РОССИЙСКАЯ ФЕДЕРАЦИЯ

(19) **RU** (11) **2013 105 450** (13) **A**

(51) МПК
C07D 487/04 (2006.01)

ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ

(12) ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ

(21)(22) Заявка: **2013105450/04, 08.07.2011**

Приоритет(ы):
(30) Конвенционный приоритет:
09.07.2010 US 61/363,095

(43) Дата публикации заявки: **20.08.2014** Бюл. № **23**

(85) Дата начала рассмотрения заявки PCT на национальной фазе: **11.02.2013**

(86) Заявка PCT:
DK 2011/000080 (08.07.2011)

(87) Публикация заявки PCT:
WO 2012/003829 (12.01.2012)

Адрес для переписки:
129090, Москва, ул. Б. Спасская, 25, строение 3, ООО "Юридическая фирма Городисский и Партнеры"

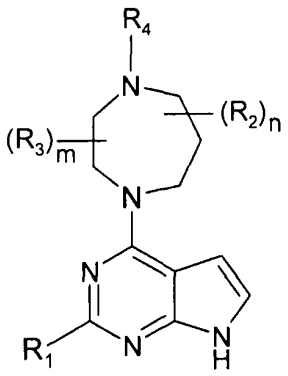
(71) Заявитель(и):
ЛЕО ФАРМА А/С (DK)

(72) Автор(ы):
НИЛЬСЕН Симон Фельдбек (DK),
ГРЕВЕ Даниель Родригез (DK),
ГРУЭ-СЕРЕНСЕН Гуннар (DK),
РЮТТЕРСГОР Карстен (DK),
СХОУ Серен Христиан (DK),
САМС Анетте Гравен (DK)

(54) НОВЫЕ ПРОИЗВОДНЫЕ ГОМОПИПЕРЗИНА В КАЧЕСТВЕ ИНГИБИТОРОВ ПРОТЕИНТИРОЗИНКИНАЗ И ИХ ФАРМАЦЕВТИЧЕСКОЕ ПРИМЕНЕНИЕ

(57) Формула изобретения

1. Соединение общей формулы I:



I

в которой m является 0, 1 или 2;

n является 2 или 4;

R_1 выбран из группы, состоящей из водорода, галогена, циано, $-NH_2$, $-SO_2NH_2$, $-SONH_2$ и $-CONH_2$;

или R_1 выбран из группы, состоящей из алкила-, гетероалкила-, циклоалкила-,

RU 2013105450 A

RU 2013105450 A

гетероциклила-, $R_{1a}O$-, $R_{1a}S$-, $(R_{1a})_2N$-, R_{1b}-C(=O)N(R_{1c})-, $R_{1b}O$-C(=O)N(R_{1c})-, $(R_{1b})_2N$-C(=O)N(R_{1c})-, R_{1b}-$S(=O)_2N(R_{1c})$- и $(R_{1b})_2N$-$S(=O)_2N(R_{1c})$-, любой из которых необязательно может быть замещен одним или несколькими R_{1d};

R_{1a} является водородом;

или R_{1a} независимо, в каждом случае, выбран из группы, состоящей из алкила-, гетероалкила-, циклоалкила-, гетероциклила-, любой из которых необязательно может быть замещен одним или несколькими R_{1e};

или в том случае, когда два R_{1a} присоединены к одному и тому же N, они, вместе с атомом N, к которому они присоединены, могут образовывать гетероцикл, который необязательно может быть замещен одним или несколькими R_{1e};

R_{1b} и R_{1c} независимо, в каждом случае, выбраны из группы, состоящей из водорода, алкила-, гетероалкила-, циклоалкила-, гетероциклила-, любой из которых необязательно может быть замещен одним или несколькими R_{1e};

или в том случае, когда два R_{1b} присоединены к одному и тому же N, они, вместе с атомом N, к которому они присоединены, могут образовывать гетероцикл, который необязательно может быть замещен одним или более R_{1e};

R_{1d} и R_{1e} независимо, в каждом случае, выбраны из группы, состоящей из галогена, циано, гидрокси, оксо, $-NH_2$, $-SO_2NH_2$, $-CONH_2$, алкила-, гетероалкила-, циклоалкила-, гетероциклила-, $R_{1f}O$, R_{1f}-, $(R_{1f})_2N$-, $R_{1f}O$-C(=O)-, $(R_{1f})_2N$-C(=O)-, R_{1f}-C(=O)N(R_{1f})-, $R_{1f}O$-C(=O)N(R_{1f})-, $(R_{1f})_2N$-C(=O)N(R_{1f})-, R_{1f}-C(=O)O-, $(R_{1f})_2N$-C(=O)O-, $(R_{1f})_2N$-$S(=O)_2$-, R_{1f}-$S(=O)_2N(R_{1f})$-;

R_{1f} независимо, в каждом случае, выбран из группы, состоящей из водорода, алкила-, гетероалкила-, циклоалкила-, гетероциклила-;

или в том случае, когда два R_{1f} присоединены к одному и тому же N, они, вместе с атомом N, к которому они присоединены, могут образовывать гетероцикл;

R_2 независимо, в каждом случае, является ковалентной связью или алкил- или гетероалкилгруппой, где любые два R_2 присоединены к одному и тому же атому C кольца, и вместе с этим атомом C кольца указанные два R_2 формируют карбоцикл или гетероцикл, всегда формируя, таким образом, спироциклический гомопиперазин;

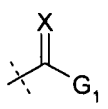
R_3 независимо, в каждом случае, выбран из группы, состоящей из галогена, циано, гидрокси, оксо, алкила-, гетероалкила-, циклоалкила-, гетероциклила-, $R_{3a}O$-, $R_{3a}S$-, $(R_{3a})_2N$-, R_{3a}-C(=O)-, $R_{3a}O$-C(=O)-, $(R_{3a})_2N$-C(=O)-, R_{3a}-C(=O)N(R_{3b})-, $R_{3a}O$-C(=O)N(R_{3b})-, R_{3a}-C(=O)O-, $(R_{3a})_2N$-C(=O)O-, R_{3a}-$S(=O)_2$-, $(R_{3a})_2N$-$S(=O)_2$-, R_{3a}-$S(=O)_2N(R_{3b})$- ;

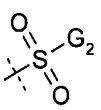
R_{3a} и R_{3b} независимо, в каждом случае, выбраны из группы, состоящей из водорода, алкила-, гетероалкила-, циклоалкила-, гетероциклила-;

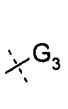
или в том случае, когда два R_{3a} присоединены к одному и тому же N, они, вместе с атомом N, к которому они присоединены, могут образовывать гетероцикл;

R_4 выбран из группы, состоящей из водорода или

R_{4a} R_{4b} R_{4c}







где X является O или S;

RU 2013105450 A

RU 2013105450 A

G_1 выбран из группы, состоящей из алкила-, гетероалкила-, алкенила-, алкинила-, циклоалкила-, циклоалкенила-, циклоалкинила-, гетероциклила-, циклоалкилалкила-, гетероциклилалкила-, $R_{G1a}O$-L-, $R_{G1a}S$-L-, $(R_{G1a})_2N$-L-, R_{G1a}-C(=O)-L-, $R_{G1a}O$-C(=O)-L-, $(R_{G1a})_2N$-C(=O)-L-, R_{G1a}-C(=O)N(R_{G1b})-L-, $R_{G1a}O$-C(=O)N(R_{G1b})-L-, $(R_{G1a})_2N$-C(=O)N(R_{G1b})-L-, R_{G1a}-C(=O)O-L-, $(R_{G1a})_2N$-C(=O)O-L-, R_{G1a}-$S(=O)_2$-L-, $(R_{G1a})_2N$-$S(=O)_2$-L-, R_{G1a}-$S(=O)_2N(R_{G1b})$-L-, $(R_{G1a})_2N$-$S(=O)_2N(R_{G1b})$-, арила-, арилокси-, арилалкила-, арилалкилокси-, арилоксиалкила-, арилоксиалкилокси-, гетероарила-, гетероарилокси-, гетероарилалкила-, гетероарилалкилокси-, гетероарилоксиалкила-, гетероарилоксиалкилокси-, любой из которых необязательно может быть замещен одним или несколькими R_{G1c};

R_{G1a} и R_{G1b} независимо, в каждом случае, выбраны из группы, состоящей из водорода, алкила-, гетероалкила-, алкенила-, алкинила-, циклоалкила-, гетероциклила-, арила- и гетероарила-, любой из которых необязательно может быть замещен одним или несколькими R_{G1c};

или в том случае, когда два R_{G1a} присоединены к одному и тому же N, они, вместе с атомом N, к которому они присоединены, могут образовывать гетероцикл, который необязательно может быть замещен одним или несколькими R_{G1c};

R_{G1c} выбран из группы, состоящей из галогена, циано, гидрокси, трифторметила, оксо, $-NH_2$, $-SO_2NH_2$, $-SONH_2$, $-CONH_2$,

или R_{G1c} выбран из группы, состоящей из алкила-, гетероалкила-, циклоалкила-, алкенила-, алкинила-, алкенилалкила-, алкинилалкила-, циклоалкенила-, циклоалкилалкила-, циклоалкилалкенила-, циклоалкилалкинила-, циклоалкенилалкила-, циклоалкенилалкенила-, циклоалкенилалкинила-, гетероциклила-, гетероциклилалкила-, гетероциклилалкенила-, гетероциклилалкинила-, $R_{G1d}O$-L-, $R_{G1d}S$-L-, $(R_{G1d})_2N$-L-, R_{G1d}-C(=O)-L-, $R_{G1d}O$-C(=O)-L-, $(R_{G1d})_2N$-C(=O)-L-, R_{G1d}-C(=O)N(R_{G1e})-L-, $R_{G1d}O$-C(=O)N(R_{G1e})-L-, $(R_{G1d})_2N$-C(=O)N(R_{G1e})-L-, R_{G1d}-C(=O)O-L-, $(R_{G1d})_2N$-C(=O)O-L-, R_{G1d}-$S(=O)_2$-L-, $(R_{G1d})_2N$-$S(=O)_2$-L-, R_{G1d}-$S(=O)_2N(R_{G1e})$-L-, $(R_{G1d})_2N$-$S(=O)_2N(R_{G1e})$-L-, арила-, арилалкила-, арилциклоалкила-, арилокси-, арилоксиалкила-, арилоксициклоалкила-, гетероарила-, гетероарилалкила-, гетероарилциклоалкила, гетероарилокси-, гетероарилоксиалкила- и гетероарилоксициклоалкила-, любой из которых необязательно может быть замещен одним или несколькими заместителями, выбранными из группы, состоящей из галогена, циано, гидрокси, трифторметила, оксо, $-NH_2$, $-SO_2NH_2$, $-SONH_2$, $-CONH_2$;

R_{G1d} и R_{G1e} независимо, в каждом случае, выбраны из группы, состоящей из водорода или алкила-, гетероалкила-, алкенила-, алкинила-, циклоалкила-, гетероциклила-, циклоалкилалкила-, гетероциклилалкила-, арила-, арилалкила-, гетероарила-, гетероарилалкила- и алкоксиалкила-, любой из которых необязательно может быть замещен одним или несколькими заместителями, выбранными из группы, состоящей из галогена, циано, гидрокси, трифторметила, оксо, $-NH_2$, $-SO_2NH_2$, $-SONH_2$, $-CONH_2$;

или в том случае, когда два R_{G1d} присоединены к одному и тому же N, они, вместе с атомом N, к которому они присоединены, могут образовывать гетероцикл, который необязательно может быть замещен одним или несколькими заместителями, выбранными из группы, состоящей из галогена, циано, гидрокси, трифторметила, оксо, $-NH_2$, $-SO_2NH_2$, $-SONH_2$, $-CONH_2$;

G_2 выбран из группы, состоящей из алкила-, гетероалкила-, алкенила-, алкинила-,

RU 2013105450 A

RU 2013105450 A

циклоалкила-, циклоалкенила-, циклоалкинила-, гетероциклила-, циклоалкилалкила-, гетероциклилалкила-, $R_{G2a}O$-L-, $R_{G2a}S$-L-, $(R_{G2a})_2N$-L-, R_{G2a}-C(=O)-L-, $R_{G2a}O$-C(=O)-L-, $(R_{G2a})_2N$-C(=O)-L-, R_{G2a}-C(=O)N(R_{G2b})-L-, $R_{G2a}O$-C(=O)N(R_{G2b})-L-, $(R_{G2a})_2N$-C(=O)N(R_{G2b})-L-, R_{G2a}-C(=O)O-L-, $(R_{G2a})_2N$-C(=O)O-L-, R_{G2a}-$S(=O)_2$-L-, $(R_{G2a})_2N$-$S(=O)_2$-L-, R_{G2a}-$S(=O)_2N(R_{G2b})$-L-, $(R_{G2a})_2N$-$S(=O)_2N(R_{G2b})$-L-, арила-, арилокси-, арилалкила-, арилалкилокси-, арилоксиалкила-, арилоксиалкилокси-, гетероарила-, гетероарилокси-, гетероарилалкила-, гетероарилалкилокси-, гетероарилоксиалкила-, гетероарилоксиалкилокси-, любой из которых необязательно может быть замещен одним или несколькими R_{G2c};

R_{G2a} и R_{G2b} независимо, в каждом случае, выбраны из группы, состоящей из водорода, алкила-, гетероалкила-, алкенила-, алкинила-, циклоалкила-, гетероциклила-, арила- и гетероарила-, любой из которых необязательно может быть замещен одним или несколькими R_{G2c};

или в том случае, когда два R_{G2a} присоединены к одному и тому же N, они, вместе с атомом N, к которому они присоединены, могут образовывать гетероцикл, который необязательно может быть замещен одним или более R_{G2c};

R_{G2c} выбран из группы, состоящей из галогена, циано, гидрокси, трифторметила, оксо, $-NH_2$, $-SO_2NH_2$, $-SONH_2$, $-CONH_2$;

или R_{G2c} выбран из группы, состоящей из алкила-, гетероалкила-, циклоалкила-, алкенила-, алкинила-, алкенилалкила-, алкинилалкила-, циклоалкенила-, циклоалкилалкила-, циклоалкилалкенила-, циклоалкилалкинила-, циклоалкенилалкила-, циклоалкенилалкенила-, циклоалкенилалкинила-, гетероциклила-, гетероциклилалкила-, гетероциклилалкенила-, гетероциклилалкинила-, $R_{G2d}O$-L-, $R_{G2d}S$-L-, $(R_{G2d})_2N$-L-, R_{G2d}-C(=O)-L-, $R_{G2d}O$-C(=O)-L-, $(R_{G2d})_2N$-C(=O)-L-, R_{G2d}-C(=O)N(R_{G2e})-L-, $R_{G2d}O$-C(=O)N(R_{G2e})-L-, $(R_{G2d})_2N$-C(=O)N(R_{G2e})-L-, R_{G2d}-C(=O)O-L-, $(R_{G2d})_2N$-C(=O)O-L-, R_{G2d}-$S(=O)_2$-L-; $(R_{G2d})_2N$-$S(=O)_2$-L-, R_{G2d}-$S(=O)_2N(R_{G2e})$-L-, $(R_{G2d})_2N$-$S(=O)_2N(R_{G2e})$-L-, арила-, арилалкила-, арилциклоалкила-, арилокси-, арилоксиалкила-, арилоксициклоалкила-, гетероарила-, гетероарилалкила-, гетероарилциклоалкила, гетероарилокси-, гетероарилоксиалкила- и гетероарилоксициклоалкила-, любой из которых необязательно может быть замещен одним или несколькими заместителями, выбранными из группы, состоящей из галогена, циано, гидрокси, трифторметила, оксо, $-NH_2$, $-SO_2NH_2$, $-SONH_2$, $-CONH_2$;

R_{G2d} и R_{G2e} независимо, в каждом случае, выбраны из группы, состоящей из алкила-, гетероалкила-, алкенила-, алкинила-, циклоалкила-, гетероциклила-, циклоалкилалкила-, гетероциклилалкила-, арила-, арилалкила-, гетероарила- и гетероарилалкила-, любой из которых необязательно может быть замещен одним или несколькими заместителями, выбранными из группы, состоящей из галогена, циано, гидрокси, трифторметила, оксо, $-NH_2$, $-SO_2NH_2$, $-SONH_2$, $-CONH_2$;

G_3 выбран из группы, состоящей из алкила-, гетероалкила-, алкенила-, алкинила-, циклоалкила-, циклоалкенила-, циклоалкинила-, гетероциклила-, циклоалкилалкила-, гетероциклилалкила-, арила-, арилокси-, арилалкила-, арилалкилокси-, арилоксиалкила-, арилоксиалкилокси-, гетероарила-, гетероарилокси-, гетероарилалкила-, гетероарилалкилокси-, гетероарилоксиалкила-, гетероарилоксиалкилокси-, любой из которых необязательно может быть замещен одним или несколькими R_{G3c};

R_{G3a} и R_{G3b} независимо, в каждом случае, выбраны из группы, состоящей из водорода,

RU 2013105450 A

RU 2013105450 A

алкила-, гетероалкила-, алкенила-, алкинила-, циклоалкила-, гетероциклила-, арила- и гетероарила-, любой из которых необязательно может быть замещен одним или несколькими R_{G3c};

или в том случае, когда два R_{G3a} присоединены к одному и тому же N, они, вместе с атомом N, к которому они присоединены, могут образовывать гетероцикл, который необязательно может быть замещен одним или более R_{G3c};

R_{G3c} выбран из группы, состоящей из галогена, циано, гидрокси, трифторметила, оксо, $-NH_2$, $-SO_2NH_2$, $-SONH_2$, $-CONH_2$;

или R_{G3c} выбран из группы, состоящей из алкила-, гетероалкила-, циклоалкила-, алкенила-, алкинила-, алкенилалкила-, алкинилалкила-, циклоалкенила-, циклоалкилалкила-, циклоалкилалкенила-, циклоалкилалкинила-, циклоалкенилалкила-, циклоалкенилалкенила-, циклоалкенилалкинила-, гетероциклила-, гетероциклилалкила-, гетероциклилалкенила-, гетероциклилалкинила-, $R_{G3d}O$-L-, $R_{G3d}S$-L-, $(R_{G3d})_2N$-L-, R_{G3d}-C(=O)-L-, $R_{G3d}O$-C(=O)-L-, $(R_{G3d})_2N$-C(=O)-L-, R_{G3d}-C(=O)N(R_{G3e})-L-, $R_{G3d}O$-C(=O)N(R_{G3e})-L-, $(R_{G3d})_2N$-C(=O)N(R_{G3e})-L-, R_{G3d}-C(=O)O-L-, $(R_{G3d})_2N$-C(=O)O-L-, R_{G3d}-$S(=O)_2$-L-, $(R_{G3d})_2N$-$S(=O)_2$-L-, R_{G3d}-$S(=O)_2N(R_{G3e})$-L-, $(R_{G3d})_2N$-$S(=O)_2N(R_{G3e})$-L-, арила-, арилалкила-, арилциклоалкила-, арилокси-, арилоксиалкила-, арилоксициклоалкила-, гетероарила-, гетероарилалкила-, гетероарилциклоалкила, гетероарилокси-, гетероарилоксиалкила- и гетероарилоксициклоалкила-, любой из которых необязательно может быть замещен одним или несколькими заместителями, выбранными из группы, состоящей из галогена, циано, гидрокси, трифторметила, оксо, $-NH_2$, $-SO_2NH_2$, $-SONH_2$, $-CONH_2$;

R_{G3d} и R_{G3e} независимо, в каждом случае, выбраны из группы, состоящей из алкила-, гетероалкила-, алкенила-, алкинила-, циклоалкила-, гетероциклила-, циклоалкилалкила-, гетероциклилалкила-, арила-, арилалкила-, гетероарила- и гетероарилалкила-, любой из которых необязательно может быть замещен одним или несколькими заместителями, выбранными из группы, состоящей из галогена, циано, гидрокси, трифторметила, оксо, $-NH_2$, $-SO_2NH_2$, $-SONH_2$, $-CONH_2$;

или в том случае, когда два R_{G3d} присоединены к одному и тому же N, они, вместе с атомом N, к которому они присоединены, могут образовывать гетероцикл, который необязательно может быть замещен одним или несколькими заместителями, выбранными из группы, состоящей из галогена, циано, гидрокси, трифторметила, оксо, $-NH_2$, $-SO_2NH_2$, $-SONH_2$, $-CONH_2$;

L является ковалентной связью или L независимо, в каждом случае, выбран из группы, состоящей из алкила-, гетероалкила-, циклоалкила-, гетероциклила-, алкилциклоалкила-, циклоалкилалкила-, арила и гетероарила;

и его фармацевтически приемлемые соли, гидраты или сольваты.

2. Соединение по п. 1, где m является 0 или 1.

3. Соединение по пп. 1 и 2, где m является 0.

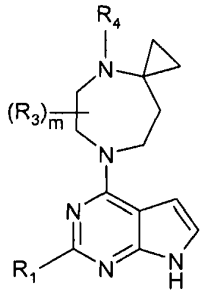
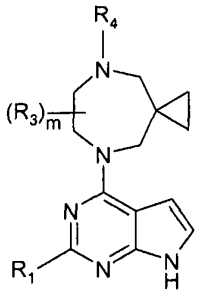
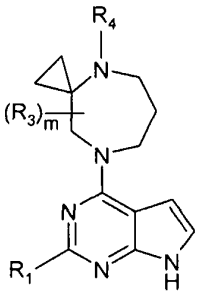
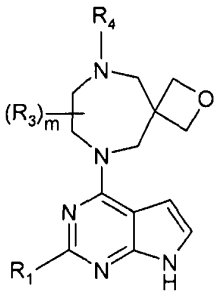
4. Соединение по п.1, где n=2.

5. Соединение по любому из пп. 1, 2 и 4, где $(R_2)_n$ вместе с углеродом С-кольца образует спироциклопропил.

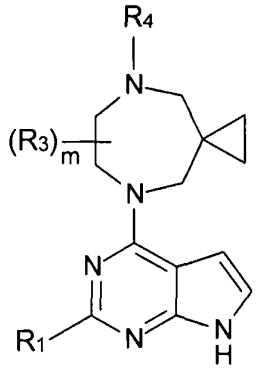
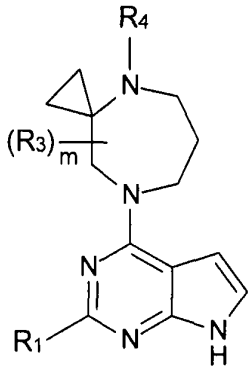
6. Соединение по п.1, где $(R_2)_n$ выбран так, чтобы образовывалось соединение, выбранное из

RU 2013105450 A

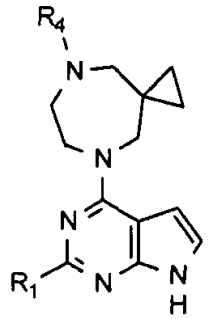
RU 2013105450 A

7. Соединение по п.1, где $(R_2)_n$ выбран так, чтобы образовывалось соединение, выбранное из

8. Соединение по п.1 общей формулы Ia:

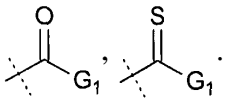


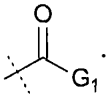
Ia

в которой R_1 и R_4 являются такими, как определено в п. 1.

9. Соединение по любому из пп.1, 2, 4 и 6-8, где R_1 выбран из водорода, $(R_{1a})_2N$-, R_{1b}-C(=O)N(R_{1c})-, R_{1b}O-C(=O)N(R_{1c})-, $(R_{1b})_2$N-C(=O)N(R_{1c})-, R_{1b}-S(=O)$_2$N(R_{1c})- и $(R_{1b})_2$N-S(=O)$_2$N(R_{1c})-.

10. Соединение по любому из пп.1, 2, 4 и 6-8, где R_1 является водородом.

11. Соединение по любому из пп.1, 2, 4 и 6-8, где R_4 выбран из группы, состоящей из водорода, .

12. Соединение по любому из пп.1, 2, 4 и 6-8, где R_4 является .

13. Соединение по любому из пп.1, 2, 4 и 6-8, где G_1 выбран из группы, состоящей из алкила-, алкенила-, циклоалкила-, гетероциклила-, R_{G1a}-C(=O)-L-, $(R_{G1a})_2$N-C(=O)-L-, арила-, арилалкила-, арилоксиалкила-, гетероарила-, гетероарилалкила-, циклоалкилалкила-, гетероциклилалкила-, $(R_{G1a})_2$N-L-, любой из которых необязательно может быть замещен одним или несколькими R_{G1c}.

14. Соединение по любому из пп.1, 2, 4 и 6-8, где G_1 выбран из группы, состоящей

RU 2013105450 A

RU 2013105450 A

из метила, этила, пропила, изопропилфенила, пиридила, индолила, тетразолила, фурила, тиазолила, имидазолила, пиразолила, оксазолила, оксадиазолила, тиофенила, 1,2,4-триазолила, изоксазолила, тиенила, пиразинила, пиримидинила, [1,2,3]триазолила, изотиазолила, бензотиофенила, 5,6-дигидро-4H-циклопента[b]тиофенила, пирролила, оксадиазолила, 1,2,5-оксадиазолила, 1,3,4-оксадиазолила, тиадиазолила, пиридазинила или 1,2,5-тиадиазолила, пиперидинила, тиазолидинила, имидазолидинила, оксазолидинила, 4,5-дигидроизоксазолила, циклопропила, циклобутила, циклопентила, циклогексила, бензила, тиенилметила, фенилэтила, тетрагидропиранила, тиенилэтила, фенилоксиметилтиазолидинилметила, имидазолидинилметила, оксазолидинилметила, пирролидинилметила, изоксазолилметила, тиазолилметила, имидазолилметила, циклопентилметила, пиридилметила, тетразолилметила, оксадиазолилметила и пиразолилметила, (алкил)$_2$-N-, фенил-NH-, любой из которых неоябязательно может быть замещен одним или несколькими R_{G1c}-.

15. Соединение по любому из пп.1, 2, 4 и 6-8, где каждый R_{G1c} независимо выбран из группы, состоящей из алкила, гетероарила, галогена, оксо, циано, гидрокси, -SO_2NH_2, -NH_2, R_{G1d}O-L-, $(R_{G1d})_2$N-S(=O)$_2$-L-, R_{G1d}-S(=O)$_2$-L-, $(R_{G1d})_2$N-S(=O)$_2$-L-.

16. Соединение по любому из пп.1, 2, 4 и 6-8, где каждый R_{G1c} независимо выбран из группы, состоящей из циано, метил-O-, метила, этила, пропила, изопропила, бутила, оксо, -SO_2NH_2, -NH_2, метил-NH-S(=O)$_2$-, (метил)$_2$-N-S(=O)$_2$-, фтора, хлора, брома, йода, метил-S(=O)$_2$-, тетразолила, гидроксила.

17. Соединение по любому из пп.1, 2, 4 и 6-8, где каждый R_{G1c} независимо выбран из группы, состоящей из циано, метил-O-, метил, оксо, -SO_2NH_2, метил-NH-S(=O)$_2$-, фтора, хлора, метил-S(=O)$_2$-.

18. Соединение по любому из пп.1, 2, 4 и 6-8, где каждый R_{G1d} независимо выбран из группы, состоящей из водорода, алкила-, циклоалкилалкила-, гетероциклилалкила-, где указанный алкил-, циклоалкилалкил-, гетероциклилалкил- необязательно могут быть замещены одним или несколькими заместителями, выбранными из группы, состоящей из галогена, циано и -SO_2NH_2.

19. Соединение по любому из пп.1, 2, 4 и 6-7, где каждый R_3 независимо выбран из циано, гидрокси, оксо, алкила-, гетероалкила-, R_{3a}O- или R_{3a}S-.

20. Соединение по любому из пп.1, 2, 4 и 6-8, которое выбрано из следующего:

4-оксо-4-[8-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нон-5-ил] бутиронитрил

(2,3-диметоксифенил)-[8-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил) 5,8-диазаспиро[2.6]нон-5-ил]метанон

3-[8-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-5-карбонил] бензонитрил

(2-метоксипиридин-3-ил)-[8-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6] нон-5-ил]метанон

3-оксо-3-[8-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нон-5-ил] пропионитрил

1-{4-[8-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-5-карбонил] пиперидин-1-ил}этанон

2-[8-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-5-карбонил] бензонитрил

2-[8-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-5-карбонил]-1H-индол-5-карбонитрил

RU 2013105450 A

RU 2013105450 A

3-{2-оксо-2-[8-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нон-5-ил]этил}бензонитрил

4-{2-оксо-2-[8-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нон-5-ил]этил}бензонитрил

2,2-диметил-3-оксо-3-[8-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нон-5-ил]пропионитрил

{4-[8-(7Н-Пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-5-карбонил]фенил}ацетонитрил

4-[1,1-дифтор-2-оксо-2-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]этил]бензонитрил

2-[3-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-карбонил]феноксиацетонитрил

2-[4-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-карбонил]феноксиацетонитрил

2-[4-[2-оксо-2-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]этил]феноксиацетонитрил

2-[3-[2-оксо-2-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]этил]феноксиацетонитрил

бензотиофен-2-ил-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]метанон

5-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-карбонил]тиофен-3-карбонитрил

4-[2-оксо-2-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]этил]бензолсульфонамид

5,6-дигидро-4Н-циклопента[b]тиофен-2-ил-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]метанон

(4-метокси-2-тиенил)-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]метанон

N,4-диметил-5-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-карбонил]тиофен-3-сульфонамид

2-метил-5-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-карбонил]тиофен-3-сульфонамид

4-метил-5-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-карбонил]тиофен-3-сульфонамид

N,2-диметил-5-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-карбонил]тиофен-3-сульфонамид

5-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-карбонил]тиофен-3-сульфонамид

N-метил-5-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-карбонил]тиофен-3-сульфонамид

2-метил-4-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-карбонил]бензолсульфонамид

1-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]-2-(2-тиенил)этанон

4-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-карбонил]бензолсульфонамид

2-хлор-4-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-карбонил]бензолсульфонамид

N,N-диметил-4-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-карбонил]бензолсульфонамид

RU 2013105450 A

RU 2013105450 A

4-[3-оксо-3-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]пропил]бензолсульфонамид

1-метил-5-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-карбонил]пиррол-2-сульфонамид

1-метил-5-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-карбонил]пиррол-3-сульфонамид

5-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-карбонил]фуран-2-сульфонамид

2-метил-5-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-карбонил]бензолсульфонамид

4-оксо-4-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]бутан-1-сульфонамид

1-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-карбонил]циклопентанкарбонитрил

4-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-карбонил]тетрагидропиран-4-карбонитрил

2-фтор-4-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-карбонил]бензонитрил

(3,5-диметоксифенил)-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]метанон

1-[6-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-6,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-карбонил]циклопропанкарбонитрил

4,4,4-трифтор-1-[6-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-6,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-ил]бутан-1-он

бензотиофен-2-ил-[6-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-6,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-ил]метанон

3-[2-оксо-2-[6-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-6,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-ил]этил]бензонитрил

2-[2-[6-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-6,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-карбонил]фенил]ацетонитрил

4-оксо-4-[6-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-6,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-ил]бутаннитрил

4-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-карбонил]-N-[2-(2-тиенил)этил]бензолсульфонамид

5-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-карбонил]тиофен-2-карбонитрил

3-метокси-4-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-карбонил]бензолсульфонамид

2-метокси-4-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-карбонил]бензолсульфонамид

4-[(E)-3-оксо-3-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]проп-1-енил]бензолсульфонамид

2-(4-метилсульфонилфенил)-1-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]этанон

4-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-карбонил]бензонитрил

3-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-карбонил]бензонитрил

3-[2-оксо-2-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-ил]этил]бензонитрил

RU 2013105450 A

RU 2013105450 A

4-[2-оксо-2-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-ил]этил]бензонитрил

1-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-карбонил]циклопропанкарбонитрил

4-оксо-4-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-ил]бутаннитрил

4-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-карбонил]бензонитрил

4-[2-оксо-2-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]этокси]бензолсульфонамид

2-оксо-2-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]-N-(4-сульфамоилфенил)ацетамид

4-[5-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-карбонил]-2-фурил]бензолсульфонамид

2-(4-йодфенил)-1-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]этанон

4-(9-бензил-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-5-ил)-7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-2-амин

4-(5-бензил-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил)-7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-2-амин

N-(2-цианоэтил)-4-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-карбонил]бензолсульфонамид

4-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-карбонил]-N-(тетрагидрофуран-2-илметил)бензолсульфонамид

3-метил-4-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-карбонил]бензолсульфонамид

N-метил-4-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-карбонил]бензолсульфонамид

3-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-карбонил]бензолсульфонамид

N-(2-метоксиэтил)-4-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-карбонил]бензолсульфонамид

4-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-карбонил]тиофен-2-сульфонамид

5-[2-оксо-2-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]этил]тиофен-2-сульфонамид

1-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]-2-[4-(2Н-тетразол-5-ил)фенил]этанон

(4-пропил-2-тиенил)-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]метанон

3-[2-оксо-2-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]этил]тиазолидин-2,4-дион

1-метил-3-[2-оксо-2-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]этил]имидазолидин-2,4-дион

3-[2-оксо-2-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]этил]оксазолидин-2-он

1-метил-3-[2-оксо-2-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]этил]имидазолидин-2-он

1-метил-3-[2-оксо-2-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-ил]этил]имидазолидин-2-он

1-[2-оксо-2-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-ил]этил]пирролидин-2,5-дион

RU 2013105450 A

RU 2013105450 A

3-[2-оксо-2-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-ил]этил]тиазолидин-2,4-дион

3-[2-оксо-2-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-ил]этил]оксазолидин-2-он

2-(5-метилизоксазол-3-ил)-1-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]этанон

1-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]-2-тиазол-4-илэтанон

2-(1Н-имидазол-5-ил)-1-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]этанон

N-фенил-5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-карбоксамид

N-фенил-5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-карботиоамид

2-циклопентил-1-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-ил]этанон

циклогексил-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-ил]метанон

4-[9-(п-толилсульфонил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-5-ил]-7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин

2-циклопентил-1-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-ил]этантион

4-[8-(п-толилсульфонил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-5-ил]-7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин

4-(8-бутилсульфонил-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-5-ил)-7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин

4-[7-метил-8-(п-толилсульфонил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-5-ил]-7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин

7-метил-N-фенил-5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-карбоксамид

4-[2-оксо-2-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]ацетил]бензонитрил

2-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-карбонил]-1Н-индол-5-сульфонамид

N-[4-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-карбонил]фенил]метансульфонамид

N-(2-цианоэтил)-N-метил-5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-сульфонамид

N,N-диэтил-5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-сульфонамид

N-циклогексил-N-метил-5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-сульфонамид

4-[2-оксо-2-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]этокси]бензонитрил

4-(5-бензил-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил)-7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин

(5-метилизоксазол-4-ил)-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]метанон

о-толил-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]метанон

о-толил-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-ил]метанон

(2-фторфенил)-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]метанон

(2-фторфенил)-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-ил]метанон

RU 2013105450 A

RU 2013105450 A

(4-фторфенил)-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]метанон

(4-фторфенил)-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-ил]метанон

4-[3-оксо-3-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]пропил]бензонитрил

3-[3-оксо-3-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]пропил]бензонитрил

4-[(Е)-3-оксо-3-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]проп-1-енил]бензонитрил

3-[2-оксо-2-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]этокси]бензонитрил

5-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-карбонил]тиофен-3-карбонитрил

5-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-карбонил]тиофен-2-карбонитрил

1,2,5-оксадиазол-3-ил-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-ил]метанон

(3-метилизоксазол-5-ил)-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-ил]метанон

(3-этил-4,5-дигидроизоксазол-5-ил)-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-ил]метанон

1-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-ил]проп-2-ен-1-он

(рац)-2-(3-этил-2,5-дигидроизоксазол-5-ил)-1-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.5]нонан-8-ил]этанон

(3-пропил-4,5-дигидроизоксазол-5-ил)-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-ил]метанон

2-(4-хлорфенил)-1-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]этанон

2-(4-хлорфенил)-1-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-ил]этанон

3-пиридил-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]метанон

3-пиридил-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-ил]метанон

4-пиридил-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]метанон

4-пиридил-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-ил]метанон

(6-гидрокси-3-пиридил)-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]метанон

(6-гидрокси-3-пиридил)-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-ил]метанон

1Н-имидазол-4-ил-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]метанон

1Н-имидазол-4-ил-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-ил]метанон

(2-метил-3-пиридил)-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]метанон

RU 2013105450 A

RU 2013105450 A

(2-метил-3-пиридил)-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-ил]метанон

(3-метил-4-пиридил)-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]метанон

(3-метил-4-пиридил)-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-ил]метанон

пиридазин-4-ил-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]метанон

2-(2,4-диметилтиазол-5-ил)-1-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-ил]этанон

(5-метилизоксазол-3-ил)-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-ил]метанон

[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-ил]-(тиадиазол-4-ил)метанон

(2,5-диметилпиразол-3-ил)-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]метанон

(3-метилимидазол-4-ил)-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]метанон

(3-метилимидазол-4-ил)-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-ил]метанон

(4-метилтиадиазол-5-ил)-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]метанон

(4-метилтиадиазол-5-ил)-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-ил]метанон

(5-метил-1Н-пиразол-3-ил)-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]метанон

(5-метил-1Н-пиразол-3-ил)-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-ил]метанон

(4-метил-3-пиридил)-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]метанон

(4-метил-3-пиридил)-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-ил]метанон

изоксазол-3-ил-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]метанон

изоксазол-3-ил-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-ил]метанон

(5-метил-1,3,4-оксадиазол-2-ил)-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-ил]метанон

оксазол-5-ил-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]метанон

оксазол-5-ил-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-ил]метанон

1Н-пиразол-4-ил-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]метанон

2-(4-фторфенил)-1-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]этанон

2-(4-фторфенил)-1-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-ил]этанон

пиримидин-5-ил-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]метанон

RU 2013105450 A

пиримидин-5-ил-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-ил]метанон

2-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-карбонил] бензонитрил

(6-гидрокси-2-пиридил)-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6] нонан-8-ил]метанон

(6-гидрокси-2-пиридил)-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6] нонан-9-ил]метанон

пиримидин-4-ил-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]метанон

пиримидин-4-ил-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-ил]метанон

2-(2-пиридил)-1-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]этанон

(3-метилпиразин-2-ил)-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6] нонан-8-ил]метанон

(6-метилпиразин-2-ил)-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6] нонан-8-ил]метанон

(3,5-диметилизоксазол-4-ил)-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро [2.6]нонан-8-ил]метанон

(2-метил-4-пиридил)-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]метанон

(2-метил-4-пиридил)-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-ил]метанон

2-(2-хлорфенил)-1-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]этанон

2-(2-хлорфенил)-1-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-ил]этанон

(5-метилизоксазол-3-ил)-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6] нонан-8-ил]метанон

(4-хлорфенил)-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]метанон

изоксазол-5-ил-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]метанон

(2-хлорфенил)-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-ил]метанон

(3-хлорфенил)-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-ил]метанон

(4-хлорфенил)-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-ил]метанон

изоксазол-5-ил-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-ил]метанон

1Н-пиразол-3-ил-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]метанон

1Н-пиразол-3-ил-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-ил]метанон

2-(3-метилизоксазол-5-ил)-1-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро [2.6]нонан-8-ил]этанон

(2-хлорфенил)-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]метанон

RU 2013105450 A

RU 2013105450 A

(3-хлорфенил)-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]метанон

(5-метилизоксазол-4-ил)-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-ил]метанон

2-пиридил-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]метанон

2-пиридил-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-ил]метанон

(2-гидрокси-4-пиридил)-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]метанон

(4-метилоксазол-5-ил)-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]метанон

(4-метилоксазол-5-ил)-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-ил]метанон

(2,5-диметилпиразол-3-ил)-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-ил]метанон

(5-метил-1,3,4-оксадиазол-2-ил)-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]метанон

[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]-(1Н-1,2,4-триазол-3-ил)метанон

(5-метилпиразин-2-ил)-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]метанон

(5-метилпиразин-2-ил)-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-ил]метанон

(6-метилпиразин-2-ил)-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-ил]метанон

(3,5-диметилизоксазол-4-ил)-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-ил]метанон

изотиазол-3-ил-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]метанон

изотиазол-3-ил-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-ил]метанон

[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]-(1,2,5-тиадиазол-3-ил)метанон

[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-ил]-(1,2,5-тиадиазол-3-ил)метанон

[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]-(1Н-триазол-4-ил)метанон

[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-ил]-(1Н-триазол-4-ил)метанон

(5-метил-1Н-пиразол-4-ил)-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]метанон

(5-метил-1Н-пиразол-4-ил)-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-ил]метанон

5-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-карбонил]-1Н-пиррол-3-карбонитрил

5-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-карбонил]-1Н-пиррол-3-карбонитрил

изотиазол-4-ил-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]метанон

RU 2013105450 A

RU 2013105450 A

изотиазол-4-ил-[5-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-ил]метанон

(5-гидрокси-1H-пиразол-3-ил)-[5-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-ил]метанон

(5-фтор-3-пиридил)-[5-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]метанон

(5-фтор-3-пиридил)-[5-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-ил]метанон

1-[5-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]-2-(1H-тетразол-5-ил)этанон

[5-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]тиазол-4-илметанон

2-(3-метилизоксазол-5-ил)-1-[5-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-ил]этанон

N-(2-цианоэтил)-N-этил-5-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-карбоксамид

N-(цианометил)-N-метил-5-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-карбоксамид

N,N-бис(цианометил)-5-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-карбоксамид

N-(2-цианоэтил)-N-метил-5-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-карбоксамид

(2R)-1-[5-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-карбонил]пирролидин-2-карбонитрил

(2S)-1-[5-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-карбонил]пирролидин-2-карбонитрил

N-изопропил-N-метил-5-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-карбоксамид

N,N-бис(2-цианоэтил)-5-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-карбоксамид

1-[5-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-ил]-2-(1H-тетразол-5-ил)этанон

[5-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-ил]тиазол-4-илметанон

[5-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-ил]-(1H-1,2,4-триазол-3-ил)метанон

(5-метилизотиазол-4-ил)-[5-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]метанон

(5-метилизотиазол-4-ил)-[5-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-ил]метанон

(5-хлор-1H-1,2,4-триазол-3-ил)-[5-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]метанон

(5-хлор-1H-1,2,4-триазол-3-ил)-[5-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-ил]метанон

(3-метилизотиазол-5-ил)-[5-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]метанон

(3-метилизотиазол-5-ил)-[5-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-ил]метанон

изотиазол-5-ил-[5-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]метанон

RU 2013105450 A

RU 2013105450 A

изотиазол-5-ил-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-ил]метанон

(3-метил-1Н-пиразол-5-ил)-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]метанон

(3-метил-1Н-пиразол-5-ил)-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-ил]метанон

[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]тиазол-5-илметанон

[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-ил]тиазол-5-илметанон

(5-метилтиазол-2-ил)-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]метанон

1Н-имидазол-5-ил-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]метанон

1Н-имидазол-5-ил-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-ил]метанон

(3-метилизоксазол-4-ил)-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]метанон

(3-метилизоксазол-4-ил)-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-ил]метанон

2-(4-метилтиазол-5-ил)-1-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]этанон

2-(2-метилтиазол-5-ил)-1-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]этанон

2-(5-метил-1Н-пиразол-3-ил)-1-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]этанон

2-(3,5-диметилизоксазол-4-ил)-1-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]этанон

2-(3-метил-1Н-1,2,4-триазол-5-ил)-1-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]этанон

2-(4-метил-1,2,5-оксадиазол-3-ил)-1-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]этанон

1-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]-2-тиазол-5-илэтанон

2-(1-метилпиразол-4-ил)-1-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]этанон

2-(2-метилтиазол-4-ил)-1-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]этанон

[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-ил]-(1Н-пиррол-2-ил)метанон

(4-амино-1,2,5-оксадиазол-3-ил)-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-ил]метанон

(5-метил-4Н-1,2,4-триазол-3-ил)-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-ил]метанон

5-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-карбонил]фуран-2-карбонитрил

2-фенил-1-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]этанон

(1-фенилциклопропил)-[5-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]метанон

RU 2013105450 A

RU 2013105450 A

2-(4-метоксифенил)-1-[5-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]этанон

2-(м-толил)-1-[5-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]этанон

2-(п-толил)-1-[5-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]этанон

2-(4-бромфенил)-1-[5-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]этанон

2-(2-нафтил)-1-[5-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]этанон

2-[4-[2-оксо-2-[5-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]этил]фенил]ацетонитрил

2-(4-трет-бутилфенил)-1-[5-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]этанон

2-(4-диметиламинофенил)-1-[5-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]этанон

2-(4-хлорфенил)-2-метил-1-[5-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]пропан-1-он

2-(2,4-дихлорфенил)-1-[5-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]этанон

2-[2-оксо-2-[5-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]этил]бензонитрил

2-фтор-5-[2-оксо-2-[5-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]этил]бензонитрил

1-[5-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]-2-[4-(трифторметокси)фенил]этанон

2-фенил-1-[5-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]пропан-1-он

N-[4-[2-оксо-2-[5-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]этил]фенил]ацетамид

(4-метил-1H-пиррол-2-ил)-[5-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-ил]метанон

2-метил-5-[5-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-9-карбонил]-1H-пиррол-3-карбонитрил

4-(5-бутил-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил)-7H-пирроло[2,3-d]пиримидин

4-(9-бензил-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-5-ил)-7H-пирроло[2,3-d]пиримидин

4-(9-бутил-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-5-ил)-7H-пирроло[2,3-d]пиримидин

N-[4-(5-бензил-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил)-7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-2-ил]пентанамид

N-[4-(9-бензил-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-5-ил)-7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-2-ил]пентанамид

[7-метил-5-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]фенилметанон

2-циклопентил-1-[7-метил-5-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]этанон

4-[2-[7-метил-5-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]-2-оксоэтил]бензонитрил

N-[4-[9-(2-фенилацетил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-5-ил]-7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-2-ил]пентанамид

N-[4-[9-(5-цианотиофен-2-карбонил)-5,9-диазаспиро[2.6]нонан-5-ил]-7H-пирроло[2,3-

RU 2013105450 A

RU 2013105450 A

d]пиримидин-2-ил]пентанамид

N-[4-[8-(5-цианотиофен-2-карбонил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-5-ил]-7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-2-ил]пентанамид

5-(7H-Пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан

4-(6,9-диазаспиро[2.6]нонан-6-ил)-7H-пирроло[2,3-d]пиримидин

4-(5,9-диазаспиро[2.6]нонан-5-ил)-7H-пирроло[2,3-d]пиримидин

4-(6-метил-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил)-7H-пирроло[2,3-d]пиримидин

N-[4-(5,9-диазаспиро[2.6]нонан-5-ил)-7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-2-ил]пентанамид

N-[4-(5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил)-7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-2-ил]пентанамид

1-[5-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-5,8-диазаспиро[2.6]нонан-8-ил]-2-[4-(трифторметил)фенил]этанон.

21. Фармацевтическая композиция, включающая соединение по любому из предыдущих пунктов или его фармацевтически приемлемую соль, гидрат или сольват вместе с фармацевтически приемлемым носителем или эксципиентом.

22. Композиция по п. 21, дополнительно включающая другое терапевтически активное соединение.

23. Соединение по любому из пп.1, 2, 4 и 6-8 для применения в терапии.

24. Соединение по любому из пп.1, 2, 4 и 6-8, предназначенное для предотвращения, лечения и/или уменьшения интенсивности заболеваний иммунной системы, таких как аутоиммунные заболевания.

25. Соединение по п. 24, предназначенное для предотвращения, лечения и/или уменьшения интенсивности кожных заболеваний, таких как псориаз, розацеа, волчанка, рассеянный склероз, ревматоидный артрит, диабет I типа и осложнения при диабете, астма, атопический дерматит, рак, аутоиммунные заболевания щитовидной железы, язвенный колит, болезнь Крона, болезнь Альцгеймера, лейкоз, болезней глаз, таких как диабетическая ретинопатия и дегенерация желтого пятна, а также других аутоиммунных заболеваний.

26. Соединение по п. 24, предназначенное для предотвращения, лечения и/или уменьшения интенсивности кожного заболевания или состояния, выбранного из группы, состоящей из пролиферативных и воспалительных заболеваний кожи, псориаза, рака, эпидермального воспаления, алопеции, атрофии кожи, вызванной стероидами атрофии кожи, старения кожи, светового старения кожи, акне, дерматита, атопического дерматита, себорейного дерматита, контактного дерматита, крапивницы, зуда и экземы.

27. Применение соединения по любому из пп. 1-20 для производства лекарственного средства для предотвращения, лечения и/или уменьшения интенсивности заболеваний иммунной системы, таких как аутоиммунные заболевания.

28. Применение по п. 27 для производства лекарственного средства для предотвращения, лечения и/или уменьшении интенсивности кожных заболеваний, таких как псориаз, розацеа, волчанка, рассеянный склероз, ревматоидный артрит, диабет I типа и осложнения при диабете, астма, атопический дерматит, рак, аутоиммунные заболевания щитовидной железы, язвенный колит, болезнь Крона, болезнь Альцгеймера, лейкоз, болезней глаз, таких как диабетическая ретинопатия и дегенерация желтого пятна, а также других аутоиммунных заболеваний.

29. Применение по любому из пп. 27-28, где лекарственное средство дополнительно включает другое терапевтически активное соединение.

30. Соединение по любому из пп. 1, 2, 4 и 6-8 для применения в качестве противовоспалительного средства, способного модулировать активность протеинтирозинкиназы семейства JAK протеинтирозинкиназ.

31. Соединение по п. 30 для применения в качестве противовоспалительного средства, способного модулировать активность протеинтирозинкиназ JAK1, JAK2, JAK3 или

RU 2013105450 A

RU 2013105450 A

TYK2.

32. Соединение по п. 31 для применения в лечении, уменьшении интенсивности или профилактике неинфекционных воспалительных или аутоиммунных заболеваний или состояний, где неинфекционные воспалительные заболевания или состояния выбраны из группы, состоящей из острых воспалительных заболеваний, таких как острое повреждение легких, острый респираторный дистресс-синдром, аллергия, анафилаксия, сепсис или реакция трансплантат-против-хозяина, или хронических воспалительных заболеваний, таких как остеоартрит, подагра, псориатический артрит, цирроз печени, рассеянный склероз, или глазных болезней или состояний, таких как неинфекционный (например, аллергический) конъюнктивит, увеит, ирит, кератит, склерит, эписклерит, симпатический офтальмит, блефарит, сухой кератоконъюнктивит или иммунологическое отторжение трансплантата роговицы, а также аутоиммунных заболеваний или состояний, выбранных из группы, состоящей из аутоиммунного гастрита, болезни Аддисона, аутоиммунной гемолитической анемии, аутоиммунного тиреоидита, хронической идиопатической крапивницы, хронической иммунной полинефропатии, диабета, диабетической нефропатии, миастении гравис, обыкновенной пузырчатки, пернициозной анемии, первичного билиарного цирроза печени, системной красной волчанки и тиреоидной орбитопатии.

33. Способ предотвращения, лечения или уменьшения интенсивности заболеваний иммунной системы, таких как аутоиммунные заболевания, включающий введение пациенту, испытывающему в этом потребность, эффективного количества соединения по любому из пп. 1-20.

34. Способ по п. 33 предотвращения, лечения или уменьшения интенсивности кожных заболеваний, таких как псориаз, розацеа, волчанка, рассеянный склероз, ревматоидный артрит, диабет I типа и осложнения при диабете, астма, атопический дерматит, рак, аутоиммунные заболевания щитовидной железы, язвенный колит, болезнь Крона, болезнь Альцгеймера, лейкоз, болезней глаз, таких как диабетическая ретинопатия и дегенерация желтого пятна, а также других аутоиммунных заболеваний.

RU 2013105450 A

RU 2013105450 A