S(O)R⁵, SO₂R⁶, SO₂R⁵, SO₂N(R⁶)₂, SO₂N(R⁵)₂, SO₂NR⁵R⁶, SO₃R⁶, SO₃R⁵, C(O)R⁵, C(O)OR⁵, C(O)R⁶, C(O)OR⁶, C(O)N(R⁶)₂, C(O)N(R⁵)₂, C(O)N(R⁵R⁶), C(O)N(OR⁶)R⁶, C(O)N(OR⁵)R⁶, C(O)N(OR⁶)R⁵, C(O)N(OR⁵)R⁵, C(NOR⁶)R⁶, C(NOR⁶)R⁵, C(NOR⁵)R⁶, C(NOR⁵)R⁵, N(R⁶)₂, N(R⁵)₂, N(R⁵R⁶), NR⁵C(O)R⁵, NR⁶C(O)R⁶, NR⁶C(O)R⁵, NR⁵C(O)R⁶, NR⁶C(O)OR⁶, NR⁵C(O)OR⁶, NR⁶C(O)OR⁵, NR⁵C(O)OR⁵, NR⁶C(O)N(R⁶)₂, NR⁶C(O)NR⁵R⁶, NR⁶C(O)N(R⁵)₂, NR⁵C(O)N(R⁶)₂, NR⁵C(O)NR⁵R⁶, NR⁵C(O)N(R⁵)₂, NR⁶SO₂R⁶, NR⁶SO₂R⁵, NR⁵SO₂R⁵, NR⁵SO₂R⁶, NR⁶SO₂N(R⁶)₂, NR⁶SO₂NR⁵R⁶, NR⁶SO₂N(R⁵)₂, NR⁵SO₂N(R⁶)₂, NR⁵SO₂NR⁵R⁶, NR⁵SO₂N(R⁵)₂, N(OR⁶)R⁶, N(OR⁶)R⁵, N(OR⁵)R⁵ или N(OR⁵)R⁶;

R⁵ представляет собой циклоалифатическое, арильное, гетероциклическое или гетероарильное кольцо, необязательно содержащие до 3 заместителей R¹;

R⁶ представляет собой H или алифатическую группу, где R⁶ необязательно содержит заместитель R⁷;

R⁷ представляет собой циклоалифатическое, арильное, гетероциклическое или гетероарильное кольцо, и каждый R⁷ необязательно содержит до 2 заместителей, независимо выбранных из H, прямого или разветвленного (C₁-C₆)алкила, прямого или разветвленного (C₂-C₆)алкенила или алкинила, 1,2-метилендиокси, 1,2-этилендиокси или (CH₂)_n-Z;

Z выбирают из галогена, CN, NO₂, CF₃, OCF₃, OH, S-алифатической группы, S(O)-алифатической группы, SO₂-алифатической группы, NH₂, NH-алифатической группы, N(алифатическая группа)₂, N(алифатическая группа)R⁸, NHR⁸, N(R⁸)₂, COOH, C(O)O-алифатической группы или O-алифатической группы; и

R⁸ представляет собой амино блокирующую группу.

178. Соединение по п.177, где Ak выбирают из CH₂, CH(CH₃), C(CH₃)₂, CH(Et), C(Et)₂, CH(н-пропила), CH(изо-Pr), CH(н-бутила), CH(бут-2-ила) или CH(трет-бутила).

179. Соединение по п.177, где Ar' представляет собой фенил, необязательно замещенный галогеном, C1-C4алкилом или O-(C1-C4алкилом).

180. Соединение по п.177, где X₄ представляет собой CH₂.

181. Соединение по п.177, где X₄ представляет собой O или S.

182. Соединение по п.177, где R представляет собой водород.

183. Соединение по п.177, где r равно 2, X представляет собой связь, и каждый A представляет собой необязательно замещенный фенил.

184. Соединение по п.177, где указанное соединение обладает одним или более из следующих признаков:

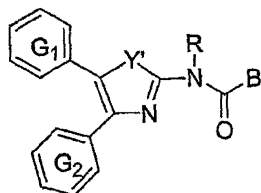
a) Y' представляет собой S;

b) R представляет собой водород;

c) r равно 2, X представляет собой связь, и каждый A представляет собой фенил;

d) B представляет собой кольцо (iii) выше, где Ar представляет собой CH(CH₃) и Ar' представляет собой фенил, необязательно замещенный галогеном, C1-C4алкилом или O-(C1-C4алкилом).

185. Соединение формулы VI



VI;

или его фармацевтически приемлемая соль;

Y' представляет собой O или S;

R представляет собой водород или R²;

B представляет собой фенил, 3-7-членное, моноциклическое, насыщенное, карбоциклическое кольцо, или 3-10-членное насыщенное или ненасыщенное, моноциклическое или бициклическое гетероциклическое кольцо, содержащее до 4 гетероатомов, выбранных из O, S или N, или 5-10-членное моноциклическое или бициклическое гетероарильное кольцо, содержащее до 4 гетероатомов, выбранных из O, S или N;

где каждое кольцо G₁, G₂ и B независимо замещено до 4 заместителями, выбранными из R¹, R², R³, R⁴ или R⁵;

R¹ представляет собой оксо, R⁶ или ((C1-C4)алифатическая группа)_n-Y;

n равно 0 или 1;

Y представляет собой галоген, CN, NO₂, CF₃, OCF₃, OH, SR⁶, S(O)R⁶, SO₂R⁶, NH₂, NHR⁶, N(R⁶)₂, NR⁶R⁸, N(R⁸)₂, COOH, COOR⁶ или OR⁶;

или два R¹ на соседних атомах кольца, взятые вместе, образуют 1,2-метилендиокси или 1,2-этилендиокси;

R² представляет собой алифатическую группу, где каждый R² необязательно содержит до 2 заместителей, независимо выбранных из R¹, R⁴ или R⁵;

R³ представляет собой циклоалифатическое, арильное, гетероциклическое или гетероарильное кольцо, необязательно содержащие до 3 заместителей, независимо выбранных из R¹, R², R⁴ или R⁵;

R⁴ представляет собой OR⁵, OR⁶, OC(O)R⁶, OC(O)R⁵, OC(O)OR⁶, OC(O)OR⁵, OC(O)N(R⁶)₂, OC(O)N(R⁵)₂, OC(O)N(R⁶R⁵), SR⁶, SR⁵, S(O)R⁶, S(O)R⁵, SO₂R⁶, SO₂R⁵, SO₂N(R⁶)₂, SO₂N(R⁵)₂, SO₂NR⁵R⁶, SO₃R⁶, SO₃R⁵, C(O)R⁵, C(O)OR⁵, C(O)R⁶, C(O)OR⁶, C(O)N(R⁶)₂, C(O)N(R⁵)₂, C(O)N(R⁵R⁶), C(O)N(OR⁶)R⁶, C(O)N(OR⁵)R⁶, C(O)N(OR⁶)R⁵, C(O)N(OR⁵)R⁵, C(NOR⁶)R⁶, C(NOR⁶)R⁵, C(NOR⁵)R⁶, C(NOR⁵)R⁵, N(R⁶)₂, N(R⁵)₂, N(R⁵R⁶), NR⁵C(O)R⁵, NR⁶C(O)R⁶, NR⁶C(O)R⁵, NR⁵C(O)R⁶, NR⁶C(O)OR⁶, NR⁵C(O)OR⁶, NR⁶C(O)OR⁵, NR⁵C(O)OR⁵, NR⁶C(O)N(R⁶)₂, NR⁶C(O)NR⁵R⁶, NR⁶C(O)N(R⁵)₂, NR⁵C(O)N(R⁶)₂, NR⁵C(O)NR⁵R⁶, NR⁵C(O)N(R⁵)₂, NR⁶SO₂R⁶, NR⁶SO₂R⁵, NR⁵SO₂R⁵, NR⁵SO₂R⁶, NR⁶SO₂N(R⁶)₂, NR⁶SO₂NR⁵R⁶, NR⁶SO₂N(R⁵)₂, NR⁵SO₂N(R⁶)₂, NR⁵SO₂NR⁵R⁶, NR⁵SO₂N(R⁵)₂, N(OR⁶)R⁶, N(OR⁶)R⁵, N(OR⁵)R⁵ или N(OR⁵)R⁶;

R⁵ представляет собой циклоалифатическое, арильное, гетероциклическое или гетероарильное кольцо, необязательно содержащие до 3 заместителей R¹;

R^6 представляет собой H или алифатическую группу, где R^6 необязательно содержит заместитель R^7 ;

R^7 представляет собой циклоалифатическое, арильное, гетероциклическое или гетероарильное кольцо, и каждый R^7 необязательно содержит до 2 заместителей, независимо выбранных из H, прямого или разветвленного (C_1 - C_6)алкила, прямого или разветвленного (C_2 - C_6)алкенила или алкинила, 1,2-метилендиокси, 1,2-этилендиокси или $(CH_2)_n-Z$;

Z выбирают из галогена, CN, NO_2 , CF_3 , OCF_3 , OH, S-алифатической группы, S(O)-алифатической группы, SO_2 -алифатической группы, NH_2 , NH-алифатической группы, N(алифатическая группа) $_2$, N(алифатическая группа) R^8 , NHR^8 , $N(R^8)_2$, COOH, C(O)O-алифатической группы или O-алифатической группы; и

R^8 представляет собой амино блокирующую группу;

при условии, что, когда R представляет собой водород

а) В не является хинолин-2-илом или 1,2-дигидро-2-оксохинолин-4-илом;

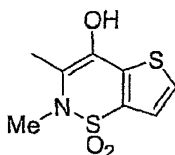
б) когда G_1 и G_2 оба представляют собой фенил, и Y' представляет собой S, тогда В не является 1,4-бензодиоксин-2-илом, циклопропилом, циклогексилем, тиен-2-илом, 1H-тиено [2,3-с]пиразол-1-фенил-3-метил-5-илом, 5-метилтиен-3-илом, 2,5-дихлортиен-3-илом, 2-фенилхинолин-4-илом, фуран-2-илом, тиен-5-(4,5-дифенил-2-тиазолилкарбоксамид)-2-илом, бензо[b]тиофен-2-илом, пиридин-2-(4,5-дифенил-2-тиазолилкарбоксамид)-6-илом, 5-нитротиен-2-илом, 3-хлорбензо[b]тиофен-2-илом, 4H-1-бензопиран-3-илом или 2H-1-бензопиран-3,4-дигидро-3-оксо-4-илом, 4H-1-бензопиран-3-илом или 2H-1-бензопиран-3,4-дигидро-3-оксо-4-илом;

с) когда G_1 и G_2 оба представляют собой фенил, и Y' представляет собой O, тогда В не является 1,2-дигидро-2-оксохинолин-4-илом или 3,4-дигидро-3-фенил-фалазин-1-илом, или тиен-2-илом;

д) исключены следующие соединения:

Y'	G_1	G_2	В
S	Ph	4-Me-Ph	2-C1-тиен-5-ил или 2,5-дихлортиен-3-ил
S	Ph или 3,4-диметилфенил	3,4-диметилфенил или Ph	пиридин-3-ил
S	3,4-диметилфенил	Ph	пиридин-4-ил
S	4-Cl-Ph	Ph	тиен-2-ил
S	3,4-диметилфенил	Ph	пиридин-4-ил
S	Ph	4-Me-фенил	тиен-2-ил или бензотиазол-2-ил
S	4- NO_2 -Ph или 4-Me-Ph	Ph или 4-OMe-Ph или 2,4-диметилфенил	тиен-2-ил или фуран-2-ил
S	4-OMe-Ph или 2,4-диметилфенил	4- NO_2 -Ph	фуран-2-ил или тиен-2-ил
S	4-OMe-Ph или Ph	4-OMe-Ph	фуран-2-ил или тиен-2-ил
S	Ph	4-Me-Ph	фуран-2-ил
S	Ph	4-Me-Ph	5-нитротиен-2-ил
S	4-Me-Ph	4-Me-Ph	2-хлорпиридин-3-ил
S	Ph	4-Me-Ph	3-хлорбензо[b]тиофен-2-ил
S	4-Me-Ph или Ph	4- NO_2 -Ph	тиен-2-ил или фуран-2-ил
S	2,4-диметоксифенил	4- NO_2 -Ph	пиридин-3-ил или тиен-2-ил
S	4-Cl-Ph	4- NO_2 -Ph	тиен-2-ил
S	Ph или 2-OMe-Ph или 3-OMe-Ph, или 4-OMe-Ph	2,4-диметоксифенил	1H-индол-2-ил

е) когда Y' представляет собой S, G_1 и G_2 оба представляют фенил, тогда В не является



186. Соединение по п.185, где G_1 и G_2 оба представляют собой фенил.

187. Соединение по п.185, где каждый из G_1 и G_2 независимо и необязательно замещен до двух заместителями, выбранными из галогена или C_1 - C_4 алкила.

188. Соединение по п.185, где В представляет собой фенил, необязательно замещенный до двух заместителями, выбранными из галогена, C_1 - C_4 алкила, O-(C_1 - C_4 алкила), COOH, COO(C_1 - C_4 алкила) или циано.

189. Соединение по п.185, где В представляет собой фенил, метиловый эфир фенил-2-карбоновой кислоты, 3,4-дихлорфенил, 4-хлорфенил, 4-метоксифенил, 4-метилфенил, 2,6-дифторфенил, 2-метилфенил, 3-метилфенил, фенил-2-карбоновую кислоту, 2-хлорфенил, 4-цианофенил, 2-метоксифенил, 3-хлорфенил или 3-метоксифенил.

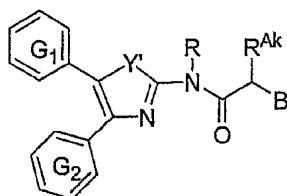
190. Соединение по п.185, где В представляет собой 3-7-членное, моноциклическое, насыщенное, карбоциклическое кольцо.

191. Соединение по п.190, где В выбирают из циклопропила, цикlopентила, циклогексила или циклогептила.

192. Соединение по п.185, где В представляет собой 3-10-членное насыщенное или ненасыщенное, моноциклическое или бициклическое гетероциклическое кольцо, содержащее до 4 гетероатомов, выбранных из О, S или N.

193. Соединение по п.192, где В выбирают из тетрагидрофуранила.

194. Соединение формулы VII



VII;

или его фармацевтически приемлемая соль;

где Y' представляет собой О или S;

R представляет собой водород или R²;

R^{Ак} представляет собой C₁-C₆алифатическую группу, необязательно замещенную до 3 заместителями, независимо выбранными из R¹, R² или R³;

В представляет собой фенил, 3-7-членное, моноциклическое, насыщенное, карбоциклическое кольцо, или 3-10-членное насыщенное или ненасыщенное, моноциклическое или бициклическое гетероциклическое кольцо, содержащее до 4 гетероатомов, выбранных из О, S или N, или 5-10-членное моноциклическое или бициклическое гетероарильное кольцо, содержащее до 4 гетероатомов, выбранных из О, S или N;

где каждое кольцо G₁, G₂ и В независимо замещено до 4 заместителями, выбранными из R¹, R², R³, R⁴ или R⁵;

R¹ представляет собой оксо, R⁶ или ((C1-C4)алифатическая группа)_n-Y;

n равно 0 или 1;

Y представляет собой галоген, CN, NO₂, CF₃, OCF₃, OH, SR⁶, S(O)R⁶, SO₂R⁶, NH₂, NHR⁶, N(R⁶)₂, NR⁶R⁸, N(R³)₂, COOH, COOR⁶ или OR⁶;

или два R¹ на соседних атомах кольца, взятые вместе, образуют 1,2-метилendiокси или 1,2-этилендиокси;

R² представляет собой алифатическую группу, где каждый R² необязательно содержит до 2 заместителей, независимо выбранных из R¹, R⁴ или R⁵;

R³ представляет собой циклоалифатическое, арильное, гетероциклическое или гетероарильное кольцо, необязательно содержащие до 3 заместителей, независимо выбранных из R¹, R², R⁴ или R⁵;

R⁴ представляет собой OR⁵, OR⁶, OC(O)R⁶, OC(O)R⁵, OC(O)OR⁶, OC(O)OR⁵, OC(O)N(R⁶)₂, OC(O)N(R⁵)₂, OC(O)N(R⁶R⁵), SR⁶, SR⁵, S(O)R⁶, S(O)R⁵, SO₂R⁶, SO₂R⁵, SO₂N(R⁶)₂, SO₂N(R⁵)₂, SO₂NR⁵R⁶, SO₃R⁶, SO₃R⁵, C(O)R⁵, C(O)OR⁵, C(O)R⁶, C(O)OR⁶, C(O)N(R⁶)₂, C(O)N(R⁵)₂, C(O)N(R⁵R⁶), C(O)N(OR⁶)R⁶, C(O)N(OR⁵)R⁶, C(O)N(OR⁶)R⁵, C(O)N(OR⁵)R⁵, C(NOR⁶)R⁶, C(NOR⁶)R⁵, C(NOR⁵)R⁶, C(NOR⁵)R⁵, N(R⁶)₂, N(R⁵)₂, N(R⁵R⁶), NR⁵C(O)R⁵, NR⁶C(O)R⁶, NR⁶C(O)R⁵, NR⁵C(O)R⁶, NR⁶C(O)OR⁶, NR⁵C(O)OR⁶, NR⁶C(O)OR⁵, NR⁵C(O)OR⁵, NR⁶C(O)N(R⁶)₂, NR⁶C(O)NR⁵R⁶, NR⁶C(O)N(R⁵)₂, NR⁵C(O)N(R⁶)₂, NR⁵C(O)NR⁵R⁶, NR⁵C(O)N(R⁵)₂, NR⁶SO₂R⁶, NR⁶SO₂R⁵, NR⁵SO₂R⁵, NR⁵SO₂R⁶, NR⁶SO₂N(R⁶)₂, NR⁶SO₂NR⁵R⁶, NR⁶SO₂N(R⁵)₂, NR⁵SO₂N(R⁶)₂, NR⁵SO₂NR⁵R⁶,

$\text{NR}^5\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^5)_2$, $\text{N}(\text{OR}^6)\text{R}^6$, $\text{N}(\text{OR}^6)\text{R}^5$, $\text{N}(\text{OR}^5)\text{R}^5$ или $\text{N}(\text{OR}^5)\text{R}^6$;

R^5 представляет собой циклоалифатическое, арильное, гетероциклическое или гетероарильное кольцо, необязательно содержащие до 3 заместителей R^1 ;

R^6 представляет собой H или алифатическую группу, где R^6 необязательно содержит заместитель R^7 ;

R^7 представляет собой циклоалифатическое, арильное, гетероциклическое или гетероарильное кольцо, и каждый R^7 необязательно содержит до 2 заместителей, независимо выбранных из H, прямого или разветвленного (C_1 - C_6)алкила, прямого или разветвленного (C_2 - C_6)алкенила или алкинила, 1,2-метилендиокси, 1,2-этилендиокси или $(\text{CH}_2)_n\text{-Z}$;

Z выбирают из галогена, CN, NO_2 , CF_3 , OCF_3 , OH, S-алифатической группы, S(O)-алифатической группы, SO_2 -алифатической группы, NH_2 , NH-алифатической группы, $\text{N}(\text{алифатическая группа})_2$, $\text{N}(\text{алифатическая группа})\text{R}^8$, NHR^8 , $\text{N}(\text{R}^8)_2$, COOH , C(O)O-алифатической группы или O-алифатической группы; и

R^8 представляет собой аминозащитную группу;

при условии, что, когда каждый из G_1 , G_2 и B представляет собой незамещенный фенил, и R представляет собой водород, тогда B не является 3,4,5-триметоксифенилом.

195. Соединение по п.194, где R^{Ak} выбирают из метила, этила, изопропила, н-пропила, втор-бутила, н-бутила или трет-бутила.

196. Соединение по п.194, где B представляет собой необязательно замещенный фенил.

197. Соединение по п.194, где B представляет собой 3-7-членное, моноциклическое, насыщенное, карбоциклическое кольцо.

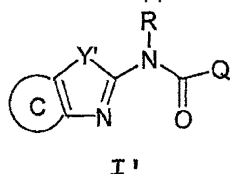
198. Соединение по п.197, где B выбирают из циклопропила, цикlopентила, циклогексила или циклогептила.

199. Соединение по п.194, где B представляет собой 3-10-членное насыщенное или ненасыщенное, моноциклическое или бициклическое гетероциклическое кольцо, содержащее до 4 гетероатомов, выбранных из O, S или N.

200. Соединение по п.199, где B выбирают из тетрагидрофуранила, тетрагидротиофенила, пирролидинила или пиперазинила.

201. Соединение по п.194, где B представляет собой 5-10-членное моноциклическое или бициклическое гетероарильное кольцо, содержащее до 4 гетероатомов, выбранных из O, S или N.

202. Соединение формулы I'



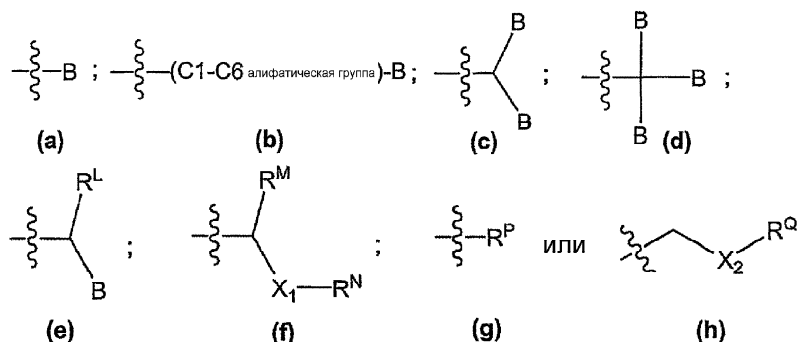
или его фармацевтически приемлемая соль;

где Y' представляет собой O, S или NR;

R представляет собой H, R^2 или R^6 ;

C представляет собой фенил или 5-8-членное циклоалифатическое кольцо;

Q выбирают из



каждый В независимо выбирают из 3-7-членного моноциклического или 8-14-членного бициклического или трициклического, насыщенного, ненасыщенного или ароматического кольца, содержащего 0-4 гетероатома в каждом кольце, где каждый указанный гетероатом независимо выбирают из N, NH, S или O;

где каждый В и С независимо и необязательно замещен до 4 заместителями, независимо выбранными из R^1 , R^2 , R^3 , R^4 или R^5 ;

R^L представляет собой $-OR^A$, $-SR^A$ или $-N(R^{AB})_2$;

каждый R^A независимо представляет собой водород, C_1 - C_6 алифатическую группу, или 3-7-членное карбоциклическое или гетероциклическое, насыщенное или ненасыщенное кольцо, содержащее до 3 гетероатомов, выбранных из O, N или S, где каждый R^A необязательно замещен до 3 заместителями, независимо выбранными из R^1 , R^4 или R^7 ;

каждый R^{AB} независимо представляет собой водород или C_1 - C_6 алифатическую группу, необязательно замещенную до 3 заместителями, независимо выбранными из R^1 , R^4 или R^7 ;

где до двух метиленовых звеньев в R^A или R^{AB} необязательно заменены $-CO-$, $-CS-$, $-COCO-$, $-CONR-$, $-CO_2-$, $-OCO-$, $-NRCO_2-$, $-O-$, $-NRCONR-$, $-OCONR-$, $-NRCO-$, $-S-$, $-SO-$, $-SO_2-$, $-NR-$, $-SO_2NR-$, $NRSO_2-$ или $-NRSO_2NR$; или

два R^{AB} , взятые вместе с атомом азота, представляют собой 3-7-членное гетероциклическое или гетероарильное кольцо, содержащее до 4 гетероатомов, выбранных из O, N или S, где указанное кольцо необязательно замещено до 2 заместителями, выбранными из оксо или $(C_1$ -4алифатическая группа) $_p$ -Y;

R^M представляет собой C_1 - C_6 алифатическую группу, необязательно замещенную до двух заместителями, выбранными из R^1 , R^2 , R^3 или R^4 ;

каждый из X_1 и X_2 независимо выбирают из O, S или NR;

R^N представляет собой C_1 - C_6 алифатическую группу или фенил, где R^N необязательно замещен до двух заместителями, выбранными из R^1 , R^2 , R^3 или R^4 ;

R^P равно C_1 - C_6 алифатическую группу, необязательно замещенную до двух заместителями, выбранными из R^1 , R^2 , R^3 или R^4 ;

R^Q представляет собой C_1 - C_6 алифатическую группу или арил, где R^Q необязательно замещен до двух заместителями, выбранными из R^1 , R^2 , R^3 или R^4 ;

R^1 представляет собой оксо, R^6 или $((C_1$ -4алифатическая группа) $_n$ -Y;
n равно 0 или 1;

Y представляет собой галоген, CN, NO_2 , CF_3 , OCF_3 , OH, SR^6 , $S(O)R^6$, SO_2R^6 , NH_2 , NHR^6 , $N(R^6)_2$, NR^6R^8 , $N(R^8)_2$, COOH, $COOR^6$ или OR^6 ; или

два R^1 на соседних атомах кольца, взятые вместе, образуют 1,2-метилендиокси или 1,2-этилендиокси;

R^2 представляет собой алифатическую группу, где каждый R^2 необязательно содержит до 2 заместителей, независимо выбранных из R^1 , R^4 или R^5 ;

R^3 представляет собой циклоалифатическое, арильное, гетероциклическое или гетероарильное кольцо, необязательно содержащие до 3 заместителей, независимо выбранных из R^1 , R^2 , R^4 или R^5 ;

R^4 представляет собой OR^5 , OR^6 , $OC(O)R^6$, $OC(O)R^5$, $OC(O)OR^6$, $OC(O)OR^5$, $OC(O)N(R^6)_2$, $OC(O)N(R^5)_2$, $OC(O)N(R^6R^5)$, SR^6 , SR^5 , $S(O)R^6$, $S(O)R^5$, SO_2R^6 , SO_2R^5 , $SO_2N(R^6)_2$, $SO_2N(R^5)_2$, $SO_2NR^5R^6$, SO_3R^6 , SO_3R^5 , $C(O)R^5$, $C(O)OR^5$, $C(O)R^6$, $C(O)OR^6$, $C(O)N(R^6)_2$, $C(O)N(R^5)_2$, $C(O)N(R^5R^6)$, $C(O)N(OR^6)R^6$, $C(O)N(OR^5)R^6$, $C(O)N(OR^6)R^5$, $C(O)N(OR^5)R^5$, $C(NOR^6)R^6$, $C(NOR^6)R^5$, $C(NOR^5)R^6$, $C(NOR^5)R^5$, $N(R^6)_2$, $N(R^5)_2$, $N(R^5R^6)$, $NR^5C(O)R^5$, $NR^6C(O)R^6$, $NR^6C(O)R^5$, $NR^5C(O)R^6$, $NR^6C(O)OR^6$, $NR^5C(O)OR^6$, $NR^6C(O)OR^5$, $NR^5C(O)OR^5$, $NR^6C(O)N(R^6)_2$, $NR^6C(O)NR^5R^6$, $NR^6C(O)N(R^5)_2$, $NR^5C(O)N(R^6)_2$, $NR^5C(O)NR^5R^6$, $NR^5C(O)N(R^5)_2$, $NR^6SO_2R^6$, $NR^6SO_2R^5$, $NR^5SO_2R^5$, $NR^5SO_2R^6$, $NR^6SO_2N(R^6)_2$, $NR^6SO_2NR^5R^6$, $NR^6SO_2N(R^5)_2$, $NR^5SO_2N(R^6)_2$, $NR^5SO_2NR^5R^6$, $NR^5SO_2N(R^5)_2$, $N(OR^6)R^6$, $N(OR^6)R^5$, $N(OR^5)R^5$ или $N(OR^5)R^6$;

R⁵ представляет собой циклоалифатическое, арильное, гетероциклическое или гетероарильное кольцо, необязательно содержащие до 3 заместителей R¹;

R⁶ представляет собой H или алифатическую группу, где R⁶ необязательно содержит заместитель R⁷;

R⁷ представляет собой циклоалифатическое, арильное, гетероциклическое или гетероарильное кольцо, и каждый R⁷ необязательно содержит до 2 заместителей, независимо выбранных из H, прямого или разветвленного (C₁-C₆)алкила, прямого или разветвленного (C₂-C₆)алкенила или алкинила, 1,2-метилендиокси, 1,2-этилендиокси или (CH₂)_n-Z;

Z выбирают из галогена, CN, NO₂, CF₃, OCF₃, OH, S-алифатической группы, S(O)-алифатической группы, SO₂-алифатической группы, NH₂, NH-алифатической группы, N(алифатическая группа)₂, N(алифатическая группа)R⁸, NHR⁸, N(R⁸)₂, COOH, C(O)O-алифатической группы или O-алифатической группы; и

R⁸ представляет собой аминокзащитную группу.

203. Соединение по п.202, где Y' представляет собой O.

204. Соединение по п.202, где Y' представляет собой S.

205. Соединение по п.202, где R представляет собой водород.

206. Соединение по п.202, где Q в формуле I' представляет собой B (структура (a)).

207. Соединение по п.202, где Q в формуле I' представляет собой -(C₁-C₆алифатическая группа)-B (структура (b)).

208. Соединение по п.207, где указанная C₁-C₆алифатическая группа представляет собой прямой или разветвленный C1-C4алкилиден.

209. Соединение по п.208, где указанный алкилиден выбирают из -CH₂-, -CH(Me)-, -C(Me)₂-, -CH(Et)-, -C(Et)₂- или -CH₂-CH(Me)-.

210. Соединение по п.202, где B выбирают из необязательно замещенного фенила или C3-C8циклоалифатической группы.

211. Соединение по п.210, где B представляет собой фенил или C3-C8циклоалкил, необязательно замещенные до двух заместителями, выбранными из R¹, R² или фенила, необязательно замещенного до двух заместителями, выбранными из R¹ или R².

212. Соединение по п.202, где B выбирают из необязательно замещенных C3-C8циклоалкила, фенила, пиперидила или пирролидинила.

213. Соединение по п.212, где B представляет собой фенил, цикlopентил, циклогексил или пиперидил, необязательно замещенные до двух заместителями R¹ или R².

214. Соединение по п.202, где кольцо C представляет собой фенил, необязательно замещенный до двух R¹.

215. Соединение по п.202, где кольцо C представляет собой циклогексенил, необязательно замещенный до двух R¹.

216. Способ по п.1, где указанный ABC-транспортер или его фрагмент находится in vivo.

217. Способ по п.1, где указанный ABC-транспортер или его фрагмент находится in vitro.

218. Способ по п.1, где указанный ABC-транспортер представляет собой CFTR.

219. Способ лечения заболевания, опосредованного ABC транспортером у млекопитающего, включающий стадию введения указанному млекопитающему композиции, содержащей соединение по любому из пп.1-104 или соединение по любому из пп.105-215.

220. Способ по п.219, где указанное заболевание выбрано из кистозного фиброза, наследственной эмфиземы, наследственного гемохроматоза, нарушения коагуляции-фибринолиза, такого как недостаточность белка C, наследственной крапивницы 1 типа, нарушения липидного процессинга, такого как семейная гиперхолестеринемия, хиломикромемия 1 типа, бета-липопротеинемия, лизосомных болезней накопления, таких как I-клеточное заболевание/псевдо Hurler, секреторная диарея или полициститное заболевание почек, мукополисахаридоз, болезни Сандхофа/Тай-Сачса (Sandhof/Tay-Sachs), синдрома Кринглера-Найяра II типа, полиэндокринопатии/гиперинсулинемии, сахарного диабета, карликовости Ларона, недостаточности миеопероксидазы, первичного гипопаратиреоидизма, меланомы, гликанозиза CDG 1 типа, наследственной эмфиземы, наследственного гипертиреоза, остеопситироза, наследственной гипофибриногенемии,

недостаточности АСТ, несахарного диабета, нейрофизеального DI, неврогенного DI, синдрома Шарко-Мари-Туфа, болезни Перлизауса-Мерзбахера, нейродегенеративных заболеваний, таких как болезнь Альцгеймера, болезнь Паркинсона, боковой амиотрофический склероз, прогрессирующая супрануклеарная плазия, заболевание Пика, некоторых полиглутаминовых неврологических заболеваний, таких как болезнь Хантингтона, спинно-церебеллярная атаксия I типа, спинальная и бульбарная мышечная атрофия, *dentatorubal pallidoluysian* и миотоническая дистрофия, а также губчатых энцефалопатий, таких как болезнь Крейтцфельда-Якоба (связанная с белком Prior, процессирующим дефект), болезнь Фабри, синдром Страуслера-Шенкера, COPD, сухость глаз или болезнь Шегрена.

221. Способ по п.220, где указанным заболеванием является кистозный фиброз.

222. Способ модулирования активности анионного канала *in vitro* или *in vivo*, включающий стадию контактирования указанного канала с соединением по любому из пп.1-104 или соединением по любому из пп.105-215.

223. Способ по п.222, где указанным анионным каналом является канал ионов хлора или бикарбонатный канал.

224. Способ по п.223, где указанным анионным каналом является канал ионов хлора.

225. Способ лечения заболевания, опосредованного анионным каналом, у млекопитающих, включающий стадию введения указанному млекопитающему композиции, содержащей соединение по любому из пп.1-104 или соединение по любому из пп.105-220.

226. Способ по п.225, где указанным является кистозный фиброз.

227. Фармацевтическая композиция, содержащая соединение по любому из пп.104-215 и фармацевтически приемлемый носитель.

228. Фармацевтическая композиция, содержащая

(i) соединение по любому из пп.105-215;

(ii) фармацевтически приемлемый носитель; и

(iii) дополнительный агент, выбранный из муколитического средства, бронходилататора, противомикробного (антибактериального) агента, противoinфекционного агента, противовоспалительного агента, модулятора CFTR или пищевого агента.

229. Набор для измерения активности транспортера ABC или его фрагмента в биологическом образце *in vitro* или *in vivo*, включающий

(i) композицию, содержащую соединение по любому из пп.105-215; и

(ii) инструкции по

a) приведению в контакт композиции с биологическим образцом;

b) измерению активности указанного транспортера ABC или его фрагмента.

230. Набор по п.229, где указанный транспортер ABC представляет собой CFTR.