

ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ

(12) ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ

(21)(22) Заявка: 2012127368/04, 01.12.2010

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:
01.12.2009 US 61/265,591

(43) Дата публикации заявки: 10.01.2014 Бюл. № 1

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на
национальной фазе: 02.07.2012(86) Заявка РСТ:
US 2010/058598 (01.12.2010)(87) Публикация заявки РСТ:
WO 2011/068899 (09.06.2011)

Адрес для переписки:

129090, Москва, ул. Б. Спасская, 25, стр.3, ООО
"Юридическая фирма Городиский и Партнеры"

(71) Заявитель(и):

ЭББОТТ ЛЭБОРЕТРИЗ (US)

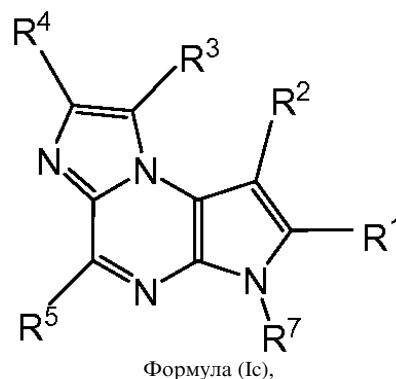
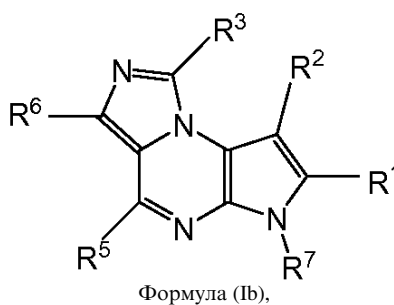
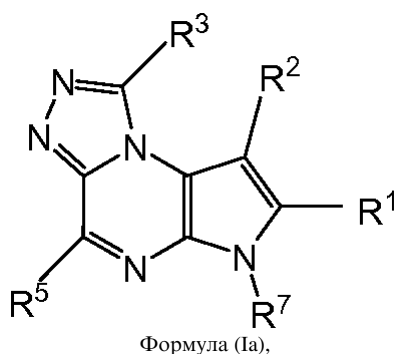
(72) Автор(ы):

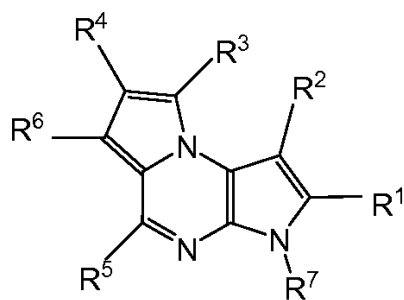
ХОУМАНН Майкл З. (US),
УИШАРТ Нейл (US),
АРДЖИРИАДИ Мария А. (US),
БРЕЙНЛИНДЖЕР Эрик К. (US),
КОЛДЕРВУД Дэвид Дж. (US),
ЭРИКССОН Анна М. (US),
ФИАМЕНГО Брайан А. (US),
ФРЭНК Кристин Е. (US),
ФРИДМАН Майкл (US),
ДЖОРДЖ Дон М. (US),
ГОДКЕН Эрик Р. (US),
ДЖОЗЕФСОН Натан С. (US),
ЛИ Бицин С. (US),
МОРЫТКО Майкл Дж. (US),
МАЛЛЕН Келли Д. (US),
СОМАЛ Гагандип (US),
СТЮАРТ Кент Д. (US),
ВОСС Джеффри В. (US),
УОЛЛЕЙС Грив А. (US),
ВАН Лу (US),
ВОЛЛЕР Кевин Р. (US)

(54) НОВЫЕ ТРИЦИКЛИЧЕСКИЕ СОЕДИНЕНИЯ

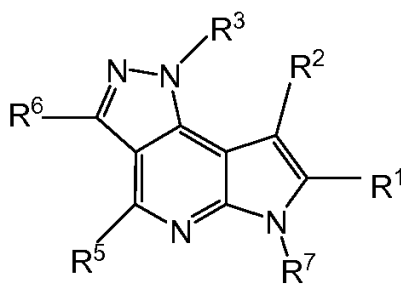
(57) Формула изобретения

1. Соединение формулы

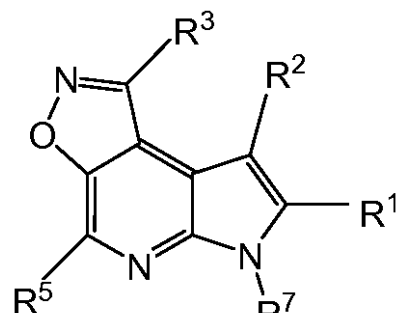




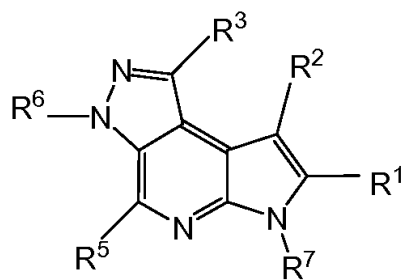
Формула (Id),



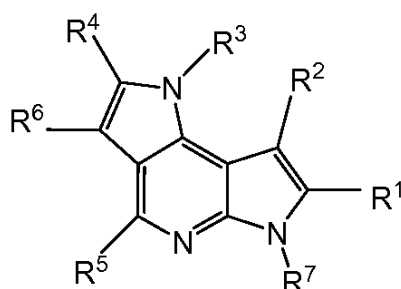
Формула (Ie),



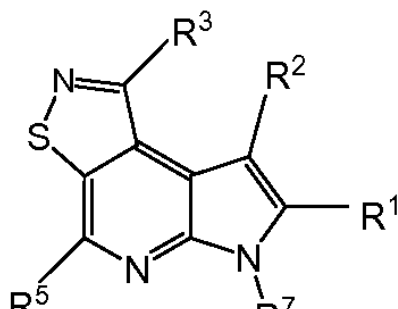
Формула (If),



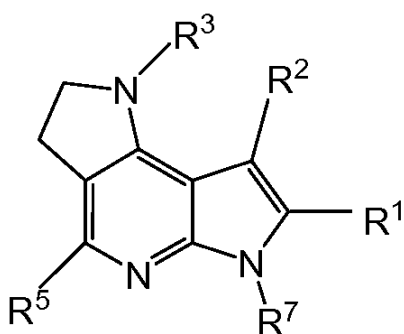
Формула (Ig),



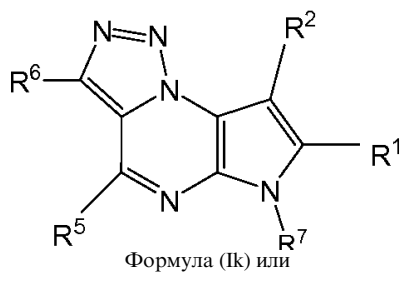
Формула (Ih),



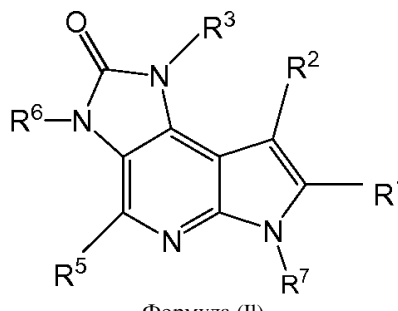
Формула (Ii),



Формула (Ij),



Формула (Ik) или



Формула (Il),

его фармацевтически приемлемые соли, пролекарства, биологически активные метаболиты, стереоизомеры и изомеры, где

R^1 представляет собой H, дейтерий, галоген, CF_3 , CN, OR^a , $N(R^a)(R^b)$, OCF_3 , $-C(O)-N(R^a)(R^b)$, $-C(O)-OR^a$, $-C(O)$ -необязательно замещенный (C_1-C_6)алкил, $-C(O)$ -необязательно замещенный (C_3-C_6)циклоалкил, $-C(O)$ -необязательно замещенный (C_6-C_{10})арил, $-C(O)$ -необязательно замещенный (C_1-C_{10})гетероарил, $-C(O)$ -необязательно замещенный (C_1-C_{10})гетероцикл, $-S$ -необязательно замещенный (C_1-C_6)алкил, $-S(O)$ -необязательно замещенный (C_1-C_6)алкил, $-S(O)_2$ -необязательно замещенный (C_1-C_6)алкил, $-S(O)_2N(R^a)(R^b)$, необязательно замещенный (C_1-C_6)алкил, необязательно замещенный (C_1-C_6)алкокси, необязательно замещенный (C_2-C_6)алкенил, необязательно замещенный (C_2-C_6)алкинил, необязательно замещенный (C_3-C_{10})циклоалкил, необязательно замещенный (C_1-C_{10})гетероарил, необязательно замещенный (C_1-C_{10})гетероцикл или необязательно замещенный (C_6-C_{10})арил; или

R^1 представляет собой $-Z^{101}-L^1-Z^{102}$, где

Z^{101} представляет собой необязательно замещенный (C_1-C_6)алкилен, необязательно замещенный (C_1-C_{10})гетероарил, необязательно замещенный (C_1-C_{10})гетероцикл или необязательно замещенный (C_6-C_{10})арил;

L^1 представляет собой связь, необязательно замещенный (C_1 - C_4)алкилен, $-CH_2C(O)$, $-C(O)-$, $-C(O)CH_2-$, $-N(R^a)-$, $-O-$, необязательно замещенный (C_1 - C_4)алкилен- $N(R^a)C(O)$ -, $-$, необязательно замещенный (C_1 - C_4)алкилен- $C(O)N(R^a)-$, $-C(O)N(R^a)-$, $-N(R^a)C(O)-$, $-C(O)N(R^a)$ -необязательно замещенный (C_1 - C_4)алкилен-, $-N(R^a)C(O)$ -необязательно замещенный (C_1 - C_4)алкилен-, $-C(O)N(R^a)$ -необязательно замещенный (C_1 - C_4)алкилен- $C(O)$, $-N(R^a)C(O)$ -необязательно замещенный (C_1 - C_4)алкилен- $C(O)-$, $-C(O)$ -необязательно замещенный (C_1 - C_4)алкилен- $N(R^a)C(O)-$, $-C(O)$ -необязательно замещенный (C_1 - C_4)алкилен- $C(O)N(R^a)-$, $-$, необязательно замещенный (C_1 - C_4)алкилен- $N(R^a)C(O)-$, $-N(R^a)C(O)$ -необязательно замещенный (C_1 - C_4)алкилен-, $-$, необязательно замещенный (C_1 - C_4)алкилен- $C(O)N(R^a)$ -необязательно замещенный (C_1 - C_4)алкилен-, $-$, необязательно замещенный (C_1 - C_4)алкилен- $N(R^a)S(O)_2-$, $-$, необязательно замещенный (C_1 - C_4)алкилен- $S(O)_2N(R^a)-$, $-N(R^a)S(O)_2CH_2-$, $-S(O)_2N(R^a)$ -необязательно замещенный (C_1 - C_4)алкилен-, $-C(O)N(R^a)S(O)_2-$, $-S(O)_2N(R^a)C(O)-$, $-S(O)_2-$, $-S(O)_2N(R^a)-$, $-N(R^a)S(O)_2-$, $-O-(C_1-C_4)$ алкилен-, (C_1-C_6) алкилен- $O-$, $-C(O)N(R^a)-(C_1-C_6)$ алкилен- $C(O)-$ или $-C(O)-(C_1-C_6)$ алкилен- $N(R^a)C(O)-$;

Z^{102} представляет собой H , $-CN$, $-N(R^a)(R^b)$, $-OR^a$, необязательно замещенный (C_1 - C_6)алкил, необязательно замещенный (C_1 - C_4)алкокси, необязательно замещенный (C_3 - C_{10})циклоалкил, необязательно замещенный (C_6 - C_{10})арил, необязательно замещенный (C_1 - C_{10})гетероарил или необязательно замещенный (C_1 - C_{10})гетероцикл, необязательно замещенный соединенный мостиковой связью (C_5 - C_{12})циклоалкил или необязательно замещенный соединенный мостиковой связью (C_2 - C_{10})гетероцикл;

R^2 представляет собой H , дейтерий, галоген, CF_3 , CN , OR^a , $N(R^a)(R^b)$, OCF_3 , $-C(O)$ -необязательно замещенный (C_1 - C_6)алкил, $-C(O)$ -необязательно замещенный (C_3 - C_6)циклоалкил, $-S$ -необязательно замещенный (C_1 - C_6)алкил, $-S(O)_2$ -необязательно замещенный (C_1 - C_6)алкил, $-S(O)_2N(R^a)(R^b)$, необязательно замещенный (C_1 - C_6)алкокси, $-C(O)N(R^a)(R^b)$, $-S(O)_2$ -необязательно замещенный (C_1 - C_6)алкил, необязательно замещенный (C_1 - C_6)алкил, необязательно замещенный (C_2 - C_6)алкенил, необязательно замещенный (C_2 - C_6)алкинил, необязательно замещенный (C_3 - C_{10})циклоалкил, необязательно замещенный (C_6 - C_{10})арил, необязательно замещенный (C_1 - C_{10})гетероарил или необязательно замещенный (C_1 - C_{10})гетероцикл;

R^3 представляет собой H , дейтерий, CF_3 , CN , $-C(O)OR^a$, OR^a , OCF_3 , $N(R^a)(R^b)$, необязательно замещенный (C_1 - C_6)алкил, необязательно замещенный (C_3 - C_7)циклоалкил, необязательно замещенный (C_1 - C_{10})гетероарил, необязательно замещенный (C_1 - C_{10})гетероцикл или необязательно замещенный (C_6 - C_{10})арил;

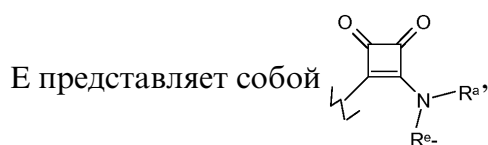
или

R^3 представляет собой -A-D-E-G, где

A представляет собой связь, -C(O)-, необязательно замещенный (C₁-C₆)алкилен, необязательно замещенный (C₂-C₆)алкенилен, необязательно замещенный (C₂-C₆)алкинилен, необязательно замещенный (C₃-C₁₂)циклоалкилен, необязательно замещенный (C₂-C₆)гетероциклилен, -необязательно замещенный (C₁-C₆)алкилен-N(R^a)-, -R^e-C(O)N(R^a)-R^e-, -R^e-N(R^a)C(O)-R^e-, -R^e-O-R^e-, -N(R^a)-R^e-, -S-R^e-, -S(O)₂-R^e-, -S(O)R^e-, -C(O-R^a)(R^b)-R^e-, -S(O)₂N(R^a)-R^e-, -N(R^a)S(O)₂-R^e- или -N(R^a)C(O)N(R^b)-R^e-;

D представляет собой связь, необязательно замещенный (C₁-C₈)алкилен, необязательно замещенный соединенный мостиковой связью (C₅-C₁₂)циклоалкилен, необязательно замещенный (C₃-C₁₀)циклоалкилен, необязательно замещенный соединенный мостиковой связью (C₅-C₁₀)циклоалкенилен, необязательно замещенный (C₃-C₁₀)циклоалкенилен, необязательно замещенный (C₆-C₁₀)арилен, необязательно замещенный (C₁-C₁₀)гетероарил, необязательно замещенный соединенный мостиковой связью (C₂-C₁₀)гетероциклилен или необязательно замещенный (C₂-C₁₀)гетероциклилен;

E представляет собой связь, -R^e-, -R^e-C(O)-R^e-, -R^e-C(O)C(O)-R^e-, -R^e-C(O)O-R^e-, -R^e-C(O)C(O)N(R^a)-R^e-, -R^e-N(R^a)-C(O)C(O)-R^e-, -R^e-C(O)N(R^a)C(O)R^e-, -R^e-O-R^e-, -R^e-S(O)₂-R^e-, -R^e-S(O)-R^e-, -R^e-S-R^e-, -R^e-N(R^a)-R^e-, -R^e-N(R^a)C(O)-R^e-, -R^e-C(O)N(R^a)R^e-, -R^e-OC(O)N(R^a)-R^e-, -R^e-N(R^a)C(O)OR^e-, -R^e-OC(O)-R^e-, -R^e-N(R^a)C(O)N(R^b)-R^e-, -R^e-N(R^a)S(O)₂-R^e- или -R^e-S(O)₂N(R^a)-R^e-; или



где во всех случаях E соединен либо с атомом углерода либо с атомом азота в D;

G представляет собой H, дейтерий, -N(R^a)(R^b), галоген, -OR^a, -SR^a, -S(O)R^a, -S(O)₂R^a, -NO₂, -C(O)OR^a, -CN, -C(O)N(R^a)(R^b), -N(R^a)C(O)R^b, -N(R^a)C(O)OR^b, -OC(O)N(R^a), -N(R^a)C(O)N(R^b)₂, -C(O-R^a)(R^b)₂, -C(O)R^a, -CF₃, -OCF₃, -N(R^a)S(O)₂R^b, -S(O)₂N(R^a)(R^b), -S(O)₂N(R^a)C(O)R^b, необязательно замещенный (C₁-C₆)алкил, необязательно замещенный (C₂-C₆)алкенил, необязательно замещенный (C₂-C₆)алкинил, необязательно замещенный (C₃-C₁₀)циклоалкил, необязательно замещенный (C₁-C₁₀)гетероарил, необязательно замещенный (C₁-C₁₀)гетероциклил, необязательно замещенный (C₆-C₁₀)арил, необязательно замещенный -(C₁-C₆)алкил-(C₃-C₁₀)циклоалкил, необязательно замещенный -(C₁-C₆)алкил-(C₆-C₁₀)арил, необязательно замещенный -(C₁-C₆)алкил-(C₁-C₁₀)гетероарил или необязательно замещенный -(C₁-C₆)алкил-(C₁-C₁₀)гетероциклил;

где в содержащем -N(R^a)(R^b) фрагменте атом азота, R^a и R^b могут образовывать кольцо так, что -N(R^a)(R^b) представляет собой необязательно замещенный (C₂-C₁₀)гетероциклил или необязательно замещенный (C₁-C₁₀)гетероарил, соединенный через атом азота;

R⁴ представляет собой H, дейтерий, CF₃, CN, OR^a, OCF₃, N(R^a)(R^b), необязательно

замещенный (C₁-C₆)алкил, необязательно замещенный (C₃-C₇)циклоалкил, необязательно замещенный (C₁-C₁₀)гетероарил, необязательно замещенный (C₁-C₁₀)гетероциклил или необязательно замещенный (C₆-C₁₀)арил;

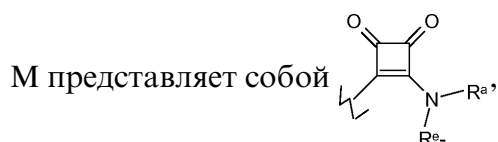
или

R⁴ представляет собой -J-L-M-Q, где

J представляет собой связь, -C(O)-, необязательно замещенный (C₁-C₆)алкилен, необязательно замещенный (C₂-C₆)алкенилен, необязательно замещенный (C₂-C₆)алкинилен, необязательно замещенный (C₃-C₁₂)циклоалкилен, необязательно замещенный (C₂-C₆)гетероциклилен, -необязательно замещенный (C₁-C₆)алкилен-N(R^a)-, -R^e-C(O)N(R^a)-R^e-, -R^e-N(R^a)C(O)-R^e-, -R^e-O-R^e-, -N(R^a)-R^e-, -S-R^e-, -S(O)₂-R^e-, -S(O)R^e-, -C(O-R^a)(R^b)-R^e-, -S(O)₂N(R^a)-R^e-, -N(R^a)S(O)₂-R^e- или -N(R^a)C(O)N(R^b)-R^e-;

L представляет собой необязательно замещенный (C₁-C₈)алкилен, необязательно замещенный соединенный мостиковой связью (C₅-C₁₂)циклоалкилен, необязательно замещенный (C₃-C₁₀)циклоалкилен, необязательно замещенный соединенный мостиковой связью (C₅-C₁₀)циклоалкенилен, необязательно замещенный (C₃-C₁₀)циклоалкенилен, необязательно замещенный (C₆-C₁₀)арилен, необязательно замещенный (C₁-C₁₀)гетероарилен, необязательно замещенный соединенный мостиковой связью (C₂-C₁₀)гетероциклилен или необязательно замещенный (C₂-C₁₀)гетероциклилен;

M представляет собой связь, -R^e-, -R^e-C(O)-R^e-, -R^e-C(O)C(O)-R^e-, -R^e-C(O)O-R^e-, -R^e-C(O)C(O)N(R^a)-R^e-, -R^e-N(R^a)-C(O)C(O)-R^e-, -R^e-C(O)N(R^a)C(O)R^e-, -R^e-O-R^e-, -R^e-S(O)₂-R^e-, -R^e-S(O)-R^e-, -R^e-S-R^e-, -R^e-N(R^a)-R^e-, -R^e-N(R^a)C(O)-R^e-, -R^e-C(O)N(R^a)R^e-, -R^e-OC(O)N(R^a)-R^e-, -R^e-N(R^a)C(O)OR^e-, -R^e-OC(O)-R^e-, -R^e-N(R^a)C(O)N(R^b)-R^e-, -R^e-N(R^a)S(O)₂-R^e- или -R^e-S(O)₂N(R^a)-R^e-; или



где во всех случаях М соединен либо с атомом углерода либо с атомом азота в L;

Q представляет собой H, дейтерий, -N(R^a)(R^b), галоген, -OR^a, -SR^a, -S(O)R^a, -S(O)₂R^a, -NO₂, -C(O)OR^a, -CN, -C(O)N(R^a)(R^b), -N(R^a)C(O)R^b, -N(R^a)C(O)OR^b, -OC(O)N(R^a), -N(R^a)C(O)N(R^b)₂, -C(O-R^a)(R^b)₂, -C(O)R^a, -CF₃, -OCF₃, -N(R^a)S(O)₂R^b, -S(O)₂N(R^a)(R^b), -S(O)₂N(R^a)C(O)R^b, необязательно замещенный -(C₁-C₆)алкил, необязательно замещенный -(C₂-C₆)алкенил, необязательно замещенный -(C₂-C₆)алкинил, необязательно замещенный -(C₃-C₁₀)циклоалкил, необязательно замещенный -(C₁-C₁₀)гетероарил, необязательно замещенный -(C₁-C₁₀)гетероциклил, необязательно замещенный -(C₆-C₁₀)арил, необязательно замещенный -(C₁-C₆)алкил-(C₃-C₁₀)циклоалкил, необязательно замещенный -(C₁-C₆)алкил-(C₆-C₁₀)арил, необязательно замещенный -(C₁-C₆)алкил-(C₁-C₁₀)гетероарил или необязательно замещенный -(C₁-C₆)алкил-(C₁-C₁₀)гетероциклил;

где в содержащем -N(R^a)(R^b) фрагменте атом азота, R^a и R^b могут образовывать

кольцо так, что $-N(R^a)(R^b)$ представляет собой необязательно замещенный (C_2-C_{10}) гетероциклил или необязательно замещенный (C_1-C_{10}) гетероарил, соединенный через атом азота;

R^5 представляет собой H, дейтерий, $N(R^a)(R^b)$, галоген, CN, CF_3 , OR^a , необязательно замещенный (C_1-C_6) алкил, OCF_3 , $-C(O)$ -необязательно замещенный (C_1-C_6) алкил, $-C(O)$ -необязательно замещенный (C_3-C_6) циклоалкил, $-S$ -необязательно замещенный (C_1-C_6) алкил, $-S(O)$ -необязательно замещенный (C_1-C_6) алкил, $-S(O)_2$ -необязательно замещенный (C_1-C_6) алкил, $-S(O)_2N(R^a)(R^b)$, необязательно замещенный (C_1-C_6) алкил или необязательно замещенный (C_1-C_6) алкокси;

R^6 представляет собой H, дейтерий, галоген, CF_3 , CN, OR^a , $N(R^a)(R^b)$, OCF_3 , $-C(O)-N(R^a)(R^b)$, $-C(O)-OR^a$, $-C(O)$ -необязательно замещенный (C_1-C_6) алкил, $-C(O)$ -необязательно замещенный (C_3-C_6) циклоалкил, $-C(O)$ -необязательно замещенный (C_6-C_{10}) арил, $-C(O)$ -необязательно замещенный (C_1-C_{10}) гетероарил, $-C(O)$ -необязательно замещенный (C_1-C_{10}) гетероциклил, $-S$ -необязательно замещенный (C_1-C_6) алкил, $-S(O)$ -необязательно замещенный (C_1-C_6) алкил, $-S(O)_2$ -необязательно замещенный (C_1-C_6) алкил, $-S(O)_2N(R^a)(R^b)$, необязательно замещенный (C_1-C_6) алкил, необязательно замещенный (C_1-C_6) алкокси, необязательно замещенный (C_2-C_6) алкенил, необязательно замещенный (C_2-C_6) алкинил, необязательно замещенный (C_3-C_{10}) циклоалкил, необязательно замещенный (C_1-C_{10}) гетероарил, необязательно замещенный (C_1-C_{10}) гетероциклил или необязательно замещенный (C_6-C_{10}) арил;

или

R^6 представляет собой $-Z^{201}-L^2-Z^{202}$, где

Z^{201} представляет собой необязательно замещенный (C_1-C_6) алкилен, необязательно замещенный (C_1-C_{10}) гетероарилен, необязательно замещенный (C_1-C_{10}) гетероциклилен или необязательно замещенный (C_6-C_{10}) арилен;

L^2 представляет собой связь, необязательно замещенный (C_1-C_4) алкилен, $-CH_2C(O)$, $-C(O)-$, $-C(O)CH_2-$, $-N(R^a)-$, $-O-$, необязательно замещенный (C_1-C_4) алкилен- $N(R^a)C(O)$ -, необязательно замещенный (C_1-C_4) алкилен- $C(O)N(R^a)-$, $-C(O)N(R^a)-$, $-N(R^a)C(O)-$, $-C(O)N(R^a)S(O)_2-$, $-S(O)_2N(R^a)C(O)-$, $-C(O)N(R^a)$ -необязательно замещенный (C_1-C_4) алкилен-, $-N(R^a)C(O)$ -необязательно замещенный (C_1-C_4) алкилен-, необязательно замещенный (C_1-C_4) алкилен- $N(R^a)C(O)$ -необязательно замещенный (C_1-C_4) алкилен-, необязательно замещенный (C_1-C_4) алкилен- $C(O)N(R^a)$ -необязательно замещенный (C_1-C_4) алкилен-, необязательно замещенный (C_1-C_4) алкилен- $N(R^a)S(O)_2-$, необязательно замещенный (C_1-C_4) алкилен- $S(O)_2N(R^a)-$, $-N(R^a)S(O)_2CH_2-$, $-S(O)_2N(R^a)$ -необязательно замещенный (C_1-C_4) алкилен-, $-S(O)_2-$, $-S(O)_2N(R^a)-$, $-N(R^a)S(O)_2-$, $-(C_1-C_4)$ алкилен-O- или $-O-(C_1-C_4)$ алкилен-;

Z^{202} представляет собой H, $-CN$, $-N(R^a)(R^b)$, $-OR^a$, необязательно замещенный

(C₁-C₆)алкил, необязательно замещенный (C₁-C₄)алкокси, необязательно замещенный (C₃-C₁₀)циклоалкил, необязательно замещенный (C₆-C₁₀)арил, необязательно замещенный (C₁-C₁₀)гетероарил или необязательно замещенный (C₁-C₁₀)гетероцикл, необязательно замещенный соединенный мостиковой связью (C₅-C₁₂)циклоалкил или необязательно замещенный соединенный мостиковой связью (C₂-C₁₀)гетероцикл;

R⁷ представляет собой H, дейтерий, необязательно замещенный-(CH₂)_n-P(=O)(OR^a)(OR^a), необязательно замещенный -(CH₂)_n-O-P(=O)(OR^a)(OR^a), необязательно замещенный -(CH₂)_n-P(=O)(OR^a)(R^a), -CH=CH-P(=O)(OR^a)(OR^a);

каждый из R^a и R^b независимо представляет собой H, дейтерий, необязательно замещенный (C₁-C₁₀)алкил, необязательно замещенный (C₂-C₁₀)алкенил, необязательно замещенный (C₂-C₁₀)алкинил, необязательно замещенный (C₁-C₁₀)алкил-O-(C₁-C₁₀)алкил, необязательно замещенный (C₃-C₁₀)циклоалкил, необязательно замещенный (C₆-C₁₀)арил, необязательно замещенный (C₁-C₁₀)гетероарил, необязательно замещенный (C₁-C₁₀)гетероцикл, необязательно замещенный -(C₁-C₆)алкилен-(C₃-C₁₀)циклоалкил, необязательно замещенный -(C₁-C₆)алкилен-(C₆-C₁₀)арил, необязательно замещенный -(C₁-C₆)алкилен-(C₁-C₁₀)гетероарил или необязательно замещенный -(C₁-C₆)алкилен-(C₁-C₁₀)гетероцикл;

в каждом случае R^e независимо представляет собой связь, необязательно замещенный (C₁-C₁₀)алкилен, необязательно замещенный (C₂-C₁₀)алкенилен, необязательно замещенный (C₂-C₁₀)алкинилен, необязательно замещенную -(C₁-C₁₀)алкилен-O-(C₁-C₁₀)алкиленовую группу, необязательно замещенный (C₃-C₁₀)циклоалкилен, необязательно замещенный (C₆-C₁₀)арилен, необязательно замещенный (C₁-C₁₀)гетероарилен или необязательно замещенный (C₁-C₁₀)гетероциклилен; и n равно 1, 2 или 3;

при условии, что R¹ и R⁶, оба не представляют собой H и если R⁶ представляет собой H, то R¹ не представляет собой H.
2. Соединение по п.1, где

R¹ представляет собой H, галоген, CF₃, CN, OH, N(R^a)(R^b), OCF₃, -C(O)-необязательно замещенный (C₁-C₆)алкил, -C(O)-необязательно замещенный (C₃-C₆)циклоалкил, -S-необязательно замещенный (C₁-C₆)алкил, -S(O)₂-необязательно замещенный (C₁-C₆)алкил, -S(O)₂N(R^a)(R^b), необязательно замещенный (C₁-C₆)алкокси, необязательно замещенный азаиндолил, необязательно замещенный азепинил, необязательно замещенный азетидинил, необязательно замещенный бензо(b)тиенил, необязательно замещенный бензофурил, необязательно замещенный бензимидазолил, необязательно замещенный бензоксазолил, необязательно замещенный бензотиазолил, необязательно замещенный бензотиадиазолил, необязательно замещенный бензоксадиазолил, необязательно замещенный 6,7-дигидро-5H-циклопентапиримидинил, необязательно замещенный фурил, необязательно замещенный имидазолил, имидазопиридинил, 5,6,7,8-тетрагидроимидазо[1,2-a]пиразинил, 5,6,7,8-тетрагидроимидазо[1,5-a]пиразинил, 5,6,7,8-тетрагидро[1,2,4]триазоло[4,3-a]пиразинил, необязательно замещенный индазолил, необязательно замещенный индолинил, необязательно замещенный индолил, необязательно замещенный изоиндолинил, необязательно замещенный изоксазолил,

необязательно замещенный изотиазолил, необязательно замещенный морфолинил, необязательно замещенный оксадиазолил, необязательно замещенный оксазолил, необязательно замещенный фенил, необязательно замещенный пиперазинил, необязательно замещенный пиперидинил, необязательно замещенный пуринил, необязательно замещенный пиранил, необязательно замещенный пиразолил, необязательно замещенный пиразоло[3,4-d]пиримидинил, необязательно замещенный пиридинил, необязательно замещенный пиримидинил, необязательно замещенный пирролидинил, 6,7-дигидро-5Н-пирроло[1,2-а]имидазолил, необязательно замещенный пирролил, необязательно замещенный пирроло[3,2-с]пиримидинил, необязательно замещенный пирроло[2,3-d]пиримидинил, необязательно замещенный пирроло[2,3-b]пиридинил, необязательно замещенный октагидропирроло[3,4-с]пирролил, необязательно замещенный хиназолинил, необязательно замещенный хинолинил, необязательно замещенный хинуклидинил, необязательно замещенный хиноксалинил, необязательно замещенный тиоморфолинил, необязательно замещенный тетрагидропиранил, необязательно замещенный тетрагидрофуранил, необязательно замещенный тетрагидроиндолил, необязательно замещенный тиазолил, необязательно замещенный тиенил, необязательно замещенный тетразолил, необязательно замещенный тиадиазолил, необязательно замещенный [1,3,5]триазилил, необязательно замещенный тиоморфолинил, необязательно замещенный триазолил или необязательно замещенный тропанил; или

R^1 представляет собой $-Z^{101}-L^1-Z^{102}$, где

Z^{101} представляет собой Н, необязательно замещенный (C_1-C_6)алкилен, необязательно замещенный (C_1-C_{10})гетероарил, необязательно замещенный (C_1-C_{10})гетероциклилен или необязательно замещенный (C_6-C_{10})арил;

L^1 представляет собой связь, необязательно замещенный (C_1-C_4)алкилен, $-\text{CH}_2\text{C}(\text{O})$, $-\text{C}(\text{O})-$, $-\text{C}(\text{O})\text{CH}_2-$, $-\text{N}(\text{R}^a)-$, $-\text{O}-$, необязательно замещенный (C_1-C_4)алкилен- $\text{N}(\text{R}^a)\text{C}(\text{O})$ -, $-\text{N}(\text{R}^a)\text{C}(\text{O})-$, $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^a)-$, $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^a)-$, $-\text{N}(\text{R}^a)\text{C}(\text{O})-$, $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^a)-$ необязательно замещенный (C_1-C_4)алкилен-, $-\text{N}(\text{R}^a)\text{C}(\text{O})$ -необязательно замещенный (C_1-C_4)алкилен-, $-\text{N}(\text{R}^a)\text{C}(\text{O})$ -необязательно замещенный (C_1-C_4)алкилен- $\text{N}(\text{R}^a)\text{C}(\text{O})$ -, $-\text{N}(\text{R}^a)\text{C}(\text{O})$ -необязательно замещенный (C_1-C_4)алкилен- $\text{N}(\text{R}^a)\text{C}(\text{O})$ -необязательно замещенный (C_1-C_4)алкилен-, $-\text{N}(\text{R}^a)\text{C}(\text{O})$ -необязательно замещенный (C_1-C_4)алкилен- $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^a)$ -необязательно замещенный (C_1-C_4)алкилен-, $-\text{N}(\text{R}^a)\text{S}(\text{O})_2$ -, $-\text{N}(\text{R}^a)\text{S}(\text{O})_2\text{CH}_2-$, $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^a)-$ необязательно замещенный (C_1-C_4)алкилен-, $-\text{S}(\text{O})_2-$, $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^a)-$, $-\text{N}(\text{R}^a)\text{S}(\text{O})_2-$ или $-\text{O}-$ (C_1-C_4)алкилен-; и

Z^{102} представляет собой $-\text{N}(\text{R}^a)(\text{R}^b)$, необязательно замещенный (C_1-C_4)алкил, необязательно замещенный (C_1-C_4)алкокси, необязательно замещенный (C_1-C_{10})гетероарил или необязательно замещенный (C_1-C_{10})гетероциклил.

3. Соединение по п.2, где R^1 представляет собой Н, галоген, CF_3 , CN , OH , $\text{N}(\text{R}^a)(\text{R}^b)$, OCF_3 , $-\text{C}(\text{O})$ -необязательно замещенный (C_1-C_6)алкил, $-\text{C}(\text{O})$ -необязательно замещенный (C_3-C_6)циклоалкил, $-\text{S}$ -необязательно замещенный (C_1-C_6)алкил, $-\text{S}(\text{O})_2$ -необязательно

замещенный (C₁-C₆)алкил, -S(O)₂N(R^a)(R^b), необязательно замещенный (C₁-C₆)алкокси, необязательно замещенный бензофуранил, необязательно замещенный бензо(б)тиенил, необязательно замещенный фуранил, необязательно замещенный имидазолил, имидазопиридинил, 5,6,7,8-тетрагидроимидазо[1,2-а]пиразинил, 5,6,7,8-тетрагидроимидазо[1,5-а]пиразинил, 5,6,7,8-тетрагидро[1,2,4]триазоло[4,3-а]пиразинил, необязательно замещенный индазолил, необязательно замещенный индолинил, необязательно замещенный индолил, необязательно замещенный изоксазолил, необязательно замещенный оксадиазолил, необязательно замещенный оксазолил, необязательно замещенный фенил, необязательно замещенный пиразолил, необязательно замещенный пиразоло[3,4-d]пиримидинил, необязательно замещенный пиридинил, необязательно замещенный пиримидинил, необязательно замещенный пирролил, необязательно замещенный октагидропирроло[3,4-с]пирролил, необязательно замещенный пирроло[2,3-с]пиридинил, необязательно замещенный хинолинил, необязательно замещенный тиазолил, необязательно замещенный тиенил или необязательно замещенный тетразолил; или

R¹ представляет собой -Z¹⁰¹-L¹-Z¹⁰², где

Z¹⁰¹ представляет собой H, необязательно замещенный (C₁-C₆)алкилен, необязательно замещенный (C₁-C₁₀)гетероарилен, необязательно замещенный (C₁-C₁₀)гетероциклилен или необязательно замещенный (C₆-C₁₀)арилен;

L¹ представляет собой связь, необязательно замещенный (C₁-C₄)алкилен, -CH₂C(O), -C(O)-, -C(O)CH₂-, -N(R^a)-, -O-, -необязательно замещенный (C₁-C₄)алкилен-N(R^a)C(O)-, -необязательно замещенный (C₁-C₄)алкилен-C(O)N(R^a)-, -C(O)N(R^a)-, -N(R^a)C(O)-, -C(O)N(R^a)-необязательно замещенный (C₁-C₄)алкилен-, -N(R^a)C(O)-необязательно замещенный (C₁-C₄)алкилен-, -C(O)N(R^a)-необязательно замещенный (C₁-C₄)алкилен-C(O), -N(R^a)C(O)-необязательно замещенный (C₁-C₄)алкилен-C(O)-, -C(O)-необязательно замещенный (C₁-C₄)алкилен-N(R^a)C(O)-, -C(O)-необязательно замещенный (C₁-C₄)алкилен-C(O)N(R^a)-, -необязательно замещенный (C₁-C₄)алкилен-N(R^a)C(O)-необязательно замещенный (C₁-C₄)алкилен-, -необязательно замещенный (C₁-C₄)алкилен-C(O)N(R^a)-необязательно замещенный (C₁-C₄)алкилен-, -необязательно замещенный (C₁-C₄)алкилен-N(R^a)S(O)₂-, -необязательно замещенный (C₁-C₄)алкилен-S(O)₂N(R^a)-, -N(R^a)S(O)₂CH₂-, -S(O)₂N(R^a)-необязательно замещенный (C₁-C₄)алкилен-, -C(O)N(R^a)S(O)₂-, -S(O)₂N(R^a)C(O)-, -S(O)₂-, -S(O)₂N(R^a)-, -N(R^a)S(O)₂- или -O-(C₁-C₄)алкилен-; и

Z¹⁰² представляет собой -N(R^a)(R^b), -необязательно замещенный (C₁-C₄)алкил, необязательно замещенный (C₁-C₄)алкокси, необязательно замещенный (C₁-C₁₀)гетероарил или необязательно замещенный (C₁-C₁₀)гетероциклил.

4. Соединение по п.3, где Z¹⁰¹ представляет собой необязательно замещенный индазолил, необязательно замещенный индолил, необязательно замещенный фенил, необязательно замещенный пиразолил или необязательно замещенный пирролил.

5. Соединение по п.4, где Z¹⁰² представляет собой -N(R^a)(R^b), -необязательно замещенный (C₁-C₄)алкил, необязательно замещенный морфолинил, необязательно

замещенный пиперазинил, необязательно замещенный пиперидинил или необязательно замещенный пирролидинил.

6. Соединение по п.1, где R^2 представляет собой H, галоген, CF_3 , CN, OR^a , $N(R^a)(R^b)$, OCF_3 , $-C(O)$ -необязательно замещенный (C_1-C_6)алкил, $-C(O)$ -необязательно замещенный (C_3-C_6)циклоалкил, $-S$ -необязательно замещенный (C_1-C_6)алкил, $-S(O)_2$ -необязательно замещенный (C_1-C_6)алкил, $-S(O)_2N(R^a)(R^b)$, необязательно замещенный (C_1-C_6)алкил, необязательно замещенный (C_1-C_6)алкокси, $-C(O)N(R^a)(R^b)$, необязательно замещенный (C_1-C_6)алкил, необязательно замещенный (C_2-C_6)алкенил, необязательно замещенный (C_2-C_6)алкинил, необязательно замещенный (C_3-C_{10})циклоалкил, необязательно замещенный азетидинил, необязательно замещенный морфолинил, необязательно замещенный пиперазинил, необязательно замещенный пиперидинил, необязательно замещенный пиранил, необязательно замещенный пирролидинил, необязательно замещенный тиоморфолинил, необязательно замещенный тетрагидропиранил, необязательно замещенный тетрагидрофуранил, необязательно замещенный тетрагидроиндолил, необязательно замещенный тетрагидропиридинил или необязательно замещенный тропанил.

7. Соединение по п.1, где R^3 представляет собой H, CF_3 , $-C(O)OR^a$, $N(R^a)(R^b)$, необязательно замещенный (C_1-C_6)алкил, необязательно замещенный (C_3-C_6)циклоалкил, необязательно замещенный азепинил, необязательно замещенный азетидинил, необязательно замещенный дигидробензофуранил, необязательно замещенный бензо [b]тиенил, необязательно замещенный изохинолинил, необязательно замещенный морфолинил, необязательно замещенный фенил, необязательно замещенный пиперазинил, необязательно замещенный пиперидинил, необязательно замещенный пиранил, необязательно замещенный пиридинил, необязательно замещенный пирролидинил, необязательно замещенный тиоморфолинил, необязательно замещенный тетрагидропиранил, необязательно замещенный тетрагидрофуранил, необязательно замещенный тетрагидроиндолил или необязательно замещенный тропанил.

8. Соединение по п.1, где R^3 представляет собой -A-D-E-G, где A представляет собой связь, $-C(O)-$, необязательно замещенный (C_1-C_6)алкилен, необязательно замещенный (C_2-C_6)алкенилен, необязательно замещенный (C_2-C_6)алкинилен, необязательно замещенный (C_3-C_8)циклоалкилен, необязательно замещенный азетидинил, необязательно замещенный морфолинил, необязательно замещенный пиперазинил, необязательно замещенный пиперидинил, необязательно замещенный пиранил, необязательно замещенный пирролидинил, необязательно замещенный тетрагидропиранил, необязательно замещенный тетрагидрофуранил, необязательно замещенный тетрагидроиндолил, необязательно замещенный тиоморфолинил, -необязательно замещенный (C_1-C_6)алкилен- $N(R^a)-$, $-R^e-C(O)N(R^a)-R^e-$, $-R^e-N(R^a)C(O)-R^e-$, $-O-R^e-$, $-N(R^a)-R^e-$, $-S-R^e-$, $-S(O)_2-R^e-$, $-S(O)R^e-$, $-C(O-R^a)(R^b)-R^e-$, $-S(O)_2N(R^a)-R^e-$, $-N(R^a)S(O)_2-R^e-$ или $-N(R^a)C(O)N(R^b)-R^e-$.

9. Соединение по п.1, где R^3 представляет собой -A-D-E-G, где D представляет собой связь, необязательно замещенный (C_1-C_8)алкилен, необязательно замещенный адамантанилен, необязательно замещенный (C_3-C_8)циклоалкилен, необязательно замещенный (C_3-C_{10})циклоалкенилен,

необязательно замещенный азаиндолил, обязательно замещенный азепанил, обязательно замещенный азетидинил, обязательно замещенный бензо(b)тиенил, обязательно замещенный бензофуранил, обязательно замещенный бензимидазолил, обязательно замещенный бензофуранил, обязательно замещенный бензоксазол, обязательно замещенный бензотиазол, обязательно замещенный бензотиадиазол, обязательно замещенный бензоксадиазол, обязательно замещенный 6,7-дигидро-5Н-циклопентапиримидинил, обязательно замещенный фуранил, обязательно замещенный имидазол, имидазопиридинил, обязательно замещенный индазол, обязательно замещенный индолинил, обязательно замещенный индолил, обязательно замещенный изоиндолинил, обязательно замещенный изоксазол, обязательно замещенный изотиазол, обязательно замещенный морфолинил, обязательно замещенный оксадиазол, обязательно замещенный оксазол, обязательно замещенный фенилен, обязательно замещенный пиперазинил, обязательно замещенный пиперидинил, обязательно замещенный пуринил, обязательно замещенный пиранил, обязательно замещенный пиразол, обязательно замещенный пиразоло[3,4-d]пиримидинил, обязательно замещенный пиридинил, обязательно замещенный пиримидинил, обязательно замещенный пирролидинил, 6,7-дигидро-5Н-пирроло[1,2-a]имидазол, обязательно замещенный пирролил, обязательно замещенный пирроло[2,3-d]пиримидинил, обязательно замещенный хиназолинил, обязательно замещенный хинолинил, обязательно замещенный хинуклидинил, обязательно замещенный хиноксалинил, обязательно замещенный тиоморфолинил, обязательно замещенный тетрагидропиранил, обязательно замещенный тетрагидрофуранил, обязательно замещенный тетрагидроиндолил, обязательно замещенный тиазол, обязательно замещенный тиенил, обязательно замещенный тетразол, обязательно замещенный тиадиазол, обязательно замещенный [1,3,5]триазинил, обязательно замещенный тиоморфолинил, обязательно замещенный триазол или обязательно замещенный тропанил.

10. Соединение по п.1, где R^3 представляет собой -A-D-E-G, где E представляет собой связь, $-R^e$ -, $-R^e-C(O)-R^e$ -, $-R^e-C(O)C(O)-R^e$ -, $-R^e-C(O)O-R^e$ -, $-R^e-C(O)N(R^a)C(O)R^e$ -, $-R^e-O-R^e$ -, $-R^e-S(O)_2-R^e$ -, $-R^e-S(O)-R^e$ -, $-R^e-S-R^e$ -, $-R^e-N(R^a)-R^e$ -, $-R^e-N(R^a)C(O)-R^e$ -, $-R^eC(O)N(R^a)R^e$ -, $-R^e-OC(O)N(R^a)-R^e$ -, $-R^e-N(R^a)C(O)OR^e$ -, $-R^e-N(R^a)C(O)N(R^b)-R^e$ -, $-R^e-N(R^a)S(O)_2-R^e$ или $-R^e-S(O)_2N(R^a)-R^e$ -, где во всех случаях E соединен или с атомом углерода, или с атомом азота в D.

11. Соединение по п.10, где E представляет собой связь, (C_1-C_6) алкилен, $-C(O)-$, $-CH_2-C(O)-$, $-C(O)CH_2-$, $-C(O)N(R^a)C(O)-$, $-O-$, $-S(O)_2-$, $-S(O)-$, $-S-$, $-N(R^a)-$, $-N(R^a)C(O)-$, $-C(O)N(R^a)-$, $-OC(O)N(R^a)-$, $-N(R^a)C(O)O-$, $-N(R^a)C(O)N(R^b)-$, $-N(R^a)S(O)_2-$ или $-S(O)_2N(R^a)-$.

12. Соединение по п.1, где R^3 представляет собой -A-D-E-G, где G представляет собой H, дейтерий, $-N(R^a)(R^b)$, галоген, $-OR^a$, $-SR^a$, $-S(O)R^a$, $-S(O)_2R^a$, $-NO_2$, $-C(O)OR^a$, $-CN$, $-C(O)N(R^a)(R^b)$, $-N(R^a)C(O)R^b$, $-N(R^a)C(O)OR^b$, $-OC(O)N(R^a)$, $-N(R^a)C(O)N(R^b)_2$, $-C(O-R^a)(R^b)_2$, $-C(O)R^a$, $-CF_3$, $-OCF_3$, $-N(R^a)S(O)_2R^b$, $-S(O)_2N(R^a)(R^b)$, $-S(O)_2N(R^a)C(O)R^b$, обязательно замещенный $-(C_1-C_6)$ алкил, обязательно замещенный $-(C_2-C_6)$ алкенил, обязательно замещенный $-(C_2-C_6)$ алкинил, обязательно замещенный $-(C_3-C_8)$ циклоалкил, обязательно замещенный азаиндолил, обязательно замещенный азепанил,

необязательно замещенный азетидинил, необязательно замещенный бензо(б)тиенил, необязательно замещенный бензофуранил, необязательно замещенный бензимидазолил, необязательно замещенный бензоксазолил, необязательно замещенный бензотиазолил, необязательно замещенный бензотиадиазолил, необязательно замещенный бензоксадиазолил, необязательно замещенный 6,7-дигидро-5Н-циклопентапиримидинил, необязательно замещенный фуранил, необязательно замещенный имидазолил, необязательно замещенный имидазопиридинил, необязательно замещенный индазолил, необязательно замещенный индолинил, необязательно замещенный индолил, необязательно замещенный изоиндолинил, необязательно замещенный изоксазолил, необязательно замещенный изотиазолил, необязательно замещенный морфолинил, необязательно замещенный оксадиазолил, необязательно замещенный оксазолил, необязательно замещенный фенил, необязательно замещенный пиперазинил, необязательно замещенный пиперидинил, необязательно замещенный пуринил, необязательно замещенный пиранил, необязательно замещенный пиразолил, необязательно замещенный пиразоло[3,4-d]пиримидинил, необязательно замещенный пиридинил, необязательно замещенный пиримидинил, необязательно замещенный пирролидинил, 6,7-дигидро-5Н-пирроло[1,2-a]имидазолил, необязательно замещенный пирролил, необязательно замещенный пирроло[2,3-d]пиримидинил, необязательно замещенный хиназолинил, необязательно замещенный хинолинил, необязательно замещенный хинуклидинил, необязательно замещенный хиноксалинил, необязательно замещенный тетрагидропиранил, необязательно замещенный тетрагидрофуранил, необязательно замещенный тетрагидроиндолил, необязательно замещенный тиазолил, необязательно замещенный тиенил, необязательно замещенный тетразолил, необязательно замещенный тиадиазолил, необязательно замещенный [1,3,5]триазилил, необязательно замещенный тиоморфолинил, необязательно замещенный триазолил, необязательно замещенный тропанил, необязательно замещенный -(C₁-C₆)алкил-(C₃-C₈)циклоалкил, необязательно замещенный -(C₁-C₆)алкилфенил, необязательно замещенный -(C₁-C₆)алкил-(C₁-C₁₀)гетероарил или необязательно замещенный -(C₁-C₆)алкил-(C₁-C₁₀)гетероцикл.

13. Соединение по п.12, где G представляет собой H, дейтерий, -N(R^a)(R^b), галоген, -OR^a, -SR^a, -S(O)R^a, -S(O)₂R^a, -NO₂, -C(O)OR^a, -CN, -C(O)N(R^a)(R^b), -N(R^a)C(O)R^b, -N(R^a)C(O)OR^b, -OC(O)N(R^a), -N(R^a)C(O)N(R^b)₂, -C(O-R^a)(R^b)₂, -C(O)R^a, -CF₃, -OCF₃, -N(R^a)S(O)₂R^b, -S(O)₂N(R^a)(R^b), -S(O)₂N(R^a)C(O)R^b, необязательно замещенный -(C₁-C₆)алкил, необязательно замещенный -(C₂-C₆)алкенил, необязательно замещенный -(C₂-C₆)алкинил, необязательно замещенный -(C₃-C₈)циклоалкил, необязательно замещенный азетидинил, необязательно замещенный фуранил, необязательно замещенный имидазолил, необязательно замещенный индолил, необязательно замещенный изоиндолинил, необязательно замещенный изоксазолил, необязательно замещенный морфолинил, необязательно замещенный фенил, необязательно замещенный пиперазинил, необязательно замещенный пиперидинил, необязательно замещенный пиразолил, необязательно замещенный пиридинил, необязательно замещенный пиримидинил, необязательно замещенный пирролидинил, необязательно замещенный пирролил, необязательно замещенный тетрагидропиранил, необязательно замещенный тетрагидрофуранил, необязательно замещенный тиазолил, необязательно замещенный тиенил, необязательно замещенный тетразолил, необязательно замещенный тиадиазолил, необязательно замещенный [1,3,5]триазилил, необязательно замещенный тиоморфолинил, необязательно замещенный триазолил, необязательно замещенный -

(C₁-C₆)алкил-(C₃-C₈)циклоалкил или необязательно замещенный -(C₁-C₆)алкилфенил.

14. Соединение по п.1, где R⁴ представляет собой H, CF₃, N(R^a)(R^b), необязательно замещенный (C₁-C₆)алкил, необязательно замещенный (C₃-C₆)циклоалкил, необязательно замещенный азаиндолил, необязательно замещенный азепинил, необязательно замещенный азетидинил, необязательно замещенный морфолинил, необязательно замещенный фенил, необязательно замещенный пиперазинил, необязательно замещенный пиперидинил, необязательно замещенный пиранил, необязательно замещенный пиридинил, необязательно замещенный пиримидинил, необязательно замещенный пирролидинил, необязательно замещенный тиоморфолинил, необязательно замещенный тетрагидропиранил, необязательно замещенный тетрагидрофуранил, необязательно замещенный тетрагидроиндолил или необязательно замещенный тропанил.

15. Соединение по п.1, где R⁴ представляет собой -J-L-M-Q, где J представляет собой связь, -C(O)-, необязательно замещенный (C₁-C₆)алкилен, необязательно замещенный (C₂-C₆)алкенилен, необязательно замещенный (C₂-C₆)алкинилен, необязательно замещенный (C₃-C₈)циклоалкилен, необязательно замещенный азетидинил, необязательно замещенный морфолинил, необязательно замещенный пиперазинил, необязательно замещенный пиперидинил, необязательно замещенный пиранил, необязательно замещенный пирролидинил, необязательно замещенный тетрагидропиранил, необязательно замещенный тетрагидрофуранил, необязательно замещенный тетрагидроиндолил, -необязательно замещенный (C₁-C₆)алкилен-N(R^a)-, -R^e-C(O)N(R^a)-R^e-, -R^e-N(R^a)C(O)-R^e-, -OR^e-, -N(R^a)-R^e-, -S-R^e-, -S(O)₂-R^e-, -S(O)R^e-, -C(O-R^a)(R^b)-R^e-, -S(O)₂N(R^a)-R^e-, -N(R^a)S(O)₂-R^e- или -N(R^a)C(O)N(R^b)-R^e-.

16. Соединение по п.1, где R⁴ представляет собой -J-L-M-Q, где L представляет собой связь, необязательно замещенный (C₁-C₈)алкилен, необязательно замещенный адамантанилен, необязательно замещенный (C₃-C₈)циклоалкилен, необязательно замещенный (C₃-C₁₀)циклоалкенилен, необязательно замещенный азаиндолил, необязательно замещенный азепинил, необязательно замещенный азетидинил, необязательно замещенный бензо(b)тиенил, необязательно замещенный бензофуранил, необязательно замещенный бензимидазолил, необязательно замещенный бензофуранил, необязательно замещенный бензоксазолил, необязательно замещенный бензотиазолил, необязательно замещенный бензотиадиазолил, необязательно замещенный бензоксадиазолил, необязательно замещенный 6,7-дигидро-5Н-циклопентапиримидинил, необязательно замещенный фуранил, необязательно замещенный имидазолил, имидазопиридинил, необязательно замещенный индазолил, необязательно замещенный индолинил, необязательно замещенный индолил, необязательно замещенный изоиндолинил, необязательно замещенный изоксазолил, необязательно замещенный изотиазолил, необязательно замещенный морфолинил, необязательно замещенный оксадиазолил, необязательно замещенный оксазолил, необязательно замещенный фенилен, необязательно замещенный пиперазинил, необязательно замещенный пиперидинил, необязательно замещенный пуринил, необязательно замещенный пиранил, необязательно замещенный пиразолил, необязательно замещенный пиразоло[3,4-d]пиримидинил, необязательно замещенный пиридинил, необязательно замещенный пиримидинил, необязательно замещенный пирролидинил, 6,7-дигидро-5Н-пирроло[1,2-a]имидазолил, необязательно замещенный пирролил, необязательно замещенный

пирроло[2,3-d]пиримидинил, необязательно замещенный хиназолинил, необязательно замещенный хинолинил, необязательно замещенный хинуклидинил, необязательно замещенный хиноксалинил, необязательно замещенный тиоморфолинил, необязательно замещенный тетрагидропиранил, необязательно замещенный тетрагидрофуранил, необязательно замещенный тетрагидроиндолил, необязательно замещенный тиазолил, необязательно замещенный тиенил, необязательно замещенный тетразолил, необязательно замещенный тиадиазолил, необязательно замещенный [1,3,5]триазилил, необязательно замещенный тиоморфолинил, необязательно замещенный триазолил или необязательно замещенный тропанил.

17. Соединение по п.1, где R^4 представляет собой -J-L-M-Q, где M представляет собой связь, $-R^e$ -, $-R^e-C(O)-R^e$ -, $-R^e-C(O)C(O)-R^e$ -, $-R^e-C(O)O-R^e$ -, $-R^e-C(O)N(R^a)C(O)R^e$ -, $-R^e-O-R^e$ -, $-R^e-S(O)_2-R^e$ -, $-R^e-S(O)-R^e$ -, $-R^e-S-R^e$ -, $-R^e-N(R^a)-R^e$ -, $-R^e-N(R^a)C(O)-R^e$ -, $-R^eC(O)N(R^a)R^e$ -, $-R^e-OC(O)N(R^a)-R^e$ -, $-R^e-N(R^a)C(O)OR^e$ -, $-R^e-N(R^a)C(O)N(R^b)-R^e$ -, $-R^e-N(R^a)S(O)_2-R^e$ - или $-R^e-S(O)_2N(R^a)-R^e$ -; где во всех случаях M соединен или с атомом углерода, или с атомом азота в L.

18. Соединение по п.17, где M представляет собой связь, (C_1-C_6) алкилен, $-C(O)-$ -, $-CH_2-C(O)-$ -, $-C(O)CH_2-$ -, $-C(O)N(R^a)C(O)-$ -, $-O-$ -, $-S(O)_2-$ -, $-S(O)-$ -, $-S-$ -, $-N(R^a)-$ -, $-N(R^a)C(O)-$ -, $-C(O)N(R^a)-$ -, $-OC(O)N(R^a)-$ -, $-N(R^a)C(O)O-$ -, $-N(R^a)C(O)N(R^b)-$ -, $-N(R^a)S(O)_2-$ - или $-S(O)_2N(R^a)-$.

19. Соединение по п.1, где R^4 представляет собой -J-L-M-Q, где Q представляет собой H, дейтерий, $-N(R^a)(R^b)$, галоген, $-OR^a$ -, $-SR^a$ -, $-S(O)R^a$ -, $-S(O)_2R^a$ -, $-NO_2$ -, $-C(O)OR^a$ -, $-CN$ -, $-C(O)N(R^a)(R^b)$ -, $-N(R^a)C(O)R^b$ -, $-N(R^a)C(O)OR^b$ -, $-OC(O)N(R^a)$ -, $-N(R^a)C(O)N(R^b)_2$ -, $-C(O-R^a)(R^b)_2$ -, $-C(O)R^a$ -, $-CF_3$ -, $-OCF_3$ -, $-N(R^a)S(O)_2R^b$ -, $-S(O)_2N(R^a)(R^b)$ -, $-S(O)_2N(R^a)C(O)R^b$ -, необязательно замещенный $-(C_1-C_6)$ алкил, необязательно замещенный $-(C_2-C_6)$ алкенил, необязательно замещенный $-(C_2-C_6)$ алкинил, необязательно замещенный $-(C_3-C_8)$ циклоалкил, необязательно замещенный азаиндолил, необязательно замещенный азепинил, необязательно замещенный азетидинил, необязательно замещенный бензо(b)тиенил, необязательно замещенный бензофуранил, необязательно замещенный бензимидазолил, необязательно замещенный бензоксазолил, необязательно замещенный бензотиазолил, необязательно замещенный бензотиадиазолил, необязательно замещенный бензоксадиазолил, необязательно замещенный 6,7-дигидро-5H-циклопентапиримидинил, необязательно замещенный фуранил, необязательно замещенный имидазолил, необязательно замещенный имидазопиридинил, необязательно замещенный индазолил, необязательно замещенный индолинил, необязательно замещенный индолил, необязательно замещенный изоиндолинил, необязательно замещенный изоксазолил, необязательно замещенный изотиазолил, необязательно замещенный морфолинил, необязательно замещенный оксадиазолил, необязательно замещенный оксазолил, необязательно замещенный фенил, необязательно замещенный пиперазинил, необязательно замещенный пиперидинил, необязательно замещенный пуринил, необязательно замещенный пиранил, необязательно замещенный пиразолил, необязательно замещенный пиразоло[3,4-d]пиримидинил, необязательно замещенный пиридинил, необязательно замещенный пиримидинил, необязательно замещенный пирролидинил, 6,7-дигидро-5H-пирроло[1,2-a]имидазолил, необязательно замещенный пирролил, необязательно замещенный пирроло[2,3-d]пиримидинил, необязательно замещенный хиназолинил, необязательно замещенный хинолинил, необязательно

замещенный хинуклидинил, необязательно замещенный хиноксалинил, необязательно замещенный тетрагидропиранил, необязательно замещенный тетрагидрофуранил, необязательно замещенный тетрагидроиндолил, необязательно замещенный тиазолил, необязательно замещенный тиенил, необязательно замещенный тетразолил, необязательно замещенный тиадиазолил, необязательно замещенный [1,3,5]триазилил, необязательно замещенный тиоморфолинил, необязательно замещенный триазолил, необязательно замещенный тропанил, необязательно замещенный $-(C_1-C_6)$ алкил- (C_3-C_8) циклоалкил, необязательно замещенный $-(C_1-C_6)$ алкилфенил, необязательно замещенный $-(C_1-C_6)$ алкил- (C_1-C_{10}) гетероарил или необязательно замещенный $-(C_1-C_6)$ алкил- (C_1-C_{10}) гетероцикл.

20. Соединение по п.19, где Q представляет собой H, дейтерий, $-N(R^a)(R^b)$, галоген, $-OR^a$, $-SR^a$, $-S(O)R^a$, $-S(O)_2R^a$, $-NO_2$, $-C(O)OR^a$, $-CN$, $-C(O)N(R^a)(R^b)$, $-N(R^a)C(O)R^b$, $-N(R^a)C(O)OR^b$, $-OC(O)N(R^a)$, $-N(R^a)C(O)N(R^b)_2$, $-C(O-R^a)(R^b)_2$, $-C(O)R^a$, $-CF_3$, $-OCF_3$, $-N(R^a)S(O)_2R^b$, $-S(O)_2N(R^a)(R^b)$, $-S(O)_2N(R^a)C(O)R^b$, необязательно замещенный $-(C_1-C_6)$ алкил, необязательно замещенный $-(C_2-C_6)$ алкенил, необязательно замещенный $-(C_2-C_6)$ алкинил, необязательно замещенный $-(C_3-C_8)$ циклоалкил, необязательно замещенный азетидинил, необязательно замещенный фуранил, необязательно замещенный имидазолил, необязательно замещенный индолил, необязательно замещенный изоиндолинил, необязательно замещенный изоксазолил, необязательно замещенный морфолинил, необязательно замещенный фенил, необязательно замещенный пиперазинил, необязательно замещенный пиперидинил, необязательно замещенный пиразолил, необязательно замещенный пиридинил, необязательно замещенный пиримидинил, необязательно замещенный пирролидинил, необязательно замещенный пирролил, необязательно замещенный тетрагидропиранил, необязательно замещенный тетрагидрофуранил, необязательно замещенный тиазолил, необязательно замещенный тиенил, необязательно замещенный тетразолил, необязательно замещенный тиадиазолил, необязательно замещенный [1,3,5]триазилил, необязательно замещенный тиоморфолинил, необязательно замещенный триазолил, необязательно замещенный $-(C_1-C_6)$ алкил- (C_3-C_8) циклоалкил или необязательно замещенный $-(C_1-C_6)$ алкилфенил.

21. Соединение по п.1, где R^6 представляет собой необязательно замещенный (C_1-C_6) алкил, необязательно замещенный (C_2-C_6) алкенил, необязательно замещенный (C_3-C_6) циклоалкил, необязательно замещенный дигидробензофуранил, необязательно замещенный бензо(b)тиенил, необязательно замещенный фуранил, необязательно замещенный индолил, необязательно замещенный изохинолинил, необязательно замещенный фенил, необязательно замещенный пиперидинил, необязательно замещенный пиридинил, необязательно замещенный пиридо[3,2-b]оксазин-3-(4H)-он, необязательно замещенный пиримидинил, необязательно замещенный пиразолил, необязательно замещенный хинолинил, необязательно замещенный хиноксалинил, необязательно замещенный тетрагидропиридинил или необязательно замещенный тиенил;

или

R^6 представляет собой $-Z^{201}-L^2-Z^{202}$, где

Z^{201} представляет собой необязательно замещенный (C_1-C_6) алкилен, необязательно замещенный фенил, необязательно замещенный пиперидинил, необязательно замещенный пиразолил, необязательно замещенный тиенил или необязательно

замещенный тетрагидропиридинил;

L^2 представляет собой связь, $-\text{CH}_2\text{C}(\text{O})-$, $-\text{C}(\text{O})\text{CH}_2$, $-\text{C}(\text{O})-$, $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^a)-$, $-\text{N}(\text{R}^a)\text{C}(\text{O})$, $-\text{S}(\text{O})_2$; необязательно замещенный (C_1-C_6) алкилен, -необязательно замещенный (C_1-C_4) алкилен- $\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^a)-$, -необязательно замещенный (C_1-C_4) алкилен- $\text{N}(\text{R}^a)\text{S}(\text{O})_2-$, $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^a)$ -необязательно замещенный (C_1-C_4) алкилен- или $-\text{O}-(\text{C}_1-\text{C}_4)$ алкилен-; и

Z^{202} представляет собой $-\text{CN}$, $-\text{N}(\text{R}^a)(\text{R}^b)$, $-\text{OR}^a$, необязательно замещенный (C_1-C_6) алкил, необязательно замещенный (C_3-C_6) циклоалкил, необязательно замещенный морфолинил, необязательно замещенный оксетанил, необязательно замещенный пиперазинил или необязательно замещенный пиперидинил.

RU 2012127368 A

RU 2012127368 A