



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.Спаская, 25, стр.3,
ООО "Юридическая фирма Городиский и
Партнеры", пат.пов. А.В.Мишу, рег.№ 364

(71) Заявитель(и):

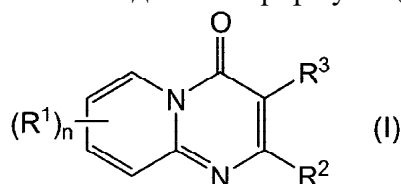
**КСЕНОН ФАРМАСЬЮТИКАЛЗ ИНК.
(СА)**

(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, гетероциклила, гетероциклилалкила, гетероциклилалкенила, гетероциклилалкинила, 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, -

$R^6-N(R^5)C(O)OR^4$, $-R^6-N(R^5)C(S)OR^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(S)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)S(O)_tR^4$, $-R^6-N(R^5)S(O)_tN(R^4)R^5$, $-R^6-S(O)_tN(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(=NR^5)N(R^4)R^5$ 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, гидроксialкил, 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, $-R^6-CN$, $-R^6-NO_2$, $-R^6-OR^5$, $-R^6-OC(O)R^4$, $-R^6-OS(O)_2R^4$, $-R^6-C(O)R^4$, $-R^6-C(O)OR^4$, $-R^6-C(O)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(O)R^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)OR^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)S(O)_tR^4$, $-R^6-N[S(O)_tR^4]_2$, $-R^6-N(R^5)C(=NR^5)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(=NR^5)N(R^4)CN$, $-R^6-N(R^5)C[=NC(O)OR^4]-N(R^4)-C(O)OR^4$, $-R^6-N(R^5)-R^7-N(R^4)R^5$, $-R^6-N=C(OR^4)R^5$, $-R^6-N=C(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)-R^6-OR^5$, $-R^6-S(O)_pR^4$ 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, гидроксialкила, алкоксialкила, необязательно замещенного циклоалкила, необязательно замещенного циклоалкилалкила, необязательно замещенного арила, необязательно замещенного аралкила, необязательно замещенного гетероциклила, необязательно замещенного

гетероциклилалкила, необязательно замещенного гетероарила и необязательно замещенного гетероариалалкила;

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, 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, гетероциклилалкила, гетероарила, гетероариалалкила, $-R^6-CN$, $-R^6-NO_2$, $-R^6-OR^5$, $-R^6-N(R^4)R^5$, $-R^6-S-(O)_pR^4$, $-R^6-C(O)R^4$, $R^6-C(S)R^4$, $-R^6-C(R^4)_2C(O)R^5$, $-R^6-C(O)OR^4$, $-R^6-OC(O)R^4$, $-R^6-C(S)OR^4$, $-R^6-C(O)N(R^4)R^5$, $-R^6-C(S)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(O)R^4$, $-R^6-N(R^5)C(S)R^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)OR^4$, $-R^6-N(R^5)C(S)OR^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(S)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)S(O)_tR^4$, $-R^6-N(R^5)S(O)_tN(R^4)R^5$, $-R^6-S(O)_tN(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(=NR^5)N(R^4)R^5$ 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, гетероциклил, гетероциклилалкил, гетероарил, гетероариалалкил, $-R^6-OR^5$ или $-R^6-N(R^4)R^5$;

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

где циклоалкил, циклоалкилалкил, арил, аралкил, гетероциклил, гетероциклилалкил, гетероарил и гетероариалалкил, 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 гетероариалалкила, $-R^6-CN$, $-R^6-NO_2$, $-R^6-OR^5$, $-R^6-OC(O)R^4$, $-R^6-OS(O)_2R^4$, $-R^6-C(O)R^4$, $-R^6-C(O)OR^4$, $-R^6-C(O)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(O)R^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)OR^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)S(O)_tR^4$, $-R^6-N[S(O)_tR^4]_2$, $-R^6-N(R^5)C(=NR^5)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(=NR^5)N(R^4)CN$, $-R^6-N(R^5)C[=NC(O)OR^4]N(R^4)C(O)OR^4$, $-R^6-N(R^5)-R^7-N(R^4)R^5$, $-R^6-N=C(OR^4)R^5$, $-R^6-N=C(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)-R^6-OR^5$, -

$R^6-S(O)_pR^4$ 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, гидроксипалкила, алкоксипалкила, 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-гетероциклический 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.

3. Соединение по п.2, 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 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, гетероциклический, гетероциклилалкил, гетероарил, гетероарилалкил, $-R^6-OR^5$ или $-R^6-N(R^4)R^5$;

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

где циклоалкил, циклоалкилалкил, арил, аралкил, гетероциклический, 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 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, гидроксикала, алкоксикала, 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-гетероциклический 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 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, гетероциклический, гетероциклилалкил, гетероарил, гетероарилалкил, $-R^6-OR^5$ или $-R^6-N(R^4)R^5$;

R^3 представляет собой арил, аралкил, гетероциклический, гетероциклилалкил, гетероарил или гетероарилалкил, где арил, аралкил, гетероциклический, 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 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, гидроксикала, алкоксикала, 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-гетероцикл 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, гетероциклилалкил или гетероариалкил;

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 гетероариалкила, $-R^6-CN$, $-R^6-NO_2$, $-R^6-OR^5$, $-R^6-OC(O)R^4$, $-R^6-OS(O)_2R^4$, $-R^6-C(O)R^4$, $-R^6-C(O)OR^4$, $-R^6-C(O)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(O)R^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)OR^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)S(O)_tR^4$, $-R^6-N[S(O)_tR^4]_2$, $-R^6-N(R^5)C(=NR^5)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(=NR^5)N(R^4)CN$, $-R^6-N(R^5)C[=NC(O)OR^4]-N(R^4)-C(O)OR^4$, $-R^6-N(R^5)-R^7-N(R^4)R^5$, $-R^6-N=C(OR^4)R^5$, $-R^6-N=C(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)-R^6-OR^5$, $-R^6-S(O)_pR^4$ 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, гидроксипалкила, алкоксипалкила, необязательно замещенного циклоалкила, необязательно замещенного циклоалкилалкила, необязательно замещенного арила, необязательно замещенного аралкила, необязательно замещенного гетероциклила, необязательно замещенного гетероциклилалкила, необязательно замещенного гетероарила и необязательно замещенного гетероариалкила;

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

7. Соединение по п.6, 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 галогена, алкила, галогеналкила, $-R^6-OR^5$, $-R^6-OC(O)R^4$, $-R^6-OS(O)_2R^4$, $-R^6-N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(O)R^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)OR^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)S(O)_tR^4$ 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, гидроксисалкила, алкоксисалкила, 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-гетероциклил или необязательно замещенный N-гетероарил; и

каждый R^6 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]пиримидин-4-он;
2-бутил-3-(4-гидроксифенил)-4Н-пиридо[1,2-а]пиримидин-4-он;
2-бутил-3-(4-хлорфенил)-4Н-пиридо[1,2-а]пиримидин-4-он;
трет-бутил-3-{[4-(2-бутил-4-оксо-4Н-пиридо[1,2-а]пиримидин-3-ил)фенил]амино}
пирролидин-1-карбоксилат;
(S)-трет-бутил-2-{[4-(2-бутил-4-оксо-4Н-пиридо[1,2-а]пиримидин-3-ил)фенил]
карбамоил} пирролидин-1-карбоксилат;
трет-бутил-4-(2-бутил-4-оксо-4Н-пиридо[1,2-а]пиримидин-3-ил)фенилкарбамат;
2-бутил-3-(3-хлор-4-метоксифенил)-4Н-пиридо[1,2-а]пиримидин-4-он;
2-бутил-3-(3-хлорфенил)-4Н-пиридо[1,2-а]пиримидин-4-он;
2-бутил-3-(4-хлор-3-фторфенил)-4Н-пиридо[1,2-а]пиримидин-4-он;
3-(4-хлорфенил)-2-(трифторметил)-4Н-пиридо[1,2-а]пиримидин-4-он;
4-(2-бутил-4-оксо-4Н-пиридо[1,2-а]пиримидин-3-ил)фенилтрифторметансульфонат;
(S)-трет-бутил-3-(4-(2-бутил-4-оксо-4Н-пиридо[1,2-а]пиримидин-3-
ил)фениламино)пирролидин-1-карбоксилат;
(R)-трет-бутил-3-(4-(2-бутил-4-оксо-4Н-пиридо[1,2-а]пиримидин-3-
ил)фениламино)пирролидин-1-карбоксилат;
трет-бутил-3-(3-(2-бутил-4-оксо-4Н-пиридо[1,2-а]пиримидин-3-
ил)фениламино)пирролидин-1-карбоксилат;
трет-бутил-3-({4-[2-(1-метилэтил)-4-оксо-4Н-пиридо[1,2-а]пиримидин-3-ил]фенил}
амино)пирролидин-1-карбоксилат;
(R)-трет-бутил-3-(4-(2-бутил-4-оксо-4Н-пиридо[1,2-а]пиримидин-3-ил)-2-
фторфениламино)пирролидин-1-карбоксилат;
2-бутил-3-(4-(пирролидин-3-иламино)фенил)-4Н-пиридо[1,2-а]пиримидин-4-он;
(S)-N-[4-(2-бутил-4-оксо-4Н-пиридо[1,2-а]пиримидин-3-ил)фенил]-L-пролинамид;
(S)-2-бутил-3-{4-[пирролидин-3-иламино]фенил}-4Н-пиридо[1,2-а]пиримидин-4-он;
(R)-2-бутил-3-(4-(пирролидин-3-иламино)фенил)-4Н-пиридо[1,2-а]пиримидин-4-он;
(R)-2-бутил-3-{3-фтор-4-[(пирролидин-3-иламино)фенил]-4Н-пиридо[1,2-а]
пиримидин-4-он;
2-бутил-3-[3-(пирролидин-3-иламино)фенил]-4Н-пиридо[1,2-а]пиримидин-4-он;
2-(1-метилэтил)-3-[4-(пирролидин-3-иламино)фенил]-4Н-пиридо[1,2-а]пиримидин-4-
он;
3-(4-хлорфенил)-2-метил-4Н-пиридо[1,2-а]пиримидин-4-он;
3-(4-хлорфенил)-2-этил-4Н-пиридо[1,2-а]пиримидин-4-он;
3-(4-хлорфенил)-2-пропил-4Н-пиридо[1,2-а]пиримидин-4-он;
2-бутил-3-(2-хлорфенил)-4Н-пиридо[1,2-а]пиримидин-4-он;
2-бутил-3-(4-хлор-2-метилфенил)-4Н-пиридо[1,2-а]пиримидин-4-он;
2-бутил-3-(4-хлор-3-метилфенил)-4Н-пиридо[1,2-а]пиримидин-4-он;
2-бутил-3-(4-хлор-3-(трифторметил)фенил)-4Н-пиридо[1,2-а]пиримидин-4-он;
3-(4-хлорфенил)-2-изопентил-4Н-пиридо[1,2-а]пиримидин-4-он;
3-(4-хлорфенил)-2-(2-циклопропилэтил)-4Н-пиридо[1,2-а]пиримидин-4-он;
2-бутил-3-(4-хлорфенил)-7-метил-4Н-пиридо[1,2-а]пиримидин-4-он;
2-бутил-3-(4-хлорфенил)-7-фтор-4Н-пиридо[1,2-а]пиримидин-4-он;
2-бутил-3-(4-хлорфенил)-8-(трифторметил)-4Н-пиридо[1,2-а]пиримидин-4-он;
2-бутил-7-хлор-3-(4-метоксифенил)-4Н-пиридо[1,2-а]пиримидин-4-он;
трет-бутил-3-{[4-(2-бутил-4-оксо-4Н-пиридо[1,2-а]пиримидин-3-ил)фенил]амино}
пиперидин-1-карбоксилат;
(R)-трет-бутил-3-{[4-(2-бутил-4-оксо-4Н-пиридо[1,2-а]пиримидин-3-ил)фенил]амино}
пиперидин-1-карбоксилат;
трет-бутил-4-{[4-(2-бутил-4-оксо-4Н-пиридо[1,2-а]пиримидин-3-ил)фенил]амино}

пиперидин-1-карбоксилат;

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

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

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

(R)-трет-бутил-3-([4-(2-бутил-4-оксо-4Н-пиридо[1,2-а]пиримидин-3-ил)-3-метилфенил]амино)пирролидин-1-карбоксилат;

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

9. 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 $-R^6-OR^5$ 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-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.

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

каждый R^1 представляет собой водород;

R^2 представляет собой $-R^6-OR^5$ 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 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, гидроксисалкила, алкоксисалкила, 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-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.

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

каждый R^1 представляет собой водород;

R^2 представляет собой $-R^6-OR^5$ 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, $-R^6-OR^5$, $-R^6-OC(O)R^4$, $-R^6-OS(O)_2R^4$, $-R^6-N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(O)R^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)OR^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)S(O)_tR^4$ 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, гидроксисалкила, алкоксисалкила, 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-гетероциклил или необязательно замещенный N-гетероарил; и

каждый R^6 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]пиримидин-4-он;

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

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

13. 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, гетероциклилалкил или гетероарилалкил;

R^3 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 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, гидроксипалкила, алкоксипалкила, 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-гетероцикл 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.

14. 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, гетероциклилалкил или гетероарилалкил;

R^3 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 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, гидроксипалкила, алкоксипалкила, 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-гетероцикл 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.

15. Соединение по п.14, 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 циклоалкилалкил;

R^3 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, $-R^6-CN$, $-R^6-NO_2$, $-R^6-OR^5$, $-R^6-OC(O)R^4$, $-R^6-OS(O)_2R^4$, $-R^6-C(O)R^4$, $-R^6-C(O)OR^4$, $-R^6-C(O)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(O)R^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)OR^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)S(O)_tR^4$, $-R^6-N[S(O)_tR^4]_2$, $-R^6-N(R^5)C(=NR^5)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(=NR^5)N(R^4)CN$, $-R^6-N(R^5)C[=NC(O)OR^4]-N(R^4)-C(O)OR^4$, $-R^6-N(R^5)-R^7-N(R^4)R^5$, $-R^6-N=C(OR^4)R^5$, $-R^6-N=C(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)-R^6-OR^5$, $-R^6-S(O)_pR^4$ 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, гидроксипалкила, алкоксипалкила, 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-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.

16. Соединение по п.15, 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 циклоалкилалкил;

R^3 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, $-R^6-OR^5$, $-R^6-C(O)R^4$, $-R^6-OS(O)_2R^4$, $-R^6-N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(O)R^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)OR^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)S(O)_tR^4$ 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, гидроксипалкила, алкоксипалкила, 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-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 группы, включающей

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

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

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

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

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

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

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

2-бутил-3-(6-пиперазин-1-илпиридин-3-ил)-4Н-пиридо[1,2-а]пиримидин-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, гетероциклилалкил или гетероарилалкил;

R^3 представляет собой гетероарилалкил, 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, гидроксилалкила, алкоксилалкила, 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-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.

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, 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 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, гетероциклил, гетероциклилалкил, 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, гетероциклил, гетероциклилалкил, гетероарил, гетероарилалкил, $-R^6-N(R^4)R^5$ или $-R^6-N(R^4)C(O)OR^4$;

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, $-R^6-CN$, $-R^6-NO_2$, $-R^6-OR^5$, $-R^6-OC(O)R^4$, $-R^6-OS(O)_2R^4$, $-R^6-C(O)R^4$, $-R^6-C(O)OR^4$, $-R^6-C(O)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(O)R^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)OR^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)S(O)_tR^4$, $-R^6-N[S(O)_tR^4]_2$, $-R^6-N(R^5)C(=NR^5)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(=NR^5)N(R^4)CN$, $-R^6-N(R^5)C[=NC(O)OR^4]-N(R^4)-C(O)OR^4$, $-R^6-N(R^5)-R^7-N(R^4)R^5$, $-R^6-N=C(OR^4)R^5$, $-R^6-N=C(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)-R^6-OR^5$, $-R^6-S(O)_pR^4$ 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-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.

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, гидроксилалкила, алкоксилалкила, 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-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.

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, гетероциклилалкил, 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 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, гидроксialкила, алкоксialкила, 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-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, гетероциклилалкил, 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, $-R^6-OR^5$, $-R^6-OC(O)R^4$, $-R^6-OS(O)_2R^4$, $-R^6-N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(O)R^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)OR^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)S(O)_tR^4$ 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, гидроксialкила, алкоксialкила, 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-гетероцикл или необязательно замещенный N-гетероарил; и

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

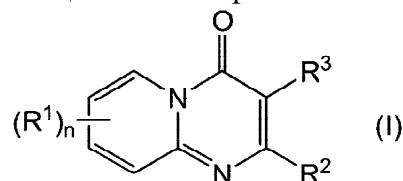
23. Соединение по п.22, выбранное из группы, включающей

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 R¹ независимо выбирают из группы, состоящей из водорода, алкила, алкенила, алкинила, галогена, галогеналкила, галогеналкенила, галогеналкинила, циклоалкила, циклоалкилалкила, циклоалкилалкенила, циклоалкилалкинила, арила, аралкила, аралкенила, аралкинила, гетероцикла, гетероциклалкила, гетероциклалкенила, гетероциклалкинила, 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)_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;

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 гетероцикла 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, гетероцикл, гетероциклалкил, гетероциклалкенил, гетероциклалкинил, гетероарил, гетероарилалкил, гетероарилалкенил, гетероарилалкинил, -R⁶-OR⁵ или -R⁶-N(R⁴)R⁵;

R³ представляет собой водород, алкил, алкенил, алкинил, галогеналкил, галогеналкенил, галогеналкинил, гидроксипалкил, циклоалкил, циклоалкилалкил, циклоалкилалкенил, циклоалкилалкинил, арил, аралкил, аралкенил, аралкинил, гетероцикл, гетероциклалкил, гетероциклалкенил, гетероциклалкинил, гетероарил, гетероарилалкил, гетероарилалкенил, гетероарилалкинил, -R⁶-N(R⁴)R⁵ или -R⁶-N(R⁴)C(O)OR⁴;

где циклоалкил, циклоалкилалкил, циклоалкилалкенил, циклоалкилалкинил, арил, аралкил, аралкенил, аралкинил, гетероцикл, гетероциклалкил, гетероциклалкенил, гетероциклалкинил, 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 гетероцикла, необязательно замещенного гетероциклалкила, необязательно замещенного гетероциклалкенила, 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 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, гидроксипалкила, алкоксипалкила, необязательно замещенного циклоалкила, необязательно замещенного циклоалкилалкила, необязательно замещенного арила, необязательно замещенного аралкила, необязательно замещенного гетероцикла, необязательно замещенного гетероциклалкила, 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-гетероцикл или необязательно замещенный N-гетероарил;

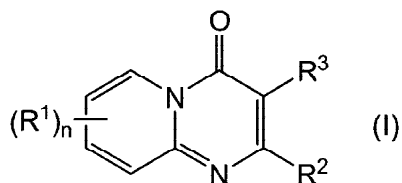
каждый R^6 представляет собой прямую связь, необязательно замещенную линейную или разветвленную алкиленовую цепь, необязательно замещенную линейную или разветвленную алкениленовую цепь или необязательно замещенную линейную или разветвленную алкиниленовую цепь; и

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, сольвата 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, гидроксипалкил, 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, $-R^6-CN$, $-R^6-NO_2$, $-R^6-OR^5$, $-R^6-OC(O)R^4$, $-R^6-OS(O)_2R^4$, $-R^6-C(O)R^4$, $-R^6-C(O)OR^4$, $-R^6-C(O)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(O)R^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)OR^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)S(O)_tR^4$, $-R^6-N[S(O)_tR^4]_2$, $-R^6-N(R^5)C(=NR^5)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(=NR^5)N(R^4)CN$, $-R^6-N(R^5)C[=NC(O)OR^4]-N(R^4)-C(O)OR^4$, $-R^6-N(R^5)-R^7-N(R^4)R^5$, $-R^6-N=C(OR^4)R^5$, $-R^6-N=C(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)-R^6-OR^5$, $-R^6-S(O)_pR^4$ 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-гетероциклил 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;

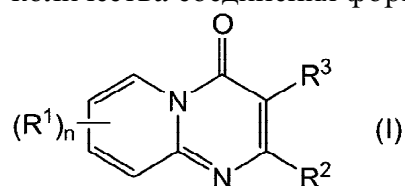
или его фармацевтически приемлемой соли, сольвата или пролекарства.

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, нейрозащиты 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, гидроксипалкил, 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, $-R^6-CN$, $-R^6-NO_2$, $-R^6-OR^5$, $-R^6-OC(O)R^4$, $-R^6-OS(O)_2R^4$, $-R^6-C(O)R^4$, $-R^6-C(O)OR^4$, $-R^6-C(O)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(O)R^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)OR^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)S(O)_tR^4$, $-R^6-N[S(O)_tR^4]_2$, $-R^6-N(R^5)C(=NR^5)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(=NR^5)N(R^4)CN$, $-R^6-N(R^5)C[=NC(O)OR^4]N(R^4)-C(O)OR^4$, $-R^6-N(R^5)-R^7-N(R^4)R^5$, $-R^6-N=C(OR^4)R^5$, $-R^6-N=C(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)-R^6-OR^5$, $-R^6-S(O)_pR^4$ 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, гидроксилалкила, алкоксилалкила, 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-гетероцикл или необязательно замещенный N-гетероарил;

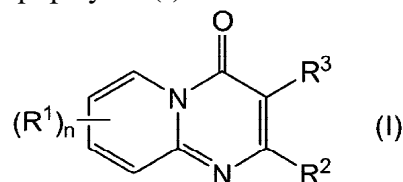
каждый R^6 представляет собой прямую связь, необязательно замещенную линейную или разветвленную алкиленовую цепь, необязательно замещенную линейную или разветвленную алкениленовую цепь или необязательно замещенную линейную или разветвленную алкиниленовую цепь; и

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, сольвата 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, 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, гидроксикал, 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, $-R^6-CN$, $-R^6-NO_2$, $-R^6-OR^5$, $-R^6-OC(O)R^4$, $-R^6-OS(O)_2R^4$, $-R^6-C(O)R^4$, $-R^6-C(O)OR^4$, $-R^6-C(O)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(O)R^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)OR^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)S(O)_tR^4$, $-R^6-N[S(O)_tR^4]_2$, $-R^6-N(R^5)C(=NR^5)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(=NR^5)N(R^4)CN$, $-R^6-N(R^5)C[=NC(O)OR^4]-N(R^4)-C(O)OR^4$, $-R^6-N(R^5)-R^7-N(R^4)R^5$, $-R^6-N=C(OR^4)R^5$, $-R^6-N=C(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)-R^6-OR^5$, $-R^6-S(O)_pR^4$ 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, гидроксикала, алкоксикала, 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-гетероциклил или необязательно замещенный N-гетероарил;

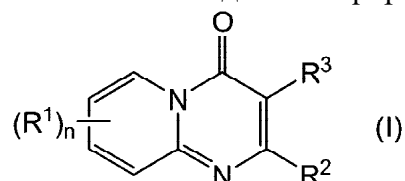
каждый R^6 представляет собой прямую связь, необязательно замещенную линейную или разветвленную алкиленовую цепь, необязательно замещенную линейную или разветвленную алкениленовую цепь или необязательно замещенную линейную или разветвленную алкиниленовую цепь; и

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, 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, гетероцикл, 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, гетероцикл, 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 гетероцикла, 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 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 гетероцикла, 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-гетероцикл 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

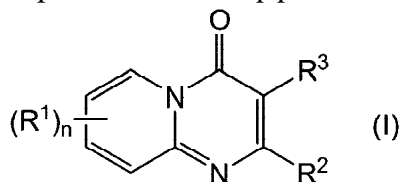
R^7 представляет собой линейную или разветвленную алкиленовую цепь, линейную или разветвленную алкениленовую цепь или линейную или разветвленную алкиниленовую цепь;

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

или его фармацевтически приемлемой солью, сольвата 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, 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, гидроксialкил, 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, $-R^6-CN$, $-R^6-NO_2$, $-R^6-OR^5$, $-R^6-OC(O)R^4$, $-R^6-OS(O)_2R^4$, $-R^6-C(O)R^4$, $-R^6-C(O)OR^4$, $-R^6-C(O)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(O)R^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)OR^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)S(O)_tR^4$, $-R^6-N[S(O)_tR^4]_2$, $-R^6-N(R^5)C(=NR^5)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(=NR^5)N(R^4)CN$, $-R^6-N(R^5)C[=NC(O)OR^4]-N(R^4)-C(O)OR^4$, $-R^6-N(R^5)-R^7-N(R^4)R^5$, $-R^6-N=C(OR^4)R^5$, $-R^6-N=C(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)-R^6-OR^5$, $-R^6-S(O)_pR^4$ 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, гидроксипалкила, алкоксипалкила, необязательно замещенного циклоалкила, необязательно замещенного циклоалкилалкила, необязательно замещенного арила, необязательно замещенного аралкила, необязательно замещенного гетероцикла, необязательно замещенного гетероциклалкила, 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-гетероцикл или необязательно замещенный N-гетероарил;

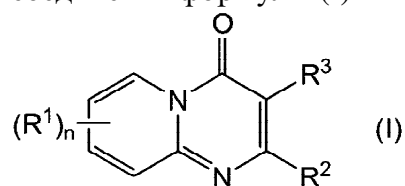
каждый R^6 представляет собой прямую связь, необязательно замещенную линейную или разветвленную алкиленовую цепь, необязательно замещенную линейную или разветвленную алкениленовую цепь или необязательно замещенную линейную или разветвленную алкиниленовую цепь; и

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, сольвата 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, гетероцикла, гетероциклалкила, гетероциклалкенила, гетероциклалкинила, 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 гетероцикла 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, гетероцикл, гетероциклалкил, гетероциклалкенил, гетероциклалкинил, 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, гетероцикл, гетероциклалкил, гетероциклалкенил, гетероциклалкинил, 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, гетероцикл, гетероциклалкил, гетероциклалкенил, гетероциклалкинил, 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 гетероцикла, необязательно замещенного гетероциклалкила, необязательно замещенного гетероциклалкенила, необязательно замещенного гетероциклалкинила, 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 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 гетероцикла, необязательно замещенного гетероциклалкила, 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-гетероцикл или необязательно замещенный N-

гетероарил;

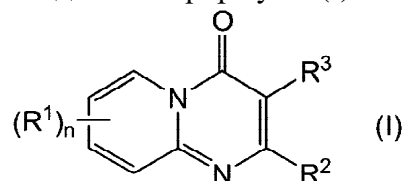
каждый R^6 представляет собой прямую связь, необязательно замещенную линейную или разветвленную алкиленовую цепь, необязательно замещенную линейную или разветвленную алкениленовую цепь или необязательно замещенную линейную или разветвленную алкиниленовую цепь; и

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, сольвата или пролекарства.

33. Способ лечения рака 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, гетероцикла, гетероциклалкила, гетероциклалкенила, гетероциклалкинила, 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 гетероцикла 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, гетероцикл, гетероциклалкил, гетероциклалкенил, гетероциклалкинил, 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, гидроксильный алкил, циклоалкил, циклоалкилалкил, циклоалкилалкенил, циклоалкилалкинил, арил, аралкил, аралкенил, аралкинил, гетероцикл, гетероциклалкил, гетероциклалкенил, гетероциклалкинил, 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, гетероцикллил, 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, $-R^6-CN$, $-R^6-NO_2$, $-R^6-OR^5$, $-R^6-OC(O)R^4$, $-R^6-OS(O)_2R^4$, $-R^6-C(O)R^4$, $-R^6-C(O)OR^4$, $-R^6-C(O)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(O)R^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)OR^4$, $-R^6-N(R^5)C(O)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)S(O)_tR^4$, $-R^6-N[S(O)_tR^4]_2$, $-R^6-N(R^5)C(=NR^5)N(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)C(=NR^5)N(R^4)CN$, $-R^6-N(R^5)C[=NC(O)OR^4]N(R^4)C(O)OR^4$, $-R^6-N(R^5)-R^7-N(R^4)R^5$, $-R^6-N=C(OR^4)R^5$, $-R^6-N=C(R^4)R^5$, $-R^6-N(R^5)-R^6-OR^5$, $-R^6-S(O)_pR^4$ 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, гидроксипалкила, алкоксипалкила, 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-гетероцикллил 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, сольвата или пролекарства.