



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ,
ПАТЕНТАМ И ТОВАРНЫМ ЗНАКАМ

(12) ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ

(21)(22) Заявка: 2009133336/04, 05.02.2008

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:

05.02.2007 US 60/888,253
16.04.2007 US 60/912,122

(43) Дата публикации заявки: 20.03.2011 Бюл. № 8

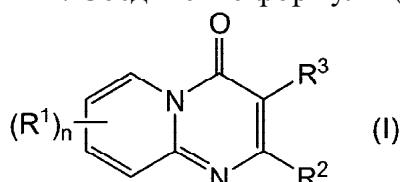
(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на
национальной фазе: 07.09.2009(86) Заявка РСТ:
US 2008/053075 (05.02.2008)(87) Публикация заявки РСТ:
WO 2008/097991 (14.08.2008)

Адрес для переписки:

129090, Москва, ул.Б.Спасская, 25, стр.3,
ООО "Юридическая фирма Городисский и
Партнеры", пат.пov. А.В.Мишу, рег.№ 364(71) Заявитель(и):
КСЕНОН ФАРМАСЮТИКАЛЗ ИНК.
(СА)(72) Автор(ы):
ЛЮ Шифэн (СА),
ФУ Цзяньминь (СА),
КАМБОДЖ Раджендер (СА),
ЦЗЯ Ци (СА),
ВУД Марк (СА),
ЧОВДХУРИ Султан (СА),
СУНЬ Цзяниу (СА)(54) ПИРИДОПИРИМИДИНОВЫЕ СОЕДИНЕНИЯ, ПРИМЕНИМЫЕ ПРИ ЛЕЧЕНИИ
ЗАБОЛЕВАНИЙ ИЛИ СОСТОЯНИЙ, ОПОСРЕДУЕМЫХ НАТРИЕВЫМИ КАНАЛАМИ

(57) Формула изобретения

1. Соединение формулы (I)



где n равен 1, 2, 3 или 4;

каждый R¹ независимо выбирают из группы, состоящей из водорода, алкила, алкенила, алкинила, галогена, галогеналкила, галогеналкенила, галогеналкинила, циклоалкила, циклоалкилалкила, циклоалкилалкенила, циклоалкилалкинила, арила, аралкила, аралкенила, аралкинила, гетероциклического арила, гетероциклического аралкила, гетероциклического аралкенила, гетероциклического аралкинила, гетероарилалкила, гетероарилалкенила, гетероарилалкинила, гетероарилалкенила, гетероарилалкенинила, -R⁶-CN, -R⁶-NO₂, -R⁶-OR⁵, -R⁶-N(R⁴)R⁵, -R⁶-S-(O)_pR⁴, -R⁶-C(O)R⁴, R⁶-C(S)R⁴, -R⁶-C(R⁴)₂C(O)R⁵, -R⁶-C(O)OR⁴, -R⁶-OC(O)R⁴, -R⁶-C(S)OR⁴, -R⁶-C(O)N(R⁴)R⁵, -R⁶-C(S)N(R⁴)R⁵, -R⁶-N(R⁵)C(O)R⁴, -R⁶-N(R⁵)C(S)R⁴, -

RU 2009133336 A

RU 2009133336 A

R^6 - $N(R^5)C(O)OR^4$, $-R^6-N(R^5)C(S)OR^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(S)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)S(O)_tR^4$, $-R^6-N(R^5)S(O)_tN(R^4)R^5$, $-R^6-S(O)_tN(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(=NR^5)N(R^4)R^5$ и $-R^6-N(R^5)C(N=C(R^4)R^5)N(R^4)R^5$, где каждый r независимо равен 0, 1 или 2, и каждый t независимо равен 1 или 2;

или две соседние группы R^1 вместе с атомами углерода, к которым они непосредственно присоединены, образуют конденсированное кольцо, выбранное из необязательно замещенного циклоалкила, необязательно замещенного арила, необязательно замещенного гетероциклила или необязательно замещенного гетероарила, и другие R^1 , если присутствуют, имеют указанные выше значения;

R^2 представляет собой водород, алкил, алкенил, алкинил, галогеналкил, галогеналкенил, галогеналкинил, циклоалкил, циклоалкилалкил, циклоалкилалкенил, арил, аралкил, аралкенил, аралкинил, гетероциклил, гетероциклилалкил, гетероциклилалкенил, гетероциклилалкинил, гетероарил, гетероарилалкил, гетероарилалкенил, гетероарилалкинил, $-R^6-OR^5$ или $-R^6-N(R^4)R^5$;

R^3 представляет собой водород, алкил, алкенил, алкинил, галогеналкил, галогеналкенил, галогеналкинил, гидроксиалкил, циклоалкил, циклоалкилалкил, циклоалкилалкенил, циклоалкилалкинил, арил, аралкил, аралкенил, аралкинил, гетероциклил, гетероциклилалкил, гетероциклилалкенил, гетероциклилалкинил, гетероарил, гетероарилалкил, гетероарилалкенил, гетероарилалкинил, $-R^6-N(R^4)R^5$ или $-R^6-N(R^4)C(O)OR^4$;

где циклоалкил, циклоалкилалкил, циклоалкилалкенил, циклоалкилалкинил, арил, аралкил, аралкенил, аралкинил, гетероциклил, гетероциклилалкил, гетероциклилалкенил, гетероциклилалкинил, гетероарил, гетероарилалкил, гетероарилалкенил и гетероарилалкинил, каждый необязательно замещен одним или несколькими заместителями, выбранными из группы, состоящей из алкила, алкенила, алкинила, галогена, галогеналкила, галогеналкенила, галогеналкинила, необязательно замещенного циклоалкила, необязательно замещенного циклоалкилалкила, необязательно замещенного циклоалкилалкенила, необязательно замещенного циклоалкилалкинила, необязательно замещенного арила, необязательно замещенного аралкила, необязательно замещенного аралкинила, необязательно замещенного гетероциклила, необязательно замещенного гетероциклилалкила, необязательно замещенного гетероциклилалкенила, необязательно замещенного гетероциклилалкинила, необязательно замещенного гетероарила, необязательно замещенного гетероарилалкила, необязательно замещенного гетероарилалкенила, необязательно замещенного гетероарилалкинила, $-R^6-CN$, $-R^6-NO_2$, $-R^6-OR^5$, $-R^6-OC(O)R^4$, $-R^6-OS(O)_2R^4$, $-R^6-C(O)R^4$, $-R^6-C(O)OR^4$, $-R^6-C(O)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(O)R^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)OR^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)S(O)_tR^4$, $-R^6-N[S(O)_tR^4]_2$, $-R^6-N(R^5)C(=NR^5)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(=NR^5)N(R^4)CN$, $-R^6-N(R^5)C[=NC(O)OR^4]-N(R^4)-C(O)OR^4$, $-R^6-N(R^5)-R^7-N(R^4)R^5$, $-R^6-N=C(OR^4)R^5$, $-R^6-N=C(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)-R^6-OR^5$, $-R^6-S(O)_pR^4$ и $-R^6-S(O)_tN(R^4)R^5$, где каждый r независимо равен 0, 1 или 2, и каждый t независимо равен 1 или 2;

каждый R^4 и R^5 независимо выбирают из группы, состоящей из водорода, алкила, алкенила, алкинила, галогеналкила, гидроксиалкила, алкоксиалкила, необязательно замещенного циклоалкила, необязательно замещенного циклоалкилалкила, необязательно замещенного арила, необязательно замещенного аралкила, необязательно замещенного гетероциклила, необязательно замещенного

гетероцикликалкила, необязательно замещенного гетероарила и необязательно замещенного гетероарилалкила;

или R^4 и R^5 вместе с атомом азота, к которому они оба присоединены, образуют необязательно замещенный N-гетероциклик или необязательно замещенный N-гетероарил;

каждый R^6 представляет собой прямую связь, необязательно замещенную линейную или разветвленную алкиленовую цепь, необязательно замещенную линейную или разветвленную алкениленовую цепь или необязательно замещенную линейную или разветвленную алкиниленовую цепь; и

R^7 представляет собой линейную или разветвленную алкиленовую цепь, линейную или разветвленную алкениленовую цепь или линейную или разветвленную алкиниленовую цепь;

в виде его стереоизомера, энантиомера, таутомера или их смеси; или его фармацевтически приемлемая соль, сольват или пролекарство.

2. Соединение по п.1, где n равен 1, 2, 3 или 4;

каждый R^1 независимо выбирают из группы, состоящей из водорода, алкила, галогена, галогеналкила, циклоалкила, циклоалкилалкила, арила, аралкила, гетероциклила, гетероцикликалкила, гетероарила, гетероарилалкила, $-R^6-CN$, $-R^6-NO_2$, $-R^6-OR^5$, $-R^6-N(R^4)R^5$, $-R^6-S-(O)_pR^4$, $-R^6-C(O)R^4$, $R^6-C(S)R^4$, $-R^6-C(R^4)_2C(O)R^5$, $-R^6-C(O)OR^4$, $-R^6-OC(O)R^4$, $-R^6-C(S)OR^4$, $-R^6-C(O)N(R^4)R^5$, $-R^6-C(S)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(O)R^4$, $-R^6-N(R^5)C(S)R^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)OR^4$, $-R^6-N(R^5)C(S)OR^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(S)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)S(O)_tR^4$, $-R^6-N(R^5)S(O)_tN(R^4)R^5$, $-R^6-S(O)_tN(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(=NR^5)N(R^4)R^5$ и $-R^6-N(R^5)C(N=C(R^4)R^5)N(R^4)R^5$, где каждый p независимо равен 0, 1 или 2, и каждый t независимо равен 1 или 2;

или две соседние группы R^1 вместе с атомами углерода, к которым они непосредственно присоединены, образуют конденсированное кольцо, выбранное из необязательно замещенного циклоалкила, необязательно замещенного арила, необязательно замещенного гетероциклила или необязательно замещенного гетероарила, и другие R^1 , если присутствуют, имеют указанные выше значения;

R^2 представляет собой водород, алкил, алкенил, галогеналкил, циклоалкил, циклоалкилалкил, арил, аралкил, гетероциклик, гетероцикликалкил, гетероарил, гетероарилалкил, $-R^6-OR^5$ или $-R^6-N(R^4)R^5$;

R^3 представляет собой водород, алкил, алкенил, галогеналкил, гидроксиалкил, циклоалкил, циклоалкилалкил, арил, аралкил, гетероциклик, гетероцикликалкил, гетероарил, гетероарилалкил, $-R^6-N(R^4)R^5$ или $-R^6-N(R^4)C(O)OR^4$;

где циклоалкил, циклоалкилалкил, арил, аралкил, гетероциклик, гетероцикликалкил, гетероарил и гетероарилалкил, каждый необязательно замещен одним или несколькими заместителями, выбранными из группы, состоящей из алкила, галогена, галогеналкила, необязательно замещенного циклоалкила, необязательно замещенного циклоалкилалкила, необязательно замещенного арила, необязательно замещенного аралкила, необязательно замещенного гетероциклила, необязательно замещенного гетероцикликалкила, необязательно замещенного гетероарила, необязательно замещенного гетероарилалкила, $-R^6-CN$, $-R^6-NO_2$, $-R^6-OR^5$, $-R^6-OC(O)R^4$, $-R^6-OS(O)_2R^4$, $-R^6-C(O)R^4$, $-R^6-C(O)OR^4$, $-R^6-C(O)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(O)R^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)OR^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)S(O)_tR^4$, $-R^6-N[S(O)_tR^4]_2$, $-R^6-N(R^5)C(=NR^5)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(=NR^5)N(R^4)CN$, $-R^6-N(R^5)C[=NC(O)OR^4]-N(R^4)-C(O)OR^4$, $-R^6-N(R^5)-R^7-N(R^4)R^5$, $-R^6-N=C(OR^4)R^5$, $-R^6-N=C(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)-R^6-OR^5$, -

R^6 -S(O)_pR⁴ и $-R^6$ -S(O)_tN(R⁴)R⁵, где каждый p независимо равен 0, 1 или 2, и каждый t независимо равен 1 или 2;

каждый R⁴ и R⁵ независимо выбирают из группы, состоящей из водорода, алкила, алкенила, алкинила, галогеналкила, гидроксиалкила, алкоксиалкила, необязательно замещенного циклоалкила, необязательно замещенного циклоалкилалкила, необязательно замещенного арила, необязательно замещенного аралкила, необязательно замещенного гетероциклила, необязательно замещенного гетероциклилалкила, необязательно замещенного гетероарила и необязательно замещенного гетероарилалкила;

или R⁴ и R⁵ вместе с атомом азота, к которому они оба присоединены, образуют необязательно замещенный N-гетероциклил или необязательно замещенный N-гетероарил;

каждый R⁶ представляет собой прямую связь или необязательно замещенную линейную или разветвленную алкиленовую цепь; и

R⁷ представляет собой линейную или разветвленную алкиленовую цепь.

3. Соединение по п.2, где n равен 1, 2, 3 или 4;

каждый R¹ независимо выбирают из группы, состоящей из водорода, алкила, галогена, галогеналкила, циклоалкила, циклоалкилалкила, арила, аралкила, гетероциклила, гетероциклилалкила, гетероарила, гетероарилалкила, -R⁶-CN, -R⁶-NO₂, -R⁶-OR⁵, -R⁶-N(R⁴)R⁵, -R⁶-S-(O)_pR⁴, -R⁶-C(O)R⁴, R⁶-C(S)R⁴, -R⁶-C(R⁴)₂C(O)R⁵, -R⁶-C(O)OR⁴, -R⁶-OC(O)R⁴, -R⁶-C(S)OR⁴, -R⁶-C(O)N(R⁴)R⁵, -R⁶-C(S)N(R⁴)R⁵, -R⁶-N(R⁵)C(O)R⁴, -R⁶-N(R⁵)C(S)R⁴, -R⁶-N(R⁵)C(O)OR⁴, -R⁶-N(R⁵)C(S)OR⁴, -R⁶-N(R⁵)C(O)N(R⁴)R⁵, -R⁶-N(R⁵)C(S)N(R⁴)R⁵, -R⁶-N(R⁵)S(O)_tR⁴, -R⁶-N(R⁵)S(O)_tN(R⁴)R⁵, -R⁶-S(O)_tN(R⁴)R⁵, -R⁶-N(R⁵)C(=NR⁵)N(R⁴)R⁵ и -R⁶-N(R⁵)C(N=C(R⁴)R⁵)N(R⁴)R⁵, где каждый p независимо равен 0, 1 или 2, и каждый t независимо равен 1 или 2;

R² представляет собой водород, алкил, алкенил, галогеналкил, циклоалкил, циклоалкилалкил, арил, аралкил, гетероциклил, гетероциклилалкил, гетероарил, гетероарилалкил, -R⁶-OR⁵ или -R⁶-N(R⁴)R⁵;

R³ представляет собой алкил, алкенил, галогеналкил, гидроксиалкил, циклоалкил, циклоалкилалкил, арил, аралкил, гетероциклил, гетероциклилалкил, гетероарил, гетероарилалкил, -R⁶-N(R⁴)R⁵ или -R⁶-N(R⁴)C(O)OR⁴;

где циклоалкил, циклоалкилалкил, арил, аралкил, гетероциклил, гетероциклилалкил, гетероарил и гетероарилалкил, каждый необязательно замещен одним или несколькими заместителями, выбранными из группы, состоящей из алкила, галогена, галогеналкила, необязательно замещенного циклоалкила, необязательно замещенного циклоалкилалкила, необязательно замещенного арила, необязательно замещенного аралкила, необязательно замещенного гетероциклила, необязательно замещенного гетероциклилалкила, необязательно замещенного гетероарила, необязательно замещенного гетероарилалкила, -R⁶-CN, -R⁶-NO₂, -R⁶-OR⁵, -R⁶-OC(O)R⁴, -R⁶-OS(O)₂R⁴, -R⁶-C(O)R⁴, -R⁶-C(O)OR⁴, -R⁶-C(O)N(R⁴)R⁵, -R⁶-N(R⁴)R⁵, -R⁶-N(R⁵)C(O)R⁴, -R⁶-N(R⁵)C(O)OR⁴, -R⁶-N(R⁵)C(O)N(R⁴)R⁵, -R⁶-N(R⁵)S(O)_tR⁴, -R⁶-N[S(O)_tR⁴]₂, -R⁶-N(R⁵)C(=NR⁵)N(R⁴)R⁵, -R⁶-N(R⁵)C(=NR⁵)N(R⁴)CN, -R⁶-N(R⁵)C[=NC(O)OR⁴]-N(R⁴)-C(O)OR⁴, -R⁶-N(R⁵)-R⁷-N(R⁴)R⁵, -R⁶-N=C(OR⁴)R⁵, -R⁶-N=C(R⁴)R⁵, -R⁶-N(R⁵)-R⁶-OR⁵, -R⁶-S(O)_pR⁴ и -R⁶-S(O)_tN(R⁴)R⁵, где каждый p независимо равен 0, 1 или 2, и каждый t независимо равен 1 или 2;

каждый R⁴ и R⁵ независимо выбирают из группы, состоящей из водорода, алкила,

алкенила, алкинила, галогеналкила, гидроксиалкила, алcoxиалкила, необязательно замещенного циклоалкила, необязательно замещенного циклоалкилалкила, необязательно замещенного арила, необязательно замещенного аралкила, необязательно замещенного гетероциклила, необязательно замещенного гетероарила и необязательно замещенного гетероарилалкила;

или R^4 и R^5 вместе с атомом азота, к которому они оба присоединены, образуют необязательно замещенный N-гетероциклил или необязательно замещенный N-гетероарил;

каждый R^6 представляет собой прямую связь или необязательно замещенную линейную или разветвленную алкиленовую цепь; и

R^7 представляет собой линейную или разветвленную алкиленовую цепь.

4. Соединение по п.3, где n равен 1, 2, 3 или 4;

каждый R^1 независимо выбирают из группы, состоящей из водорода, алкила, галогена, галогеналкила, циклоалкила, циклоалкилалкила, арила, аралкила, гетероциклила, гетероциклилалкила, гетероарила, гетероарилалкила, $-R^6-CN$, $-R^6-NO_2$, $-R^6-OR^5$, $-R^6-N(R^4)R^5$, $-R^6-S-(O)_pR^4$, $-R^6-C(O)R^4$, $R^6-C(S)R^4$, $-R^6-C(R^4)_2C(O)R^5$, $-R^6-C(O)OR^4$, $-R^6-OC(O)R^4$, $-R^6-C(S)OR^4$, $-R^6-C(O)N(R^4)R^5$, $-R^6-C(S)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(O)R^4$, $-R^6-N(R^5)C(S)R^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)OR^4$, $-R^6-N(R^5)C(S)OR^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(S)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)S(O)_tR^4$, $-R^6-N(R^5)S(O)_tN(R^4)R^5$, $-R^6-S(O)_tN(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(=NR^5)N(R^4)R^5$ и $-R^6-N(R^5)C(N=C(R^4)R^5)N(R^4)R^5$, где каждый r независимо равен 0, 1 или 2, и каждый t независимо равен 1 или 2;

R^2 представляет собой водород, алкил, алкенил, галогеналкил, циклоалкил, циклоалкилалкил, арил, аралкил, гетероциклил, гетероциклилалкил, гетероарил, гетероарилалкил, $-R^6-OR^5$ или $-R^6-N(R^4)R^5$;

R^3 представляет собой арил, аралкил, гетероциклил, гетероциклилалкил, гетероарил или гетероарилалкил, где арил, аралкил, гетероциклил, гетероциклилалкил, гетероарил и гетероарилалкил, каждый необязательно замещен одним или несколькими заместителями, выбранными из группы, состоящей из алкила, галогена, галогеналкила, необязательно замещенного циклоалкила, необязательно замещенного циклоалкилалкила, необязательно замещенного арила, необязательно замещенного аралкила, необязательно замещенного гетероциклила, необязательно замещенного гетероциклилалкила, необязательно замещенного гетероарила, необязательно замещенного гетероарилалкила, $-R^6-CN$, $-R^6-NO_2$, $-R^6-OR^5$, $-R^6-OC(O)R^4$, $-R^6-OS(O)_2R^4$, $-R^6-C(O)R^4$, $-R^6-C(O)OR^4$, $-R^6-C(O)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(O)R^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)OR^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)S(O)_tR^4$, $-R^6-N[S(O)_tR^4]_2$, $-R^6-N(R^5)C(=NR^5)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(=NR^5)N(R^4)CN$, $-R^6-N(R^5)C[=NC(O)OR^4]-N(R^4)C(O)OR^4$, $-R^6-N(R^5)-R^7-N(R^4)R^5$, $-R^6-N=C(OR^4)R^5$, $-R^6-N=C(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)-R^6-OR^5$, $-R^6-S(O)_pR^4$ и $-R^6-S(O)_tN(R^4)R^5$, где каждый r независимо равен 0, 1 или 2, и каждый t независимо равен 1 или 2;

каждый R^4 и R^5 независимо выбирают из группы, состоящей из водорода, алкила, алкенила, алкинила, галогеналкила, гидроксиалкила, алcoxиалкила, необязательно замещенного циклоалкила, необязательно замещенного циклоалкилалкила, необязательно замещенного арила, необязательно замещенного аралкила, необязательно замещенного гетероциклила, необязательно замещенного гетероциклилалкила, необязательно замещенного гетероарила и необязательно замещенного гетероарилалкила;

или R^4 и R^5 вместе с атомом азота, к которому они оба присоединены, образуют необязательно замещенный N-гетероциклик или необязательно замещенный N-гетероарил;

каждый R^6 представляет собой прямую связь или необязательно замещенную линейную или разветвленную алкиленовую цепь; и

R^7 представляет собой линейную или разветвленную алкиленовую цепь.

5. Соединение по п.4, где n равен 1, 2, 3 или 4;

каждый R^1 независимо выбирают из группы, состоящей из водорода, алкила, галогена, галогеналкила, $-R^6-CN$, $-R^6-NO_2$, $-R^6-OR^5$, $-R^6-N(R^4)R^5$, $-R^6-S-(O)_pR^4$, $-R^6-C(O)R^4$, $-R^6-C(O)OR^4$, $-R^6-C(O)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(O)R^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)OR^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)S(O)_tR^4$, $-R^6-N(R^5)S(O)_tN(R^4)R^5$, $-R^6-S(O)_tN(R^4)R^5$ и $-R^6-N(R^5)C(=NR^5)N(R^4)R^5$, где каждый p независимо равен 0, 1 или 2, и каждый t независимо равен 1 или 2;

R^2 представляет собой алкил, галогеналкил, циклоалкилалкил, аралкил, гетероцикликлалкил или гетероарилалкил;

R^3 представляет собой арил, необязательно замещенный одним или несколькими заместителями, выбранными из группы, состоящей из алкила, галогена, галогеналкила, необязательно замещенного циклоалкила, необязательно замещенного циклоалкилалкила, необязательно замещенного арила, необязательно замещенного аралкила, необязательно замещенного гетероциклика, необязательно замещенного гетероцикликлалкила, необязательно замещенного гетероарила, необязательно замещенного гетероарилалкила, $-R^6-CN$, $-R^6-NO_2$, $-R^6-OR^5$, $-R^6-OC(O)R^4$, $-R^6-OS(O)_2R^4$, $-R^6-C(O)R^4$, $-R^6-C(O)OR^4$, $-R^6-C(O)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(O)R^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)OR^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)S(O)_tR^4$, $-R^6-N[S(O)_tR^4]_2$, $-R^6-N(R^5)C(=NR^5)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(=NR^5)N(R^4)CN$, $-R^6-N(R^5)C[=NC(O)OR^4]N(R^4)C(O)OR^4$, $-R^6-N(R^5)-R^7-N(R^4)R^5$, $-R^6-N=C(OR^4)R^5$, $-R^6-N=C(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)-R^6-OR^5$, $-R^6-S(O)_pR^4$ и $-R^6-S(O)_tN(R^4)R^5$, где каждый p независимо равен 0, 1 или 2, и каждый t независимо равен 1 или 2;

каждый R^4 и R^5 независимо выбирают из группы, состоящей из водорода, алкила, алкенила, алкинила, галогеналкила, гидроксиалкила, алкоксиалкила, необязательно замещенного циклоалкила, необязательно замещенного циклоалкилалкила, необязательно замещенного арила, необязательно замещенного аралкила, необязательно замещенного гетероциклика, необязательно замещенного гетероцикликлалкила, необязательно замещенного гетероарила и необязательно замещенного гетероарилалкила;

или R^4 и R^5 вместе с атомом азота, к которому они оба присоединены, образуют необязательно замещенный N-гетероциклик или необязательно замещенный N-гетероарил;

каждый R^6 представляет собой прямую связь или необязательно замещенную линейную или разветвленную алкиленовую цепь; и

R^7 представляет собой линейную или разветвленную алкиленовую цепь.

6. Соединение по п.5, где n равен 1, 2, 3 или 4;

каждый R^1 независимо выбирают из группы, состоящей из водорода, алкила, галогена и галогеналкила;

R^2 представляет собой алкил, галогеналкил или циклоалкил;

R^3 представляет собой фенил, необязательно замещенный одним или несколькими

заместителями, выбранными из группы, состоящей из алкила, галогена, галогеналкила, необязательно замещенного циклоалкила, необязательно замещенного циклоалкилалкила, необязательно замещенного арила, необязательно замещенного аралкила, необязательно замещенного гетероциклила, необязательно замещенного гетероциклилалкила, необязательно замещенного гетероарилалкила, -R⁶-CN, -R⁶-NO₂, -R⁶-OR⁵, -R⁶-OC(O)R⁴, -R⁶-OS(O)₂R⁴, -R⁶-C(O)R⁴, -R⁶-C(O)OR⁴, -R⁶-C(O)N(R⁴)R⁵, -R⁶-N(R⁴)R⁵, -R⁶-N(R⁵)C(O)R⁴, -R⁶-N(R⁵)C(O)OR⁴, -R⁶-N(R⁵)C(O)N(R⁴)R⁵, -R⁶-N(R⁵)S(O)_tR⁴, -R⁶-N[S(O)_tR⁴]₂, -R⁶-N(R⁵)C(=NR⁵)N(R⁴)R⁵, -R⁶-N(R⁵)C(=NR⁵)N(R⁴)CN, -R⁶-N(R⁵)C[=NC(O)OR⁴]-N(R⁴)-C(O)OR⁴, -R⁶-N(R⁵)-R⁷-N(R⁴)R⁵, -R⁶-N=C(OR⁴)R⁵, -R⁶-N=C(R⁴)R⁵, -R⁶-N(R⁵)-R⁶-OR⁵, -R⁶-S(O)_pR⁴ и -R⁶-S(O)_tN(R⁴)R⁵, где каждый p независимо равен 0, 1 или 2, и каждый t независимо равен 1 или 2;

каждый R⁴ и R⁵ независимо выбирают из группы, состоящей из водорода, алкила, алкенила, алкинила, галогеналкила, гидроксиалкила, алкоксиалкила, необязательно замещенного циклоалкила, необязательно замещенного циклоалкилалкила, необязательно замещенного арила, необязательно замещенного аралкила, необязательно замещенного гетероциклила, необязательно замещенного гетероарила и необязательно замещенного гетероарилалкила;

или R⁴ и R⁵ вместе с атомом азота, к которому они оба присоединены, образуют необязательно замещенный N-гетероциклик или необязательно замещенный N-гетероарил;

каждый R⁶ представляет собой прямую связь или необязательно замещенную линейную или разветвленную алкиленовую цепь; и

R⁷ представляет собой линейную или разветвленную алкиленовую цепь.

7. Соединение по п.6, где n равен 1, 2, 3 или 4;

каждый R¹ независимо выбирают из группы, состоящей из водорода, алкила, галогена и галогеналкила;

R² представляет собой алкил, галогеналкил или циклоалкил;

R³ представляет собой фенил, необязательно замещенный одним или несколькими заместителями, выбранными из группы, состоящей из галогена, алкила, галогеналкила, -R⁶-OR⁵, -R⁶-OC(O)R⁴, -R⁶-OS(O)₂R⁴, -R⁶-N(R⁴)R⁵, -R⁶-N(R⁵)C(O)R⁴, -R⁶-N(R⁵)C(O)OR⁴, -R⁶-N(R⁵)C(O)N(R⁴)R⁵, -R⁶-N(R⁵)S(O)_tR⁴ и -R⁶-N(R⁵)C(=NR⁵)N(R⁴)R⁵;

каждый R⁴ и R⁵ независимо выбирают из группы, состоящей из водорода, алкила, алкенила, алкинила, галогеналкила, гидроксиалкила, алкоксиалкила, необязательно замещенного циклоалкила, необязательно замещенного циклоалкилалкила, необязательно замещенного арила, необязательно замещенного аралкила, необязательно замещенного гетероциклила, необязательно замещенного гетероарила и необязательно замещенного гетероарилалкила;

или R⁴ и R⁵ вместе с атомом азота, к которому они оба присоединены, образуют необязательно замещенный N-гетероциклик или необязательно замещенный N-гетероарил; и

каждый R⁶ представляет собой прямую связь или необязательно замещенную линейную или разветвленную алкиленовую цепь.

8. Соединение по п.7, выбранное из группы, включающей

2-бутил-3-(4-метоксифенил)-4Н-пиридо[1,2-а]пиримидин-4-он;

2-бутил-3-(4-аминофенил)-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-4-он;
2-бутил-3-(4-гидроксифенил)-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-4-он;
2-бутил-3-(4-хлорфенил)-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-4-он;
трет-бутил-3-{{4-(2-бутил-4-оксо-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-3-ил)фенил]амино}
пиrrолидин-1-карбоксилат;
(S)-трет-бутил-2-{{4-(2-бутил-4-оксо-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-3-ил)фенил]
карбамоил}пиrrолидин-1-карбоксилат;
трет-бутил-4-(2-бутил-4-оксо-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-3-ил)фенилкарбамат;
2-бутил-3-(3-хлор-4-метоксифенил)-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-4-он;
2-бутил-3-(3-хлорфенил)-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-4-он;
2-бутил-3-(4-хлор-3-фторфенил)-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-4-он;
3-(4-хлорфенил)-2-(трифторметил)-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-4-он;
4-(2-бутил-4-оксо-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-3-ил)фенилтрифторметансульфонат;
(S)-трет-бутил-3-(4-(2-бутил-4-оксо-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-3-
ил)фениламино)пиrrолидин-1-карбоксилат;
(R)-трет-бутил-3-(4-(2-бутил-4-оксо-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-3-
ил)фениламино)пиrrолидин-1-карбоксилат;
трет-бутил-3-(3-(2-бутил-4-оксо-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-3-
ил)фениламино)пиrrолидин-1-карбоксилат;
трет-бутил-3-{{4-[2-(1-метилэтил)-4-оксо-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-3-ил]фенил}
амино)пиrrолидин-1-карбоксилат;
(R)-трет-бутил-3-(4-(2-бутил-4-оксо-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-3-ил)-2-
фторфениламино)пиrrолидин-1-карбоксилат;
2-бутил-3-(4-(пиrrолидин-3-иламино)фенил)-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-4-он;
(S)-N-[4-(2-бутил-4-оксо-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-3-ил)фенил]-L-пролинамид;
(S)-2-бутил-3-{{4-[пиrrолидин-3-иламино]фенил}-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-4-он;
(R)-2-бутил-3-(4-(пиrrолидин-3-иламино)фенил)-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-4-он;
(R)-2-бутил-3-{{3-фтор-4-[(пиrrолидин-3-иламино]фенил}-4Н-пиридо[1,2-а]
пиrimидин-4-он;
2-бутил-3-[3-(пиrrолидин-3-иламино)фенил]-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-4-он;
2-(1-метилэтил)-3-[4-(пиrrолидин-3-иламино)фенил]-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-4-
он;
3-(4-хлорфенил)-2-метил-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-4-он;
3-(4-хлорфенил)-2-этил-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-4-он;
3-(4-хлорфенил)-2-пропил-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-4-он;
2-бутил-3-(2-хлорфенил)-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-4-он;
2-бутил-3-(4-хлор-2-метилфенил)-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-4-он;
2-бутил-3-(4-хлор-3-метилфенил)-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-4-он;
2-бутил-3-(4-хлор-3-(трифторметил)фенил)-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-4-он;
3-(4-хлорфенил)-2-изопентил-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-4-он;
3-(4-хлорфенил)-2-(2-циклогексилэтокси)-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-4-он;
2-бутил-3-(4-хлорфенил)-7-метил-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-4-он;
2-бутил-3-(4-хлорфенил)-7-фтор-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-4-он;
2-бутил-3-(4-хлорфенил)-8-(трифторметил)-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-4-он;
2-бутил-7-хлор-3-(4-метоксифенил)-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-4-он;
трет-бутил-3-{{4-(2-бутил-4-оксо-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-3-ил)фенил]амино}
пиperидин-1-карбоксилат;
(R)-трет-бутил-3-{{4-(2-бутил-4-оксо-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-3-ил)фенил]амино}
пиperидин-1-карбоксилат;
трет-бутил-4-{{4-(2-бутил-4-оксо-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-3-ил)фенил]амино}

RU 200913336 А

пиперидин-1-карбоксилат;

(R)-трет-бутил-3-(4-(2-метил-4-оксо-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-3-ил)фениламино)пирролидин-1-карбоксилат;

(R)-трет-бутил-3-(4-(2-этил-4-оксо-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-3-ил)фениламино)пирролидин-1-карбоксилат;

(R)-трет-бутил-3-(4-(4-оксо-2-пропил-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-3-ил)фениламино)пирролидин-1-карбоксилат;

(R)-трет-бутил-3-{[4-(2-бутил-4-оксо-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-3-ил)фенил]амино}пирролидин-1-карбоксилат;

(R)-трет-бутил-3-(4-(2-изопентил-4-оксо-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-3-ил)фениламино)пирролидин-1-карбоксилат;

(R)-трет-бутил-3-(4-(2-(2-цикlopропилэтил)-4-оксо-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-3-ил)фениламино)пирролидин-1-карбоксилат;

трет-бутил-3-{[4-(2-бутил-7-метил-4-оксо-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-3-ил)фенил]амино}пирролидин-1-карбоксилат;

трет-бутил-3-{[4-(2-бутил-7-фтор-4-оксо-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-3-ил)фенил]амино}пирролидин-1-карбоксилат;

(R)-трет-бутил-3-({4-[2-бутил-4-оксо-8-(трифторметил)-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-3-ил]фенил}амино)пирролидин-1-карбоксилат;

2-бутил-3-(4-морфолин-4-илфенил)-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-4-он;

2-бутил-3-[4-(тетрагидро-2Н-пиран-4-иламино)фенил]-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-4-он;

(R)-2-бутил-3-(4-{{тетрагидрофуран-2-илметил}амино}фенил)-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-4-он;

(S)-2-бутил-3-(4-{{тетрагидрофуран-2-илметил}амино}фенил)-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-4-он;

гидрохлорид (R)-2-бутил-3-{4-[тетрагидрофуран-3-иламино]фенил}-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-4-она;

2-бутил-3-[4-(пиперидин-3-иламино)фенил]-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-4-он;

2-бутил-3-[4-(пиперидин-4-иламино)фенил]-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-4-он;

(R)-2-бутил-3-{4-[пиперидин-3-иламино]фенил}-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-4-он;

(R)-2-метил-3-(4-(пирролидин-3-иламино)фенил)-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-4-он;

(R)-2-этил-3-(4-(пирролидин-3-иламино)фенил)-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-4-он;

(R)-2-пропил-3-(4-(пирролидин-3-иламино)фенил)-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-4-он;

(R)-2-бутил-7-метил-3-{4-[пирролидин-3-иламино]фенил}-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-4-он;

(R)-2-бутил-7-фтор-3-{4-[пирролидин-3-иламино]фенил}-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-4-он;

(R)-2-бутил-3-{4-[пирролидин-3-иламино]фенил}-8-(трифторметил)-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-4-он;

(R)-2-бутил-3-{2-метил-4-[пирролидин-3-иламино]фенил}-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-4-он;

(R)-2-изопентил-3-(4-(пирролидин-3-иламино)фенил)-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-4-он;

(R)-2-(2-цикlopропилэтил)-3-(4-(пирролидин-3-иламино)фенил)-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-4-он;

(R)-2-бутил-3-(4-{{1-метилпирролидин-3-ил}амино}фенил)-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-4-он;

(R)-2-бутил-3-(4-{{метил[1-метилпирролидин-3-ил]амино}фенил}-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-4-он;

A
6
6
3
3
3
1
1
9
0
0
2
R
U

R
U
2
0
0
9
1
3
3
3
3
6
A

2-бутил-7-хлор-3-(4-гидроксифенил)-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-4-он;
трет-бутил-(R)-3-[4-(2-бутил-4-оксо-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-3-ил)фенокси]
пиrrолидин-1-карбоксилат;
(R)-2-бутил-3-{4-[пиrrолидин-3-илокси]фенил}-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-4-он;
трет-бутил-3-{[4-(2-бутил-4-оксо-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-3-ил)фенил]
(метил)амино}пиперидин-1-карбоксилат и
2-бутил-3-{4-[метил(пиперидин-3-ил)амино]фенил}-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-4-он.

9. Соединение по п.4, где

п равен 1, 2, 3 или 4;

каждый R¹ независимо выбирают из группы, состоящей из водорода, алкила, галогена, галогеналкила, -R⁶-CN, -R⁶-NO₂, -R⁶-OR⁵, -R⁶-N(R⁴)R⁵, -R⁶-S-(O)_pR⁴, -R⁶-C(O)R⁴, -R⁶-C(O)OR⁴, -R⁶-C(O)N(R⁴)R⁵, -R⁶-N(R⁵)C(O)R⁴, -R⁶-N(R⁵)C(O)OR⁴, -R⁶-N(R⁵)C(O)N(R⁴)R⁵, -R⁶-N(R⁵)S(O)_tR⁴, -R⁶-N(R⁵)S(O)_tN(R⁴)R⁵, -R⁶-S(O)_tN(R⁴)R⁵ и -R⁶-N(R⁵)C(=NR⁵)N(R⁴)R⁵, где каждый p независимо равен 0, 1 или 2, и каждый t независимо равен 1 или 2;

R² представляет собой -R⁶-OR⁵ или -R⁶-N(R⁴)R⁵;

R³ представляет собой арил, необязательно замещенный одним или несколькими заместителями, выбранными из группы, состоящей из алкила, галогена, галогеналкила, необязательно замещенного циклоалкила, необязательно замещенного циклоалкилалкила, необязательно замещенного арила, необязательно замещенного аралкила, необязательно замещенного гетероциклила, необязательно замещенного гетероциклилалкила, необязательно замещенного гетероарила, необязательно замещенного гетероарилалкила, -R⁶-CN, -R⁶-NO₂, -R⁶-OR⁵, -R⁶-OC(O)R⁴, -R⁶-OS(O)₂R⁴, -R⁶-C(O)R⁴, -R⁶-C(O)OR⁴, -R⁶-C(O)N(R⁴)R⁵, -R⁶-N(R⁴)R⁵, -R⁶-N(R⁵)C(O)R⁴, -R⁶-N(R⁵)C(O)OR⁴, -R⁶-N(R⁵)C(O)N(R⁴)R⁵, -R⁶-N(R⁵)S(O)_tR⁴, -R⁶-N[S(O)_tR⁴]₂, -R⁶-N(R⁵)C(=NR⁵)N(R⁴)R⁵, -R⁶-N(R⁵)C(=NR⁵)N(R⁴)CN, -R⁶-N(R⁵)C[=NC(O)OR⁴]-N(R⁴)-C(O)OR⁴, -R⁶-N(R⁵)-R⁷-N(R⁴)R⁵, -R⁶-N=C(OR⁴)R⁵, -R⁶-N=C(R⁴)R⁵, -R⁶-N(R⁵)-R⁶-OR⁵, -R⁶-S(O)_pR⁴ и -R⁶-S(O)_tN(R⁴)R⁵, где каждый p независимо равен 0, 1 или 2, и каждый t независимо равен 1 или 2;

каждый R⁴ и R⁵ независимо выбирают из группы, состоящей из водорода, алкила, алкенила, алкинила, галогеналкила, гидроксиалкила, алкоксиалкила, необязательно замещенного циклоалкила, необязательно замещенного циклоалкилалкила, необязательно замещенного арила, необязательно замещенного аралкила, необязательно замещенного гетероциклила, необязательно замещенного гетероциклилалкила, необязательно замещенного гетероарила и необязательно замещенного гетероарилалкила;

или R⁴ и R⁵ вместе с атомом азота, к которому они оба присоединены, образуют необязательно замещенный N-гетероциклик или необязательно замещенный N-гетероарил;

каждый R⁶ представляет собой прямую связь или необязательно замещенную линейную или разветвленную алкиленовую цепь; и

R⁷ представляет собой линейную или разветвленную алкиленовую цепь.

10. Соединение по п.9, где п равен 1, 2, 3 или 4;

каждый R¹ представляет собой водород;

R² представляет собой -R⁶-OR⁵ или -R⁶-N(R⁴)R⁵;

R³ представляет собой фенил, необязательно замещенный одним или несколькими

заместителями, выбранными из группы, состоящей из алкила, галогена, галогеналкила, необязательно замещенного циклоалкила, необязательно замещенного циклоалкилалкила, необязательно замещенного арила, необязательно замещенного аралкила, необязательно замещенного гетероциклила, необязательно замещенного гетероциклилалкила, необязательно замещенного гетероарилалкила, -R⁶-CN, -R⁶-NO₂, -R⁶-OR⁵, -R⁶-OC(O)R⁴, -R⁶-OS(O)₂R⁴, -R⁶-C(O)R⁴, -R⁶-C(O)OR⁴, -R⁶-C(O)N(R⁴)R⁵, -R⁶-N(R⁴)R⁵, -R⁶-N(R⁵)C(O)R⁴, -R⁶-N(R⁵)C(O)OR⁴, -R⁶-N(R⁵)C(O)N(R⁴)R⁵, -R⁶-N(R⁵)S(O)_tR⁴, -R⁶-N[S(O)_tR⁴]₂, -R⁶-N(R⁵)C(=NR⁵)N(R⁴)R⁵, -R⁶-N(R⁵)C(=NR⁵)N(R⁴)CN, -R⁶-N(R⁵)C[=NC(O)OR⁴]-N(R⁴)-C(O)OR⁴, -R⁶-N(R⁵)-R⁷-N(R⁴)R⁵, -R⁶-N=C(OR⁴)R⁵, -R⁶-N=C(R⁴)R⁵, -R⁶-N(R⁵)-R⁶-OR⁵, -R⁶-S(O)_pR⁴ и -R⁶-S(O)_tN(R⁴)R⁵, где каждый p независимо равен 0, 1 или 2, и каждый t независимо равен 1 или 2;

каждый R⁴ и R⁵ независимо выбирают из группы, состоящей из водорода, алкила, алкенила, алкинила, галогеналкила, гидроксиалкила, алкоксиалкила, необязательно замещенного циклоалкила, необязательно замещенного циклоалкилалкила, необязательно замещенного арила, необязательно замещенного аралкила, необязательно замещенного гетероциклила, необязательно замещенного гетероарила и необязательно замещенного гетероарилалкила;

или R⁴ и R⁵ вместе с атомом азота, к которому они оба присоединены, образуют необязательно замещенный N-гетероциклик или необязательно замещенный N-гетероарил;

каждый R⁶ представляет собой прямую связь или необязательно замещенную линейную или разветвленную алкиленовую цепь; и

R⁷ представляет собой линейную или разветвленную алкиленовую цепь.

11. Соединение по п.10, где n равен 1, 2, 3 или 4;

каждый R¹ представляет собой водород;

R² представляет собой -R⁶-OR⁵ или -R⁶-N(R⁴)R⁵;

R³ представляет собой фенил, необязательно замещенный одним или несколькими заместителями, выбранными из группы, состоящей из галогена, -R⁶-OR⁵, -R⁶-OC(O)R⁴, -R⁶-OS(O)₂R⁴, -R⁶-N(R⁴)R⁵, -R⁶-N(R⁵)C(O)R⁴, -R⁶-N(R⁵)C(O)OR⁴, -R⁶-N(R⁵)C(O)N(R⁴)R⁵, -R⁶-N(R⁵)S(O)_tR⁴ и -R⁶-N(R⁵)C(=NR⁵)N(R⁴)R⁵;

каждый R⁴ и R⁵ независимо выбирают из группы, состоящей из водорода, алкила, алкенила, алкинила, галогеналкила, гидроксиалкила, алкоксиалкила, необязательно замещенного циклоалкила, необязательно замещенного циклоалкилалкила, необязательно замещенного арила, необязательно замещенного аралкила, необязательно замещенного гетероциклила, необязательно замещенного гетероарила и необязательно замещенного гетероарилалкила;

или R⁴ и R⁵ вместе с атомом азота, к которому они оба присоединены, образуют необязательно замещенный N-гетероциклик или необязательно замещенный N-гетероарил; и

каждый R⁶ представляет собой прямую связь или необязательно замещенную линейную или разветвленную алкиленовую цепь.

12. Соединение по п.11, выбранное из группы, включающей

3-(4-хлорфенил)-2-[(1-метилэтил)амино]-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-4-он;

3-(4-хлорфенил)-2-(пропиламино)-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-4-он;

R U 2 0 0 9 1 3 3 3 6 A

3-(4-хлорфенил)-2-пирролидин-1-ил-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-4-он;
3-(4-хлорфенил)-2-метокси-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-4-он;
3-(4-хлорфенил)-2-(1-метилэтил)-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-4-он;
(R)-трет-бутил-3-{{4-(4-оксо-2-пирролидин-1-ил)-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-3-ил)фенил}амино}пирролидин-1-карбоксилат;
трет-бутил-3-{{4-[4-оксо-2-(пропиламино)-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-3-ил]фенил}амино}пирролидин-1-карбоксилат;
трет-бутил-3-[(4-{2-[(1-метилэтил)амино]-4-оксо-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-3-ил}фенил)амино]пирролидин-1-карбоксилат;
(R)-трет-бутил-3-[(4-{2-[(1-метилэтил)амино]-4-оксо-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-3-ил}фенил)амино]пирролидин-1-карбоксилат;
2-метокси-3-[4-(пирролидин-3-иламино)фенил]-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-4-он;
(R)-2-пирролидин-1-ил-3-{{4-[пирролидин-3-иламино]фенил}-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-4-он;
2-(пропиламино)-3-[4-(пирролидин-3-иламино)фенил]-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-4-он;
(R)-2-[(1-метилэтил)амино]-3-{{4-[пирролидин-3-иламино]фенил}-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-4-он;
2-[(1-метилэтил)амино]-3-[4-(пирролидин-3-иламино)фенил]-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-4-он;
2-пропокси-3-(4-хлорфенил)-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-4-он;
3-(4-хлорфенил)-2-(2-метоксиэтил)-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-4-он;
трет-бутил-3-{{4-(2-метокси-4-оксо-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-3-ил)фенил}амино}пирролидин-1-карбоксилат;
(R)-трет-бутил-3-(4-(4-оксо-2-пропокси-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-3-ил)фениламино)пирролидин-1-карбоксилат и
(R)-2-пропокси-3-(4-(пирролидин-3-иламино)фенил)-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-4-он.

13. Соединение по п.4, где n равен 1, 2, 3 или 4;

каждый R¹ независимо выбирают из группы, состоящей из водорода, алкила, галогена, галогеналкила, -R⁶-CN, -R⁶-NO₂, -R⁶-OR⁵, -R⁶-N(R⁴)R⁵, -R⁶-S-(O)_pR⁴, -R⁶-C(O)R⁴, -R⁶-C(O)OR⁴, -R⁶-C(O)N(R⁴)R⁵, -R⁶-N(R⁵)C(O)R⁴, -R⁶-N(R⁵)C(O)OR⁴, -R⁶-N(R⁵)C(O)N(R⁴)R⁵, -R⁶-N(R⁵)S(O)_tR⁴, -R⁶-N(R⁵)S(O)_tN(R⁴)R⁵, -R⁶-S(O)_tN(R⁴)R⁵ и -R⁶-N(R⁵)C(=NR⁵)N(R⁴)R⁵, где каждый p независимо равен 0, 1 или 2, и каждый t независимо равен 1 или 2;

R² представляет собой алкил, галогеналкил, аралкил, гетероцикликалкил или гетероарилалкил;

R³ представляет собой аралкил, необязательно замещенный одним или несколькими заместителями, выбранными из группы, состоящей из алкила, галогена, галогеналкила, необязательно замещенного циклоалкила, необязательно замещенного циклоалкилалкила, необязательно замещенного арила, необязательно замещенного аралкила, необязательно замещенного гетероциклила, необязательно замещенного гетероцикликалкила, необязательно замещенного гетероарилалкила, необязательно замещенного гетероарилкила, -R⁶-CN, -R⁶-NO₂, -R⁶-OR⁵, -R⁶-OC(O)R⁴, -R⁶-OS(O)₂R⁴, -R⁶-C(O)R⁴, -R⁶-C(O)OR⁴, -R⁶-C(O)N(R⁴)R⁵, -R⁶-N(R⁴)R⁵, -R⁶-N(R⁵)C(O)R⁴, -R⁶-N(R⁵)C(O)OR⁴, -R⁶-N(R⁵)C(O)N(R⁴)R⁵, -R⁶-N(R⁵)S(O)_tR⁴, -R⁶-N[S(O)_tR⁴]₂, -R⁶-N(R⁵)C(=NR⁵)N(R⁴)R⁵, -R⁶-N(R⁵)C(=NR⁵)N(R⁴)CN, -R⁶-N(R⁵)C[=NC(O)OR⁴]-N(R⁴)-C(O)OR⁴, -R⁶-N(R⁵)-R⁷-N(R⁴)R⁵, -R⁶-N=C(OR⁴)R⁵, -R⁶-N=C(R⁴)R⁵, -R⁶-N(R⁵)-R⁶-OR⁵, -

R U 2 0 0 9 1 3 3 3 6 A

R^6 -S(O)_pR⁴ и $-R^6$ -S(O)_tN(R⁴)R⁵, где каждый p независимо равен 0, 1 или 2, и каждый t независимо равен 1 или 2;

каждый R⁴ и R⁵ независимо выбирают из группы, состоящей из водорода, алкила, алкенила, алкинила, галогеналкила, гидроксиалкила, алкоксиалкила, необязательно замещенного циклоалкила, необязательно замещенного циклоалкилалкила, необязательно замещенного арила, необязательно замещенного аралкила, необязательно замещенного гетероциклила, необязательно замещенного гетероарила и необязательно замещенного гетероарилалкила;

или R⁴ и R⁵ вместе с атомом азота, к которому они оба присоединены, образуют необязательно замещенный N-гетероциклик или необязательно замещенный N-гетероарил;

каждый R⁶ представляет собой прямую связь или необязательно замещенную линейную или разветвленную алкиленовую цепь; и

R⁷ представляет собой линейную или разветвленную алкиленовую цепь.

14. Соединение по п.4, где n равен 1, 2, 3 или 4;

каждый R¹ независимо выбирают из группы, состоящей из водорода, алкила, галогена, галогеналкила, -R⁶-CN, -R⁶-NO₂, -R⁶-OR⁵, -R⁶-N(R⁴)R⁵, -R⁶-S-(O)_pR⁴, -R⁶-C(O)R⁴, -R⁶-C(O)OR⁴, -R⁶-C(O)N(R⁴)R⁵, -R⁶-N(R⁵)C(O)R⁴, -R⁶-N(R⁵)C(O)OR⁴, -R⁶-N(R⁵)C(O)N(R⁴)R⁵, -R⁶-N(R⁵)S(O)_tR⁴, -R⁶-N(R⁵)S(O)_tN(R⁴)R⁵, -R⁶-S(O)_tN(R⁴)R⁵ и -R⁶-N(R⁵)C(=NR⁵)N(R⁴)R⁵, где каждый p независимо равен 0, 1 или 2, и каждый t независимо равен 1 или 2;

R² представляет собой алкил, галогеналкил, циклоалкилалкил, аралкил, гетероциклик или гетероарилалкил;

R³ представляет собой гетероарил, необязательно замещенный одним или несколькими заместителями, выбранными из группы, состоящей из алкила, галогена, галогеналкила, необязательно замещенного циклоалкила, необязательно замещенного циклоалкилалкила, необязательно замещенного арила, необязательно замещенного аралкила, необязательно замещенного гетероциклила, необязательно замещенного гетероцикликликла, необязательно замещенного гетероарила, необязательно замещенного гетероарилалкила, -R⁶-CN, -R⁶-NO₂, -R⁶-OR⁵, -R⁶-OC(O)R⁴, -R⁶-OS(O)₂R⁴, -R⁶-C(O)R⁴, -R⁶-C(O)OR⁴, -R⁶-C(O)N(R⁴)R⁵, -R⁶-N(R⁴)R⁵, -R⁶-N(R⁵)C(O)R⁴, -R⁶-N(R⁵)C(O)OR⁴, -R⁶-N(R⁵)C(O)N(R⁴)R⁵, -R⁶-N(R⁵)S(O)_tR⁴, -R⁶-N[S(O)_tR⁴]₂, -R⁶-N(R⁵)C(=NR⁵)N(R⁴)R⁵, -R⁶-N(R⁵)C(=NR⁵)N(R⁴)CN, -R⁶-N(R⁵)C[=NC(O)OR⁴]-N(R⁴)-C(O)OR⁴, -R⁶-N(R⁵)-R⁷-N(R⁴)R⁵, -R⁶-N=C(OR⁴)R⁵, -R⁶-N=C(R⁴)R⁵, -R⁶-N(R⁵)-R⁶-OR⁵, -R⁶-S(O)_pR⁴ и -R⁶-S(O)_tN(R⁴)R⁵, где каждый p независимо равен 0, 1 или 2, и каждый t независимо равен 1 или 2;

каждый R⁴ и R⁵ независимо выбирают из группы, состоящей из водорода, алкила, алкенила, алкинила, галогеналкила, гидроксиалкила, алкоксиалкила, необязательно замещенного циклоалкила, необязательно замещенного циклоалкилалкила, необязательно замещенного арила, необязательно замещенного аралкила, необязательно замещенного гетероциклила, необязательно замещенного гетероцикликликла, необязательно замещенного гетероарила и необязательно замещенного гетероарилалкила;

или R⁴ и R⁵ вместе с атомом азота, к которому они оба присоединены, образуют необязательно замещенный N-гетероциклик или необязательно замещенный N-гетероарил;

R U 2 0 0 9 1 3 3 3 6 A

каждый R⁶ представляет собой прямую связь или необязательно замещенную линейную или разветвленную алкиленовую цепь; и

R⁷ представляет собой линейную или разветвленную алкиленовую цепь.

15. Соединение по п.14, где n равен 1, 2, 3 или 4;

каждый R¹ независимо выбирают из группы, состоящей из водорода, алкила, галогена и галогеналкила;

R² представляет собой алкил, галогеналкил или циклоалкилалкил;

R³ представляет собой пиридинил, индолил или индолинил, где пиридинил, индолил или индолинил, каждый необязательно замещен одним или несколькими заместителями, выбранными из группы, состоящей из алкила, галогена, галогеналкила, необязательно замещенного циклоалкила, необязательно замещенного циклоалкилалкила, необязательно замещенного арила, необязательно замещенного аралкила, необязательно замещенного гетероциклила, необязательно замещенного гетероциклилалкила, необязательно замещенного гетероарила, необязательно замещенного гетероарилалкила, -R⁶-CN, -R⁶-NO₂, -R⁶-OR⁵, -R⁶-OC(O)R⁴, -R⁶-OS(O)₂R⁴, -R⁶-C(O)R⁴, -R⁶-C(O)OR⁴, -R⁶-C(O)N(R⁴)R⁵, -R⁶-N(R⁴)R⁵, -R⁶-N(R⁵)C(O)R⁴, -R⁶-N(R⁵)C(O)OR⁴, -R⁶-N(R⁵)C(O)N(R⁴)R⁵, -R⁶-N(R⁵)S(O)_tR⁴, -R⁶-N[S(O)_tR⁴]₂, -R⁶-N(R⁵)C(=NR⁵)N(R⁴)R⁵, -R⁶-N(R⁵)C(=NR⁵)N(R⁴)CN, -R⁶-N(R⁵)C[=NC(O)OR⁴]-N(R⁴)-C(O)OR⁴, -R⁶-N(R⁵)-R⁷-N(R⁴)R⁵, -R⁶-N=C(OR⁴)R⁵, -R⁶-N=C(R⁴)R⁵, -R⁶-N(R⁵)-R⁶-OR⁵, -R⁶-S(O)_pR⁴ и -R⁶-S(O)_tN(R⁴)R⁵, где каждый p независимо равен 0, 1 или 2, и каждый t независимо равен 1 или 2;

каждый R⁴ и R⁵ независимо выбирают из группы, состоящей из водорода, алкила, алкенила, алкинила, галогеналкила, гидроксиалкила, алкоксиалкила, необязательно замещенного циклоалкила, необязательно замещенного циклоалкилалкила, необязательно замещенного арила, необязательно замещенного аралкила, необязательно замещенного гетероциклила, необязательно замещенного гетероциклилалкила, необязательно замещенного гетероарила и необязательно замещенного гетероарилалкила;

или R⁴ и R⁵ вместе с атомом азота, к которому они оба присоединены, образуют необязательно замещенный N-гетероциклик или необязательно замещенный N-гетероарил;

каждый R⁶ представляет собой прямую связь или необязательно замещенную линейную или разветвленную алкиленовую цепь; и

R⁷ представляет собой линейную или разветвленную алкиленовую цепь.

16. Соединение по п.15, где n равен 1, 2, 3 или 4;

каждый R¹ независимо выбирают из группы, состоящей из водорода, алкила, галогена и галогеналкила;

R² представляет собой алкил, галогеналкил или циклоалкилалкил;

R³ представляет собой пиридинил, индолил или индолинил, где пиридинил, индолил или индолинил, каждый необязательно замещен одним или несколькими заместителями, выбранными из группы, состоящей из галогена, алкила, галогеналкила, -R⁶-OR⁵, -R⁶-C(O)R⁴, -R⁶-OS(O)₂R⁴, -R⁶-N(R⁴)R⁵, -R⁶-N(R⁵)C(O)R⁴, -R⁶-N(R⁵)C(O)OR⁴, -R⁶-N(R⁵)C(O)N(R⁴)R⁵, -R⁶-N(R⁵)S(O)_tR⁴ и -R⁶-N(R⁵)C(=NR⁵)N(R⁴)R⁵;

каждый R⁴ и R⁵ независимо выбирают из группы, состоящей из водорода, алкила, алкенила, алкинила, галогеналкила, гидроксиалкила, алкоксиалкила, необязательно замещенного циклоалкила, необязательно замещенного циклоалкилалкила, необязательно замещенного арила, необязательно замещенного аралкила,

необязательно замещенного гетероциклила, необязательно замещенного гетероцикликапилкила, необязательно замещенного гетероарила и необязательно замещенного гетероарилапилкила;

или R^4 и R^5 вместе с атомом азота, к которому они оба присоединены, образуют необязательно замещенный N-гетероциклил или необязательно замещенный N-гетероарил; и

каждый R^6 представляет собой прямую связь или необязательно замещенную линейную или разветвленную алкиленовую цепь.

17. Соединение по п.16, выбранное из групп, включающей

2-бутил-3-(6-хлорпиридин-3-ил)-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-4-он;

2-бутил-3-(1Н-индол-5-ил)-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-4-он;

трет-бутил-4-(5-(4-оксо-2-бутил-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-3-ил)пиридин-2-ил)пиперазин-1-карбоксилат;

2-бутил-3-(индолин-5-ил)-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-4-он;

(R)-трет-бутил-3-(5-(2-бутил-4-оксо-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-3-ил)пиридин-2-иламино)пирролидин-1-карбоксилат;

трет-бутил-3-(5-(2-бутил-4-оксо-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-3-ил)индолин-1-ил)пирролидин-1-карбоксилат;

2-бутил-3-(1-(пирролидин-3-ил)индолин-5-ил)-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-4-он и

2-бутил-3-(6-пиперазин-1-илпиридин-3-ил)-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-4-он.

18. Соединение по п.4, где n равен 1, 2, 3 или 4;

каждый R^1 независимо выбирают из группы, состоящей из водорода, алкила, галогена, галогеналкила, $-R^6-CN$, $-R^6-NO_2$, $-R^6-OR^5$, $-R^6-N(R^4)R^5$, $-R^6-S-(O)_pR^4$, $-R^6-C(O)R^4$, $-R^6-C(O)OR^4$, $-R^6-C(O)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(O)R^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)OR^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)S(O)_tR^4$, $-R^6-N(R^5)S(O)_tN(R^4)R^5$, $-R^6-S(O)_tN(R^4)R^5$ и $-R^6-N(R^5)C(=NR^5)N(R^4)R^5$, где каждый p независимо равен 0, 1 или 2, и каждый t независимо равен 1 или 2;

R^2 представляет собой алкил, галогеналкил, аралкил, гетероцикликапилкил или гетероарилапилкил;

R^3 представляет собой гетероарилапилкил, необязательно замещенный одним или несколькими заместителями, выбранными из группы, состоящей из алкила, галогена, галогеналкила, необязательно замещенного циклоалкила, необязательно замещенного циклоалкилапилкила, необязательно замещенного арила, необязательно замещенного аралкила, необязательно замещенного гетероциклила, необязательно замещенного гетероцикликапилкила, необязательно замещенного гетероарила, необязательно замещенного гетероарилапилкила, $-R^6-CN$, $-R^6-NO_2$, $-R^6-OR^5$, $-R^6-OC(O)R^4$, $-R^6-OS(O)_2R^4$, $-R^6-C(O)R^4$, $-R^6-C(O)OR^4$, $-R^6-C(O)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(O)R^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)OR^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)S(O)_tR^4$, $-R^6-N[S(O)_tR^4]_2$, $-R^6-N(R^5)C(=NR^5)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(=NR^5)N(R^4)CN$, $-R^6-N(R^5)C(=NC(O)OR^4)-N(R^4)-C(O)OR^4$, $-R^6-N(R^5)-R^7-N(R^4)R^5$, $-R^6-N=C(OR^4)R^5$, $-R^6-N=C(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)-R^6-OR^5$, $-R^6-S(O)_pR^4$ и $-R^6-S(O)_tN(R^4)R^5$, где каждый p независимо равен 0, 1 или 2, и каждый t независимо равен 1 или 2;

каждый R^4 и R^5 независимо выбирают из группы, состоящей из водорода, алкила, алкенила, алкинила, галогеналкила, гидроксиалкила, алкоксиалкила, необязательно замещенного циклоалкила, необязательно замещенного циклоалкилапилкила, необязательно замещенного арила, необязательно замещенного аралкила, необязательно замещенного гетероциклила, необязательно замещенного

гетероцикликалкила, необязательно замещенного гетероарила и необязательно замещенного гетероарилалкила;

или R^4 и R^5 вместе с атомом азота, к которому они оба присоединены, образуют необязательно замещенный N-гетероциклик или необязательно замещенный N-гетероарил;

каждый R^6 представляет собой прямую связь или необязательно замещенную линейную или разветвленную алкиленовую цепь; и

R^7 представляет собой линейную или разветвленную алкиленовую цепь.

19. Соединение по п.1, где n равен 2, 3 или 4;

две соседние группы R^1 вместе с атомами углерода, к которым они непосредственно присоединены, образуют конденсированное кольцо, выбранное из необязательно замещенного циклоалкила, необязательно замещенного арила, необязательно замещенного гетероциклила или необязательно замещенного гетероарила, и другие R^1 , если присутствуют, независимо выбирают из группы, состоящей из водорода, алкила, галогена, галогеналкила, циклоалкила, циклоалкилалкила, арила, аралкила, гетероциклила, гетероцикликалкила, гетероарила, гетероарилалкила, $-R^6-CN$, $-R^6-NO_2$, $-R^6-OR^5$, $-R^6-N(R^4)R^5$, $-R^6-S-(O)_pR^4$, $-R^6-C(O)R^4$, $R^6-C(S)R^4$, $-R^6-C(R^4)_2C(O)R^5$, $-R^6-C(O)OR^4$, $-R^6-OC(O)R^4$, $-R^6-C(S)OR^4$, $-R^6-C(O)N(R^4)R^5$, $-R^6-C(S)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(O)R^4$, $-R^6-N(R^5)C(S)R^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)OR^4$, $-R^6-N(R^5)C(S)OR^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(S)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)S(O)_tR^4$, $-R^6-N(R^5)S(O)_tN(R^4)R^5$, $-R^6-S(O)_tN(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(=NR^5)N(R^4)R^5$ и $-R^6-N(R^5)C(N=C(R^4)R^5)N(R^4)R^5$, где каждый p независимо равен 0, 1 или 2, и каждый t независимо равен 1 или 2;

R^2 представляет собой водород, алкил, алкенил, галогеналкил, циклоалкил, циклоалкилалкил, арил, аралкил, гетероциклик, гетероцикликалкил, гетероарил, гетероарилалкил, $-R^6-OR^5$ или $-R^6-N(R^4)R^5$;

R^3 представляет собой водород, алкил, алкенил, галогеналкил, гидроксиалкил, циклоалкил, циклоалкилалкил, арил, аралкил, гетероциклик, гетероцикликалкил, гетероарил, гетероарилалкил, $-R^6-N(R^4)R^5$ или $-R^6-N(R^4)C(O)OR^4$;

где циклоалкил, циклоалкилалкил, арил, аралкил, гетероциклик, гетероцикликалкил, гетероарил и гетероарилалкил, каждый необязательно замещен одним или несколькими заместителями, выбранными из группы, состоящей из алкила, галогена, галогеналкила, необязательно замещенного циклоалкила, необязательно замещенного циклоалкилалкила, необязательно замещенного арила, необязательно замещенного аралкила, необязательно замещенного гетероциклила, необязательно замещенного гетероцикликалкила, необязательно замещенного гетероарила, необязательно замещенного гетероарилалкила, $-R^6-CN$, $-R^6-NO_2$, $-R^6-OR^5$, $-R^6-OC(O)R^4$, $-R^6-OS(O)_2R^4$, $-R^6-C(O)R^4$, $-R^6-C(O)OR^4$, $-R^6-C(O)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(O)R^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)OR^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)S(O)_tR^4$, $-R^6-N[S(O)_tR^4]_2$, $-R^6-N(R^5)C(=NR^5)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(=NR^5)N(R^4)CN$, $-R^6-N(R^5)C[=NC(O)OR^4]N(R^4)C(O)OR^4$, $-R^6-N(R^5)-R^7-N(R^4)R^5$, $-R^6-N=C(OR^4)R^5$, $-R^6-N=C(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)-R^6-OR^5$, $-R^6-S(O)_pR^4$ и $-R^6-S(O)_tN(R^4)R^5$, где каждый p независимо равен 0, 1 или 2, и каждый t независимо равен 1 или 2;

каждый R^4 и R^5 независимо выбирают из группы, состоящей из водорода, алкила, алкенила, алкинила, галогеналкила, гидроксиалкила, алкоксиалкила, необязательно замещенного циклоалкила, необязательно замещенного циклоалкилалкила, необязательно замещенного арила, необязательно замещенного аралкила,

необязательно замещенного гетероциклила, необязательно замещенного гетероциклилалкила, необязательно замещенного гетероарила и необязательно замещенного гетероарилалкила;

или R^4 и R^5 вместе с атомом азота, к которому они оба присоединены, образуют необязательно замещенный N-гетероциклик или необязательно замещенный N-гетероарил;

каждый R^6 представляет собой прямую связь или необязательно замещенную линейную или разветвленную алкиленовую цепь; и

R^7 представляет собой линейную или разветвленную алкиленовую цепь.

20. Соединение по п.19, где n равен 2, 3 или 4;

две соседние группы R^1 вместе с атомами углерода, к которым они непосредственно присоединены, образуют необязательно замещенный арил, и другие R^1 независимо выбирают из группы, состоящей из водорода, алкила, галогена и галогеналкила;

R^2 представляет собой алкил, галогеналкил, циклоалкилалкил, аралкил, гетероциклилалкил, гетероарилалкил, $-R^6-OR^5$ или $-R^6-N(R^4)R^5$;

R^3 представляет собой арил, необязательно замещенный одним или несколькими заместителями, выбранными из группы, состоящей из алкила, галогена, галогеналкила, необязательно замещенного циклоалкила, необязательно замещенного циклоалкилалкила, необязательно замещенного арила, необязательно замещенного аралкила, необязательно замещенного гетероциклила, необязательно замещенного гетероциклилалкила, необязательно замещенного гетероарила, необязательно замещенного гетероарилалкила, $-R^6-CN$, $-R^6-NO_2$, $-R^6-OR^5$, $-R^6-OC(O)R^4$, $-R^6-OS(O)_2R^4$, $-R^6-C(O)R^4$, $-R^6-C(O)OR^4$, $-R^6-C(O)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(O)R^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)OR^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)S(O)_tR^4$, $-R^6-N[S(O)_tR^4]_2$, $-R^6-N(R^5)C(=NR^5)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(=NR^5)N(R^4)CN$, $-R^6-N(R^5)C[=NC(O)OR^4]-N(R^4)-C(O)OR^4$, $-R^6-N(R^5)-R^7-N(R^4)R^5$, $-R^6-N=C(OR^4)R^5$, $-R^6-N=C(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)-R^6-OR^5$, $-R^6-S(O)_pR^4$ и $-R^6-S(O)_tN(R^4)R^5$, где каждый p независимо равен 0, 1 или 2, и каждый t независимо равен 1 или 2;

каждый R^4 и R^5 независимо выбирают из группы, состоящей из водорода, алкила, алкенила, алкинила, галогеналкила, гидроксиалкила, алкоксиалкила, необязательно замещенного циклоалкила, необязательно замещенного циклоалкилалкила, необязательно замещенного арила, необязательно замещенного аралкила, необязательно замещенного гетероциклила, необязательно замещенного гетероциклилалкила, необязательно замещенного гетероарила и необязательно замещенного гетероарилалкила;

или R^4 и R^5 вместе с атомом азота, к которому они оба присоединены, образуют необязательно замещенный N-гетероциклик или необязательно замещенный N-гетероарил;

каждый R^6 представляет собой прямую связь или необязательно замещенную линейную или разветвленную алкиленовую цепь; и

R^7 представляет собой линейную или разветвленную алкиленовую цепь.

21. Соединение по п.20, где

n равен 2, 3 или 4;

две соседние группы R^1 вместе с атомами углерода, к которым они непосредственно присоединены, образуют необязательно замещенный фенил, и другие R^1 независимо выбирают из группы, состоящей из водорода, алкила, галогена

и галогеналкила;

R^2 представляет собой алкил, галогеналкил, циклоалкилалкил, аралкил, гетероцикликапилкил, гетероарилалкил, $-R^6-OR^5$ или $-R^6-N(R^4)R^5$;

R^3 представляет собой фенил, необязательно замещенный одним или несколькими заместителями, выбранными из группы, состоящей из алкила, галогена, галогеналкила, необязательно замещенного циклоалкила, необязательно замещенного циклоалкилалкила, необязательно замещенного арила, необязательно замещенного аралкила, необязательно замещенного гетероциклила, необязательно замещенного гетероцикликапилкила, необязательно замещенного гетероарила, необязательно замещенного гетероарилалкила, $-R^6-CN$, $-R^6-NO_2$, $-R^6-OR^5$, $-R^6-OC(O)R^4$, $-R^6-OS(O)_2R^4$, $-R^6-C(O)R^4$, $-R^6-C(O)OR^4$, $-R^6-C(O)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(O)R^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)OR^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)S(O)R^4$, $-R^6-N[S(O)R^4]_2$, $-R^6-N(R^5)C(=NR^5)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(=NR^5)N(R^4)CN$, $-R^6-N(R^5)C[=NC(O)OR^4]-N(R^4)-C(O)OR^4$, $-R^6-N(R^5)-R^7-N(R^4)R^5$, $-R^6-N=C(OR^4)R^5$, $-R^6-N=C(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)-R^6-OR^5$, $-R^6-S(O)_pR^4$ и $-R^6-S(O)_tN(R^4)R^5$, где каждый p независимо равен 0, 1 или 2, и каждый t независимо равен 1 или 2;

каждый R^4 и R^5 независимо выбирают из группы, состоящей из водорода, алкила, алкенила, алкинила, галогеналкила, гидроксиалкила, алкоксиалкила, необязательно замещенного циклоалкила, необязательно замещенного циклоалкилалкила, необязательно замещенного арила, необязательно замещенного аралкила, необязательно замещенного гетероциклила, необязательно замещенного гетероцикликапилкила, необязательно замещенного гетероарила и необязательно замещенного гетероарилалкила;

или R^4 и R^5 вместе с атомом азота, к которому они оба присоединены, образуют необязательно замещенный N -гетероциклил или необязательно замещенный N -гетероарил;

каждый R^6 представляет собой прямую связь или необязательно замещенную линейную или разветвленную алкиленовую цепь; и

R^7 представляет собой линейную или разветвленную алкиленовую цепь.

22. Соединение по п.21, где n равен 2, 3 или 4;

две соседние группы R^1 вместе с атомами углерода, к которым они непосредственно присоединены, образуют необязательно замещенный фенил, и другие R^1 независимо выбирают из группы, состоящей из водорода, алкила, галогена и галогеналкила;

R^2 представляет собой алкил, галогеналкил, циклоалкилалкил, аралкил, гетероцикликапилкил, гетероарилалкил, $-R^6-OR^5$ или $-R^6-N(R^4)R^5$;

R^3 представляет собой фенил, необязательно замещенный одним или несколькими заместителями, выбранными из группы, состоящей из галогена, алкила, галогеналкила, $-R^6-OR^5$, $-R^6-OC(O)R^4$, $-R^6-OS(O)_2R^4$, $-R^6-N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(O)R^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)OR^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)S(O)R^4$ и $-R^6-N(R^5)C(=NR^5)N(R^4)R^5$;

каждый R^4 и R^5 независимо выбирают из группы, состоящей из водорода, алкила, алкенила, алкинила, галогеналкила, гидроксиалкила, алкоксиалкила, необязательно замещенного циклоалкила, необязательно замещенного циклоалкилалкила, необязательно замещенного арила, необязательно замещенного аралкила, необязательно замещенного гетероциклила, необязательно замещенного гетероцикликапилкила, необязательно замещенного гетероарила и необязательно замещенного гетероарилалкила;

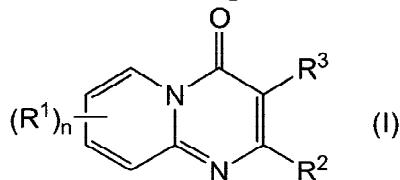
R U 2 0 0 9 1 3 3 3 1 3 9 0 2 0 A

или R^4 и R^5 вместе с атомом азота, к которому они оба присоединены, образуют необязательно замещенный N-гетероциклик или необязательно замещенный N-гетероарил; и

каждый R^6 представляет собой прямую связь или необязательно замещенную линейную или разветвленную алкиленовую цепь.

23. Соединение по п.22, выбранное из группы, включающей 2-бутил-3-(4-хлорфенил)-4Н-пиримидо[2,1-а]изохинолин-4-он; (R)-трет-бутил-3-{{[4-(2-бутил-4-оксо-4Н-пиримидо[2,1-а]изохинолин-3-ил)фенил]амино}пирролидин-1-карбоксилат и (R)-2-бутил-3-{{4-[пирролидин-3-иламино]фенил}-4Н-пиримидо[2,1-а]изохинолин-4-он.

24. Фармацевтическая композиция, содержащая фармацевтически приемлемый эксципиент и терапевтически эффективное количество соединения формулы (I)



где

n равен 1, 2, 3 или 4;

каждый R^1 независимо выбирают из группы, состоящей из водорода, алкила, алкенила, алкинила, галогена, галогеналкила, галогеналкенила, галогеналкинила, циклоалкила, циклоалкилалкила, циклоалкилалкенила, циклоалкилалкинила, арила, аралкила, аралкенила, аралкинила, гетероциклица, гетероцикликалкила, гетероцикликалкенила, гетероцикликалкинила, гетероарила, гетероарилалкила, гетероарилалкенила, гетероарилалкинила, $-R^6-CN$, $-R^6-NO_2$, $-R^6-OR^5$, $-R^6-N(R^4)R^5$, $-R^6-S(O)_pR^4$, $-R^6-C(O)R^4$, $R^6-C(S)R^4$, $-R^6-C(R^4)_2C(O)R^5$, $-R^6-C(O)OR^4$, $-R^6-OC(O)R^4$, $-R^6-C(S)OR^4$, $-R^6-C(O)N(R^4)R^5$, $-R^6-C(S)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(O)R^4$, $-R^6-N(R^5)C(S)R^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)OR^4$, $-R^6-N(R^5)C(S)OR^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(S)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)S(O)_tR^4$, $-R^6-N(R^5)S(O)_tN(R^4)R^5$, $-R^6-S(O)_tN(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(=NR^5)N(R^4)R^5$ и $-R^6-N(R^5)C(N=C(R^4)R^5)N(R^4)R^5$, где каждый p независимо равен 0, 1 или 2, и каждый t независимо равен 1 или 2;

или две соседние группы R^1 вместе с атомами углерода, к которым они непосредственно присоединены, образуют конденсированное кольцо, выбранное из необязательно замещенного циклоалкила, необязательно замещенного арила, необязательно замещенного гетероциклила или необязательно замещенного гетероарила, и другие R^1 , если присутствуют, имеют указанные выше значения;

R^2 представляет собой водород, алкил, алкенил, алкинил, галогеналкил, галогеналкенил, галогеналкинил, циклоалкил, циклоалкилалкил, циклоалкилалкенил, арил, аралкил, аралкенил, аралкинил, гетероциклик, гетероцикликалкил, гетероарил, гетероарилалкил, гетероарилалкенил, гетероарилалкинил, $-R^6-OR^5$ или $-R^6-N(R^4)R^5$;

R^3 представляет собой водород, алкил, алкенил, алкинил, галогеналкил, галогеналкенил, галогеналкинил, гидроксиалкил, циклоалкил, циклоалкилалкил, циклоалкилалкенил, циклоалкилалкинил, арил, аралкил, аралкенил, аралкинил, гетероциклик, гетероцикликалкил, гетероцикликалкенил, гетероцикликалкинил, гетероарил, гетероарилалкил, гетероарилалкенил, гетероарилалкинил, $-R^6-N(R^4)R^5$ или $-R^6-N(R^4)C(O)OR^4$;

R U 2 0 0 9 1 3 3 3 6 A

где циклоалкил, циклоалкилалкил, циклоалкилалкенил, циклоалкилалкинил, арил, аралкил, аралкенил, аралкинил, гетероциклик, гетероцикликлиалкил, гетероцикликлиалкенил, гетероцикликлиалкинил, гетероарил, гетероарилалкил, гетероарилалкенил и гетероарилалкинил, каждый необязательно замещен одним или несколькими заместителями, выбранными из группы, состоящей из алкила, алкенила, алкинила, галогена, галогеналкила, галогеналкенила, галогеналкинила, необязательно замещенного циклоалкила, необязательно замещенного циклоалкилалкила, необязательно замещенного циклоалкилалкенила, необязательно замещенного циклоалкилалкинила, необязательно замещенного арила, необязательно замещенного аралкила, необязательно замещенного аралкенила, необязательно замещенного аралкинила, необязательно замещенного гетероцикликла, необязательно замещенного гетероцикликлиалкила, необязательно замещенного гетероцикликлиалкенила, необязательно замещенного гетероарила, необязательно замещенного гетероарилалкила, необязательно замещенного гетероарилалкенила, необязательно замещенного гетероарилалкинила, -R⁶-CN, -R⁶-NO₂, -R⁶-OR⁵, -R⁶-OC(O)R⁴, -R⁶-OS(O)₂R⁴, -R⁶-C(O)R⁴, -R⁶-C(O)OR⁴, -R⁶-C(O)N(R⁴)R⁵, -R⁶-N(R⁴)R⁵, -R⁶-N(R⁵)C(O)R⁴, -R⁶-N(R⁵)C(O)OR⁴, -R⁶-N(R⁵)C(O)N(R⁴)R⁵, -R⁶-N(R⁵)S(O)_tR⁴, -R⁶-N[S(O)_tR⁴]₂, -R⁶-N(R⁵)C(=NR⁵)N(R⁴)R⁵, -R⁶-N(R⁵)C(=NR⁵)N(R⁴)CN, -R⁶-N(R⁵)C[=NC(O)OR⁴]-N(R⁴)-C(O)OR⁴, -R⁶-N(R⁵)-R⁷-N(R⁴)R⁵, -R⁶-N=C(OR⁴)R⁵, -R⁶-N=C(R⁴)R⁵, -R⁶-N(R⁵)-R⁶-OR⁵, -R⁶-S(O)_pR⁴ и -R⁶-S(O)_tN(R⁴)R⁵, где каждый р независимо равен 0, 1 или 2, и каждый t независимо равен 1 или 2;

каждый R⁴ и R⁵ независимо выбирают из группы, состоящей из водорода, алкила, алкенила, алкинила, галогеналкила, гидроксиалкила, алкоксиалкила, необязательно замещенного циклоалкила, необязательно замещенного циклоалкилалкила, необязательно замещенного арила, необязательно замещенного аралкила, необязательно замещенного гетероцикликла, необязательно замещенного гетероцикликлиалкила, необязательно замещенного гетероарила и необязательно замещенного гетероарилалкила;

или R⁴ и R⁵ вместе с атомом азота, к которому они оба присоединены, образуют необязательно замещенный N-гетероциклик или необязательно замещенный N-гетероарил;

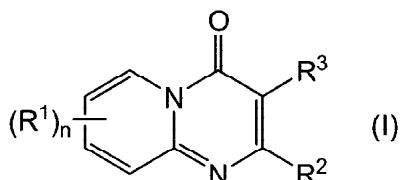
каждый R⁶ представляет собой прямую связь, необязательно замещенную линейную или разветвленную алкиленовую цепь, необязательно замещенную линейную или разветвленную алкениленовую цепь или необязательно замещенную линейную или разветвленную алкиниленовую цепь; и

R⁷ представляет собой линейную или разветвленную алкиленовую цепь, линейную или разветвленную алкениленовую цепь или линейную или разветвленную алкиниленовую цепь;

в виде его стереоизомера, энантиомера, таутомера или их смеси;

или его фармацевтически приемлемой соли, сольваты или пролекарства.

25. Способ лечения, предупреждения или облегчения заболевания или состояния, выбранного из группы, состоящей из боли, депрессии, сердечно-сосудистых заболеваний, респираторных заболеваний и психических заболеваний и их комбинаций у млекопитающего, включающий введение млекопитающему, нуждающемуся в этом, терапевтически эффективного количества соединения формулы (I)



где n равен 1, 2, 3 или 4;

каждый R^1 независимо выбирают из группы, состоящей из водорода, алкила, алкенила, алкинила, галогена, галогеналкила, галогеналкенила, галогеналкинила, циклоалкила, циклоалкилалкила, циклоалкилалкенила, циклоалкилалкинила, арила, аралкила, аралкенила, аралкинила, гетероциклила, гетероциклилалкила, гетероциклилалкенила, гетероциклилалкинила, гетероарила, гетероарилалкила, гетероарилалкенила, гетероарилалкинила, $-R^6-CN$, $-R^6-NO_2$, $-R^6-OR^5$, $-R^6-N(R^4)R^5$, $-R^6-S-(O)_pR^4$, $-R^6-C(O)R^4$, $R^6-C(S)R^4$, $-R^6-C(R^4)_2C(O)R^5$, $-R^6-C(O)OR^4$, $-R^6-OC(O)R^4$, $-R^6-C(S)OR^4$, $-R^6-C(O)N(R^4)R^5$, $-R^6-C(S)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(O)R^4$, $-R^6-N(R^5)C(S)R^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)OR^4$, $-R^6-N(R^5)C(S)OR^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(S)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)S(O)_tR^4$, $-R^6-N(R^5)S(O)_tN(R^4)R^5$, $-R^6-S(O)_tN(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(=NR^5)N(R^4)R^5$ и $-R^6-N(R^5)C(N=C(R^4)R^5)N(R^4)R^5$, где каждый p независимо равен 0, 1 или 2, и каждый t независимо равен 1 или 2;

или две соседние группы R^1 вместе с атомами углерода, к которым они непосредственно присоединены, образуют конденсированное кольцо, выбранное из необязательно замещенного циклоалкила, необязательно замещенного арила, необязательно замещенного гетероциклила или необязательно замещенного гетероарила, и другие R^1 , если присутствуют, имеют указанные выше значения;

R^2 представляет собой водород, алкил, алкенил, алкинил, галогеналкил, галогеналкенил, галогеналкинил, циклоалкил, циклоалкилалкил, циклоалкилалкенил, арил, аралкил, аралкенил, аралкинил, гетероциклил, гетероциклилалкил, гетероциклилалкенил, гетероциклилалкинил, гетероарил, гетероарилалкил, гетероарилалкенил, гетероарилалкинил, $-R^6-OR^5$ или $-R^6-N(R^4)R^5$;

R^3 представляет собой водород, алкил, алкенил, алкинил, галогеналкил, галогеналкенил, галогеналкинил, гидроксиалкил, циклоалкил, циклоалкилалкил, циклоалкилалкенил, циклоалкилалкинил, арил, аралкил, аралкенил, аралкинил, гетероциклил, гетероциклилалкил, гетероциклилалкенил, гетероциклилалкинил, гетероарил, гетероарилалкил, гетероарилалкенил, гетероарилалкинил, $-R^6-N(R^4)R^5$ или $-R^6-N(R^4)C(O)OR^4$;

где циклоалкил, циклоалкилалкил, циклоалкилалкенил, циклоалкилалкинил, арил, аралкил, аралкенил, аралкинил, гетероциклил, гетероциклилалкил, гетероциклилалкенил, гетероциклилалкинил, гетероарил, гетероарилалкил, гетероарилалкенил и гетероарилалкинил, каждый необязательно замещен одним или несколькими заместителями, выбранными из группы, состоящей из алкила, алкенила, алкинила, галогена, галогеналкила, галогеналкенила, галогеналкинила, необязательно замещенного циклоалкила, необязательно замещенного циклоалкилалкила, необязательно замещенного циклоалкилалкенила, необязательно замещенного циклоалкилалкинила, необязательно замещенного арила, необязательно замещенного аралкила, необязательно замещенного аралкенила, необязательно замещенного аралкинила, необязательно замещенного гетероциклила, необязательно замещенного гетероциклилалкила, необязательно замещенного гетероциклилалкенила, необязательно замещенного гетероциклилалкинила, необязательно замещенного гетероарила, необязательно замещенного гетероарилалкила, необязательно замещенного гетероарилалкенила, необязательно замещенного гетероарилалкинила, необязательно замещенного гетероарила, необязательно замещенного гетероарилалкила, необязательно

RU 200913336 A

RU 200913336 A

замещенного гетероарилалкенила, необязательно замещенного гетероарилалкинила, $-R^6-CN$, $-R^6-NO_2$, $-R^6-OR^5$, $-R^6-OC(O)R^4$, $-R^6-OS(O)_2R^4$, $-R^6-C(O)R^4$, $-R^6-C(O)OR^4$, $-R^6-C(O)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(O)R^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)OR^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)S(O)_tR^4$, $-R^6-N[S(O)_tR^4]_2$, $-R^6-N(R^5)C(=NR^5)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(=NR^5)N(R^4)CN$, $-R^6-N(R^5)C[=NC(O)OR^4]-N(R^4)-C(O)OR^4$, $-R^6-N(R^5)-R^7-N(R^4)R^5$, $-R^6-N=C(OR^4)R^5$, $-R^6-N=C(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)-R^6-OR^5$, $-R^6-S(O)_pR^4$ и $-R^6-S(O)_tN(R^4)R^5$, где каждый R независимо равен 0, 1 или 2, и каждый t независимо равен 1 или 2;

каждый R^4 и R^5 независимо выбирают из группы, состоящей из водорода, алкила, алкенила, алкинила, галогеналкила, гидроксиалкила, алкоксиалкила, необязательно замещенного циклоалкила, необязательно замещенного циклоалкилалкила, необязательно замещенного арила, необязательно замещенного аралкила, необязательно замещенного гетероциклила, необязательно замещенного гетероциклилалкила, необязательно замещенного гетероарилалкила и необязательно замещенного гетероарилалкенила;

или R^4 и R^5 вместе с атомом азота, к которому они оба присоединены, образуют необязательно замещенный N-гетероциклик или необязательно замещенный N-гетероарил;

каждый R^6 представляет собой прямую связь, необязательно замещенную линейную или разветвленную алкиленовую цепь, необязательно замещенную линейную или разветвленную алкениленовую цепь или необязательно замещенную линейную или разветвленную алкиниленовую цепь; и

R^7 представляет собой линейную или разветвленную алкиленовую цепь, линейную или разветвленную алкениленовую цепь или линейную или разветвленную алкиниленовую цепь;

в виде его стереоизомера, энантиомера, таутомера или их смеси;

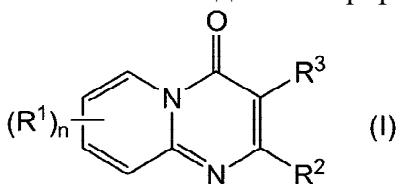
или его фармацевтически приемлемой соли, сольваты или пролекарства.

26. Способ по п.25, где указанное заболевание или состояние выбирают из группы, состоящей из невропатической боли, воспалительной боли, висцеральной боли, боли при раке, боли при химиотерапии, травматической боли, боли при операции, боли после операции, боли при родах, родовых схваток, нейрогенного мочевого пузыря, неспецифического язвенного колита, хронической боли, постоянной боли, периферически опосредованной боли, центрально опосредованной боли, хронической головной боли, мигрени, пазушной головной боли, головной боли напряжения, фантомной боли, повреждения периферического нерва и их комбинаций.

27. Способ по п.25, где указанное заболевание или состояние выбирают из группы, состоящей из боли, связанной с ВИЧ, невропатии, вызванной лечением ВИЧ, тригеминальной невралгии, постгерпетической невралгии, эудинии, теплочувствительности, саркоидоза, синдрома раздраженной толстой кишки, болезни Крона, боли, связанной с рассеянным склерозом (MS), бокового амиотрофического склероза (ALS), диабетической невропатии, периферической невропатии, артрита, ревматоидного артрита, остеоартрита, атеросклероза, пароксизмальной дистонии, миастенических синдромов, миотонии, злокачественной гипертермии, муковисцидоза, псевдоальдостеронизма, рабдомиолиза, гипотиреоза, биполярной депрессии, тревоги, шизофрении, заболеваний, связанных с токсином натриевых каналов, семейной эритермалгии, первичной эритермалгии, семейной ректальной боли, рака, эпилепсии, парциальных и общих эпилептических припадков, синдрома усталых ног, аритмий, фибромиалгии, нейропатии при ишемических состояниях, вызванных ударом или

нервной травмой, тахиаритмии, фибрилляции предсердий и фибрилляции желудочков.

28. Способ лечения боли у млекопитающего посредством ингибирования ионного потока через потенциалзависимый натриевый канал у млекопитающего, включающий введение млекопитающему, нуждающемуся в этом, терапевтически эффективного количества соединения формулы (I)



где n равен 1, 2, 3 или 4;

каждый R^1 независимо выбирают из группы, состоящей из водорода, алкила, алкенила, алкинила, галогена, галогеналкила, галогеналкенила, галогеналкинила, циклоалкила, циклоалкилалкила, циклоалкилалкенила, циклоалкилалкинила, арила, аралкила, аралкенила, аралкинила, гетероциклила, гетероциклилалкила, гетероциклилалкенила, гетероциклилалкинила, гетероарила, гетероарилалкила, гетероарилалкенила, гетероарилалкинила, $-R^6-CN$, $-R^6-NO_2$, $-R^6-OR^5$, $-R^6-N(R^4)R^5$, $-R^6-S-(O)_pR^4$, $-R^6-C(O)R^4$, $R^6-C(S)R^4$, $-R^6-C(R^4)_2C(O)R^5$, $-R^6-C(O)OR^4$, $-R^6-OC(O)R^4$, $-R^6-C(S)OR^4$, $-R^6-C(O)N(R^4)R^5$, $-R^6-C(S)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(O)R^4$, $-R^6-N(R^5)C(S)R^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)OR^4$, $-R^6-N(R^5)C(S)OR^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(S)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)S(O)_tR^4$, $-R^6-N(R^5)S(O)_tN(R^4)R^5$, $-R^6-S(O)_tN(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(=NR^5)N(R^4)R^5$ и $-R^6-N(R^5)C(N=C(R^4)R^5)N(R^4)R^5$, где каждый p независимо равен 0, 1 или 2, и каждый t независимо равен 1 или 2;

или две соседние группы R^1 вместе с атомами углерода, к которым они непосредственно присоединены, образуют конденсированное кольцо, выбранное из необязательно замещенного циклоалкила, необязательно замещенного арила, необязательно замещенного гетероциклила или необязательно замещенного гетероарила, и другие R^1 , если присутствуют, имеют указанные выше значения;

R^2 представляет собой водород, алкил, алкенил, алкинил, галогеналкил, галогеналкенил, галогеналкинил, циклоалкил, циклоалкилалкил, циклоалкилалкенил, арил, аралкил, аралкенил, аралкинил, гетероциклил, гетероциклилалкил, гетероциклилалкенил, гетероциклилалкинил, гетероарил, гетероарилалкил, гетероарилалкенил, гетероарилалкинил, $-R^6-OR^5$ или $-R^6-N(R^4)R^5$;

R^3 представляет собой водород, алкил, алкенил, алкинил, галогеналкил, галогеналкенил, галогеналкинил, гидроксиалкил, циклоалкил, циклоалкилалкил, циклоалкилалкенил, циклоалкилалкинил, арил, аралкил, аралкенил, аралкинил, гетероциклил, гетероциклилалкил, гетероциклилалкенил, гетероциклилалкинил, гетероарил, гетероарилалкил, гетероарилалкенил, гетероарилалкинил, $-R^6-N(R^4)R^5$ или $-R^6-N(R^4)C(O)OR^4$;

где циклоалкил, циклоалкилалкил, циклоалкилалкенил, циклоалкилалкинил, арил, аралкил, аралкенил, аралкинил, гетероциклил, гетероциклилалкил, гетероциклилалкенил, гетероциклилалкинил, гетероарил, гетероарилалкил, гетероарилалкенил, гетероарилалкинил, каждый необязательно замещен одним или несколькими заместителями, выбранными из группы, состоящей из алкила, алкенила, алкинила, галогена, галогеналкила, галогеналкенила, галогеналкинила, необязательно замещенного циклоалкила, необязательно замещенного циклоалкилалкила, необязательно замещенного циклоалкилалкенила, необязательно замещенного циклоалкилалкинила, необязательно замещенного арила, необязательно замещенного

аралкила, необязательно замещенного аралкенила, необязательно замещенного аралкинила, необязательно замещенного гетероциклила, необязательно замещенного гетероцикликалкила, необязательно замещенного гетероцикликалкинила, необязательно замещенного гетероарила, необязательно замещенного гетероарилалкила, необязательно замещенного гетероарилалкинила, необязательно замещенного гетероарилалкенила, $-R^6-CN$, $-R^6-NO_2$, $-R^6-OR^5$, $-R^6-OC(O)R^4$, $-R^6-OS(O)_2R^4$, $-R^6-C(O)R^4$, $-R^6-C(O)OR^4$, $-R^6-C(O)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(O)R^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)OR^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)S(O)_tR^4$, $-R^6-N[S(O)_tR^4]_2$, $-R^6-N(R^5)C(=NR^5)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(=NR^5)N(R^4)CN$, $-R^6-N(R^5)C[=NC(O)OR^4]-N(R^4)-C(O)OR^4$, $-R^6-N(R^5)-R^7-N(R^4)R^5$, $-R^6-N=C(OR^4)R^5$, $-R^6-N=C(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)-R^6-OR^5$, $-R^6-S(O)_pR^4$ и $-R^6-S(O)_tN(R^4)R^5$, где каждый p независимо равен 0, 1 или 2, и каждый t независимо равен 1 или 2;

каждый R^4 и R^5 независимо выбирают из группы, состоящей из водорода, алкила, алкенила, алкинила, галогеналкила, гидроксиалкила, алкоксиалкила, необязательно замещенного циклоалкила, необязательно замещенного циклоалкилалкила, необязательно замещенного арила, необязательно замещенного аралкила, необязательно замещенного гетероциклила, необязательно замещенного гетероцикликалкила, необязательно замещенного гетероарила и необязательно замещенного гетероарилалкила;

или R^4 и R^5 вместе с атомом азота, к которому они оба присоединены, образуют необязательно замещенный N-гетероциклик или необязательно замещенный N-гетероарил;

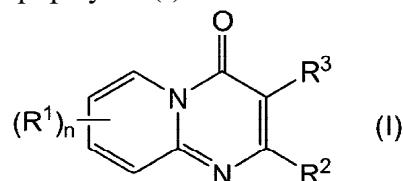
каждый R^6 представляет собой прямую связь, необязательно замещенную линейную или разветвленную алкиленовую цепь, необязательно замещенную линейную или разветвленную алкениленовую цепь или необязательно замещенную линейную или разветвленную алкиниленовую цепь; и

R^7 представляет собой линейную или разветвленную алкиленовую цепь, линейную или разветвленную алкениленовую цепь или линейную или разветвленную алкиниленовую цепь;

в виде его стереоизомера, энантиомера, таутомера или их смеси;

или его фармацевтически приемлемой соли, сольваты или пролекарства.

29. Способ уменьшения ионного потока через потенциалзависимый натриевый канал в клетке млекопитающего, включающий контактирование клетки с соединением формулы (I)



где

n равен 1, 2, 3 или 4;

каждый R^1 независимо выбирают из группы, состоящей из водорода, алкила, алкенила, алкинила, галогена, галогеналкила, галогеналкенила, галогеналкинила, циклоалкила, циклоалкилалкила, циклоалкилалкенила, циклоалкилалкенила, арила, аралкила, аралкенила, аралкинила, гетероциклила, гетероцикликалкила, гетероцикликалкенила, гетероцикликалкинила, гетероарила, гетероарилалкила, гетероарилалкенила, гетероарилалкинила, $-R^6-CN$, $-R^6-NO_2$, $-R^6-OR^5$, $-R^6-N(R^4)R^5$, -

$R^6-S-(O)_pR^4$, $-R^6-C(O)R^4$, $R^6-C(S)R^4$, $-R^6-C(R^4)_2C(O)R^5$, $-R^6-C(O)OR^4$, $-R^6-OC(O)R^4$, $-R^6-C(S)OR^4$, $-R^6-C(O)N(R^4)R^5$, $-R^6-C(S)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(O)R^4$, $-R^6-N(R^5)C(S)R^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)OR^4$, $-R^6-N(R^5)C(S)OR^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(S)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)S(O)_tR^4$, $-R^6-N(R^5)S(O)_tN(R^4)R^5$, $-R^6-S(O)_tN(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(=NR^5)N(R^4)R^5$ и $-R^6-N(R^5)C(N=C(R^4)R^5)N(R^4)R^5$, где каждый p независимо равен 0, 1 или 2, и каждый t независимо равен 1 или 2;

или две соседние группы R^1 вместе с атомами углерода, к которым они непосредственно присоединены, образуют конденсированное кольцо, выбранное из необязательно замещенного циклоалкила, необязательно замещенного арила, необязательно замещенного гетероциклила или необязательно замещенного гетероарила, и другие R^1 , если присутствуют, имеют указанные выше значения;

R^2 представляет собой водород, алкил, алкенил, алкинил, галогеналкил, галогеналкенил, галогеналкинил, циклоалкил, циклоалкилалкил, циклоалкилалкенил, арил, аралкил, аралкенил, аралкинил, гетероциклик, гетероцикликалкил, гетероцикликалкенил, гетероцикликалкинил, гетероарил, гетероарилалкил, гетероарилалкенил, гетероарилалкенил, $-R^6-OR^5$ или $-R^6-N(R^4)R^5$;

R^3 представляет собой водород, алкил, алкенил, алкинил, галогеналкил, галогеналкенил, галогеналкенил, гидроксиалкил, циклоалкил, циклоалкилалкил, циклоалкилалкенил, циклоалкилалкенил, арил, аралкил, аралкенил, аралкинил, гетероциклик, гетероциклик, гетероциклик, гетероциклик, гетероциклик, гетероциклик, гетероарил, гетероарилалкил, гетероарилалкенил, гетероарилалкенил, $-R^6-N(R^4)R^5$ или $-R^6-N(R^4)C(O)OR^4$;

где циклоалкил, циклоалкилалкил, циклоалкилалкенил, циклоалкилалкинил, арил, аралкил, аралкенил, аралкинил, гетероциклик, гетероцикликалкил, гетероцикликалкенил, гетероцикликалкинил, гетероарил, гетероарилалкил, гетероарилалкенил и гетероарилалкинил, каждый необязательно замещен одним или несколькими заместителями, выбранными из группы, состоящей из алкила, алкенила, алкинила, галогена, галогеналкила, галогеналкенила, галогеналкинила, необязательно замещенного циклоалкила, необязательно замещенного циклоалкилалкила, необязательно замещенного циклоалкилалкенила, необязательно замещенного арила, необязательно замещенного аралкила, необязательно замещенного аралкенила, необязательно замещенного аралкинила, необязательно замещенного гетероциклика, необязательно замещенного гетероцикликалкила, необязательно замещенного гетероцикликалкенила, необязательно замещенного гетероцикликалкинила, необязательно замещенного гетероарила, необязательно замещенного гетероарилалкила, необязательно замещенного гетероарилалкенила, необязательно замещенного гетероарилалкинила, -R⁶-CN, -R⁶-NO₂, -R⁶-OR⁵, -R⁶-OC(O)R⁴, -R⁶-OS(O)₂R⁴, -R⁶-C(O)R⁴, -R⁶-C(O)OR⁴, -R⁶-C(O)N(R⁴)R⁵, -R⁶-N(R⁴)R⁵, -R⁶-N(R⁵)C(O)R⁴, -R⁶-N(R⁵)C(O)OR⁴, -R⁶-N(R⁵)C(O)N(R⁴)R⁵, -R⁶-N(R⁵)S(O)_tR⁴, -R⁶-N[S(O)_tR⁴]₂, -R⁶-N(R⁵)C(=NR⁵)N(R⁴)R⁵, -R⁶-N(R⁵)C(=NR⁵)N(R⁴)CN, -R⁶-N(R⁵)C[=NC(O)OR⁴]-N(R⁴)-C(O)OR⁴, -R⁶-N(R⁵)-R⁷-N(R⁴)R⁵, -R⁶-N=C(OR⁴)R⁵, -R⁶-N=C(R⁴)R⁵, -R⁶-N(R⁵)-R⁶-OR⁵, -R⁶-S(O)_pR⁴ и -R⁶-S(O)_tN(R⁴)R⁵, где каждый р независимо равен 0, 1 или 2, и каждый t независимо равен 1 или 2;

каждый R^4 и R^5 независимо выбирают из группы, состоящей из водорода, алкила, алкенила, алкинила, галогеналкила, гидроксиалкила, алкоксиалкила, необязательно замещенного циклоалкила, необязательно замещенного циклоалкилалкила,

необязательно замещенного арила, необязательно замещенного аралкила, необязательно замещенного гетероциклила, необязательно замещенного гетероцикликапилкила, необязательно замещенного гетероарила и необязательно замещенного гетероарилалкила;

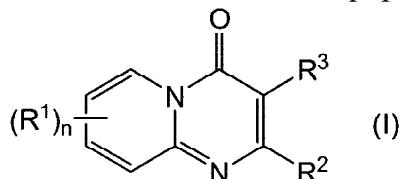
или R^4 и R^5 вместе с атомом азота, к которому они оба присоединены, образуют необязательно замещенный N-гетероциклик или необязательно замещенный N-гетероарил;

каждый R^6 представляет собой прямую связь, необязательно замещенную линейную или разветвленную алкиленовую цепь, необязательно замещенную линейную или разветвленную алкениленовую цепь или необязательно замещенную линейную или разветвленную алкиниленовую цепь; и

R^7 представляет собой линейную или разветвленную алкиленовую цепь, линейную или разветвленную алкениленовую цепь или линейную или разветвленную алкиниленовую цепь;

в виде его стереоизомером, энантиомером, таутомером или их смесями; или его фармацевтически приемлемой солью, сольватом или пролекарством.

30. Способ лечения гиперхолестеринемии у млекопитающего, включающий введение млекопитающему, нуждающемуся в этом, терапевтически эффективного количества соединения формулы (I)



где n равен 1, 2, 3 или 4;

каждый R^1 независимо выбирают из группы, состоящей из водорода, алкила, алкенила, алкинила, галогена, галогеналкила, галогеналкенила, галогеналкинила, циклоалкила, циклоалкилалкила, циклоалкилалкенила, циклоалкилалкинила, арила, аралкила, аралкенила, аралкинила, гетероциклила, гетероцикликапилкила, гетероцикликапенила, гетероцикликапинила, гетероарила, гетероарилалкила, гетероарилалкенила, гетероарилалкинила, $-R^6-CN$, $-R^6-NO_2$, $-R^6-OR^5$, $-R^6-N(R^4)R^5$, $-R^6-S(O)_pR^4$, $-R^6-C(O)R^4$, $R^6-C(S)R^4$, $-R^6-C(R^4)_2C(O)R^5$, $-R^6-C(O)OR^4$, $-R^6-OC(O)R^4$, $-R^6-C(S)OR^4$, $-R^6-C(O)N(R^4)R^5$, $-R^6-C(S)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(O)R^4$, $-R^6-N(R^5)C(S)R^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)OR^4$, $-R^6-N(R^5)C(S)OR^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(S)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)S(O)_tR^4$, $-R^6-N(R^5)S(O)_tN(R^4)R^5$, $-R^6-S(O)_tN(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(=NR^5)N(R^4)R^5$ и $-R^6-N(R^5)C(N=C(R^4)R^5)N(R^4)R^5$, где каждый p независимо равен 0, 1 или 2, и каждый t независимо равен 1 или 2;

или две соседние группы R^1 вместе с атомами углерода, к которым они непосредственно присоединены, образуют конденсированное кольцо, выбранное из необязательно замещенного циклоалкила, необязательно замещенного арила, необязательно замещенного гетероциклила или необязательно замещенного гетероарила, и другие R^1 , если присутствуют, имеют указанные выше значения;

R^2 представляет собой водород, алкил, алкенил, алкинил, галогеналкил, галогеналкенил, галогеналкинил, циклоалкил, циклоалкилалкил, циклоалкилалкенил, арил, аралкил, аралкенил, аралкинил, гетероциклил, гетероцикликапилкил, гетероцикликапенил, гетероцикликапинил, гетероарил, гетероарилалкил, гетероарилалкенил, гетероарилалкинил, $-R^6-OR^5$ или $-R^6-N(R^4)R^5$;

R^3 представляет собой водород, алкил, алкенил, алкинил, галогеналкил,

галогеналкенил, галогеналкинил, гидроксиалкил, циклоалкил, циклоалкилалкил, циклоалкилалкенил, циклоалкилалкинил, арил, аралкил, аралкенил, аралкинил, гетероциклик, гетероциклик-алкил, гетероциклик-алкенил, гетероциклик-алкинил, гетероарил, гетероарил-алкил, гетероарил-алкенил, гетероарил-алкинил, $-R^6-N(R^4)R^5$ или $-R^6-N(R^4)C(O)OR^4$;

где циклоалкил, циклоалкилалкил, циклоалкилалкенил, циклоалкилалкинил, арил, аралкил, аралкенил, аралкинил, гетероциклик, гетероциклик-алкил, гетероциклик-алкенил, гетероциклик-алкинил, гетероарил, гетероарил-алкил, гетероарил-алкенил и гетероарил-алкинил, каждый необязательно замещен одним или несколькими заместителями, выбранными из группы, состоящей из алкила, алкенила, алкинила, галогена, галогеналкила, галогеналкенила, галогеналкинила, необязательно замещенного циклоалкила, необязательно замещенного циклоалкилалкила, необязательно замещенного циклоалкилалкенила, необязательно замещенного циклоалкилалкинила, необязательно замещенного арила, необязательно замещенного аралкила, необязательно замещенного аралкенила, необязательно замещенного аралкинила, необязательно замещенного гетероциклика, необязательно замещенного гетероциклик-алкила, необязательно замещенного гетероциклик-алкенила, необязательно замещенного гетероциклик-алкинила, необязательно замещенного гетероарила, необязательно замещенного гетероарил-алкила, необязательно замещенного гетероарил-алкенила, необязательно замещенного гетероарил-алкинила, $-R^6-CN$, $-R^6-NO_2$, $-R^6-OR^5$, $-R^6-OC(O)R^4$, $-R^6-OS(O)R^4$, $-R^6-C(O)R^4$, $-R^6-C(O)OR^4$, $-R^6-C(O)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(O)R^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)OR^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)S(O)R^4$, $-R^6-N[S(O)R^4]_2$, $-R^6-N(R^5)C(=NR^5)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(=NR^5)N(R^4)CN$, $-R^6-N(R^5)C[=NC(O)OR^4]-N(R^4)-C(O)OR^4$, $-R^6-N(R^5)-R^7-N(R^4)R^5$, $-R^6-N=C(OR^4)R^5$, $-R^6-N=C(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)-R^6-OR^5$, $-R^6-S(O)_pR^4$ и $-R^6-S(O)_tN(R^4)R^5$, где каждый p независимо равен 0, 1 или 2, и каждый t независимо равен 1 или 2;

каждый R^4 и R^5 независимо выбирают из группы, состоящей из водорода, алкила, алкенила, алкинила, галогеналкила, гидроксиалкила, алкоксиалкила, необязательно замещенного циклоалкила, необязательно замещенного циклоалкилалкила, необязательно замещенного арила, необязательно замещенного аралкила, необязательно замещенного гетероциклика, необязательно замещенного гетероциклик-алкила, необязательно замещенного гетероарила и необязательно замещенного гетероарил-алкила;

или R^4 и R^5 вместе с атомом азота, к которому они оба присоединены, образуют необязательно замещенный N-гетероциклик или необязательно замещенный N-гетероарил;

каждый R^6 представляет собой прямую связь, необязательно замещенную линейную или разветвленную алкиленовую цепь, необязательно замещенную линейную или разветвленную алкениленовую цепь или необязательно замещенную линейную или разветвленную алкиниленовую цепь; и

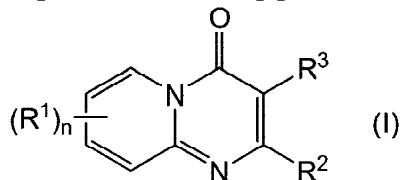
R^7 представляет собой линейную или разветвленную алкиленовую цепь, линейную или разветвленную алкениленовую цепь или линейную или разветвленную алкиниленовую цепь;

в виде его стереоизомера, энантиомера, таутомера или их смеси;

или его фармацевтически приемлемой солью, сольватом или пролекарства.

31. Способ лечения доброкачественной гиперплазии предстательной железы у млекопитающего, включающий введение млекопитающему, нуждающемуся в этом,

терапевтически эффективного количества соединения формулы (I)



где n равен 1, 2, 3 или 4;

каждый R^1 независимо выбирают из группы, состоящей из водорода, алкила, алкенила, алкинила, галогена, галогеналкила, галогеналкенила, галогеналкенила, циклоалкила, циклоалкилалкила, циклоалкилалкенила, циклоалкилалкинила, арила, аралкила, аралкенила, аралкинила, гетероциклила, гетероциклилалкила, гетероциклилалкенила, гетероциклилалкинила, гетероарила, гетероарилалкила, гетероарилалкенила, гетероарилалкинила, $-R^6-CN$, $-R^6-NO_2$, $-R^6-OR^5$, $-R^6-N(R^4)R^5$, $-R^6-S(O)_pR^4$, $-R^6-C(O)R^4$, $R^6-C(S)R^4$, $-R^6-C(R^4)_2C(O)R^5$, $-R^6-C(O)OR^4$, $-R^6-OC(O)R^4$, $-R^6-C(S)OR^4$, $-R^6-C(O)N(R^4)R^5$, $-R^6-C(S)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(O)R^4$, $-R^6-N(R^5)C(S)R^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)OR^4$, $-R^6-N(R^5)C(S)OR^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(S)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)S(O)_tR^4$, $-R^6-N(R^5)S(O)_tN(R^4)R^5$, $-R^6-S(O)_tN(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(=NR^5)N(R^4)R^5$ и $-R^6-N(R^5)C(N=C(R^4)R^5)N(R^4)R^5$, где каждый p независимо равен 0, 1 или 2, и каждый t независимо равен 1 или 2;

или две соседние группы R^1 вместе с атомами углерода, к которым они непосредственно присоединены, образуют конденсированное кольцо, выбранное из необязательно замещенного циклоалкила, необязательно замещенного арила, необязательно замещенного гетероциклила или необязательно замещенного гетероарила, и другие R^1 , если присутствуют, имеют указанные выше значения;

R^2 представляет собой водород, алкил, алкенил, алкинил, галогеналкил, галогеналкенил, галогеналкинил, циклоалкил, циклоалкилалкил, циклоалкилалкенил, арил, аралкил, аралкенил, аралкинил, гетероциклил, гетероциклилалкил, гетероциклилалкенил, гетероциклилалкинил, гетероарил, гетероарилалкил, гетероарилалкенил, гетероарилалкинил, $-R^6-OR^5$ или $-R^6-N(R^4)R^5$;

R^3 представляет собой водород, алкил, алкенил, алкинил, галогеналкил, галогеналкенил, галогеналкинил, гидроксиалкил, циклоалкил, циклоалкилалкил, циклоалкилалкенил, циклоалкилалкинил, арил, аралкил, аралкенил, аралкинил, гетероциклил, гетероциклилалкил, гетероциклилалкенил, гетероциклилалкинил, гетероарил, гетероарилалкил, гетероарилалкенил, гетероарилалкинил, $-R^6-N(R^4)R^5$ или $-R^6-N(R^4)C(O)OR^4$;

где циклоалкил, циклоалкилалкил, циклоалкилалкенил, циклоалкилалкинил, арил, аралкил, аралкенил, аралкинил, гетероциклил, гетероциклилалкил, гетероциклилалкенил, гетероциклилалкинил, гетероарил, гетероарилалкил, гетероарилалкенил и гетероарилалкинил, каждый необязательно замещен одним или несколькими заместителями, выбранными из группы, состоящей из алкила, алкенила, алкинила, галогена, галогеналкила, галогеналкенила, галогеналкинила, необязательно замещенного циклоалкила, необязательно замещенного циклоалкилалкила, необязательно замещенного циклоалкилалкенила, необязательно замещенного арила, необязательно замещенного аралкила, необязательно замещенного аралкенила, необязательно замещенного аралкинила, необязательно замещенного гетероциклила, необязательно замещенного гетероциклилалкила, необязательно замещенного гетероциклилалкенила, необязательно замещенного гетероциклилалкинила, необязательно замещенного

A
6 9 3 3 3 6 A
1 3 3 3 3 9 1 3 3 6 A
RU 200913336

RU 200913336

R U 2 0 0 9 1 3 3 3 6 A

гетероарила, необязательно замещенного гетероарилалкила, необязательно замещенного гетероарилалкенила, необязательно замещенного гетероарилалкинила, $-R^6\text{-CN}$, $-R^6\text{-NO}_2$, $-R^6\text{-OR}^5$, $-R^6\text{-OC(O)R}^4$, $-R^6\text{-OS(O)}_2\text{R}^4$, $-R^6\text{-C(O)R}^4$, $-R^6\text{-C(O)OR}^4$, $-R^6\text{-C(O)N(R}^4\text{)R}^5$, $-R^6\text{-N(R}^4\text{)R}^5$, $-R^6\text{-N(R}^5\text{)C(O)R}^4$, $-R^6\text{-N(R}^5\text{)C(O)OR}^4$, $-R^6\text{-N(R}^5\text{)C(O)N(R}^4\text{)R}^5$, $-R^6\text{-N(R}^5\text{)S(O)}_t\text{R}^4$, $-R^6\text{-N[S(O)}_t\text{R}^4\text{]}_2$, $-R^6\text{-N(R}^5\text{)C(=NR}^5\text{)N(R}^4\text{)R}^5$, $-R^6\text{-N(R}^5\text{)C(=NC(O)OR}^4\text{)N(R}^4\text{)C(O)OR}^4$, $-R^6\text{-N(R}^5\text{)R}^7\text{-N(R}^4\text{)R}^5$, $-R^6\text{-N=C(OR}^4\text{)R}^5$, $-R^6\text{-N=C(R}^4\text{)R}^5$, $-R^6\text{-N(R}^5\text{)R}^6\text{-OR}^5$, $-R^6\text{-S(O)}_p\text{R}^4$ и $-R^6\text{-S(O)}_t\text{N(R}^4\text{)R}^5$, где каждый p независимо равен 0, 1 или 2, и каждый t независимо равен 1 или 2;

каждый R^4 и R^5 независимо выбирают из группы, состоящей из водорода, алкила, алкенила, алкинила, галогеналкила, гидроксиалкила, алкоксиалкила, необязательно замещенного циклоалкила, необязательно замещенного циклоалкилалкила, необязательно замещенного арила, необязательно замещенного аралкила, необязательно замещенного гетероциклица, необязательно замещенного гетероцикликапилала, необязательно замещенного гетероарила и необязательно замещенного гетероарилалкила;

или R^4 и R^5 вместе с атомом азота, к которому они оба присоединены, образуют необязательно замещенный N-гетероциклик или необязательно замещенный N-гетероарил;

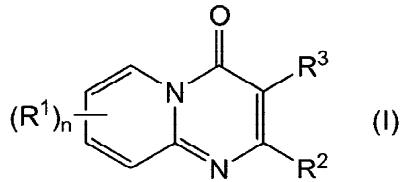
каждый R^6 представляет собой прямую связь, необязательно замещенную линейную или разветвленную алкиленовую цепь, необязательно замещенную линейную или разветвленную алкениленовую цепь или необязательно замещенную линейную или разветвленную алкиниленовую цепь; и

R^7 представляет собой линейную или разветвленную алкиленовую цепь, линейную или разветвленную алкениленовую цепь или линейную или разветвленную алкиниленовую цепь;

в виде его стереоизомера, энантиомера, таутомера или их смеси;

или его фармацевтически приемлемой солью, сольватом или пролекарства.

32. Способ лечения зуда у млекопитающего, включающий введение млекопитающему, нуждающемуся в этом, терапевтически эффективного количества соединения формулы (I)



где n равен 1, 2, 3 или 4;

каждый R^1 независимо выбирают из группы, состоящей из водорода, алкила, алкенила, алкинила, галогена, галогеналкила, галогеналкенила, галогеналкинила, циклоалкила, циклоалкилалкила, циклоалкилалкенила, циклоалкилалкинила, арила, аралкила, аралкенила, аралкинила, гетероциклица, гетероцикликапилала, гетероцикликапиленила, гетероцикликапинила, гетероарила, гетероарилалкила, гетероарилалкенила, гетероарилалкинила, $-R^6\text{-CN}$, $-R^6\text{-NO}_2$, $-R^6\text{-OR}^5$, $-R^6\text{-N(R}^4\text{)R}^5$, $-R^6\text{-S(O)}_p\text{R}^4$, $-R^6\text{-C(O)R}^4$, $R^6\text{-C(S)R}^4$, $-R^6\text{-C(R}^4\text{)}_2\text{C(O)R}^5$, $-R^6\text{-C(O)OR}^4$, $-R^6\text{-OC(O)R}^4$, $-R^6\text{-C(S)OR}^4$, $-R^6\text{-C(O)N(R}^4\text{)R}^5$, $-R^6\text{-C(S)N(R}^4\text{)R}^5$, $-R^6\text{-N(R}^5\text{)C(O)R}^4$, $-R^6\text{-N(R}^5\text{)C(S)R}^4$, $-R^6\text{-N(R}^5\text{)C(O)OR}^4$, $-R^6\text{-N(R}^5\text{)C(S)OR}^4$, $-R^6\text{-N(R}^5\text{)C(O)N(R}^4\text{)R}^5$, $-R^6\text{-N(R}^5\text{)C(S)N(R}^4\text{)R}^5$, $-R^6\text{-N(R}^5\text{)S(O)}_t\text{R}^4$, $-R^6\text{-N(R}^5\text{)S(O)}_t\text{N(R}^4\text{)R}^5$, $-R^6\text{-S(O)}_t\text{N(R}^4\text{)R}^5$, $-R^6\text{-N(R}^5\text{)C(=NR}^5\text{)N(R}^4\text{)R}^5$ и $-R^6\text{-N(R}^5\text{)C(N=C(R}^4\text{)R}^5\text{)N(R}^4\text{)R}^5$, где каждый p независимо равен 0, 1 или 2, и каждый t

независимо равен 1 или 2;

или две соседние группы R^1 вместе с атомами углерода, к которым они непосредственно присоединены, образуют конденсированное кольцо, выбранное из необязательно замещенного циклоалкила, необязательно замещенного арила, необязательно замещенного гетероциклила или необязательно замещенного гетероарила, и другие R^1 , если присутствуют, имеют указанные выше значения;

R^2 представляет собой водород, алкил, алкенил, алкинил, галогеналкил, галогеналкенил, галогеналкинил, циклоалкил, циклоалкилалкил, циклоалкилалкенил, арил, аралкил, аралкенил, аралкинил, гетероциклил, гетероциклилалкил, гетероциклилалкенил, гетероциклилакинил, гетероарил, гетероарилалкил, гетероарилалкенил, гетероарилакинил, $-R^6-OR^5$ или $-R^6-N(R^4)R^5$;

R^3 представляет собой водород, алкил, алкенил, алкинил, галогеналкил, галогеналкенил, галогеналкинил, гидроксиалкил, циклоалкил, циклоалкилалкил, циклоалкилалкенил, циклоалкилакинил, арил, аралкил, аралкенил, аралкинил, гетероциклил, гетероциклилалкил, гетероциклилалкенил, гетероциклилакинил, гетероарил, гетероарилалкил, гетероарилалкенил, $-R^6-N(R^4)R^5$ или $-R^6-N(R^4)C(O)OR^4$;

где циклоалкил, циклоалкилалкил, циклоалкилалкенил, циклоалкилакинил, арил, аралкил, аралкенил, аралкинил, гетероциклил, гетероциклилалкил, гетероциклилалкенил, гетероциклилакинил, гетероарил, гетероарилалкил, гетероарилалкенил и гетероарилакинил, каждый необязательно замещен одним или несколькими заместителями, выбранными из группы, состоящей из алкила, алкенила, алкинила, галогена, галогеналкила, галогеналкенила, галогеналкинила, необязательно замещенного циклоалкила, необязательно замещенного циклоалкилалкенила, необязательно замещенного циклоалкилакинила, необязательно замещенного арила, необязательно замещенного аралкила, необязательно замещенного аралкенила, необязательно замещенного аралкинила, необязательно замещенного гетероциклила, необязательно замещенного гетероциклилалкила, необязательно замещенного гетероциклилакинила, необязательно замещенного гетероциклилалкенила, необязательно замещенного гетероциклилакинила, необязательно замещенного гетероарилалкенила, необязательно замещенного гетероарилакинила, необязательно замещенного гетероарилалкенила, необязательно замещенного гетероарилакинила, $-R^6-CN$, $-R^6-NO_2$, $-R^6-OR^5$, $-R^6-OC(O)R^4$, $-R^6-OS(O)_2R^4$, $-R^6-C(O)R^4$, $-R^6-C(O)OR^4$, $-R^6-C(O)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(O)R^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)OR^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)S(O)_tR^4$, $-R^6-N[S(O)_tR^4]_2$, $-R^6-N(R^5)C(=NR^5)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(=NR^5)N(R^4)CN$, $-R^6-N(R^5)C[=NC(O)OR^4]-N(R^4)-C(O)OR^4$, $-R^6-N(R^5)-R^7-N(R^4)R^5$, $-R^6-N=C(OR^4)R^5$, $-R^6-N=C(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)-R^6-OR^5$, $-R^6-S(O)_pR^4$ и $-R^6-S(O)_tN(R^4)R^5$, где каждый p независимо равен 0, 1 или 2, и каждый t независимо равен 1 или 2;

каждый R^4 и R^5 независимо выбирают из группы, состоящей из водорода, алкила, алкенила, алкинила, галогеналкила, гидроксиалкила, алкоксиалкила, необязательно замещенного циклоалкила, необязательно замещенного циклоалкилалкила, необязательно замещенного арила, необязательно замещенного аралкила, необязательно замещенного гетероциклила, необязательно замещенного гетероарила и необязательно замещенного гетероарилалкила;

или R^4 и R^5 вместе с атомом азота, к которому они оба присоединены, образуют необязательно замещенный N-гетероциклил или необязательно замещенный N-

R U 2009133336 A

гетероарил;

каждый R⁶ представляет собой прямую связь, необязательно замещенную линейную или разветвленную алкиленовую цепь, необязательно замещенную линейную или разветвленную алкениленовую цепь или необязательно замещенную линейную или разветвленную алкиниленовую цепь; и

R⁷ представляет собой линейную или разветвленную алкиленовую цепь, линейную или разветвленную алкениленовую цепь или линейную или разветвленную алкиниленовую цепь;

в виде его стереоизомера, энантиомера, таутомера или их смеси;

или его фармацевтически приемлемой солью, сольватом или пролекарства.

33. Способ лечения рака у млекопитающего, включающий введение млекопитающему, нуждающемуся в этом, терапевтически эффективного количества соединения формулы (I)

(I)

где n равен 1, 2, 3 или 4;

каждый R¹ независимо выбирают из группы, состоящей из водорода, алкила, алкенила, алкинила, галогена, галогеналкила, галогеналкенила, галогеналкинила, циклоалкила, циклоалкилалкила, циклоалкилалкенила, циклоалкилалкинила, арила, аралкила, аралкенила, аралкинила, гетероциклила, гетероциклизалкила, гетероциклизалкенила, гетероциклизалкинила, гетероарила, гетероарилалкила, гетероарилалкенила, гетероарилалкинила, -R⁶-CN, -R⁶-NO₂, -R⁶-OR⁵, -R⁶-N(R⁴)R⁵, -R⁶-S-(O)_pR⁴, -R⁶-C(O)R⁴, R⁶-C(S)R⁴, -R⁶-C(R⁴)₂C(O)R⁵, -R⁶-C(O)OR⁴, -R⁶-OC(O)R⁴, -R⁶-C(S)OR⁴, -R⁶-C(O)N(R⁴)R⁵, -R⁶-C(S)N(R⁴)R⁵, -R⁶-N(R⁵)C(O)R⁴, -R⁶-N(R⁵)C(S)R⁴, -R⁶-N(R⁵)C(O)OR⁴, -R⁶-N(R⁵)C(S)OR⁴, -R⁶-N(R⁵)C(O)N(R⁴)R⁵, -R⁶-N(R⁵)C(S)N(R⁴)R⁵, -R⁶-N(R⁵)S(O)R⁴, -R⁶-N(R⁵)S(O)N(R⁴)R⁵, -R⁶-S(O)N(R⁴)R⁵, -R⁶-N(R⁵)C(=NR⁵)N(R⁴)R⁵ и -R⁶-N(R⁵)C(N=C(R⁴)R⁵)N(R⁴)R⁵, где каждый p независимо равен 0, 1 или 2, и каждый t независимо равен 1 или 2;

или две соседние группы R¹ вместе с атомами углерода, к которым они непосредственно присоединены, образуют конденсированное кольцо, выбранное из необязательно замещенного циклоалкила, необязательно замещенного арила, необязательно замещенного гетероциклила или необязательно замещенного гетероарила, и другие R¹, если присутствуют, имеют указанные выше значения;

R² представляет собой водород, алкил, алкенил, алкинил, галогеналкил, галогеналкенил, галогеналкинил, циклоалкил, циклоалкилалкил, циклоалкилалкенил, арил, аралкил, аралкенил, аралкинил, гетероциклил, гетероциклизалкил, гетероциклизалкенил, гетероциклизалкинил, гетероарилалкенил, гетероарилалкинил, -R⁶-OR⁵ или -R⁶-N(R⁴)R⁵;

R³ представляет собой водород, алкил, алкенил, алкинил, галогеналкил, галогеналкенил, галогеналкинил, гидроксиалкил, циклоалкил, циклоалкилалкил, циклоалкилалкенил, циклоалкилалкинил, арил, аралкил, аралкенил, аралкинил, гетероциклил, гетероциклизалкил, гетероциклизалкенил, гетероциклизалкинил, гетероарил, гетероарилалкил, гетероарилалкенил, гетероарилалкинил, -R⁶-N(R⁴)R⁵ или -R⁶-N(R⁴)C(O)OR⁴;

где циклоалкил, циклоалкилалкил, циклоалкилалкенил, циклоалкилалкинил, арил,

аралкил, аралкенил, аралкинил, гетероциклик, гетероцикликалкил, гетероцикликалкенил, гетероцикликалкинил, гетероарил, гетероарилалкил, гетероарилалкенил и гетероарилалкинил, каждый необязательно замещен одним или несколькими заместителями, выбранными из группы, состоящей из алкила, алкенила, алкинила, галогена, галогеналкила, галогеналкенила, галогеналкинила, необязательно замещенного циклоалкила, необязательно замещенного циклоалкенила, необязательно замещенного циклоалкенила, необязательно замещенного арила, необязательно замещенного аралкила, необязательно замещенного аралкенила, необязательно замещенного гетероциклик, необязательно замещенного гетероцикликалкила, необязательно замещенного гетероцикликалкенила, необязательно замещенного гетероцикликалкинила, необязательно замещенного гетероарила, необязательно замещенного гетероарилалкила, необязательно замещенного гетероарилалкенила, необязательно замещенного гетероарилалкинила, где каждый R независимо равен 0, 1 или 2, и каждый t независимо равен 1 или 2;

каждый R^4 и R^5 независимо выбирают из группы, состоящей из водорода, алкила, алкенила, алкинила, галогеналкила, гидроксиалкила, алкоксиалкила, необязательно замещенного циклоалкила, необязательно замещенного циклоалкенила, необязательно замещенного арила, необязательно замещенного аралкила, необязательно замещенного гетероциклик, необязательно замещенного гетероцикликалкила, необязательно замещенного гетероарила и необязательно замещенного гетероарилалкила;

или R^4 и R^5 вместе с атомом азота, к которому они оба присоединены, образуют необязательно замещенный N-гетероциклик или необязательно замещенный N-гетероарил;

каждый R^6 представляет собой прямую связь, необязательно замещенную линейную или разветвленную алкиленовую цепь, необязательно замещенную линейную или разветвленную алкениленовую цепь или необязательно замещенную линейную или разветвленную алкиниленовую цепь; и

R^7 представляет собой линейную или разветвленную алкиленовую цепь, линейную или разветвленную алкениленовую цепь или линейную или разветвленную алкиниленовую цепь;

в виде его стереоизомера, энантиомера, таутомера или их смеси;

или его фармацевтически приемлемой солью, сольватом или пролекарством.