



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ,
ПАТЕНТАМ И ТОВАРНЫМ ЗНАКАМ

(12) ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ

(21), (22) Заявка: 2007101073/04, 14.06.2005

(30) Конвенционный приоритет:
15.06.2004 US 60/579,638
24.05.2005 US 60/684,127
13.06.2005 US 11/151,667

(43) Дата публикации заявки: 20.07.2008 Бюл. № 20

(85) Дата перевода заявки РСТ на национальную фазу:
15.01.2007

(86) Заявка РСТ:
US 2005/021212 (14.06.2005)

(87) Публикация РСТ:
WO 2005/123050 (29.12.2005)

Адрес для переписки:
119034, Москва, Пречистенский пер., 14,
стр.1, 4 этаж, "Гоулингз Интернэшнл Инк.",
В.Н.Дементьеву

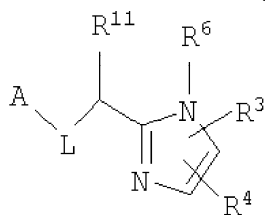
(71) Заявитель(и):
БРИСТОЛ-МАЕРС СКВИББ КОМПАНИ (US)

(72) Автор(ы):
ХЭНГЕЛЭНД Джон Дж. (US),
КВАН Мими Л. (US),
СМОЛЛХИЕР Джоанн М. (US),
БИЗАЧЧИ Грегори С. (US),
КОРТ Джеймс Р. (US),
ФРЕНДС Тодд Дж. (US),
СУН Жонг (US),
РОССИ Карен А. (US),
КАВАЛЛАРО Каллен Л. (US)

(54) ПЯТИЧЛЕННЫЕ ГЕТЕРОЦИКЛЫ, ПРИМЕНИМЫЕ В КАЧЕСТВЕ ИНГИБИТОРОВ СЕРИНОВОЙ ПРОТЕАЗЫ

(57) Формула изобретения

1. Соединение формулы (I)



(I)

или его стереоизомеры, таутомеры, фармацевтически приемлемые соли, сольваты, или пролекарства, где

А представляет собой C₃₋₁₀ карбоцикл, замещенный с помощью 0-1 R¹ и 0-3 R², или 5-12-членный гетероцикл, включающий атомы углерода и 1-4 гетероатомов, выбранных из N, O, и S(O)_p, где указанный гетероцикл является замещенным с помощью 0-1 R¹ и 0-3 R²; при условии, что когда А представляет собой гетероцикл, содержащий один или большее количество атомов азота, А не является присоединенным к L через любой из атомов азота на кольце А;

L представляет собой -C(O)NR¹⁰-, -NR¹⁰C(O)-, -CH₂C(O)NR¹⁰-, -CH₂NR¹⁰C(O)-

, $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^{10}\text{CH}_2-$, $-\text{NR}^{10}\text{C}(\text{O})\text{CH}_2-$, $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}^{10}-$, $-\text{NR}^{10}\text{S}(\text{O})_2-$, $-\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2\text{NR}^{10}-$, $-\text{CH}_2\text{NR}^{10}\text{S}(\text{O})_2-$, $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}^{10}\text{CH}_2-$, $-\text{NR}^{10}\text{S}(\text{O})_2\text{CH}_2-$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$, $-\text{CH}_2\text{NR}^7-$, $-\text{NR}^7\text{CH}_2-$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NR}^7-$, $-\text{NR}^7\text{CH}_2\text{CH}_2-$, $-\text{CH}_2\text{NR}^7\text{CH}_2-$, $-\text{CH}_2\text{O}-$, $-\text{OCH}_2-$, $-\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_p-$, $-\text{S}(\text{O})_p\text{CH}_2-$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-$, $-\text{OCH}_2\text{CH}_2-$, $-\text{CH}_2\text{OCH}_2-$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_p-$, $-\text{S}(\text{O})_p\text{CH}_2\text{CH}_2-$, $-\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_p\text{CH}_2-$, $-\text{CH}_2\text{C}(\text{O})-$, $-\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{CH}_2-$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{O})-$, $-\text{C}(\text{O})\text{CH}_2\text{CH}_2-$, или $-\text{C}(\text{O})\text{CH}_2-$;

R^1 при каждом появлении независимо представляет собой $-\text{NH}_2$, $-\text{NH}(\text{C}_1-\text{C}_3 \text{ алкил})$, $-\text{N}(\text{C}_1-\text{C}_3 \text{ алкил})_2$, $-\text{C}(=\text{NH})\text{NH}_2$, $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^8\text{R}^9$, $-\text{S}(\text{O})_p\text{NR}^8\text{R}^9$, $-(\text{CH}_2)_r\text{NR}^7\text{R}^8$, $-(\text{CH}_2)_r\text{NR}^7\text{CO}_2\text{R}^a$, $-\text{CH}_2\text{NH}_2$, $-\text{CH}_2\text{NH}(\text{C}_{1-3} \text{ алкил})$, $-\text{CH}_2\text{N}(\text{C}_{1-3} \text{ алкил})_2$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}_2$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}(\text{C}_1-\text{C}_3 \text{ алкил})$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{N}(\text{C}_{1-3} \text{ алкил})_2$, $-\text{CH}(\text{C}_{1-4} \text{ алкил})\text{NH}_2$, $-\text{C}(\text{C}_{1-4} \text{ алкил})_2\text{NH}_2$, $-\text{C}(=\text{NR}^{8a})\text{NR}^7\text{R}^8$, $-\text{NHC}(=\text{NR}^{8a})\text{NR}^7\text{R}^8$, $=\text{NR}^8$, $-\text{NR}^8\text{CR}^8(=\text{NR}^{8a})$, F , Cl , Br , I , OCF_3 , CF_3 , $-(\text{CH}_2)_r\text{OR}^a$, $-(\text{CH}_2)_r\text{SR}^a$, CN , 1- NH_2 -1-циклопропил или C_{1-6} алкил, замещенный с помощью 0-1 R^{1a} ;

R^1 представляет собой H , $-\text{C}(=\text{NR}^{8a})\text{NR}^7\text{R}^8$, $-\text{NHC}(=\text{NR}^{8a})\text{NR}^7\text{R}^8$, $-\text{NR}^8\text{CH}(=\text{NR}^{8a})$, $-\text{NR}^7\text{R}^8$, $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^8\text{R}^9$, F , OCF_3 , CF_3 , OR^a , SR^a , CN , $-\text{NR}^9\text{SO}_2\text{NR}^8\text{R}^9$, $-\text{NR}^8\text{SO}_2\text{R}^c$, $-\text{S}(\text{O})_p-\text{C}_{1-4} \text{ алкил}$, $-\text{S}(\text{O})_p$ -фенил или $-(\text{CF}_2)_r-\text{CF}_3$;

R^2 при каждом появлении независимо представляет собой H , $=\text{O}$, F , Cl , Br , I , OCF_3 , CF_3 , CHF_2 , CN , NO_2 , OR^a , SR^a , $-\text{C}(\text{O})\text{R}^a$, $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^a$, $-\text{OC}(\text{O})\text{R}^a$, $-\text{NR}^7\text{R}^8$, $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^7\text{R}^8$, $-\text{NR}^7\text{C}(\text{O})\text{R}^b$, $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}^8\text{R}^9$, $-\text{NR}^8\text{S}(\text{O})_2\text{R}^c$, $-\text{S}(\text{O})\text{R}^c$, $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^c$, C_{1-6} алкил, замещенный с помощью 0-2 R^{2a} , C_{2-6} алкенил, замещенный с помощью 0-2 R^{2a} , C_{2-6} алкинил, замещенный с помощью 0-2 R^{2a} , $-(\text{CH}_2)_r-\text{C}_{3-10}$ карбоцикл, замещенный с помощью 0-3 R^{2b} , или $-(\text{CH}_2)_r$, 5-10-членный гетероцикл, включающий атомы углерода и 1-4 гетероатомов, выбранных из N , O , и $\text{S}(\text{O})_p$, где указанный гетероцикл является замещенным с помощью 0-3 R^{2b} ;

R^{2a} при каждом появлении независимо представляет собой H , F , Cl , Br , I , $=\text{O}$, $=\text{NR}^8$, CN , OCF_3 , CF_3 , OR^a , SR^a , $-\text{NR}^7\text{R}^8$, $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^8\text{R}^9$, $-\text{NR}^7\text{C}(\text{O})\text{R}^b$, $-\text{S}(\text{O})_p\text{NR}^8\text{R}^9$, $-\text{NR}^8\text{SO}_2\text{R}^c$, $-\text{S}(\text{O})\text{R}^c$ или $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^c$;

R^{2b} при каждом появлении независимо представляет собой H , F , Cl , Br , I , $=\text{O}$, $=\text{NR}^8$, CN , NO_2 , OR^a , SR^a , $-\text{C}(\text{O})\text{R}^a$, $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^a$, $-\text{OC}(\text{O})\text{R}^a$, $-\text{NR}^7\text{R}^8$, $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^7\text{R}^8$, $-\text{NR}^7\text{C}(\text{O})\text{R}^b$, $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}^8\text{R}^9$, $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^c$, $-\text{NR}^8\text{SO}_2\text{NR}^8\text{R}^9$, $-\text{NR}^8\text{SO}_2\text{R}^c$, $-(\text{CF}_2)_r-\text{CF}_3$, C_{1-6} алкил, C_{2-6} алкенил, C_{2-6} алкинил, C_{3-6} циклоалкил, C_{1-4} галогеналкил, или C_{1-4} галогеналкоксии;

альтернативно, когда R^1 и R^2 группы являются заместителями на смежных кольцевых атомах, они могут быть взяты вместе с атомами кольца, к которому они присоединены, чтобы образовать содержащий от 5 до 7 членов карбоцикл или гетероцикл, включающий атомы углерода и 0-4 гетероатомов, выбранных из N , O , и $\text{S}(\text{O})_p$, где указанный карбоцикл или гетероцикл является замещенным с помощью 0-2 R^{2b} ;

R^3 представляет собой $-(\text{CH}_2)_r\text{C}(\text{O})\text{NR}^8\text{R}^9$, $-(\text{CH}_2)_r\text{C}(\text{O})\text{NR}^8(\text{CH}_2)_s\text{CO}_2\text{R}^{3b}$, $-(\text{CH}_2)_r\text{CO}_2\text{R}^{3b}$, $-(\text{CH}_2)_r-\text{C}_{3-10}$ карбоцикл, замещенный с помощью 0-3 R^{3a} и 0-1 R^{3d} , или $-(\text{CH}_2)_r$, 5-10-членный гетероцикл, включающий атомы углерода и 1-4 гетероатомов, выбранных из N , O , и $\text{S}(\text{O})_p$, где указанный гетероцикл является замещенным с помощью 0-3 R^{3a} и 0-1 R^{3d} ;

R^{3a} при каждом появлении независимо представляет собой $=\text{O}$, F , Cl , Br , I , OCF_3 , CF_3 , NO_2 , CN , $-(\text{CH}_2)_r\text{OR}^{3b}$, $-(\text{CH}_2)_r\text{SR}^{3b}$, $-(\text{CH}_2)_r\text{NR}^7\text{R}^8$, $\text{C}(=\text{NR}^{8a})\text{NR}^8\text{R}^9$, $-\text{NHC}(=\text{NR}^{8a})\text{NR}^7\text{R}^8$, $-\text{NR}^8\text{CR}^8(=\text{NR}^{8a})$, $-(\text{CH}_2)_r\text{NR}^8\text{C}(\text{O})\text{R}^{3b}=\text{NR}^8$, $-(\text{CH}_2)_r\text{NR}^8\text{C}(\text{O})\text{R}^{3b}$, $-(\text{CH}_2)_r\text{NR}^8\text{C}(\text{O})_2\text{R}^{3b}$, $-(\text{CH}_2)_r\text{S}(\text{O})_p\text{NR}^8\text{R}^9$, $-(\text{CH}_2)_r\text{NR}^8\text{S}(\text{O})_p\text{R}^{3c}$, $-\text{S}(\text{O})_p\text{R}^{3c}$, $-\text{S}(\text{O})_p\text{R}^{3c}$, $-\text{C}(\text{O})-\text{C}_1-\text{C}_4 \text{ алкил}$, $-(\text{CH}_2)_r\text{CO}_2\text{R}^{3b}$, $-(\text{CH}_2)_r\text{C}(\text{O})\text{NR}^8\text{R}^9$, $-(\text{CH}_2)_r\text{OC}(\text{O})\text{NR}^8\text{R}^9$, $-\text{NHCOCF}_3$, $-\text{NH}\text{SO}_2\text{CF}_3$, $-\text{SO}_2\text{NHR}^{3b}$, $-\text{SO}_2\text{NHCOR}^{3c}$, $-\text{SO}_2\text{NHCO}_2\text{R}^{3c}$, $-\text{CONHSO}_2\text{R}^{3c}$, $-\text{NHSO}_2\text{R}^{3c}$, $-\text{CONHOR}^{3b}$, C_{1-4} галогеналкил, C_{1-4} галогеналкоксии, C_{1-6} алкил, замещенный с помощью R^{3d} , C_{2-6} алкенил, замещенный с помощью R^{3d} , C_{3-6} циклоалкил, замещенный с помощью 0-1 R^{3d} , $-(\text{CH}_2)_r-\text{C}_{3-10}$ карбоцикл, замещенный с помощью 0-3 R^{3d} , или $-(\text{CH}_2)_r$, 5-10-членный гетероцикл, включающий: атомы углерода и 1-4 гетероатомов, выбранных из N ,

O, и S(O)_p, где указанный гетероцикл замещен с помощью 0-3 R^{3d};

альтернативно, когда две R^{3a} группы расположены на смежных атомах, они могут быть взяты вместе с атомами, к которым они присоединены, чтобы образовать C₃₋₁₀ карбоцикл, замещенный с помощью 0-2 R^{3d}, или 5-10-членный гетероцикл, включающий: атомы углерода и 1-4 гетероатомов, выбранных из N, O, и S(O)_p, где указанный гетероцикл замещен с помощью 0-2 R^{3d};

R^{3b} при каждом появлении независимо представляет собой H, C₁₋₆алкил, замещенный с помощью 0-2 R^{3d}, C₂₋₆алкенил, замещенный с помощью 0-2 R^{3d}, C₂₋₆алкинил, замещенный с помощью 0-2 R^{3d}, -(CH₂)_r-C₃₋₁₀карбоцикл, замещенный с помощью 0-3 R^{3d}, или -(CH₂)_r-, 5-10-членный гетероцикл, включающий атомы углерода и 1-4 гетероатомов, выбранных из N, O, и S(O)_p, где указанный гетероцикл замещен с помощью 0-3 R^{3d};

R^{3c} при каждом появлении независимо представляет собой C₁₋₆алкил, замещенный с помощью 0-2 R^{3d}, C₂₋₆алкенил, замещенный с помощью 0-2 R^{3d}, C₂₋₆алкинил, замещенный с помощью 0-2 R^{3d}, -(CH₂)_r-C₃₋₁₀карбоцикл, замещенный с помощью 0-3 R^{3d}, или -(CH₂)_r-, содержащий от 5-10-членов гетероцикл, включающий: атомы углерода и 1-4 гетероатомов, выбранных из N, O, и S(O)_p, где указанный гетероцикл замещен с помощью 0-3 R^{3d};

R^{3d} при каждом появлении независимо представляет собой H, =O, -(CH₂)_rOR^a, F, Cl, Br, CN,

NO₂, -(CH₂)_rNR^{7R8}, -C(O)R^a, -C(O)OR^a, -OC(O)R^a, -NR^{7C}(O)R^b, -C(O)NR^{8R9}, -SO₂NR^{8R9}, -NR^{8SO2R9}, -NR^{8SO2R9}, -S(O)_pR^C, -(CF₂)_r-CF₃, C₁₋₆алкил, замещенный с помощью 0-2 R^e, C₂₋₆алкенил, замещенный с помощью 0-2 R^e, C₂₋₆алкинил, замещенный с помощью 0-2 R^e, -(CH₂)_r-C₃₋₁₀карбоцикл, замещенный с помощью 0-3 R^d, или -(CH₂)_r-, содержащий от 5 до 10 членов гетероцикл, включающий атомы углерода и 1-4 гетероатомов, выбранных из N, O, и S(O)_p, где указанный гетероцикл замещен с помощью 0-3 R^d;

R⁴ представляет собой H, F, Cl, Br, I, OCF₃, CF₃, OR^a, SR^a, CN, NO₂, -C(O)R^a, -C(O)OR^a, -OC(O)R^a -NR^{7R8}, -C(O)NR^{8R9}, -NR^{7C}(O)R^b, -S(O)_pNR^{8R9}, -NR^{8S(O)pR9}, -S(O)R^C, -S(O)₂R^C, C₁₋₆алкил, замещенный с помощью 0-2 R^{4a}, C₂₋₆алкенил, замещенный с помощью 0-2 R^{4a}, C₂₋₆алкинил, замещенный с помощью 0-2 R^{4a}, -(CH₂)_r-C₃₋₁₀карбоцикл, замещенный с помощью 0-3 R^{4b}, или -(CH₂)_r-, содержащий от 5 до 10 членов гетероцикл, включающий атомы углерода и 1-4 гетероатомов, выбранных из N, O, и S(O)_p, где указанный гетероцикл замещен с помощью 0-3 R^{4b};

R^{4a} при каждом появлении независимо представляет собой H, F, =O, C₁₋₆алкил, OR^a, SR^a, CF₃, CN,

NO₂, -C(O)R^a, -C(O)OR^a, -OC(O)R^a -NR^{7R8}, -C(O)NR^{8R9}, -NR^{7C}(O)R^b, -S(O)_pNR^{8R9}, -NR^{8S(O)pR9}, -S(O)₂R^C, -S(O)R^C, или -S(O)₂R^C;

R^{4b} при каждом появлении независимо представляет собой H, =O, =NR⁸, F, Cl, Br, I, OR^a, SR^a, CN, NO₂,

CF₃, -SO₂R^C, -NR^{7R8}, -C(O)R^a, -C(O)OR^a, -OC(O)R^a, -NR^{7R8}, -C(O)NR^{8R9}, -NR^{7C}(O)R^b, -S(O)_pNR^{8R9}, C₁₋₆алкил, C₂₋₆алкенил, C₂₋₆алкинил, C₃₋₆циклоалкил, C₁₋₄галогеналкил или C₁₋₄галогеналкокси-;

альтернативно, R³ и R⁴ группы, когда расположены на смежных атомах, могут быть взяты вместе, чтобы образовать C₃₋₁₀карбоцикл, замещенный с помощью 0-2 R^{3d}, или содержащий от 5 до 10 членов гетероцикл, включающий атомы углерода и 1-4 гетероатомов, выбранных из N, O, и S(O)_p, где указанный гетероцикл замещен с помощью 0-2 R^{3d};

R⁶ представляет собой H;

R⁷ при каждом появлении независимо представляет собой H, C₁₋₆алкил, -(CH₂)_n-C₃₋₁₀карбоцикл, -(CH₂)_n-(5-10-членный гетероарил), -C(O)R^C, -CHO, -C(O)₂R^C, -S(O)₂R^C, -CONR^{8R9}, -OCONHR^C, -C(O)O-(C₁₋₄алкил)OC(O)-(C₁₋₄алкил) или -C(O)O-(C₁₋₄алкил)OC(O)-(C₆₋₁₀арил); где указанный

алкил, карбоцикл, гетероарил и арил необязательно замещены с помощью 0-2 R^f;

R⁸ при каждом появлении независимо представляет собой H, C₁₋₆алкил, или -(CH₂)_r-фенил, или -(CH₂)_n, содержащий от 5 до 10-членов гетероцикл, включающий атомы углерода и 1-4 гетероатомов, выбранных из N, O, и S(O)_p; где указанный алкил, фенил и гетероцикл необязательно замещены с помощью 0-2 R^f;

альтернативно, R⁷ и R⁸, когда присоединены к одному и тому же атому азота, объединяются, чтобы образовать содержащее от 5 до 10 членов гетероциклическое кольцо, содержащее атомы углерода и 0-2 дополнительных гетероатомов, выбранных из N, O, и S(O)_p, где указанный гетероцикл является замещенным с помощью 0-2 R^d;

R^{8a} при каждом появлении независимо представляет собой H, OH, C₁₋₆алкил, C₁₋₄алкокси, (C₆₋₁₀арил)-C₁₋₄алкокси, -(CH₂)_r-фенил, -(CH₂)_n-(5-10-членный гетероарил), -C(O)R^c, -C(O)₂R^c, -C(O)O-(C₁₋₆алкил)OC(O)-(C₁₋₄алкил) или -C(O)O-(C₁₋₄алкил)OC(O)-(C₆₋₁₀арил); где указанный фенил, арил и гетероарил необязательно замещены с помощью 0-2 R^f;

R⁹ при каждом появлении независимо представляет собой H, C₁₋₆ алкил или -(CH₂)_r-фенил; где указанный алкил и фенил необязательно замещены с помощью 0-2 R^f;

R^{9a} при каждом появлении независимо представляет собой H, C₁₋₆алкил или -(CH₂)_n-фенил;

альтернативно, R⁸ и R⁹, когда присоединены к одному и тому же атому азота, объединяются, чтобы образовать, содержащее от 5 до 10 членов гетероциклическое кольцо, содержащее атомы углерода и 0-2 дополнительных гетероатомов, выбранных из N, O, и S(O)_p, где указанный гетероцикл является замещенным с помощью 0-2 R^d;

R¹⁰ при каждом появлении независимо представляет собой H, C₁₋₆алкил, замещенный с помощью 0-3 R^{10a}, C₂₋₆алкенил, замещенный с помощью 0-3 R^{10a}, C₂₋₆алкинил, замещенный с помощью 0-3 R^{10a}, -(CH₂)_r-C₃₋₁₀карбоцикл, замещенный с помощью 0-3 R^d, или -(CH₂)_r-, содержащий от 5 до 10 членов гетероцикл, включающий атомы углерода и 1-4 гетероатомов, выбранных из N, O, и S(O)_p, где указанный гетероцикл замещен с помощью 0-3 R^d;

R^{10a} при каждом появлении независимо представляет собой H, =O, C₁₋₄алкил, OR^a, SR^a, F, CF₃, CN, NO₂, -C(O)OR^a, -NR⁷R⁸, -C(O)NR⁷R⁸, -NR⁷C(O)R^b, -S(O)_pNR⁸R⁹, -NR⁸SO₂R^c, -S(O)R^c или -S(O)₂R^c;

R¹¹ представляет собой C₁₋₄галогеналкил, -(CH₂)_rC(O)NR⁸R⁹, C₁₋₆алкил, замещенный с помощью 0-3 R^{11a}, C₂₋₆алкенил, замещенный с помощью 0-3 R^{11a}, C₂₋₆алкинил, замещенный с помощью 0-3 R^{11a}, -(CR¹⁴R¹⁵)_r-C₃₋₁₀карбоцикл, замещенный с помощью 0-3 R^{11b}, или -(CR¹⁴R¹⁵)_r-, содержащий от 5 до 10 членов гетероцикл, включающий атомы углерода и 1-4 гетероатомов, выбранных из N, O, и S(O)_p, где указанный гетероцикл замещен с помощью 0-3 R^{11b};

R^{11a} при каждом появлении независимо представляет собой H, =O, C₁₋₄алкил, OR^a, CF₃, SR^a, F, CN, NO₂, -NR⁷R⁸, -C(O)NR⁷R⁸, -NR⁷C(O)R^b, -S(O)_pNR⁸R⁹, -NR⁸S(O)_pR^c, -C(O)R^a, -C(O)OR^a, -S(O)_pR^c, C₃₋₆циклоалкил, C₁₋₄галогеналкил, C₁₋₄галогеналкокси-, -(CH₂)_r-C₃₋₁₀карбоцикл, замещенный с помощью 0-3 R^d, или -(CH₂)_r-, содержащий от 5 до 10 членов гетероцикл, включающий атомы углерода и 1-4 гетероатомов, выбранных из N, O, и S(O)_p, и замещены с помощью 0-3 R^d;

R^{11b} при каждом появлении независимо представляет собой H, =O, =NR⁸, OR^a, F, Cl, Br, CN, NO₂, CF₃, OCF₃, OCHF₂, -C(O)R^a, -C(O)OR^a, -SOR^c, -SO₂R^c, -NR⁷R⁸, -C(O)NR⁷R⁸, -NR⁷C(O)R^b, -NR⁸C(O)₂R^c, -S(O)_pNR⁸R⁹, -NR⁸S(O)_pR^c, C₁₋₆алкил, C₂₋₆алкенил, C₂₋₆алкинил, C₃₋₆циклоалкил, C₁₋₄

галогеналкил, C_{1-4} галогеналкокси-, $-(CH_2)_r-C_{3-10}$ карбоцикл, замещенный с помощью 0-3 R^d , или $-(CH_2)_r$ -, содержащий 5-10 членов гетероцикл, включающий атомы углерода и 1-4 гетероатомов, выбранных из N, O, и $S(O)_n$, где указанный гетероцикл замещен с помощью 0-3 R^d ;

альтернативно, когда две R^{11b} группы являются заместителями на смежных атомах, они могут быть взяты вместе с атомами, к которым они присоединены, чтобы образовать, содержащий от 5 до 7 членов гетероцикл, включающий атомы углерода и 1-4 гетероатомов, выбранных из N, O, и $S(O)_p$ и замещенный с помощью 0-2 R^g ;

R^{14} и R^{15} при каждом появлении независимо представляют собой H, F, или C_{1-4} алкил; альтернативно, R^{14} объединится с R^{15} , чтобы образовать $=O$;

R^a при каждом появлении независимо представляет собой H, CF_3 , C_{1-6} алкил, $-(CH_2)_r-C_{3-7}$ циклоалкил, $-(CH_2)_r-C_{6-10}$ арил или $-(CH_2)_r$ -, содержащий от 5 до 10 членов гетероцикл, включающий атомы углерода и 1-4 гетероатомов, выбранных из N, O, и $S(O)_p$; где указанный циклоалкил, арил и гетероцикльные группы необязательно замещены с помощью 0-2 R^f ;

R^b при каждом появлении независимо представляет собой CF_3 , OH, C_{1-4} алкокси, C_{1-6} алкил, $-(CH_2)_r-C_{3-10}$ карбоцикл, замещенный с помощью 0-3 R^d , или $-(CH_2)_r$ -, содержащий 5-10 членов гетероцикл, включающий атомы углерода и 1-4 гетероатомов, выбранных из N, O, и $S(O)_p$, где указанный гетероцикл замещен с помощью 0-3 R^d ;

R^c при каждом появлении независимо представляет собой CF_3 , C_{1-6} алкил, замещенный с помощью 0-2 R^f , C_{3-6} циклоалкил, замещенный с помощью 0-2 R^f , C_{6-10} арил, содержащий от 5 до 10 членов гетероарил, $(C_{6-10}арил)-C_{1-4}$ алкил или (от 5- до 10- членный гетероарил)- C_{1-4} алкил, где указанный арил и гетероарильные группы необязательно замещены с помощью 0-3 R^f ;

R^d при каждом появлении независимо представляет собой H, $=O$, $=NR^8$, OR^a , F, Cl, Br, I, CN, NO_2 , $-NR^7R^8$, $-C(O)R^a$, $-C(O)OR^a$, $-OC(O)R^a$, $-NR^8C(O)R^a$, $-C(O)NR^7R^8$, $-SO_2NR^8R^9$, $-NR^8SO_2NR^8R^9$, $-NR^8SO_2-C_{1-4}$ алкил, $-NR^8SO_2CF_3$, $-NR^8SO_2$ -фенил, $-S(O)_2CF_3$, $-S(O)_p-C_{1-4}$ алкил, $-S(O)_p$ -фенил, $-(CF_2)_r-CF_3$, C_{1-6} алкил, замещенный с помощью 0-2 R^e , C_{2-6} алкенил, замещенный с помощью 0-2 R^e , или C_{2-6} алкинил, замещенный с помощью 0-2 R^e ;

R^e при каждом появлении независимо представляет собой $=O$, OR^a , F, Cl, Br, I, CN, NO_2 , $-NR^8R^9$, $-C(O)R^a$, $-C(O)OR^a$, $-OC(O)R^a$, $-NR^8C(O)R^a$, $-C(O)NR^7R^8$, $-SO_2NR^8R^9$, $-NR^8SO_2NR^8R^9$, $-NR^8SO_2-C_{1-4}$ алкил, $-NR^8SO_2CF_3$, $-NR^8SO_2$ -фенил, $-S(O)_2CF_3$, $-S(O)_p-C_{1-4}$ алкил, $-S(O)_p$ -фенил, или $-(CF_2)_r-CF_3$;

R^f при каждом появлении независимо представляет собой H, $=O$, $-(CH_2)_r-OR^g$, F, Cl, Br, I, CN, NO_2 , $-NR^{9a}R^{9a}$, $-C(O)R^g$, $-C(O)OR^g$, $-NR^{9a}C(O)R^g$, $-C(O)NR^{9a}R^{9a}$, $-SO_2NR^{9a}R^{9a}$, $-NR^{9a}SO_2NR^{9a}R^{9a}$, $-NR^{9a}SO_2-C_{1-4}$ алкил, $-NR^{9a}SO_2CF_3$, $-NR^{9a}SO_2$ -фенил, $-S(O)_2CF_3$, $-S(O)_p-C_{1-4}$ алкил, $-S(O)_p$ -фенил, $-(CF_2)_rCF_3$, C_{1-6} алкил, C_{2-6} алкенил, C_{2-6} алкинил, или $-(CH_2)_n$ -фенил;

R^g при каждом появлении независимо представляет собой H, C_{1-6} алкил или $-(CH_2)_n$ -фенил;

n при каждом появлении выбран из 0, 1, 2, 3 и 4;

p при каждом появлении выбран из 0, 1 и 2;

r при каждом появлении выбран из 0, 1, 2, 3 и 4 и

s при каждом появлении выбран из 1, 2, 3 и 4;

при условии, что:

(a) когда L представляет собой $-C(O)NH-$, R^3 не является 2,4-дихлорфенилом, 4-нитрофенилом или пентафторфенилом;

(b) когда L представляет собой $-C(O)NH-$, R^{11} не является $-CH_2-(3$ -индолил), $-(CH_2)_4NHCO_2$ (трет-Bu) или $-(CH_2)_4NH_2$ -.

2. Соединение по п.1, где

L представляет собой $-C(O)NR^{10}$ -, $-NR^{10}C(O)$ -, $-CH_2CONR^{10}$ -, или $-NR^{10}COCH_2$ -;

R^3 представляет собой $-(CH_2)_rC(O)NR^8R^9$, $-(CH_2)_rC(O)NR^8(CH_2)_sCO_2R^{3b}$, $-(CH_2)_rCO_2R^{3b}$, $-(CH_2)_r$ -фенил, замещенный с помощью 0-3 R^{3a} и 0-1 R^{3d} , $-(CH_2)_r$ -нафтил, замещенный с помощью 0-3 R^{3a} и 0-1 R^{3d} , $-(CH_2)_r$ -инданил, замещенный с помощью 0-3 R^{3a} и 0-1 R^{3d} , или $-(CH_2)_r$ -, содержащий 5-10 членов гетероцикл, включающий: атомы углерода и 1-4 гетероатомов, выбранных из N, O, и S(O)_p, где указанный гетероцикл замещен с помощью 0-3 R^{3a} и 0-1 R^{3d} ;

R^4 представляет собой H, F, Cl, Br, I, OCF₃, CF₃, OR^a, SR^a, CN, NO₂, $-C(O)R^a$, $-C(O)OR^a$, $-NR^7R^8$, $-C(O)NR^8R^9$, $-NR^7C(O)R^b$, $-S(O)_pNR^8R^9$, $-NR^8S(O)_pR^c$, $-S(O)R^c$, $-S(O)_2R^c$, C₁₋₆ алкил, замещенный с помощью 0-2 R^{4a} , C₂₋₆алкенил, замещенный с помощью 0-2 R^{4a} , C₂₋₆алкинил, замещенный с помощью 0-2 R^{4a} , фенил, замещенный с помощью 0-2 R^{4b} , или 5-10-членный гетероцикл, включающий атомы углерода и 1-4 гетероатомов, выбранных из N, O, и S(O)_p, где указанный гетероцикл замещен с помощью 0-3 R^{4b} ;

R^{10} при каждом появлении независимо представляет собой H, C₁₋₆алкил, замещенный с помощью 0-2 R^{10a} , $-(CH_2)_r$ -фенил, замещенный с помощью 0-2 R^d , или $-(CH_2)_r$ -, содержащий 5-10 членов гетероцикл, включающий атомы углерода и 1-4 гетероатомов, выбранных из N, O, и S(O)_p, где указанный гетероцикл замещен с помощью 0-2 R^d ; и

R^{11} представляет собой C₁₋₄галогеналкил, $-(CH_2)_rCONR^8R^9$, C₁₋₆ алкил, замещенный с помощью 0-2 R^{11a} , C₂₋₆алкенил, замещенный с помощью 0-2 R^{11a} , C₁₋₆алкинил, замещенный с помощью 0-2 R^{11a} , $-(CH_2)_r$ -C₃₋₁₀карбоцикл, замещенный с помощью 0-3 R^{11b} , или $-(CH_2)_r$ -, содержащий от 5 до 10 членов гетероцикл, включающий атомы углерода и 1-4 гетероатомов, выбранных из N, O, и S(O)_p, где указанный гетероцикл замещен с помощью 0-3 R^{11b} .

3. Соединение по п.1, где

R^1 при каждом появлении независимо представляет собой F, Cl, Me, Et, -NH₂, $-C(=NH)NH_2$, $-C(O)NH_2$, $-CH_2NH_2$, $-CH_2CH_2NH_2$, $-CH_2NHCO_2Bn$, $-CH_2NHCO_2$ (трет-Bu), $-CH(Me)NH_2$, $-C(Me)_2NH_2$, -NH₂Et, $-NHCO_2$ (трет-Bu), $-NHCO_2Bn$, $-SO_2NH_2$, OR^a или $-CH_2R^{1a}$;

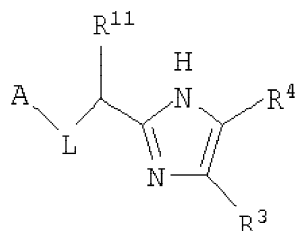
R^3 представляет собой $-CO_2H$, $-CO_2Me$, $-C(O)NHCH_2CO_2H$, $-C(O)NHCH_2CO_2Et$, $-C(O)NH_2$, $-C(O)NHMe$, $-C(O)NHb$, $-(CH_2)_r$ -фенил, замещенный с помощью 0-2 R^{3a} и 0-1 R^{3d} , нафтил, замещенный с помощью 0-2 R^{3a} и 0-1 R^{3d} , инданил, замещенный с помощью 0-2 R^{3a} и 0-1 R^{3d} , или $-(CH_2)_r$ -, содержащий от 5 до 10 членов гетероцикл, включающий атомы углерода и 1-4 гетероатомов, выбранных из N, O, и S(O)_p, где указанный гетероцикл является замещенным с помощью 0-2 R^{3a} и 0-1 R^{3d} ;

R^4 представляет собой H, F, Cl, Br, CF₃, OMe, NH₂, CO₂H, CO₂Me, CO₂Et, $-CONR^8R^9$, C₁₋₆алкил, замещенный с помощью 0-2 R^{4a} , фенил, замещенный с помощью 0-2 R^{4b} , или 5-10-членный гетероцикл, включающий: атомы углерода и 1-4 гетероатомов, выбранных из N, O, и S(O)_p, где указанный гетероцикл замещен с помощью 0-3 R^{4b} ;

R^{10} при каждом появлении независимо представляет собой H, Me, бензил, фенэтил, $-CH_2CH_2CO_2H$, $-CH_2CH_2CO_2Me$, $-CH_2CH_2CO_2Et$, $-CH_2CH_2CONH_2$, или $-CH_2CH_2CONHCH_2CH_2Ph$; и

R^{11} представляет собой C₁₋₆алкил, $-CH_2CONR^8R^9$, $-CH_2CH_2CONR^8R^9$, $-CH_2OBn$, $-CH_2SBn$, $-(CH_2)_r$ -C₃₋₇циклоалкил, замещенный с помощью 0-2 R^{11b} , $-(CH_2)_r$ -фенил, замещенный с помощью 0-2 R^{11b} , $-(CH_2)_r$ -нафтил, замещенный с помощью 0-2 R^{11b} , или $-(CH_2)_r$ -, содержащий 5-10 членов гетероцикл, включающий атомы углерода и 1-4 гетероатомов, выбранных из N, O, и S(O)_p, где указанный гетероцикл замещен с помощью 0-2 R^{11b} .

4. Соединение по п.1, которое представляет собой соединение Формулы



(II)

или его стереоизомеры, таутомеры, фармацевтически приемлемые соли, сольваты или пролекарства в рамках первого аспекта где:

A является замещенным с помощью 0-1 R^1 и 0-2 R^2 и выбран из: C_{3-7} циклоалкила, фенила, нафтила, 1,2,3,4-тетрагидронафтила, пиридила, индазолила, бензимидазолила, бензизоксазолила, изохинолинила, 5,6,7,8-тетрагидроизохинолинила, 1,2,3,4-тетрагидроизохинолинила, хиназолинила, 1H-хиназолин-4-онила, 2H-изохинолин-1-онила, 3H-хиназолин-4-онила, 3,4-дигидро-2H-изохинолин-1-онила, 2,3-дигидроизоиндолинонила и фталазинила;

L представляет собой -C(O)NH- или -NHC(O)-;

R^1 при каждом появлении независимо представляет собой F, Cl, Me, Et, $-NH_2$, $-C(=NH)NH_2$, $-C(O)NH_2$, $-CH_2NH_2$, $-CH_2NHCO_2Bn$, $-CH_2NHCO_2(t\text{-}Bu)$, $-CH(Me)NH_2$, $-CMe_2NH_2$, $-NHEt$, $-NHCO_2(t\text{-}Bu)$, $-NHCO_2Bn$, $-SO_2NH_2$, OR^a или $-CH_2R^{1a}$;

R^3 представляет собой $-CO_2H$, $-CO_2Me$, $-C(O)NHCH_2CO_2H$, $-C(O)NHCH_2CO_2Et$, $-C(O)NH_2$, $-C(O)NHMe$, $-C(O)NBn$, фенил, замещенный с помощью 0-2 R^{3a} , нафтил, замещенный с помощью 0-2 R^{3a} , инданил, замещенный с помощью 0-2 R^{3a} , или содержащий от 5 до 10 членов гетероцикл, включающий атомы углерода и 1-2 гетероатомов, выбранных из N, O, и S(O)_p, где указанный гетероцикл замещен с помощью 0-2 R^{3a} ;

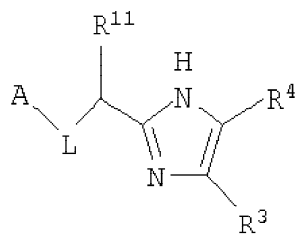
R^4 представляет собой H, F, Cl, Br, OMe, NH_2 , CF_3 , CO_2H , CO_2Me , CO_2Et , C_{1-6} алкил, замещенный с помощью 0-2 R^{4a} , фенил, замещенный с помощью 0-2 R^{4b} , или 5-10-членный гетероцикл, включающий: атомы углерода и 1-4 гетероатомов, выбранных из N, O, и S(O)_p, где указанный гетероцикл замещен с помощью 0-2 R^{4b} ;

R^{11} представляет собой C_{1-6} алкил, $-CH_2CONR^8R^9$, $-CH_2CH_2CONR^8R^9$, $-CH_2OBn$, $-CH_2SBn$, $-(CH_2)_r-C_{3-7}$ циклоалкил, замещенный с помощью 0-2 R^{11b} , $-(CH_2)_r$ -фенил, замещенный с помощью 0-2 R^{11b} , $-(CH_2)_r$ -нафтил, замещенный с помощью 0-2 R^{11b} , или $-(CH_2)_r$, содержащий от 5 до 10 членов гетероарил, замещенный с помощью 0-2 R^{11b} и выбранный из тиазолила, оксазолила, триазолила, тетразолила, имидазолила, пиридила, пиримидинила, пиразинила, пиридазинила, индолила, изоиндолила, индолинила, изоиндолинила, бензимидазолила, бензотиазолила, хинолинила, изохинолинила, тетрагидрохинолинила и тетрагидроизохинолинила; и

R^{11b} при каждом появлении независимо представляет собой H, F, Cl, Br, CF_3 , OMe, OEt, O(изо-Pr), OCF_3 , $OCHF_2$, CN, OPh, OBn, NO_2 , $-NH_2$, $-C(O)R^a$, $-C(O)OR^a$, $-C(O)NR^7R^8$, $-NR^7C(O)R^b$, $-NR^8C(O)_2R^c$, $-S(O)_pNR^8R^9$, $-NR^8S(O)_pR^c$, $-SO_2R^c$, C_1-C_4 -алкил, Ph или Bn;

альтернативно, когда две R^{11b} группы являются заместителями на смежных атомах, они могут быть взяты вместе с атомами, к которым они присоединены, чтобы образовать, содержащий от 5 до 7 членов гетероцикл, включающий атомы углерода и 1-4 гетероатомов, выбранных из N, O, и S(O)_p и замещенный с помощью 0-2 R^9 .

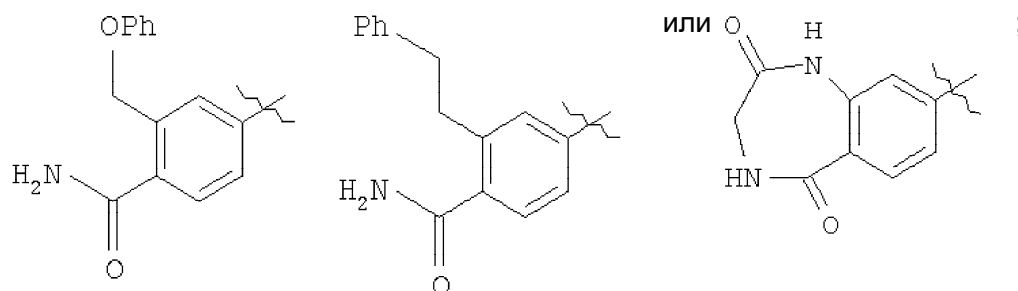
5. Соединение по п.1, которое представляет собой соединение формулы (II)



(II)

или его стереоизомеры, таутомеры, фармацевтически приемлемые соли, сольваты или пролекарства, где:

A представляет собой 4-CH₂NH₂-циклогексил, 4-CO₂Me-циклогексил, 4-CONH₂-циклогексил, 4-NHCO₂(трет-Bu)-циклогексил, 4-NHCO₂Bn-циклогексил, фенил, 4-Me-фенил, 3-OMe-фенил, 4-CH₂NH₂-фенил, 3-CONH₂-фенил, 4-CONH₂-фенил, 3-амидинофенил, 4-амидинофенил, 2-F-4-Me-фенил, 2-Bn-4-CH₂NH₂-фенил, 4-SO₂NH₂-фенил, 2-F-5-OMe-фенил, 2-F-4-Cl-фенил, 2-F-4-CH₂NH₂-фенил, 2-F-4-CONH₂-фенил, 2-Cl-4-CONH₂-фенил, 2-Et-4-CH₂NH₂-фенил, 2-NHEt-4-CH₂NH₂-фенил, 2-OMe-4-CONH₂-фенил, 3-OMe-4-CONH₂-фенил, 1,2,3,4-тетрагидронафт-2-ил, 3-Cl-тиен-2-ил, индол-5-ил, индол-6-ил, индазол-6-ил, 3-NH₂-индазол-6-ил, 3-NH₂-индазол-5-ил, 1-Me-3-NH₂-индазол-6-ил, 3-NH₂-бензизоксазол-6-ил, 1,2,3,4-тетрагидроизохинолин-6-ил, 1,2,3,4-тетрагидроизохинолин-3-ил, 2-COPh-1,2,3,4-тетрагидроизохинолин-3-ил, 2-CO₂Bn-1,2,3,4-тетрагидроизохинолин-3-ил, 1,2,3,4-тетрагидроизохинолин-1-он-6-ил, 2H-изохинолин-1-ОН-6-ил, изохинолин-6-ил, 1-NH₂-изохинолин-6-ил, 1-NH₂-3-Me-изохинолин-6-ил, 1-NH₂-5,6,7,8-тетрагидроизохинолин-6-ил, 4-NH₂-хиназолин-7-ил, 3H-хиназолин-4-он-7-ил,



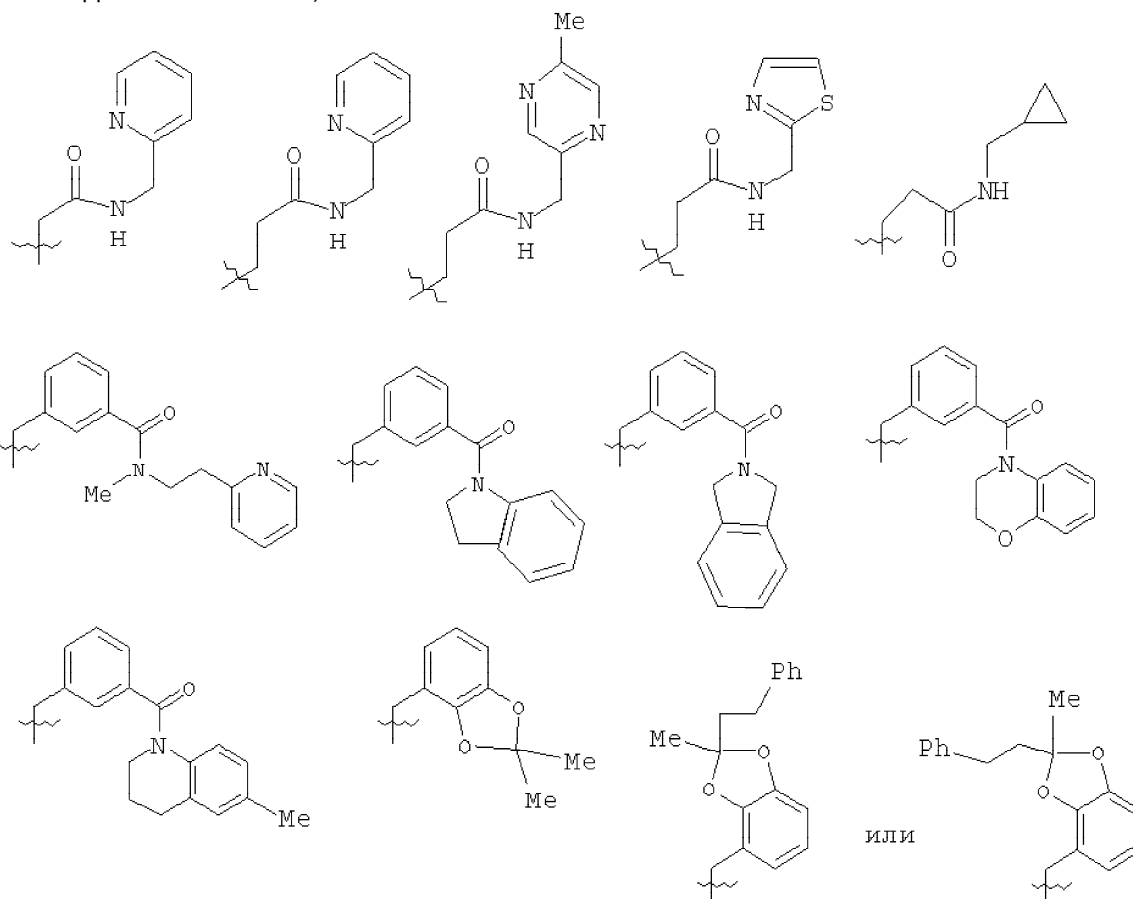
R³ представляет собой CO₂H, CO₂Me, -C(O)NHCH₂CO₂H, -G(O)NHCH₂CO₂Et, -C(O)NH₂, -C(O)NHMe, -C(O)NHBn, фенил, фенэтил, -(CH=CH)-фенил, 3-бифенил, 4-бифенил, 3,4-метилendiоксифенил, 1-нафтил, 2-нафтил, 3-NH₂-фенил, 3-NMe₂-фенил, 4-OPh-фенил, 4-OBn-фенил, 4-(трет-бутоксиметил)-фенил, 4-SO₂Me-фенил, 3-CN-фенил, 4-CN-фенил, 3-F-фенил, 4-F-фенил, 3-Cl-фенил, 4-Cl-фенил, 3-Br-фенил, 4-Br-фенил, 3-OH-фенил, 4-OH-фенил, 2-OMe-фенил, 3-OMe-фенил, 4-OMe-фенил, 3-CF₃-фенил, 4-CF₃-фенил, 3-CO₂H-фенил, 4-CO₂H-фенил, 3-CO₂Me-фенил, 4-CO₂Me-фенил, 3-CH₂CO₂H-фенил, 4-CH₂CO₂H-фенил, 4-CH₂CO₂Me-фенил, 3-CH₂CO₂Et-фенил, 4-CH₂CO₂Et-фенил, 3-CONH₂-фенил, 4-CONH₂-фенил, 3-CH₂CONH₂-фенил, 4-CH₂CONH₂-фенил, 4-CONHMe-фенил, 4-COMe₂-фенил, 4-амидинофенил, 3-NHCOMe-фенил, 4-NHCOMe-фенил, 4-NHCO₂Me-фенил, 4-SO₂NH₂-фенил, 3-NHSO₂Me-фенил, 4-NHSO₂Me-фенил, 2,4-диF-фенил, 3-F-4-CN-фенил, 3-CN-5-F-фенил, 3-F-4-CONH₂-фенил, 3-CO₂H-4-CN-фенил, 3-NMe₂-4-CN-фенил, 3-Ph-4-CONH₂-фенил, 4-(2-оксо-1-пиперидино)-фенил, тиазол-2-ил, 4-CO₂Me-тиазол-2-ил, 4-CONH₂-тиазол-2-ил, 1-Bn-пиразол-4-ил, 5-Ph-оксазол-2-ил, 5-CONH₂-тиен-2-ил, 5-CO₂H-тиен-2-ил, пирид-2-ил, пирид-3-ил, пирид-4-ил, 6-NH₂-пирид-3-ил, бензимидазол-2-ил, 1-Me-бензимидазол-2-ил, бензоксазол-2-ил, бензотиазол-2-ил, 3-NH₂-бензизоксазол-6-ил, 3-NH₂-бензизоксазол-5-ил, индазол-5-ил, индазол-6-ил, 3-NH₂-индазол-5-ил, 3-OH-индазол-5-ил, 3-NH₂-индазол-6-ил, 3-NH₂-4-F-индазол-6-ил, 3-NH₂-5-F-индазол-6-ил, 3-NH₂-7-F-индазол-6-ил, 4-имино-3,4-дигидро-2H-фталазин-1-он-7-ил, 3-(5-тетразолил)-фенил, 2,3-дигидро-изоиндол-1-он-6-ил, хинолин-5-ил, хинолин-6-ил, хинолин-8-ил, изохинолин-5-ил, 2H-изохинолин-1-он-6-ил, 2,4-диаминохиназолин-7-ил или 4-NH₂-хиназолин-7-ил;

R⁴ представляет собой H, Me, Br, Cl, CF₃, CO₂H, CO₂Me, CO₂Et, фенил, 3-F-4-CN-фенил или 3-NH₂-6-индазолил; и

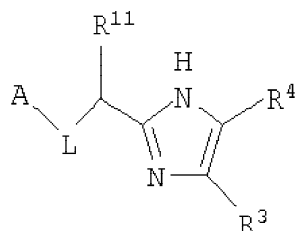
RU 2007101073 A

RU 2007101073 A

R¹¹ представляет собой Me, неопентил, циклогексилметил, -CH₂CH₂CONHBn, -CH₂CH₂CONH(CH₂CH₂Ph), -CH₂CH₂CON(Me)Bn, бензил, фенэтил, 2-Ме-бензил, 3-Ме-бензил, 4-Ме-бензил, 2-F-бензил, 3-F-бензил, 4-F-бензил, 2-Cl-бензил, 3-Cl-бензил, 4-Cl-бензил, 2-Br-бензил, 3-Br-бензил, 4-Br-бензил, 3-CF₃-бензил, 4-CF₃-бензил, 2-NH₂-бензил, 3-NH₂-бензил, 2-NO₂-бензил, 3-NO₂-бензил, 4-NO₂-бензил, 3-OMe-бензил, 4-OMe-бензил, 3-OCF₂H-бензил, 2-OCF₃-бензил, 3-OCF₃-бензил, 2-OPh-бензил, 3-OPh-бензил, 2-OBn-бензил, 3-OBn-бензил, 4-OBn-бензил, 4-COPh-бензил, 3-CO₂H-бензил, 3-CO₂Me-бензил, 3-NHAc-бензил, 2-NHCOPh-бензил, 2-NHCOBn-бензил, 3-NHCOBn-бензил, 3-N(Me)COPh-бензил, 3-(-NHCOCH₂CH₂Ph)-бензил, 2-NHSO₂Ph-бензил, 3-NHSO₂Ph-бензил, 3-[SO₂N(Me)Ph]-бензил, 3-[N(Me)SO₂Ph]-бензил, 3-[CONH(изо-Bu)]-бензил, 3-[CONH(трет-Bu)]-бензил, 3-[CONH(изопентил)]-бензил, 3-[CONH(2-Ме-Ph)]-бензил, 3-[CONH(3-Ме-Ph)]-бензил, 3-[CONH(4-Ме-Ph)]-бензил, 3-[CONH(4-F-Ph)]-бензил, 3-[CONH(1-нафтил)]-бензил, 3-(CONHBn)-бензил, 3-[CONH(4-Cl-Bn)]-бензил, 3-[CONH(4-OMe-Bn)]-бензил, 3-[CONHCH₂CH₂Ph]-бензил, 3-[CONHCH₂CH₂(4-OMe-Ph)]-бензил, 3-[CONHCH₂CH₂(2-Cl-Ph)]-бензил, 3-[CONHCH₂CH₂(3-Cl-Ph)]-бензил, 3-[CONHCH₂CH₂(4-Cl-Ph)]-бензил, 3-[CONH(CH₂)₃Ph]-бензил, 3-[CONMe₂]-бензил, 3-[CON(Me)(Et)]-бензил, 3-[CON(Me)(изо-Pr)]-бензил, 3-[CON(Me)(изо-Bu)]-бензил, 3-[CON(Me)Ph]-бензил, 3-[CON(Me)(3-Ме-Ph)]-бензил, 3-[CON(Me)(4-Ме-Ph)]-бензил, 3-[CON(Me)Bn]-бензил, 3-[CON(Me)(3)]-бензил, 3-[CON(Me)(4-Cl-Bn)]-бензил, 3-[CON(Me)(CH₂CH₂Ph)]-бензил, 3-[COM(Et)Ph]-бензил, 3-[CO(1-пиперидино)]-бензил, 3-[CO(4-Ph-1-пиперидино)]-бензил, 3-[CO(1,2,3,4-тетрагидроизохинолино)]-бензил, 2-Ph-бензил, 3-Ph-бензил, 4-Ph-бензил, 3-фенэтилбензил, -CH₂OBn, -CH₂SBn, 1-нафтилметил, 2-нафтилметил, тиазол-4-илметил, пирид-2-илметил, пирид-3-илметил, пирид-4-илметил, 1-Bn-имидазол-4-илметил, бензотиазол-2-илметил.



6. Соединение по п.1, которое представляет собой соединение формулы (II)



(II)

или его стереоизомеры, таутомеры, фармацевтически приемлемые соли, сольваты или пролекарства, где:

R^3 представляет собой 3- NH_2 -индазол-5-ил, 3-ОН-индазол-5-ил, 3- NH_2 -бензизоксазол-6-ил, 3- NH_2 -бензизоксазол-5-ил, индазол-5-ил, индазол-6-ил, 3- NH_2 -индазол-6-ил, 3- NH_2 -4- F -индазол-6-ил, 3- NH_2 -5- F -индазол-6-ил, 3- NH_2 -7- F -индазол-6-ил, изохинолин-5-ил, хинолин-5-ил, хинолин-8-ил, 2Н-изохинолин-1-он-6-ил, 2,4-диаминохиназолин-7-ил или 4- NH_2 -хиназолин-7-ил.

7. Соединение по п.6, где

L представляет собой $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^{10}-$ или $-\text{NR}^{10}\text{C}(\text{O})-$;

R^1 при каждом появлении независимо представляет собой F, Cl, Me, Et, $-\text{NH}_2$, $-\text{C}(=\text{NH})\text{NH}_2$, $-\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$, $-\text{CH}_2\text{NH}_2$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}_2$, $-\text{CH}_2\text{NHCO}_2\text{Bn}$, $-\text{CH}_2\text{NHCO}_2$ (трет-Bu), $-\text{CH}(\text{Me})\text{NH}_2$, $-\text{C}(\text{Me})_2\text{NH}_2$, $-\text{NH}_2\text{Et}$, $-\text{NHCO}_2$ (трет-Bu), $-\text{NHCO}_2\text{Bn}$, $-\text{SO}_2\text{NH}_2$, OR^a или $-\text{CH}_2\text{R}^{1a}$;

R^4 представляет собой H, F, Cl, Br, OMe, NH_2 , CF_3 , CO_2H , CO_2Me , CO_2Et , $-\text{CONR}^8\text{R}^9$, C_{1-6} алкил, замещенный с помощью 0-2 R^{4a} , фенил, замещенный с помощью 0-2 R^{4b} , или 5-10-членный гетероцикл, включающий атомы углерода и 1-4 гетероатомов, выбранных из N, O, и $\text{S}(\text{O})_p$, где указанный гетероцикл замещен с помощью 0-3 R^{4b} ;

R^{10} при каждом появлении независимо представляет собой H, Me, бензил, фенол, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CO}_2\text{H}$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CO}_2\text{Me}$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CO}_2\text{Et}$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CONH}_2$ или $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CONHCH}_2\text{CH}_2\text{Ph}$;

R^{11} представляет собой C_1 - C_6 алкил, $-\text{CH}_2\text{CONR}^8\text{R}^9$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CONR}^8\text{R}^9$, $-\text{CH}_2\text{OBn}$, $-\text{CH}_2\text{SBn}$, $-(\text{CH}_2)_r$ - C_{3-7} циклоалкил, замещенный с помощью 0-2 R^{11b} , $-(\text{CH}_2)_r$ -фенил, замещенный с помощью 0-2 R^{11b} , $-(\text{CH}_2)_r$ -нафтил, замещенный с помощью 0-2 R^{11b} , или $-(\text{CH}_2)_r$ -, содержащий 5-10 членов гетероцикл, включающий атомы углерода и 1-4 гетероатомов, выбранных из N, O, и $\text{S}(\text{O})_p$, где указанный гетероцикл замещен с помощью 0-2 R^{11b} ; и

R^{11b} при каждом появлении независимо представляет собой H, F, Cl, Br, CF_3 , OMe, OEt, O(изо-Pr), OCF_3 , OCHF_2 , CN, OPh, OBn, NO_2 , $-\text{NH}_2$, $-\text{C}(\text{O})\text{R}^a$, $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^8$, $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^7\text{R}^8$, $-\text{NR}^7\text{C}(\text{O})\text{R}^b$, $-\text{N}^8\text{CO}_2\text{R}^c$, $-\text{S}(\text{O})_p\text{NR}^8\text{R}^9$, $-\text{NR}^8\text{S}(\text{O})_p$, R^c - SO_2R^c , C_1 - C_4 -алкил, Ph или Bn.

8. Соединение по п.7, где

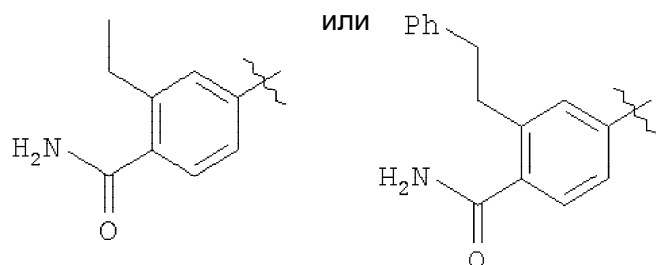
A является замещенным с помощью 0-1 R^1 и 0-2 R^2 и выбран из: C_{3-7} циклоалкила, фенила, нафтила, 1,2,3,4-тетрагидронафтила, пиридила, индазола, бензимидазола, бензизоксазола, изохинолина, 5,6,7,8-тетрагидроизохинолина, 1,2,3,4-тетрагидроизохинолина, хиназолина, 1Н-хиназолин-4-онила, 2Н-изохинолин-1-онила, 3Н-хиназолин-4-онила, 3,4-дигидро-2Н-изохинолин-1-онила, 2,3-дигидроизоиндолинонила и фталазина; и

R^{10} представляет собой H.

9. Соединение по п.8, где

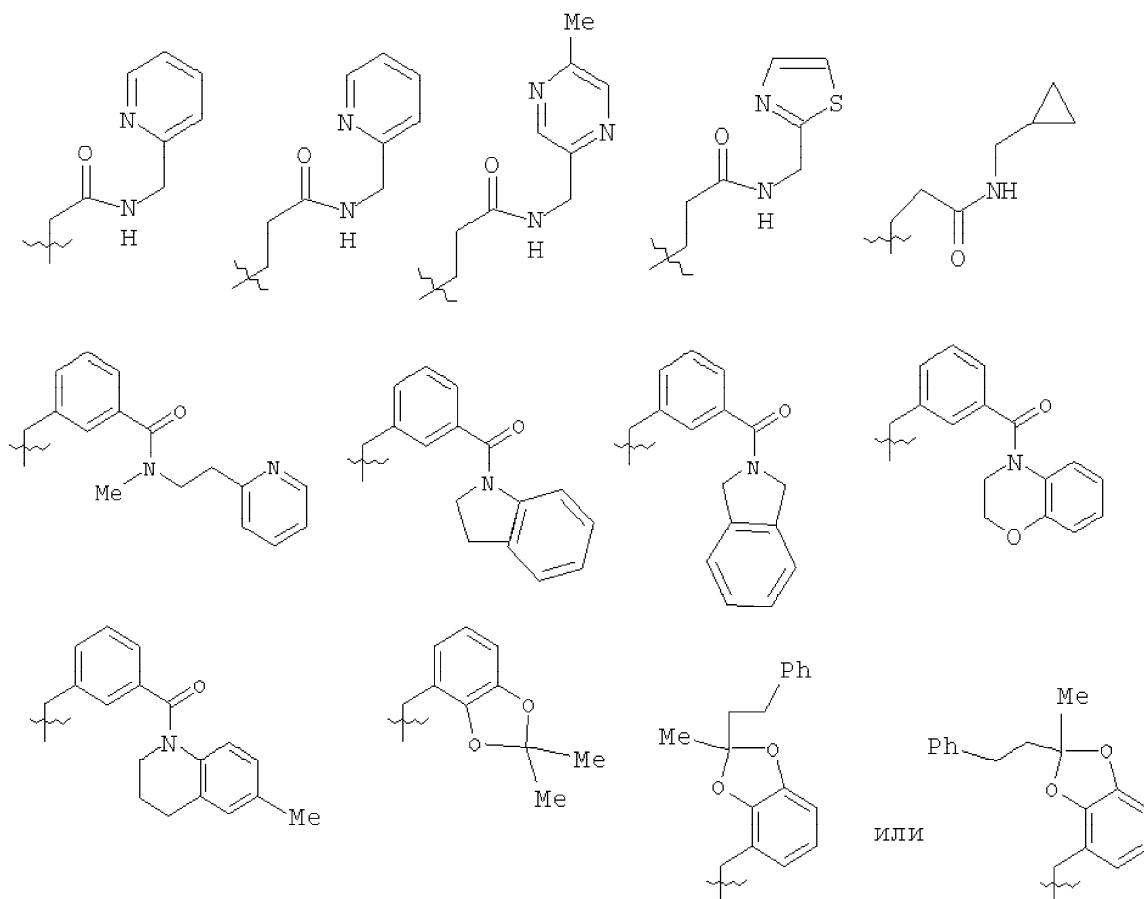
A представляет собой 4- CH_2NH_2 -циклогексил, 4- CO_2Me -циклогексил, 4- CONH_2 -циклогексил, 4- NHCO_2 (трет-Bu)-циклогексил, 4- NHCO_2Bn -циклогексил, фенил, 4-Ме-фенил, 3-ОМе-фенил, 4- CH_2NH_2 -фенил, 3- CONH_2 -фенил, 4- CONH_2 -фенил, 3-амидинофенил, 4-амидинофенил, 2- F -4-Ме-фенил, 2-Bn-4- CH_2NH_2 -фенил, 4- SO_2NH_2 -фенил, 2- F -5-ОМе-фенил, 2- F -4-Cl-фенил, 2- F -4- CH_2NH_2 -фенил, 2- F -4-

CONH₂-фенил, 2-Cl-4-CONH₂-фенил, 2-Et-4-CH₂NH₂-фенил, 2-NHEt-4-CH₂NH₂-фенил, 2-OMe-4-CONH₂-фенил, 3-OMe-4-CONH₂-фенил, 1,2,3,4-тетрагидронафт-2-ил, 3-Cl-тиен-2-ил, индол-5-ил, индол-5-ил, индазол-5-ил, индазол-6-ил, 3-NH₂-индазол-6-ил, 3-NH₂-индазол-5-ил, 1-Me-3-NH₂-индазол-6-ил, 3-NH₂-бензизоксазол-6-ил, 1,2,3,4-тетрагидроизохинолин-6-ил, 1,2,3,4-тетрагидроизохинолин-3-ил, 2-COPh-1,2,3,4-тетрагидроизохинолин-3-ил, 2-CO₂Bn-1,2,3,4-тетрагидроизохинолин-3-ил, 1,2,3,4-тетрагидроизохинолин-1-он-6-ил, 2H-изохинолин-1-он-6-ил, изохинолин-6-ил, 1-NH₂-изохинолин-6-ил, 1-NH₂-3-Me-изохинолин-6-ил, 1-NH₂-5,6,7,8-тетрагидроизохинолин-6-ил, 4-NH₂-хиназолин-7-ил, 3H-хиназолин-4-он-7-ил,



R⁴ представляет собой H, Me, Br, Cl, CF₃, CO₂H, CO₂Me, CO₂Et, фенил, 3-F-4-CH-фенил, или 3-NH₂-6-индазолил; и

R¹¹ представляет собой Me, неопентил, циклогексилметил, -CH₂CH₂CONHBn, -CH₂CH₂CONH(CH₂CH₂Ph), -CH₂CH₂CON(Me)Bn₅, бензил, фенэтил, 2-Me-бензил, 3-Me-бензил, 4-Me-бензил, 2-F-бензил, 3-F-бензил, 4-F-бензил, 2-Cl-бензил, 3-Cl-бензил, 4-Cl-бензил, 1-Br-бензил, 3-Br-бензил, 4-Br-бензил, 3-CF₃-бензил, 4-CF₃-бензил, 2-NH₂-бензил, 3-NH₂-бензил, 2-NO₂-бензил, 3-NO₂-бензил, 4-NO₂-бензил, 3-OMe-бензил, 4-OMe-бензил, 3-OCF₂H-бензил, 2-OCF₃-бензил, 3-OCF₃-бензил, 2-OPh-бензил, 3-OPh-бензил, 2-OBn-бензил, 3-OBn-бензил, 4-OBn-бензил, 4-COPh-бензил, 3-CO₂H-бензил, 3-CO₂Me-бензил, 3-NHAc-бензил, 2-NHCOPh-бензил, 2-NHCOBn-бензил, 3-NHCOBn-бензил, 3-N(Me)COPh-бензил, 3-(-NHCOCH₂CH₂Ph)-бензил, 2-NHSO₂Ph-бензил, 3-NHSO₂Ph-бензил, 3-[SO₂N(Me)Ph]-бензил, 3-[N(Me)SO₂Ph]-бензил, 3-[CONH(изо-Bu)]-бензил, 3-[CONH(трет-Bu)]-бензил, 3-[CONH(изопентил)]-бензил, 3-[CONH(2-Me-Ph)]-бензил, 3-[CONH(3-Me-Ph)]-бензил, 3-[CONH(4-Me-Ph)]-бензил, 3-[CONH(4-F-Ph)]-бензил, 3-[CONH(1-нафтил)]-бензил, 3-(CONHBn)-бензил, 3-[CONH(4-Cl-Bn)]-бензил, 3-[CONH(4-OMe-Bn)]-бензил, 3-[CONHCH₂CH₂Ph]-бензил, 3-[CONHCH₂CH₂(4-OMe-Ph)]-бензил, 3-[CONHCH₂CH₂(2-Cl-Ph)]-бензил, 3-[CONHCH₂CH₂(3-Cl-Ph)]-бензил, 3-[CONHCH₂CH₂(4-Cl-Ph)]-бензил, 3-[CONH(CH₂)₃Ph]-бензил, 3-[CONMe₂]-бензил, 3-[CON(Me)(Et)]-бензил, 3-[CON(Me)(изо-Pr)]-бензил, 3-[CON(Me)(трет-Bu)]-бензил, 3-[CON(Me)Ph]-бензил, 3-[CON(Me)(3-Me-Ph)]-бензил, 3-[CON(Me)(4-Me-Ph)]-бензил, 3-[CON(Me)Bn]-бензил, 3-[CON(Me)(3-Cl-Bn)]-бензил, 3-[CON(Me)(4-Cl-Bn)]-бензил, 3-[CON(Me)(CH₂CH₂Ph)]-бензил, 3-[CON(Et)Ph]-бензил, 3-[CO(1-пиперидино)]-бензил, 3-[CO(4-Ph-1-пиперидино)]-бензил, 3-[CO(1,2,3,4-тетрагидроизохинолин)]-бензил, 2-Ph-бензил, 3-Ph-бензил, 4-Ph-бензил, 3-фенэтилбензил, -CH₂OBn, -CH₂SBn, 1-нафтилметил, 2-нафтилметил, тиазол-4-илметил, пирид-2-илметил, пирид-3-илметил, пирид-4-илметил, 1-Bn-имидазол-4-илметил, бензотиазол-2-илметил,



10. Соединение по п.8, где

A представляет собой 4-CH₂NH₂-циклогексил, 4-NHCO₂(трет-Бу)-циклогексил, 4-NHCO₂Вп-циклогексил, или 1-NH₂-5,6,7,8-тетрагидроизохинолин-6-ил;

L представляет собой -C(O)NH- или NHC(O)-;

R³ представляет собой индазол-5-ил, индазол-6-ил, 3-NH₂-индазол-5-ил, 3-ОН-индазол-5-ил, 3-NH₂-индазол-6-ил, 3-NH₂-4-F-индазол-6-ил, 3-NH₂-5-F-индазол-6-ил, 3-NH₂-7-F-индазол-6-ил или 4-NH₂-хиназолин-7-ил;

R⁴ представляет собой H, Me, F, Br, Cl, или CF₃; и

R¹¹ представляет собой бензил, замещенный с помощью 0-2 R^{11b}.

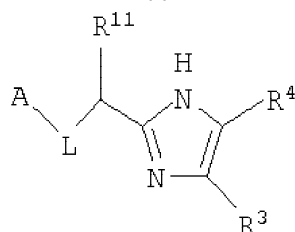
11. Соединение по п.10, где

A представляет собой 4-CH₂NH₂-циклогексил;

L представляет собой -C(O)NH-; и

R³ представляет собой 3-NH₂-индазол-6-ил или 4-NH₂-хиназолин-7-ил.

12. Соединение по п.1, которое представляет собой соединение формулы (II)



(II)

или его стереоизомеры, таутомеры, фармацевтически приемлемые соли, сольваты или пролекарства, где:

A является замещенным с помощью 0-2 R¹ и 0-1 R² и выбран из: C₃₋₇-циклоалкила, фенила, нафтила, 1,2,3,4-тетрагидронафтила, пиридила, индазолила, бензимидазолила, бензизоксазолила, изохинолинила, 5,6,7,8-тетрагидроизохинолинила, 1,2,3,4-тетрагидроизохинолинила, хиназолинила, 1H-хиназолин-4-онила, 2H-изохинолин-1-онила,

3Н-хиназолин-4-онила, 3,4-дигидро-2Н-изохинолин-1-онила, 2,3-дигидроизоиндолинонила и фталазинила;

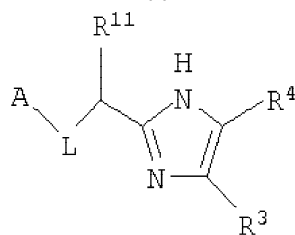
L представляет собой $-C(O)NR^{10}-$ или $-NR^{10}C(O)-$;

R^3 представляет собой $-(CH_2)_r-$, содержащий от 5 до 10 членов гетероцикл, включающий атомы углерода и 1-4 гетероатомов, выбранных из N, O, и $S(O)_p$, где указанный гетероцикл, замещенный с помощью 0-3 R^{3a} и 0-1 R^{3d} ;

R^4 представляет собой H, F, Cl, Br, OMe, NH_2 , CF_3 , CO_2H , CO_2Me , CO_2Et , $-CONR^8R^9$, C_{1-6} алкил, замещенный с помощью 0-2 R^{4a} , фенил, замещенный с помощью 0-2 R^{4b} , или 5-10-членный гетероцикл, включающий атомы углерода и 1-4 гетероатомов, выбранных из N, O, и $S(O)_p$, где указанный гетероцикл замещен с помощью 0-3 R^{4b} ; и

R^{11} представляет собой бензил, замещенный с помощью 0-2 R^{11b} .

13. Соединение по п.1, которое представляет собой соединение формулы (II)



(II)

или его стереоизомеры, таутомеры, фармацевтически приемлемые соли, сольваты или пролекарства в рамках первого аспекта, где

A является замещенным с помощью 0-1 R^1 и 0-2 R^2 и выбран из: C_{3-7} циклоалкила, фенила, нафтила, 1,2,3,4-тетрагидронафтила, пиридила, индазолила, бензимидазолила, бензизоксазолила, изохинолинила, 5,6,7,8-тетрагидроизохинолинила, 1,2,3,4-тетрагидроизохинолинила, хиназолинила, 1Н-хиназолин-4-онила, 2Н-изохинолин-1-онила, 3Н-хиназолин-4-онила, 3,4-дигидро-2Н-изохинолин-1-онила, 2,3-дигидроизоиндолинонила и фталазинила;

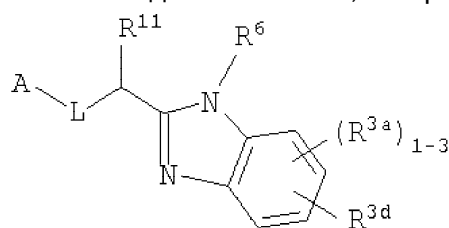
L представляет собой $-C(O)NR^{10}-$ или $-NR^{10}C(O)-$;

R^3 представляет собой $-(CH_2)_r$ -фенил, замещенный с помощью 0-3 R^{3a} и 0-1 R^{3d} , $-(CH_2)_r$ -нафтил, замещенный с помощью 0-3 R^{3a} и 0-1 R^{3d} , или $-(CH_2)_r$ -инданил, замещенный с помощью 0-3 R^{3a} и 0-1 R^{3d} ;

R^4 при каждом появлении независимо представляет собой H, Me, Br, Cl, CF_3 , CO_2H , CO_2Me , CO_2Et , фенил, 3-F-4-CN-фенил или 3- NH_2 -6-индазолил; и

R^{11} представляет собой бензил, замещенный с помощью 0-2 R^{11b} .

14. Соединение по п.1, которое представляет собой соединение формулы (III)



(III)

или его стереоизомеры, таутомеры, фармацевтически приемлемые соли, сольваты или пролекарства, где:

R^{3a} при каждом появлении независимо представляет собой $=O$, F, Cl, Br, Me, CN, OH, NH_2 , OMe, O(трет-Bu), OBn, CF_3 , CO_2H , CO_2Me , $-CH_2CO_2H$, $-CH_2CO_2Me$, $-CH_2CO_2Et$, $-NHCOMe$, $-CONH_2$, $-CH_2CONH_2$, $-CONHMe$, $-CONMe_2$, $-C(=NH)NH_2$, $-NR^7R^8$, $-SO_2Me$, $-SO_2NH_2$, Ph или 2-оксо-пиперидин-1-ил;

R^{3d} представляет собой H или C_{1-4} алкил;

R^{10} при каждом появлении независимо представляет собой H, C_{1-6} алкил, замещенный с помощью 0-2 R^{10a} , $-(CH_2)_r$ -фенил, замещенный с помощью 0-2 R^d , или $-(CH_2)_r$, содержащий 5-10 членов гетероцикл, включающий атомы углерода и 1-4 гетероатомов, выбранных из N, O, и S(O)_p, где указанный гетероцикл замещен с помощью 0-2 R^d ; и

R^{11} представляет собой C_{1-4} галогеналкил, $-(CH_2)_1-CONR^8R^9$, C_{1-6} алкил, замещенный с помощью 0-2 R^{11a} C_{1-6} алкенил, замещенный с помощью 0-2 R^{11a} C_{1-6} алкинил, замещенный 0-2 R^{11a} , $-(CH_2)_r-C_{3-10}$ карбоцикл, замещенный с помощью 0-3 R^{11b} , или $-(CH_2)_r$, содержащий 5-10 членов гетероцикл, включающий атомы углерода и 1-4 гетероатомов, выбранных из N, O, и S(O)_p, где указанный гетероцикл замещен с помощью 0-3 R^{11b} .

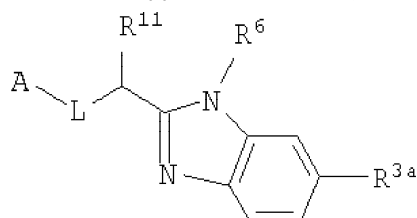
15. Соединение по п.14, где

R^1 при каждом появлении независимо представляет собой $-NH_2$, $-C(=NH)NH_2$, $-C(O)NH_2$, $-CH_2NH_2$, $-CH(Me)NH_2$, $-C(Me)_2NH_2$, или $-CH_2CH_2NH_2$;

R^{10} представляет собой H, Me, бензил, или фенэтил; и

R^{11} представляет собой Me, $-(CH_2)$ -фенил, замещенный с помощью 0-1 R^{11b} , или $-(CH_2)_r$, содержащий 5-10 членов гетероцикл, включающий: атомы углерода и 1-4 гетероатомов, выбранных из N, O, и S(O)_p, где указанный гетероцикл замещен с помощью 0-1 R^{1b}

16. Соединение по п.1, которое представляет собой соединение формулы (IV)



(IV)

или его стереоизомеры, таутомеры, фармацевтически приемлемые соли, сольваты или пролекарства, где:

A представляет собой циклогексил, замещенный с помощью 1 R^1 , фенил, замещенный с помощью 1 R^1 , пиридил, замещенный с помощью 1 R^1 , нафтил, замещенный с помощью 1 R^1 , бензизоксазол, замещенный с помощью 1 R^1 , или изохинолинил, замещенный с помощью 0-1 R^1 ;

L представляет собой $-C(O)NH-$, $-C(O)NMe-$, $-C(O)N(бензил)-$, $-C(O)N(фенэтил)-$, $-NHC(O)-$, $-CH_2C(O)NH-$, $-NHC(O)CH_2-$, $-C(O)NHCH_2-$, или $-NHC(O)CH_2-$;

R^1 при каждом появлении независимо представляет собой $-NH_2$, $-C(=NH)NH_2$, $-C(O)NH_2$, или $-CH_2NH_2$;

R^{3a} представляет собой F, Cl, Br, Me, CN, OMe, CF_3 , CO_2H , CO_2Me , CO_2Et , $-CH_2CO_2H$, $-CH_2CO_2Me$, $-CH_2CO_2Et$, $CONH_2$, $-CONHMe$, $-CON(Me)_2$, $-CH_2CONH_2$ или $-C(=NH)NH_2$;

R^6 представляет собой H;

R^{10} представляет собой H, Me, бензил или фенэтил; и

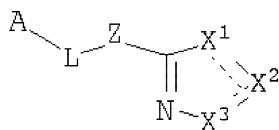
R^{11} представляет собой Me, $-(CH_2)_r$ -фенил, замещенный с помощью 0-1 R^{11} , или $-(CH_2)_r$, содержащий 5-10 членов гетероарил, замещенный с помощью 0-1 R^{11b} и выбранный из тиазолила, имидазолила, пиридила, и бензотиазолила.

17. Соединение по п.16, где

A представляет собой 4- CH_2NH_2 -пиклогексил или 4-амидинофенил; и

R^{3a} при каждом появлении независимо представляет собой CO_2H , CO_2Me , $-CH_2CO_2H$, $-CH_2CO_2Et$, $-CONH_2$ или $-CH_2CONH_2$.

18. Соединение формулы (V)

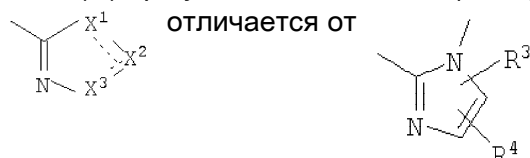


(V)

или его стереоизомеры, таутомеры, фармацевтически приемлемые соли, сольваты или пролекарства, где:

A представляет собой C₃₋₁₀карбоцикл, замещенный с помощью 0-1 R¹ и 0-3 R², или содержащий от 5 до 12 членов гетероцикл, включающий атомы углерода и 1-4 гетероатомов, выбранных из N, O, и S(O)_p, где указанный гетероцикл замещен с помощью 0-1 R¹ и 0-3 R²; при условии, что, когда A представляет собой гетероцикл, содержащий один или большее количество атомов азота, A не является присоединенным к L через любой из атомов азота на кольце A;

X¹, X² и X³ независимо представляют собой CR³, CR⁴, CR⁴R⁵, O, S(O)_p, N, NR³, NR⁶, или C(O) при условии, что в кольце отсутствует S-S, S-O или O-O связь; при условии, что



Z представляет собой -C(R¹¹XR¹²)-, -C(R¹¹)(R¹²)-(CH₂)-, -NR¹³- или -NR¹³CH₂-;

L представляет собой -C(O)NR¹⁰-, -NR¹⁰C(O)-, -CH₂C(O)NR¹⁰-, -CH₂NR¹⁰C(O)-, -C(O)NR¹⁰CH₂-, -NR¹⁰C(O)CH₂-, -S(O)₂NR¹⁰-, -NR¹⁰S(O)₂-, -CH₂S(O)₂NR¹⁰-, -CH₂NR¹⁰S(O)₂-, -S(O)₂NR¹⁰CH₂-, -NR¹⁰S(O)₂CH₂-, -CH₂CH₂-, -CH₂CH₂CH₂-, -CH₂NR⁷-, -NR⁷CH₂-, -CH₂CH₂NR⁷-, -NR⁷CH₂CH₂-, -CH₂NR⁷CH₂-, -CH₂O-, -OCH₂-, -CH₂S(O)_p-, -S(O)_pCH₂-, -CH₂CH₂O-, -OCH₂CH₂-, -CH₂OCH₂-, -CH₂CH₂S(O)_p-, -S(O)_pCH₂CH₂-, -CH₂S(O)_pCH₂-, -CH₂C(O)-, -CH₂C(O)CH₂-, -CH₂CH₂C(O)-, -C(O)CH₂CH₂- или -C(O)CH₂-;

R¹ при каждом появлении независимо представляет собой -NH₂, -NH(C₁₋₃алкил), -N(C₁₋₃алкил)₂, -C(=NH)NH₂, -C(O)NR⁸R⁹, -S(O)_pNR⁸R⁹, -(CH₂)_rNR⁷R⁸, -(CH₂)_rNR⁷C(O)OR^a, -CH₂NH₂, -CH₂NH(C₁₋₃алкил), -CH₂N(C₁₋₃алкил)₂, -CH₂CH₂NH₂, -CH₂CH₂NH(C₁₋₃алкил), -CH₂CH₂N(C₁₋₃алкил)₂, -CH(C₁₋₄алкил)NH₂, -C(C₁₋₄алкил)₂NH₂, -C(=NR^{8a})NR⁷R⁸, -NHC(=NR^{8a})NR⁷R⁸, =NR⁸, -NR⁸CR⁸(=NR^{8a}), F, Cl, Br, I, OCF₃, CF₃, -(CH₂)_rOR^a, -(CH₂)_rSR^a, CN, 1-NH₂-1-циклопропил или C₁₋₆алкил, замещенный с помощью 0-1 R^{1a};

R^{1a} представляет собой H, -C(=NR^{8a})NR⁷R⁸, -NHC(=NR^{8a})NR⁷R⁸, -NR⁸CH(=NR^{8a}), -NR⁷R⁸, -C(O)NR⁸R⁹, F, OCF₃, CF₃, OR^a, SR^a, CN, -NR⁹SO₂NR⁸R⁹, -NR⁸SO₂R^C, -S(O)_p-C₁₋₄алкил, -S(O)_p-фенил или -(CF₂)_r-CF₃;

R² при каждом появлении независимо представляет собой H, =O, F, Cl, Br, I, OCF₃, CF₃, CHF₂, CN, NO₂, OR^a, SR^a, -C(O)R^a, -C(O)OR^a, -OC(O)R^a, -NR⁷R⁸, -C(O)NR⁷R⁸, -NR⁷C(O)R^b, -S(O)₂NR⁸R⁹, -NR⁸S(O)₂R^C, -S(O)R^C, -S(O)₂R^C, C₁₋₆алкил, замещенный с помощью 0-2 R^{2a}, C₂₋₆алкенил, замещенный с помощью 0-2 R^{2a}, C₁₋₆алкил, замещенный с помощью 0-2 R^{2a}, -(CH₂)_r-C₃₋₁₀карбоцикл, замещенный с помощью 0-3 R^{2b}, или -(CH₂)_r-, содержащий от 5 до 10 членов гетероцикл, включающий атомы углерода и 1-4 гетероатомов, выбранных из N, O, и S(O)_p, где указанный гетероцикл замещен с помощью 0-3 R^{2b};

R^{2a} при каждом появлении независимо представляет собой H, F, Cl, Br, I, =O, =NR⁸, CN, OCF₃, CF₃, OR^a, SR^a, -NR⁷R⁸, -C(O)NR⁸R⁹, -NR⁷C(O)R^b, -S(O)_pNR⁸R⁹, -NR⁸SO₂R^C, -S(O)R^C или -S(O)₂R^C;

R^{2b} при каждом появлении независимо представляет собой H, F, Cl, Br, I, =O, =NR⁸, CN, NO₂, OR^a, SR^a, -C(O)R^a, -C(O)OR^a, -OC(O)R^a, -NR⁷R⁸, -C(O)NR⁷R⁸, -NR⁷C(O)R^b, -S(O)₂NR⁸R⁹, -S(O)₂R^C

C^c , $-NR^8SO_2NR^8R^9$, $-NR^8SO_2R^C$, $-(CF_2)_rCF_3$, C_{1-6} алкил, C_{2-6} алкенил, C_{2-6} алкинил, C_{3-6} циклоалкил, C_{1-4} галогеналкил, или C_{1-4} галогеналкокси;

альтернативно, когда R^1 и R^2 группы являются заместителями на смежных кольцевых атомах, они могут быть взяты вместе с атомами кольца, к которому они присоединены, чтобы образовать содержащий от 5 до 7 членов карбоцикл или гетероцикл, включающий атомы углерода и 0-4 гетероатомов, выбранных из N, O, и S(O)_p, где указанный карбоцикл или гетероцикл является замещенным с помощью 0-2 R^{2b} ;

R^3 при каждом появлении независимо представляет собой $-(CH_2)_rC(O)NR^8R^9$, $-(CH_2)_rC(O)NR^8(CH_2)_sCO_2R^{3b}$, $-(CH_2)_rCO_2R^{3b}$, $-(CH_2)_r-C_{3-10}$ карбоцикл, замещенный с помощью 0-3 R^{3a} и 0-1 R^{3d} , или $-(CH_2)_r$, содержащий от 5 до 10 членов гетероцикл, включающий атомы углерода и 1-4 гетероатомов, выбранных из N, O, и S(O)_p, где указанный гетероцикл замещен с помощью 0-3 R^{3a} и 0-1 R^{3d} ;

R^{3a} при каждом появлении независимо представляет собой $=O$, F, Cl, Br, I, OCF_3 , CF_3 , NO_2 , CN, $-(CH_2)_rOR^{3b}$, $-(CH_2)_rSR^{3b}$, $-(CH_2)_rNR^7R^8$, $C(=NR^{8a})NR^8R^9$, $-NHC(=NR^{8a})NR^7R^8$, $-NR^8CR^8(=NR^{8a})$, $-(CH_2)_rNR^8C(O)R^{3b}$, $=NR^8$, $-(CH_2)_rNR^8C(O)R^{3b}$, $-(CH_2)_rNR^8C(O)2R^{3b}$, $-(CH_2)_rS(O)_pNR^8R^9$, $-(CH_2)_rNR^8S(O)_pR^{3c}$, $-S(O)_pR^{3c}$, $-S(O)_pR^{3c}$, $-C(O)-C_{1-6}$ алкил, $-(CH_2)_rCO_2R^{3b}$, $-(CH_2)_rC(O)NR^8R^9$, $-(CH_2)_rOC(O)NR^8R^9$, $-NHCOCF_3$, $-NHCO_2CF_3$, $-SO_2NHR^{3b}$, $-SO_2NHCOR^{3c}$, $-SO_2NHCO_2R^{3c}$, $-CONHSO_2R^{3c}$, $-NHSO_2R^{3c}$, $-CONHOR^{3b}$, C_{1-4} галогеналкил, C_{1-4} галогеналкокси-, C_{1-6} алкил, замещенный с помощью R^{3d} , C_{2-6} алкенил, замещенный с помощью R^{3b} , C_{2-6} алкинил, замещенный с помощью R^{3d} , C_{3-6} циклоалкил, замещенный с помощью 0-1 R^{3d} , $-(CH_2)_r-C_{3-10}$ карбоцикл, замещенный с помощью 0-3 R^{3d} , или $-(CH_2)_r$ -, содержащий от 5 до 10 членов гетероцикл, включающий: атомы углерода и 1-4 гетероатомов, выбранных из N, O, и S(O)_p, где указанный гетероцикл замещен с помощью 0-3 R^{3d} ;

альтернативно, когда две R^{3a} группы расположены на смежных атомах, они могут быть взяты вместе с атомами, к которым они присоединены, чтобы образовать C_{3-10} карбоцикл, замещенный с помощью 0-2 R^{3d} или содержащий от 5 до 10 членов гетероцикл, включающий атомы углерода и 1-4 гетероатомов, выбранных из N, O, и S(O)_p, где указанный гетероцикл замещен с помощью 0-2 R^{3d} ;

R^{3b} при каждом появлении независимо представляет собой H, C_{1-6} алкил, замещенный с помощью 0-2 R^{3d} , C_{2-6} алкенил, замещенный с помощью 0-2 R^{3d} , C_{2-6} алкинил, замещенный 0-2 R^{3d} , $-(CH_2)_r-C_{3-10}$ карбоцикл, замещенный с помощью 0-3 R^{3b} или $-(CH_2)_r$ -, содержащий от 5 до 10 членов гетероцикл, включающий атомы углерода и 1-4 гетероатомов, выбранных из N, O, и S(O)_p, где указанный гетероцикл замещен с помощью 0-3 R^{3d} ;

R^{3c} при каждом появлении независимо представляет собой C_{1-6} алкил, замещенный с помощью 0-2 R^{3d} , C_{2-6} алкенил, замещенный с помощью 0-2 R^{3d} , C_{2-6} алкинил, замещенный с помощью 0-2 R^{3d} , $-(CH_2)_r-C_{3-10}$ карбоцикл, замещенный с помощью 0-3 R^{3d} или $-(CH_2)_r$ -, содержащий от 5 до 10 членов гетероцикл, включающий атомы углерода и 1-4 гетероатомов, выбранных из N, O, и S(O)_p, где указанный гетероцикл замещен с помощью 0-3 R^{3d} ;

R^{3d} при каждом появлении независимо представляет собой H, $=O$, $-(CH_2)_rOR^a$, F, Cl, Br, CN, NO_2 , $-(CH_2)_rNR^7R^8$, $-C(O)R^a$, $-C(O)OR^a$, $-OC(O)R^a$, $-NR^7C(O)R^b$, $-C(O)NR^8R^9$, $-SO_2NR^8R^9$, $-NR^8SO_2NR^8R^9$, $-NR^8SO_2R^C$, $-S(O)_pR^C$, $-(CF_2)_rCF_3$, C_{1-6} алкил, замещенный с помощью 0-2 R^e , C_{2-6} алкенил, замещенный с помощью 0-2 R^e , C_{2-6} алкинил, замещенный с помощью 0-2 R^e , $-(CH_2)_r-C_{3-10}$ карбоцикл, замещенный с помощью 0-3 R^d , или $-(CH_2)_r$ -, содержащий от 5 до 10 членов гетероцикл, включающий атомы углерода и 1-4 гетероатомов, выбранных из N, O, и S(O)_p, где указанный гетероцикл замещен с помощью 0-3 R^d ;

R^4 при каждом появлении независимо представляет собой H, $=O$, F, Cl, Br, I, OCF_3 , CF_3 , OR^a , SR^a , CN,

NO_2 , $-\text{C}(\text{O})\text{R}^a$, $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^a$, $-\text{OC}(\text{O})\text{R}^a$, $-\text{NR}^7\text{R}^8$, $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^8\text{R}^9$, $-\text{NR}^7\text{C}(\text{O})\text{R}^b$, $-\text{S}(\text{O})_p\text{NR}^8\text{R}^9$, $-\text{NR}^8\text{S}(\text{O})_p\text{R}^c$, $-\text{S}(\text{O})\text{R}^c$, $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^c$, C_{1-6} алкил, замещенный с помощью 0-2 R^{4a} , C_{2-6} алкенил, замещенный с помощью 0-2 R^{4a} , C_{2-6} алкинил, замещенный с помощью 0-2 R^{4a} , $-(\text{CH}_2)_r$ - C_{3-10} карбоцикл, замещенный с помощью 0-3 R^{4b} , или $-(\text{CH}_2)_r$ -, содержащий от 5 до 10 членов гетероцикл, включающий атомы углерода и 1-4 гетероатомов, выбранных из N, O, и $\text{S}(\text{O})_p$, где указанный гетероцикл замещен с помощью 0-3 R^{4b} ;

R^{4a} при каждом появлении независимо представляет собой H, F, $=\text{O}$, C_{1-6} алкил, OR^a , SR^a , CF_3 , CN, NO_2 , $-\text{C}(\text{O})\text{R}^a$, $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^a$, $-\text{OC}(\text{O})\text{R}^a$, $-\text{NR}^7\text{R}^8$, $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^8\text{R}^9$, $-\text{NR}^7\text{C}(\text{O})\text{R}^b$, $-\text{S}(\text{O})_p\text{NR}^8\text{R}^9$, $-\text{NR}^8\text{S}(\text{O})_2\text{R}^c$, $-\text{S}(\text{O})\text{R}^c$ или $\text{S}(\text{O})_2\text{R}^c$;

R^{4b} при каждом появлении независимо представляет собой H, $=\text{O}$, $=\text{NR}^8$, F, Cl, Br, I, OR^a , SR^a , CN, NO_2 , CF_3 , $-\text{SO}_2\text{R}^c$, $-\text{NR}^7\text{R}^8$, $-\text{C}(\text{O})\text{R}^a$, $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^a$, $-\text{OC}(\text{O})\text{R}^a$, $-\text{NR}^7\text{R}^8$, $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^8\text{R}^9$, $-\text{NR}^7\text{C}(\text{O})\text{R}^b$, $-\text{S}(\text{O})_p\text{NR}^8\text{R}^9$, C_{1-6} алкил, C_{2-6} алкенил, C_{2-6} алкинил, C_{3-6} циклоалкил, C_{1-4} галогеналкил или C_{1-4} галогеналкокси-;

альтернативно, R^3 и R^4 группы, когда расположены на смежных атомах, могут быть взяты вместе, чтобы образовать C_{3-10} карбоцикл, замещенный с помощью 0-2 R^{3d} , или содержащий от 5 до 10 членов гетероцикл, включающий атомы углерода и 1-4 гетероатомов, выбранных из N, O, и $\text{S}(\text{O})_p$, где указанный гетероцикл замещен с помощью 0-2 R^{3d} ;

R^5 при каждом появлении независимо представляет собой H, F, OCF_3 , CF_3 , OR^a , SR^a , CN, NO_2 , $-\text{C}(\text{O})\text{R}^a$, $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^a$, $-\text{OC}(\text{O})\text{R}^a$, $-\text{NR}^7\text{R}^8$, $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^7\text{R}^8$, $-\text{NR}^7\text{C}(\text{O})\text{R}^b$, $-\text{S}(\text{O})_p\text{NR}^8\text{R}^9$, $-\text{NR}^8\text{S}(\text{O})_2\text{R}^c$, $-\text{S}(\text{O})\text{R}^c$, $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^c$, C_{1-6} алкил, замещенный с помощью 0-2 R^{5a} , C_{2-6} алкенил, замещенный с помощью 0-2 R^{5a} , C_{2-6} алкинил, замещенный с помощью 0-2 R^{5a} , $-(\text{CH}_2)_r$ - C_{3-10} карбоцикл, замещенный с помощью 0-3 R^{5b} , или $-(\text{CH}_2)_r$ -, содержащий 5-10 членов гетероцикл, включающий атомы углерода и 1-4 гетероатомов, выбранных из N, O, и $\text{S}(\text{O})_p$, где указанный гетероцикл замещен с помощью 0-3 R^{5b} ;

R^{5a} при каждом появлении независимо представляет собой H, $=\text{O}$, OR^a , SR^a , F, Cl, Br, I, CF_3 , OCF_3 , CN, NO_2 , $-\text{NR}^7\text{R}^8$, $-\text{NR}^7\text{R}^8$, $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^7\text{R}^8$, $-\text{NR}^7\text{C}(\text{O})\text{R}^b$, $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}^8\text{R}^9$, $-\text{NR}^8\text{S}(\text{O})_2\text{R}^c$, $-\text{S}(\text{O})\text{R}^c$ или $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^c$;

R^{5b} при каждом появлении независимо представляет собой H, $=\text{O}$, $=\text{NR}^8$, F, Cl, Br, I, OR^a , SR^a , CN, NO_2 , CF_3 , $-\text{SO}_2\text{R}^c$, $-\text{NR}^7\text{R}^8$, $-\text{C}(\text{O})\text{R}^a$, $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^a$, $-\text{OC}(\text{O})\text{R}^a$, $-\text{NR}^7\text{R}^8$, $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^8\text{R}^9$, $-\text{NR}^7\text{C}(\text{O})\text{R}^b$, $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}^8\text{R}^9$, $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^c$, C_{1-6} алкил, C_{2-6} алкенил, C_{2-6} алкинил, C_{3-6} циклоалкил, C_{1-4} галогеналкил или C_{1-4} галогеналкокси-;

R^6 при каждом появлении независимо представляет собой H, C_{1-6} алкил, C_{1-4} галогеналкил, $-\text{CH}_2\text{OR}^a$, $-\text{C}(\text{O})\text{R}^c$, $-\text{C}(\text{O})_2\text{R}^c$, $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^c$ или $-(\text{CH}_2)$ фенил, замещенный с помощью 0-3 R^d ;

R^7 при каждом появлении независимо представляет собой H, C_{1-6} алкил, $-(\text{CH}_2)_n$ - C_{3-10} карбоцикл, $-(\text{CH}_2)_n$ -(5-10-членный гетероарил), $-\text{C}(\text{O})\text{R}^c$, $-\text{CHO}$, $-\text{C}(\text{O})_2\text{R}^c$, $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^c$, $-\text{CONR}^8\text{R}^c$, $-\text{OCONHR}^c$, $-\text{C}(\text{O})\text{O}-(\text{C}_{1-4}\text{алкил})\text{OC}(\text{O})-(\text{C}_{1-4}\text{алкил})$ или $-\text{C}(\text{O})\text{O}-(\text{C}_{1-4}\text{алкил})\text{OC}(\text{O})-(\text{C}_{6-10}\text{арил})$; где указанный алкил, карбоцикл, гетероарил и арил необязательно замещены с помощью 0-2 R^f ;

R^8 при каждом появлении независимо представляет собой H, C_{1-6} алкил, или $-(\text{CH}_2)_r$ -фенил, или $-(\text{CH}_2)_n$ -, содержащий 5-10 членов гетероцикл, включающий атомы углерода и 1-4 гетероатомов, выбранных из N, O, и $\text{S}(\text{O})_p$; где указанный алкил, фенил и гетероцикл необязательно замещены с помощью 0-2 R^f ;

альтернативно, R^7 и R^8 , когда присоединены к одному и тому же атому азота, объединяются, чтобы образовать содержащее от 5 до 10 членов гетероциклическое кольцо, содержащее атомы углерода и 0-2 дополнительных гетероатомов, выбранных из N, O, и S(O)_p, где указанный гетероцикл замещен с помощью 0-2 R^d ;

R^{8a} при каждом появлении независимо представляет собой H, OH, C₁₋₆алкил, C₁₋₄алкокси, (C₆₋₁₀арил)-C₁₋₄алкокси, -(CH₂)_n-фенил, -(CH₂)_n-(5-10-членный гетероарил), -C(O)R^C, -C(O)₂R^C, -C(O)O-(C₁₋₆алкил)OC(O)-(C₁₋₄алкил), или -C(O)O-(C₁₋₄алкил)OC(O)-(C₆₋₁₀арил); где указанный фенил, арил и гетероарил необязательно замещены с помощью 0-2 R^f ;

R^9 при каждом появлении независимо представляет собой H, C₁₋₆алкил или -(CH₂)_n-фенил; где указанный алкил и фенил необязательно замещены с помощью 0-2 R^f ;

R^{9a} при каждом появлении независимо представляет собой H, C₁₋₆алкил или -(CH₂)_n-фенил;

альтернативно, R^8 и R^9 , когда присоединены к одному и тому же атому азота, объединяются, чтобы образовать, содержащее от 5 до 10 членов гетероциклическое кольцо, содержащее атомы углерода и 0-2 дополнительных гетероатомов, выбранных из N, O, и S(O)_p, где указанный гетероцикл замещен с помощью 0-2 R^d ;

R^{10} при каждом появлении независимо представляет собой H, C₁₋₆алкил, замещенный с помощью 0-3 R^{10a} , C₂₋₆алкенил, замещенный с помощью 0-3 R^{10a} , C₂₋₆алкинил, замещенный с помощью 0-3 R^{10a} , -(CH₂)_r-C₃₋₁₀карбоцикл, замещенный с помощью 0-3 R^d , или -(CH₂)_r-, содержащий от 5 до 10 членов гетероцикл, включающий атомы углерода и 1-4 гетероатомов, выбранных из N, O, и S(O)_p, где указанный гетероцикл замещен с помощью 0-3 R^d ;

R^{10a} при каждом появлении независимо представляет собой H, =O, C₁₋₄алкил, OR^a, SR^a, F, CF₃, CN, NO₂, -C(O)OR^a, -NR⁷R⁸, -C(O)NR⁷R⁸, -NR⁷C(O)R^b, -S(O)_pNR⁸R⁹, -NR⁸SO₂R^C, -S(O)R^C или -S(O)₂R^C;

R^{11} представляет собой C₁₋₄галогеналкил, -(CH₂)_rC(O)NR⁸R⁹, C₁₋₆алкил, замещенный с помощью 0-3 R^{11a} , C₂₋₆алкенил, замещенный с помощью 0-3 R^{11a} , C₂₋₆алкинил, замещенный с помощью 0-3 R^{11a} , -(CR¹⁴R¹⁵)_r-C₃₋₁₀карбоцикл, замещенный с помощью 0-3 R^{11b} , или -(CR¹⁴R¹⁵)_r-, содержащий от 5 до 10 членов гетероцикл, включающий: атомы углерода и 1-4 гетероатомов, выбранных из N, O, и S(O)_p, где указанный гетероцикл замещен с помощью 0-3 R^{11b} ;

R^{11a} при каждом появлении независимо представляет собой H, =O, C₁₋₄алкил, OR^a, CF₃, SR^a, F, CN, NO₂, NR⁷R⁸, -C(O)NR⁷R⁸, -NR⁷C(O)R^b, -S(O)_pNR⁸R⁹, -NR⁸S(O)_pR^C, -C(O)R^a, -C(O)OR^a, -S(O)_pR^C, C₃₋₆циклоалкил, C₁₋₄галогеналкил, C₁₋₄галогеналкокси-, -(CH₂)_r-C₃₋₁₀карбоцикл, замещенный с помощью 0-3 R^d , или -(CH₂)_r-, содержащий от 5 до 10 членов гетероцикл, включающий: атомы углерода и 1-4 гетероатомов, выбранных из N, O, и S(O)_p, и замещенных с помощью 0-3 R^d ;

R^{11b} при каждом появлении независимо представляет собой H, =O, =NR⁸, OR^a, F, Cl, Br, CN, NO₂, CF₃, OCF₃, OCHF₂, -C(O)R^a, -C(O)OR^a, -SOR^C, -SO₂R^C, -NR⁷R⁸, -C(O)NR⁷R⁸, -NR⁷C(O)R^b, -NR⁸C(O)₂R^C, -S(O)_pNR⁸R⁹, -NR⁸S(O)_pR^C, C₁₋₆алкил, C₂₋₆алкенил, C₂₋₆алкинил, C₃₋₆циклоалкил, C₁₋₄галогеналкил, C₁₋₄галогеналкокси-, -(CH₂)_r-C₃₋₁₀карбоцикл, замещенный с помощью 0-3 R^d , или -(CH₂)_r-, содержащий 5-10 членов гетероцикл, включающий атомы углерода и 1-4 гетероатомов, выбранных из N, O, и S(O)_p, где указанный гетероцикл замещен с помощью 0-3 R^6 ;

альтернативно, когда две R^{11b} группы являются заместителями на смежных атомах, они могут быть взяты вместе с атомами, к которым они присоединены, чтобы образовать содержащий от 5 до 7 членов гетероцикл, включающий атомы углерода и 1-4 гетероатомов,

выбранных из N, O, и S(O)_p и замещенных с помощью 0-2 R^g;

R¹² при каждом появлении независимо представляет собой H, F, или C₁₋₄алкил;

R¹³ при каждом появлении независимо представляет собой H, C₁₋₆алкил, -(CH₂)_n-фенил, -(CH₂)_n-(5-10-членный гетероарил), -C(O)R^c, -C(O)OR^c, -CONR⁸R^c, -OCONR⁸R⁹, -S(O)₂R^c, -C(O)O-(C₁₋₄алкил)-OC(O)-(C₁₋₄алкил) или -C(O)O-(C₁₋₄алкил)-OC(O)-(C₆₋₁₀арил); где указанный алкил, фенил, гетероарил, арил необязательно замещены с помощью 0-2 R^f;

R¹⁴ и R¹⁵ при каждом появлении независимо представляют собой H, F, или C₁₋₄алкил;

альтернативно, R¹⁴ объединится с R¹⁵, чтобы образовать =O;

R^a при каждом появлении независимо представляет собой H, CF₃, C₁₋₆алкил, -(CH₂)_r-C₃₋₇циклоалкил, -(CH₂)_r-C₆₋₁₀арил или -(CH₂)_r-, содержащий от 5 до 10 членов гетероцикл, включающий атомы углерода и 1-4 гетероатомов, выбранных из N, O, и S(O)_p; где указанный циклоалкил, арил и гетероарильные группы необязательно замещены с помощью 0-2 R^f;

R^b при каждом появлении независимо представляет собой CF₃, OH, C₁₋₄алкокси, C₁₋₆алкил, -(CH₂)_r-C₃₋₁₀карбоцикл, замещенный с помощью 0-3 R^d, или -(CH₂)_r-, содержащий 5-10 членов гетероцикл, включающий атомы углерода и 1-4 гетероатомов, выбранных из N, O, и S(O)_p, где указанный гетероцикл замещен с помощью 0-3 R^d;

R^c при каждом появлении независимо представляет собой CF₃, C₁₋₆алкил, замещенный с помощью 0-2 R^f, C₃₋₆циклоалкил, замещенный с помощью 0-2 R^f C₆₋₁₀арил, содержащий от 5 до 10 членов гетероарил, (C₁₋₆арил)-C₁₋₄алкил или (от 5- до 10-членный гетероарил)-C₁₋₄алкил, где указанный арил и гетероарильные группы необязательно замещены с помощью 0-3 R^f;

R^d при каждом появлении независимо представляет собой H, -O, =NR⁸, OR^a, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, -NR⁷R⁸, -C(O)R^a, -C(O)OR^a, -OC(O)R^a, NR⁸C(O)R^a, -C(O)NR⁷R⁸, -SO₂NR⁸R⁹, -NR⁸SO₂NR⁸R⁹, -NR⁸SO₂-C₁₋₄алкил, -NR⁸O₂CF₃, -NR⁸SO₂-фенил, -S(O)₂CF₃, -S(O)_p-C₁₋₄алкил, -S(O)_p-фенил, -(CF₂)_r-CF₃, C₁₋₆алкил, замещенный с помощью 0-2 R^e, C₂₋₆алкенил, замещенный с помощью 0-2 R^e, или C₂₋₆алкинил, замещенный с помощью 0-2R^e;

R^e при каждом появлении независимо представляет собой =O, OR^a, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, -NR⁸R⁹, -C(O)R^a, -C(O)OR^a, -OC(O)R^a, -NR⁸(O)R^a, -C(O)NR⁷R⁸, -SO₂NR⁸R⁹, NR⁸SO₂NR⁸R⁹, -NR⁸SO₂-C₁₋₄алкил, -NR⁸SO₂CF₃, -NR⁸SO₂-фенил, -S(O)₂CF₃, -S(O)_p-C₁₋₄алкил, -S(O)_p-фенил, или -(CF₂)_r-CF₃;

R^f при каждом появлении независимо представляет собой H, =O, -(CH₂)_rOR^g, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, -NR^{9a}R^{9a}, -C(O)R^g, -C(O)OR^g, -NR^{9a}C(O)R^g, -C(O)NR^{9a}R^{9a}, -SO₂NR^{9a}R^{9a}, -NR^{9a}SO₂NR^{9a}R^{9a}, -NR^{9a}SO₂-C₁₋₄алкил, -NR^{9a}SO₂CF₃, -NR^{9a}SO₂-фенил, -S(O)₂CF₃, -S(O)_p-C₁₋₄алкил, -S(O)_p-фенил, -(CF₂)_r-CF₃, C₁₋₆алкил, C₂₋₆алкенил, или -(CH₂)_n-фенил;

R^g при каждом появлении независимо представляет собой H, C₁₋₆алкил или -(CH₂)_n-фенил;

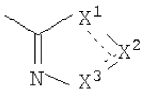
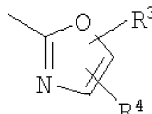
n при каждом появлении выбран из 0, 1, 2, 3 и 4;

p при каждом появлении выбран из 0, 1 и 2;

r при каждом появлении выбран из 0, 1, 2, 3 и 4 и

s при каждом появлении выбран из 1, 2, 3 и 4;

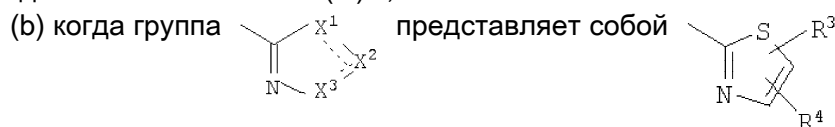
при условии, что:

(а) когда группа  представляет собой 

i. и когда L представляет собой -NHC(O)-, R¹⁴ не объединяются с R¹⁵, чтобы образовать =O;

ii. и когда L представляет собой -C(0)NH- и A представляет собой фенил, R¹ не

представляет собой -NHC(O)H ;



i. и когда L представляет собой -NHC(O)- и R^3 объединится с R^4 , чтобы образовать фенильное кольцо, конденсированное с триазолом, фенильное кольцо является замещенным, по крайней мере, одним R^{3a} ;

ii. и когда L представляет собой -C(O)NH- и A представляет собой фенил, R^1 не представляет собой -NHC(O)H ; и

(c). A не является замещенным или незамещенным оксазолином, тиюфеном, оксадиазолом. или фураном.

19. Соединение по п.18, где

A представляет собой C_{3-8} циклоалкил, замещенный с помощью 0-1 R^1 и 0-3 R^2 , C_{4-8} циклоалкенил, замещенный с помощью 0-1 R^1 и 0-3 R^2 , фенил, замещенный с помощью 0-1 R^1 и 0-3 R^2 , нафтил, замещенный с помощью 0-1 R^1 и 0-3 R^2 , или содержащий от 5 до 10 членов гетероцикл, включающий атомы углерода и 1-4 гетероатомов, выбранных из N, O, и S(O)_p , где указанный гетероцикл замещен с помощью 0-1 R^1 и 0-3 R^2 ; при условии, что, когда A представляет собой гетероцикл, содержащий один или большее количество атомов азота, A не является присоединенным к L через любой из атомов азота на кольце A;

Z представляет собой $\text{-C(R}^{11})(\text{R}^{12})\text{-}$;

L представляет собой $\text{-C(O)NR}^{10}\text{-}$, $\text{-NR}^{10}\text{C(O)-}$, $\text{-CH}_2\text{C(O)NR}^{10}\text{-}$, $\text{-CH}_2\text{NR}^{10}\text{C(O)-}$, $\text{-C(O)NR}^{10}\text{CH}_2\text{-}$ или $\text{-NR}^{10}\text{C(O)CH}_2\text{-}$;

R^3 при каждом появлении независимо представляет собой $\text{-(CH}_2)_r\text{C(O)NR}^8\text{R}^9$, $\text{-(CH}_2)_r\text{C(O)NR}^8(\text{CH}_2)_s\text{CO}_2\text{R}^{3b}$, $\text{-(CH}_2)_r\text{CO}_2\text{R}^{3b}$, $\text{-(CH}_2)_r\text{-C}_{3-8}$ циклоалкил, замещенный с помощью 0-2 R^{3a} и 0-1 R^{3d} , $\text{-(CH}_2)_r\text{-фенил}$, замещенный с помощью 0-3 R^{3a} и 0-1 R^{3d} , $\text{-(CH}_2)_r\text{-нафтил}$, замещенный с помощью 0-3 R^{3a} и 0-1 R^{3d} , $\text{-(CH}_2)_r\text{-инданил}$, замещенный с помощью 0-3 R^{3a} и 0-1 R^{3d} , или $\text{-(CH}_2)_r\text{-}$, содержащий 5-10 членов гетероцикл, включающий атомы углерода и 1-4 гетероатомов, выбранных из N, O, и S(O)_p , где указанный гетероцикл замещен с помощью 0-3 R^{3a} и 0-1 R^{3d} ;

R^4 представляет собой H, F, Cl, Br, I, OCF_3 , CF_3 , OR^a , SR^a , CN, NO_2 , -C(O)R^a , -C(O)OR^a , $\text{-NR}^7\text{R}^8$, $\text{-C(O)NR}^8\text{R}^9$, $\text{-NR}^7\text{C(O)R}^b$, $\text{-S(O)}_p\text{NR}^8\text{R}^9$, $\text{-NR}^8\text{S(O)}_p\text{R}^c$, -S(O)R^c , $\text{-S(O)}_2\text{R}^c$, C_{1-6} алкил, замещенный с помощью 0-2 R^{4a} , C_{2-6} алкенил, замещенный с помощью 0-2 R^{4a} , C_{2-6} алкинил, замещенный с помощью 0-2 R^{4a} фенил, замещенный с помощью 0-2 R^{4a} или 5-10-членный гетероцикл, включающий атомы углерода и 1-4 гетероатомы, выбранные из N, O, и S(O)_p , где указанный гетероцикл замещен с помощью 0-3 R^{4b} ;

R^6 при каждом появлении независимо представляет собой H, C_{1-6} алкил, $\text{-CH}_2\text{OR}^a$, -C(O)R^c , $\text{-C(O)}_2\text{R}^c$, или $\text{-(CH}_2)_r\text{-фенил}$, замещенный с помощью 0-3 R^d ;

R^{10} при каждом появлении независимо представляет собой H, C_{1-6} алкил, замещенный с помощью 0-3 R^{10a} , $\text{-(CH}_2)_r\text{фенил}$, замещенный с помощью 0-3 R^d , или $\text{-(CH}_2)_r\text{-}$, содержащий 5-10 членов гетероцикл, включающий атомы углерода и 1-4 гетероатомов, выбранных из N, O, и S(O)_p , где указанный гетероцикл замещен с помощью 0-3 R^d ; и

R^{11} представляет собой C_{1-4} галогеналкил, $\text{-(CH}_2)_r\text{C(O)NR}^8\text{R}^9$, C_{1-6} алкил, замещенный с помощью 0-3 R^{11a} , C_{2-6} алкенил, замещенный с помощью 0-3 R^{11a} , C_{2-6} алкинил, замещенный с помощью 0-3 R^{11a} , $\text{-(CH}_2)_r\text{-C}_{3-10}$ карбоцикл, замещенный с помощью 0-3 R^{11b} , или $\text{-(CH}_2)_r\text{-}$, содержащий 5-10 членов гетероцикл, включающий атомы углерода и 1-4 гетероатомов, выбранных из N, O, и S(O)_p , где указанный гетероцикл замещен с помощью 0-3 R^{11b} .

20. Соединение по п.18, где

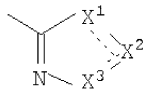
A представляет собой C_{5-6} циклоалкил, замещенный с помощью 0-1 R^1 и 0-2 R^2 , C_{5-6} циклоалкенил, замещенный с помощью 0-1 R^1 и 0-2 R^2 , фенил, замещенный с

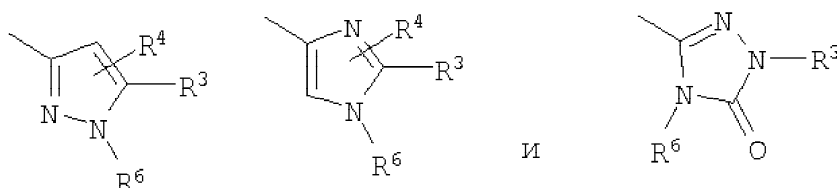
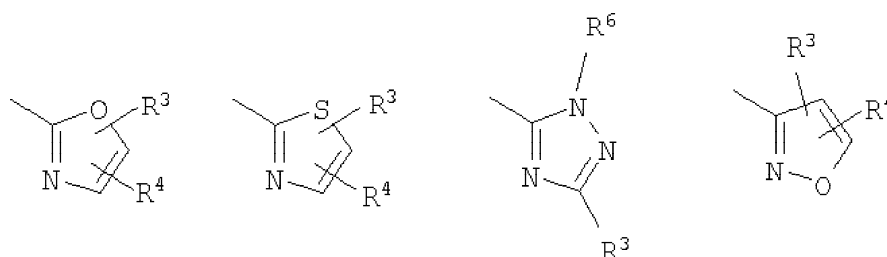
помощью 0-1 R¹ и 0-3 R², нафтил, замещенный с помощью 0-1 R¹ и 0-3 R², или содержащий от 5 до 10 членов гетероцикл, включающий атомы углерода и 1-4 гетероатомов, выбранных из N, O, и S(O)_p, где указанный гетероцикл замещен с помощью 0-1 R¹ и 0-3 R²; при условии, что, когда А представляет собой гетероцикл, содержащий один или большее количество атомов азота, А не является присоединенным к L через любой из атомов азота на кольце А;

R³ при каждом появлении независимо представляет собой -(CH₂)_rC(O)NR⁸R⁹, -(CH₂)_rC(O)NR⁸R⁹(CH₂)_sCO₂R^{3b}, -(CH₂)_rCO₂R^{3b}, -(CH₂)_rфенил, замещенный с помощью 0-3 R^{3a} и 0-1 R^{3d}, -(CH₂)_r-нафтил, замещенный с помощью 0-3 R^{3a} и 0-1 R^{3b}, -(CH₂)_r-инданил, замещенный с помощью 0-3 R^{3a} и 0-1 R^{3d}, или -(CH₂)_r-, содержащий 5-10 членов гетероцикл, включающий атомы углерода и 1-4 гетероатомов, выбранных из N, O, и S(O)_p, где указанный гетероцикл замещен с помощью 0-3 R^{3a} и 0-1 R^{3b}; и

R⁶ при каждом появлении независимо представляет собой H или C₁₋₆алкил.

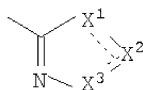
21. Соединение по п.18, где

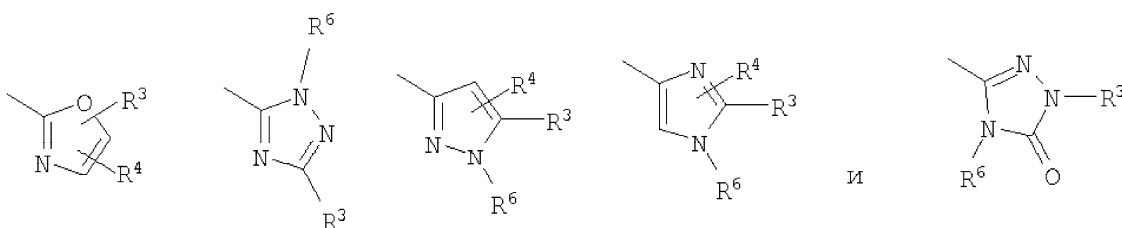
группа  выбрана из:



и

22. Соединение по п.18, где

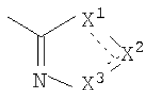
группа  выбрана из:

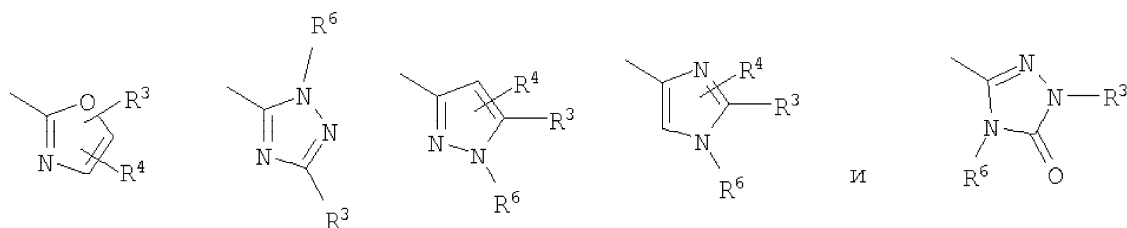


и

23. Соединение по п.18, где

А является замещенным с помощью 0-1 R¹ и 0-2 R² и выбран из C₃₋₇циклоалкила, фенила, нафтила, 1,2,3,4-тетрагидронафтила, пиридила, индазолила, бензимидазолила, бензизоксазолила, изохинолинила, 5,6,7,8-тетрагидроизохинолинила, 1,2,3,4-тетрагидроизохинолинила, хиназолинила, 1Н-хиназолин-4-онила, 2Н-изохинолин-1-онила, 3Н-хиназолин-4-онила, 3,4-дигидро-2Н-изохинолин-1-онила, 2,3-дигидроизоиндолинонила и фталазинила;

группа  выбрана из:



Z представляет собой $-\text{CH}(\text{R}^{12})-$;

L представляет собой $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^{10}-$, $-\text{NR}^{10}\text{C}(\text{O})-$, $-\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{NR}^{10}-$, $-\text{CH}_2\text{NR}^{10}\text{C}(\text{O})-$, $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^{10}\text{CH}_2-$, или $-\text{NR}^{10}\text{C}(\text{O})\text{CH}_2-$;

R^3 при каждом появлении независимо представляет собой $-(\text{CH}_2)_r\text{C}(\text{O})\text{NR}^8\text{R}^9$, $-(\text{CH}_2)_r\text{C}(\text{O})\text{NR}^8(\text{CH}_2)_s\text{CO}_2\text{R}^{3b}$, $-(\text{CH}_2)_r\text{CO}_2\text{R}^{3b}$, $-(\text{CH}_2)_r$ -фенил, замещенный с помощью 0-3 R^{3a} и 0-1 R^{3d} , $-(\text{CH}_2)_r$ -нафтил, замещенный с помощью 0-3 R^{3a} и 0-1 R^{3d} , $-(\text{CH}_2)_r$ -инданил, замещенный с помощью 0-3 R^{3a} и 0-1 R^{3d} , или $-(\text{CH}_2)_r$, содержащий 5-10 членов гетероцикл, включающий атомы углерода и 1-4 гетероатомов, выбранных из N, O, и $\text{S}(\text{O})_p$, и замещенных с помощью 0-3 R^{3a} и 0-1 R^{3d} ;

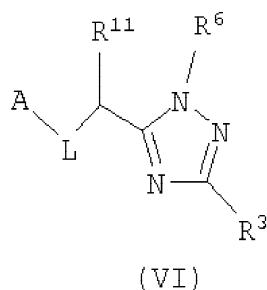
R^4 при каждом появлении независимо представляет собой H, =O, F, Cl, Br, I, OCF_3 , CF_3 , CN, NO_2 , $-\text{C}(\text{O})\text{R}^a$, $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^a$, $-\text{NR}^7\text{R}^8$, $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^8\text{R}^9$, $-\text{NR}^7\text{C}(\text{O})\text{R}^b$, $-\text{S}(\text{O})_p\text{NR}^8\text{R}^9$, $-\text{NR}^8\text{S}(\text{O})_p\text{R}^c$, $-\text{S}(\text{O})\text{R}^c$, $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^c$, C_{1-6} алкил, замещенный с помощью 0-2 R^{4a} , C_{2-6} алкенил, замещенный с помощью 0-2 R^{4a} , C_{2-6} алкинил, замещенный с помощью 0-2 R^{4a} , фенил, замещенный с помощью 0-2 R^{4b} , или 5-10-членный гетероцикл, включающий атомы углерода и 1-4 гетероатомов, выбранных из N, O, и $\text{S}(\text{O})_p$, и замещенных с помощью 0-3 R^{4b} .

R^6 представляет собой H, C_{1-6} алкил, или $-(\text{CH}_2)_r$ -фенил, замещенный с помощью 0-3 R^d ;

R^{10} при каждом появлении независимо представляет собой H, C_{1-6} алкил, замещенный с помощью 0-2 R^{10a} , $-(\text{CH}_2)_r$ -фенил, замещенный с помощью 0-2 R^d или $-(\text{CH}_2)_r$ -, содержащий 5-10 членов гетероцикл, включающий: атомы углерода и 1-4 гетероатомов, выбранных из N, O, и $\text{S}(\text{O})_p$, где указанный гетероцикл замещен с помощью 0-2 R^d и

R^{12} при каждом появлении независимо представляет собой H, F, или Me.

24. Соединение по п.18, которое представляет собой соединение формулы (VI)



или его стереоизомеры, таутомеры, фармацевтически приемлемые соли, сольваты или пролекарства, где:

R^3 представляет собой $-(\text{CH}_2)_r\text{C}(\text{O})\text{NR}^8\text{R}^9$, $-(\text{CH}_2)_s\text{C}(\text{O})\text{NR}^8(\text{CH}_2)_r\text{CO}_2\text{R}^{3b}$, $-(\text{CH}_2)_r\text{CO}_2\text{R}^{3b}$, $-(\text{CH}_2)_r$ -фенил, замещенный с помощью 0-3 R^{3a} и 0-1 R^{3d} , $-(\text{CH}_2)_r$ -нафтил, замещенный с помощью 0-2 R^{3a} , $-(\text{CH}_2)_r$ -инданил, замещенный с помощью 0-2 R^{3a} , или $-(\text{CH}_2)_r$ -, содержащий 5-10 членов гетероцикл, включающий атомы углерода и 1-4 гетероатомов, выбранных из N, O, и $\text{S}(\text{O})_p$, где указанный гетероцикл замещен с помощью 0-3 R^{3a} и 0-1 R^{3d} ;

R^6 при каждом появлении независимо представляет собой H, C_{1-6} алкил, $-\text{CH}_2\text{OR}^a$, $-\text{C}(\text{O})\text{R}^c$, $-\text{C}(\text{O})_2\text{R}^c$ или $-(\text{CH}_2)_r$ -фенил, замещенный с помощью 0-3 R^d ;

R^{10} при каждом появлении независимо представляет собой H, C_{1-6} алкил, замещенный с помощью 0-3 R^{10a} , $-(\text{CH}_2)_r$ - C_{3-10} карбоцикл, замещенный с помощью 0-3 R^d , или $-(\text{CH}_2)_r$ -, содержащий 5-10 членов гетероцикл, включающий атомы углерода и 1-4 гетероатомов,

выбранных из N, O, и S(O)_p, где указанный гетероцикл замещен с помощью 0-3 R^d; и

R¹¹ представляет собой C₁₋₄галогеналкил, -(CH₂)_rC(O)NR⁸R⁹, C₁₋₆алкил, замещенный с помощью 0-3 R^{11a}, C₂₋₆алкенил, замещенный с помощью 0-3 R^{11a}, C₂₋₆алкинил, замещенный с помощью 0-3 R^{11a}, -(CH₂)_r-C₃₋₁₀карбоцикл, замещенный с помощью 0-3 R^{11b}, или -(CH₂)_r-, содержащий 5-10 членов гетероцикл, включающий атомы углерода и 1-4 гетероатомов, выбранных из N, O, и S(O)_p, где указанный гетероцикл замещен с помощью 0-3 R^{11b}.

25. Соединение по п.24, где

R¹ при каждом появлении независимо представляет собой F, Cl, Me, Et, -NH₂, -C(=NH)NH₂, -C(O)NH₂, -CH₂NH₂, -CH₂CH₂NH₂, -CH₂NHCO₂Bn, -CH₂NHCO₂(трет-Bu), CH(Me)NH₂, -CMe₂NH₂, -NH₂Et, -NHCO₂(третBu), -NHCO₂Bn, -SO₂NH₂, OR^a или -CH₂R^{1a};

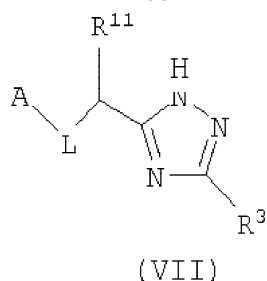
R³ представляет собой -CO₂H, -CO₂Me, -C(O)NHCH₂CO₂H, -C(O)NHCH₂CO₂Et, -C(O)NH₂, -C(O)NHMe, -C(O)NH₂Bn, -(CH₂)_r-фенил, замещенный с помощью 0-2 R^{3a} и 0-1 R^{3d}, нафтил, замещенный с помощью 0-2 R^{3a} и 0-1 R^{3d}, инданил, замещенный с помощью 0-2 R^{3a} и 0-1 R^{3d}, или -(CH₂)_r-, содержащий от 5 до 10 членов гетероцикл, включающий атомы углерода и 1-2 гетероатомов, выбранных из N, O, и S(O)_p, где указанный гетероцикл замещен с помощью 0-2 R^{3a} и 0-1 R^{3d};

R⁶ представляет собой H;

R¹⁰ при каждом появлении независимо представляет собой H, Me, бензил, фенэтил, -CH₂CH₂CO₂H, -CH₂CH₂CO₂Me, -CH₂CH₂CO₂Et, -CH₂CH₂CO₂NH₂ или -CH₂CH₂CONHCH₂CH₂Ph; и

R¹¹ представляет собой C₁₋₆алкил, -CH₂CONR⁸R⁹, -CH₂CH₂CONR⁸R⁹, -CH₂OBn, -CH₂SBn, -(CH₂)_rC₃₋₇циклоалкил, замещенный с помощью 0-2 R^{11b}, -(CH₂)_r-фенил, замещенный с помощью 0-2 R^{11b}, -(CH₂)_r-нафтил, замещенный с помощью 0-2 R^{11b}, или -(CH₂)_r-, содержащий 5-10 членов гетероцикл, включающий атомы углерода и 1-4 гетероатомов, выбранных из N, O, и S(O)_p, где указанный гетероцикл замещен с помощью 0-2 R^{11b}.

26. Соединение по п.18, которое представляет собой соединение формулы (VII)



или его стереоизомеры, таутомеры, фармацевтически приемлемые соли, сольваты или пролекарства, где:

A является замещенным с помощью 0-2 R¹ и 0-1 R² и выбран из: C₃₋₇циклоалкила, фенила, нафтила, 1,2,3,4-тетрагидронафтила, пиридила, индазолила, бензимидазолила, бензизоксазолила, изохинолинила, 5,6,7,8-тетрагидроизохинолинила, 1,2,3,4-тетрагидроизохинолинила, хиназолинила, 1H-хиназолин-4-онила, 2H-изохинолин-1-онила, 3H-хиназолин-4-онила, 3,4-дигидро-2H-изохинолин-1-онила, 2,3-дигидроизоиндолинонила и фталазинила;

L представляет собой -C(O)NH- или -NHC(O)-;

R¹ при каждом появлении независимо представляет собой F, Cl, Me, Et, -NH₂, -C(=NH)NH₂, -C(O)NH₂, -CH₂NH₂, -CH₂NHCO₂Bn, -CH₂NHCO₂(трет-Bu), -CH(Me)NH₂, -CMe₂NH₂, -NH₂Et, -NHCO₂(трет-Bu), -NHCO₂Bn, -SO₂NH₂, OR^a или -CH₂R^{1a};

R³ представляет собой -CO₂H, -CO₂Me, -C(O)NHCH₂CO₂H, -C(O)NHCH₂CO₂Et, -C(O)NH₂, -C(O)NHMe, -C(O)NH₂Bn, фенил, замещенный с помощью 0-2 R^{3a}, нафтил, замещенный с помощью 0-2 R^{3a}, инданил, замещенный с помощью 0-2 R^{3a}, или содержащий от 5 до 10 членов гетероцикл,

включающий атомы углерода и 1-2 гетероатомов, выбранных из N, O, и S(O)_p, где указанный гетероцикл замещен с помощью 0-2 R^{3a};

R⁴ представляет собой H, F, Cl, Br, CF₃, CO₂H, CO₂Me, CO₂Et, C₁₋₆алкил, замещенный с помощью 0-2 R^{4a}, фенил, замещенный с помощью 0-2 R^{4b} или 5-10-членный гетероцикл, включающий атомы углерода и 1-4 гетероатомов, выбранных из N, O, и S(O)_p, где указанный гетероцикл замещен с помощью 0-2 R^{4b};

R¹¹ представляет собой C₁₋₆алкил, -CH₂CONR⁸R⁹, -CH₂CH₂CONR⁸R⁹, -CH₂OBn, -CH₂SBn, -(CH₂)_r-C₃₋₇ циклоалкил, замещенный с помощью 0-2 R^{11b}, -(CH₂)_r-фенил, замещенный с помощью 0-2 R^{11b}, -(CH₂)_r-нафтил, замещенный с помощью 0-2 R^{11b}, или -(CH₂)_r-, содержащий от 5 до 10 членов гетероарил, замещенный с помощью 0-2 R^{11b} и выбранный из тиазолила, оксазолила, триазолила, тетразолила, имидазолила, пиридила, пиримидинила, пиазанила, пиридазинила, индолила, изоиндолила, индолинила, изоиндолинила, бензимидазолила, бензотиазолила, хинолинила, изохинолинила, тетрагидрохинолинила и тетрагидроизохинолинила; и

R^{11b} при каждом появлении независимо представляет собой H, F, Cl, Br, CF₃, OMe, OEt, O(изо-Pr), OCF₃, OCHF₂, CN, OPh, OBn, NO₂, -NH₂, -C(O)R^a, -C(O)OR^a, -C(O)NR⁷R⁸, -NR⁸C(O)R^b, -NR⁸C(O)₂R^c, -S(O)_pNR⁸R⁹, -NR⁸S(O)_pR^c, -SO₂R^c, C₁-C₄-алкил, Ph или Bn;

альтернативно, когда две R^{11b} группы являются заместителями на смежных атомах, они могут быть взяты вместе с атомами, к которым они присоединены, чтобы образовать содержащий от 5 до 7 членов гетероцикл, включающий атомы углерода и 1-4 гетероатомов, выбранных из N, O, и S(O)_p и замещенных с помощью 0-2 R⁹.

27. Соединение по п.26, где

A представляет собой 4-CH₂NH₂-циклогексил или 4-амидинофенил; и

R³ представляет собой фенил, 3-CN-фенил, 4-CN-фенил, 3-Br-фенил, 4-Br-фенил, 3-OMe-фенил, 4-OMe-фенил, 3-CF₃-фенил, 4-CF₃-фенил, 3-CO₂H-фенил, 4-CO₂H-фенил, 4-CO₂Me-фенил, 4-CH₂CO₂H-фенил, 4-CH₂CO₂Me-фенил, 3-CONH₂-фенил, 4-CONH₂-фенил, 4-CONHMe-фенил, 4-CON(Me)₂-фенил, 4-CH₂CONH₂-фенил, 4-амидинофенил или 2,4-диф-фенил.

28. Соединение, выбранное из:

(S)-4-карбамимидазил-N-(2-фенил-1-(4-фенил-1H-имидазол-2-ил)этил)бензамида,

(S)-4-(аминометил)-N-(2-фенил-1-(4-фенил-1H-имидазол-2-ил)этил)-транс-циклогексанкарбоксамида,

(S)-4-(аминометил)-N-{1-[4-(4-цианофенил)-1H-имидазол-2-ил]-2-фенилэтил}-транс-циклогексанкарбоксамида,

(S)-4-(аминометил)-N-{1-[4-(4-бромфенил)-1H-имидазол-2-ил]-2-фенилэтил}-транс-циклогексанкарбоксамида,

(S)-4-(аминометил)-N-{1-[4-(4-метоксифенил)-1H-имидазол-2-ил]-2-фенилэтил}-транс-циклогексанкарбоксамида,

(S)-4-(аминометил)-N-[2-(1-бензил-1H-имидазол-4-ил)-1-(4-фенил-1H-имидазол-2-ил)-этил]-транс-циклогексанкарбоксамида,

(S)-3-(2-{1-[транс-(4-аминометил)-циклогексанкарбоксамидо]-2-фенилэтил}-1H-имидазол-4-ил)-бензойной кислоты метилового эфира,

(S)-4-(аминометил)-N-{3-[4-(3-фторфенил)-1H-имидазол-2-ил]-2-фенилэтил}-транс-циклогексанкарбоксамида,

(S)-4-(аминометил)-N-{1-[4-(3-бромфенил)-1H-имидазол-2-ил]-2-фенилэтил}-транс-циклогексанкарбоксамида,

(S)-4-(аминометил)-N-[2-(3-хлорфенил)-1-(4-фенил-1H-имидазол-2-ил)этил]-транс-циклогексанкарбоксамида,

(S)-4-(аминометил)-N-[2-(4-хлорфенил)-1-(4-фенил-1H-имидазол-2-ил)этил]-транс-циклогексанкарбоксамида,

(S)-4-(аминометил)-N-[1-(4-фенил-1H-имидазол-2-ил)-2-(2-пиридил)этил]-транс-

циклогексанкарбоксамида,

(S)-4-(аминометил)-N-[2-фенил-1-(4-тиазол-2-ил-1H-имидазол-2-ил)этил]-транс-циклогексанкарбоксамида,

(S)-4-(аминометил)-N-[2-фенил-1-(4-пиридин-2-ил-1H-имидазол-2-ил)этил]-транс-циклогексанкарбоксамида,

(S)-[4-(2-{1-[транс-(4-аминометил)-циклогексанкарбоксамидо]-2-фенилэтил}-1H-имидазол-4-ил)-фенил]-уксусной кислоты,

(S)-4-(аминометил)-N-{1-[(4-карбамоилметилфенил)-1H-имидазол-2-ил]-2-фенилэтил}-транс-циклогексанкарбоксамида,

(S)-[4-(2-{1-[(4-аминометил)-циклогексанкарбоксамидо]-2-фенилэтил}-1H-имидазол-4-ил)]-бензамида,

(S)-[3-(2-{1-[(4-аминометил)-циклогексанкарбоксамидо]-2-фенилэтил}-1H-имидазол-4-ил)]-бензамида,

(S)-4-(2-(1-транс-(4-аминометил)-циклогексанкарбоксамидо)-2-фенилэтил)-1H-имидазол-4-ил)-N,N-диметилбензамида,

(S)-2-(1-транс-(4-аминометил)-циклогексанкарбоксамидо)-2-фенилэтил)-1H-бензо[d]имидазол-5-карбоксамида,

N-(4-карбамимидоилфенил)-3-фенил-2-(4-фенил-1H-имидазол-2-ил)пропанамида,

4-(2-(1-(4-карбамимидоилфениламино)-1-оксо-3-фенилпропан-2-ил)-1H-имидазол-4-ил)бензамида,

4-(2-(1-(1-аминоизохинолин-6-иламино)-1-оксо-3-фенилпропан-2-ил)-1H-имидазол-4-ил)бензамида,

4-(2-(4-(4-карбамимидоилфенил)-1H-имидазол-2-ил)-3-фенилпропанамидо)бензамида,

(S)-4-(аминометил)-N-{1-[4-(2,4-дифторфенил)-1H-имидазол-2-ил]-2-фенилэтил}-транс-циклогексанкарбоксамида,

(S)-4-(аминометил)-N-{1-[4-(4-фторфенил)-1H-имидазол-2-ил]-2-фенилэтил}-транс-циклогексанкарбоксамида,

(S)-3-(2-(1-транс-(4-аминометил)-циклогексанкарбоксамидо)-2-фенилэтил)-1H-имидазол-4-ил)-бензойной кислоты,

(S)-N-(1-(4-(3-амино-1H-индазол-6-ил)-1H-имидазол-2-ил)-2-фенилэтил)-4-(аминометил)-транс-циклогексанкарбоксамида,

4-[2-[1-[4-(4-карбамимидоилфенил)-1H-имидазол-2-ил]-2-фенилэтил]-1H-имидазол-4-ил]-бензамида,

(S)-4-(аминометил)-N-[1-(4-фенил-1H-имидазол-2-ил)-2-(4-пиридинил)этил]-транс-циклогексанкарбоксамида,

(S)-4-[2-[1-[4-(аминометил)циклогексанкарбоксамидо]амино]-2-фенилэтил]-4-(бром-1H-имидазол-5-ил)-бензамида,

(S)-3-[2-[1-[4-(аминометил)циклогексанкарбоксамидо]-2-фенилэтил]-1H-имидазол-4-ил]-фенилуксусной кислоты,

(S)-3-[2-[1-[4-(аминометил)циклогексанкарбоксамидо]-2-фенилэтил]-1H-имидазол-4-ил]-фенилацетамида,

(S)-4-(аминометил)-N-[1-[4-(3-гидроксифенил)-1H-имидазол-2-ил]-2-фенилэтил]-транс-циклогексанкарбоксамида,

(S)-3-[2-[1-[4-(аминометил)циклогексанкарбоксамидо]-2-фенилэтил]-1H-имидазол-4-ил]-фенилуксусной кислоты этилового эфира,

2-[4-(4-карбамимидоилфенил)-1H-имидазол-2-ил]-3,N-дифенилпропионамида,

(S)-4-(аминометил)-N-[2-(4-фторфенил)-1-(4-фенил-1H-имидазол-2-ил)этил]-транс-циклогексанкарбоксамида,

(S)-4-(аминометил)-N-[2-[4-(бензилокси)фенил]-1-(4-фенил-1H-имидазол-2-ил)этил]-тиранс-циклогексансанкарбоксамида,

(S)-4-(аминометил)-N-[2-(4-бензоилфенил)-1-(4-фенил-1H-имидазол-2-ил)этил]-транс-циклогексансанкарбоксамида,

(S)-4-(аминометил)-N-[1-(4-фенил-1H-имидазол-2-ил)-2-[3-(трифторметил)фенил]этил]-транс-циклогексанкарбоксамида,

(S)-4-(аминометил)-N-[-2-(3-нитрофенил)-1-(4-фенил-1H-имидазол-2-ил)этил]-транс-

циклогексанкарбоксамида,

(S)-4-(аминометил)-N-[2-(2-хлорфенил)-1-(4-фенил-1H-имидазол-2-илэтил)]-транс-циклогексанкарбоксамида,

(S)-4-(аминометил)-N-[2-(1-нафталенил)-1-(4-фенил-1H-имидазол-2-ил)этил]-транс-циклогексанкарбоксамида,

(S)-4-(аминометил)-N-[2-(2-нафталенил)-1-(4-фенил-1H-имидазол-2-ил)этил]-транс-циклогексанкарбоксамида,

(S)-4-(аминометил)-N-[1-[4,5-бис(3-амино-1H-индазол-6-ил)-1H-имидазол-2-ил]-2-фенилэтил]-транс-циклогексанкарбоксамида,

(S)-4-[2-[1-[4-(аминометил)циклогексанкарбоксамидо]-2-фенилэтил]-4-(трифторметил)-1H-имидазол-5-ил]-бензамида,

(S)-N-[1-[4-[4-(карбамимидоил)фенил]-1H-имидазол-2-ил]-2-фенилэтил]-бензамида,

(S)-4-(аминометил)-N-[2-(2-бромфенил)-1-(4-фенил-1H-имидазол-2-ил)этил]-транс-циклогексанкарбоксамида,

(S)-N-[1-[4-(3-амино-1H-индазол-6-ил)-5-бром-1H-имидазол-2-ил]-2-фенилэтил]-4-(аминометил)-транс-циклогексанкарбоксамида,

(S)-5-[4-(карбамоилфенил)-2-[1-[4-(аминометил)циклогексанкарбоксамидо]-2-фенилэтил]-1H-имидазол-4-карбоновой кислоты метилового эфира,

4-[2-[1-[4-(аминометил)циклогексанкарбоксамидо]-2-[2-(трифторметокси)фенил]этил]-1H-имидазол-4-ил]-бензамида,

4-[2-[1-[4-(аминометил)циклогексанкарбоксамидо]-2-[2-(дифторметокси)фенил]этил]-1H-имидазол-4-ил]-бензамида,

(S)-N-[1-[4-[4-(карбамоил)фенил]-1H-имидазол-2-ил]-2-фенилэтил]-4-(аминометил)-бензамида,

(S)-N-[1-[4-[4-(карбамоил)фенил]-1H-имидазол-2-ил]-2-фенилэтил]-4-(аминометил)-2-фторбензамида,

(S)-N-[1-[4-(3-амино-1H-индазол-6-ил)-5-хлор-1H-имидазол-2-ил]-2-фенилэтил]-4-(аминометил)-транс-циклогексанкарбоксамида,

(S)-N-[1-[4-(3-амино-1H-индазол-6-ил)-5-хлор-1H-имидазол-2-ил]-2-фенилэтил]-4-(аминометил)-бензамида,

(S)-3-амино-N-[1-[4-(3-амино-1H-индазол-6-ил)-5-хлор-1H-имидазол-2-ил]-2-фенилэтил]-1H-индазол-6-карбоксамида,

(S)-3-амино-N-[1-[4-(3-амино-1H-индазол-6-ил)-5-хлор-1H-имидазол-2-ил]-2-фенилэтил]-1,2-бензизоксазол-6-карбоксамида,

(S)-N-[1-[4-(3-амино-1H-индазол-6-ил)-5-хлор-1H-имидазол-2-ил]-2-фенилэтил]-4-(аминометил)-2-фторбензамида,

(S)-N-[1-[4-[4-(карбамимидоил)фенил]-1-(2-фенилэтил)-1H-имидазол-2-ил]-2-фенилэтил]-бензамида,

(S)-N-[1-[4-[4-(карбамимидоил)фенил]-1-метил-1H-имидазол-2-ил]-2-фенилэтил]-бензамида,

(S)-N-[1-[4-(3-амино-1H-индазол-6-ил)-5-хлор-1H-имидазол-2-ил]-2-фенилэтил]-2-фтор-5-метоксибензамида,

(S)-4-[2-[1-[4-(аминометил)циклогексанкарбоксамидо]-2-фенилэтил]-4-хлор-1H-имидазол-5-ил]-бензамида,

(S)-N[1-[4-(3-амино-1H-индазол-6-ил)-5-хлор-1H-имидазол-2-ил]-2-фенилэтил]-1,4-бензолдикарбоксамида,

(S)-N-[1-[4-(3-амино-1H-индазол-6-ил)-1H-имидазол-2-ил]-2-(2,2-диметил-1,3-бензодиоксол-4-ил)этил]-4-(аминометил)-транс-циклогексанкарбоксамида,

4-[2-[1-[4-(аминометил)циклогексанкарбоксамидо]-2-[3-(дифторметокси)фенил]этил]-1H-имидазол-4-ил]-бензамида,

(S)-4-[2-[1-[4-(аминометил)циклогексанкарбоксамидо]-2-фенилэтил]-4-фенил-1H-имидазол-5-ил]-бензамида,

(S)-1-амино-N-[1-[4-(3-амино-1H-индазол-6-ил)-5-хлор-1H-имидазол-2-ил]-2-фенилэтил]-6-изохинолинкарбоксамида,

(S)-1-амино-N-[1-[4-(3-амино-1H-индазол-6-ил)-5-хлор-1H-имидазол-2-ил]-2-фенилэтил]-

5,6,7,8-тетрагидро-6-изохинолинкарбоксамида,
N-[1-[4-(3-амино-1H-индазол-6-ил)-1H-имидазол-2-ил]-2-(3-феноксифенил)этил]-4-(аминометил)-транс-циклогексанкарбоксамида,
N-[1-[4-(3-амино-1H-индазол-6-ил)-1H-имидазол-2-ил]-2-(2-феноксифенил)этил]-4-(аминометил)-транс-циклогексанкарбоксамида,
1-амино-N-[(1S)-1-[4-(3-амино-1H-индазол-6-ил)-5-хлор-1H-имидазол-2-ил]-2-фенилэтил]-5,6,7,8-тетрагидро-(6S)-6-изохинолинкарбоксамида,
(S)-N-[1-[4-(3-амино-1H-индазол-6-ил)-1H-имидазол-2-ил]-2-(2-нитрофенил)этил]-4-(аминометил)-транс-циклогексанкарбоксамида,
(S)-N-[1-[4-(3-амино-1H-индазол-6-ил)-1H-имидазол-2-ил]-2-(3-нитрофенил)этил]-4-(аминометил)-транс-циклогексанкарбоксамида,
(S)-N-[1-[4-(3-амино-1H-индазол-6-ил)-1H-имидазол-2-ил]-2-(2-аминофенил)этил]-4-(аминометил)-транс-циклогексанкарбоксамида,
(S)-N-[1-[4-(3-амино-1H-индазол-6-ил)-1H-имидазол-2-ил]-2-(3-аминофенил)этил]-4-(аминометил)-транс-циклогексанкарбоксамида,
(S)-N-[1-[4-(3-амино-1H-индазол-6-ил)-1H-имидазол-2-ил]-2-[1,1'-бифенил]-2-илэтил]-4-(аминометил)-транс-циклогексанкарбоксамида,
(S)-N-[1-[4-(3-амино-1H-индазол-6-ил)-1H-имидазол-2-ил]-2-[1,1'-бифенил]-3-илэтил]-4-(аминометил)-транс-циклогексанкарбоксамида,
(S)-N-[1-[4-(3-амино-1H-индазол-6-ил)-5-хлор-1H-имидазол-2-ил]-2-фенилэтил]-1,2,3,4-тетрагидро-6-изохинолинкарбоксамида,
(S)-N-[1-[4-(3-амино-1H-индазол-6-ил)-1H-имидазол-2-ил]-2-[3-[(фенилсульфонил)амино]фенил]этил]-4-(аминометил)-транс-циклогексанкарбоксамида,
N-[2-(2S)-[2-[4-(3-амино-1H-индазол-6-ил)-1H-имидазол-2-ил]-2-[[транс-[4-(аминометил)циклогексанкарбоксамидо]этил]фенил]-фенилацетамида,
N-[1-[4-(3-амино-1H-индазол-6-ил)-1H-имидазол-2-ил]-2-[(2S)-2-метил-2-(2-фенилэтил)-1,3-бензодиоксол-4-ил]этил]-4-(аминометил)-транс-циклогексанкарбоксамида,
N-[1-[4-(3-амино-1H-индазол-6-ил)-1H-имидазол-2-ил]-2-[(2R)-2-метил-2-(2-фенилэтил)-1,3-бензодиоксол-4-ил]этил]-4-(аминометил)-транс-циклогексанкарбоксамида,
(S)-4-(аминометил)-N-[1-[4-(4-амино-7-хиназолинил)-5-хлор-1H-имидазол-2-ил]-2-фенилэтил]-транс-циклогексанкарбоксамида,
N-[2-[(2S)-2-[4-(3-амино-1H-индазол-6-ил)-1H-имидазол-2-ил]-2-[[[транс-4-(аминометил)циклогексанкарбоксамидо]этил]фенил]-бензолпропанамида,
(S)-N-1-[4-(3-амино-1H-индазол-6-ил)-1H-имидазол-2-ил]-2-[2-[(фенилсульфонил)амино]фенил]этил]-4-(аминометил)-транс-циклогексанкарбоксамида,
N-[1-[4-(3-амино-1H-индазол-6-ил)-1H-имидазол-2-ил]-2-[2-(фенилметокси)фенил]этил]-4-(аминометил)-транс-циклогексанкарбоксамида,
N-[2-[(2S)-2-[4-(3-амино-1H-индазол-6-ил)-1H-имидазол-2-ил]-2-[[[транс-4-(аминометил)циклогексанкарбоксамидо]этил]фенил]-бензамида,
(S)-N-[1-[4-(3-амино-1H-индазол-6-ил)-1H-имидазол-2-ил]-2-(2-бромфенил)этил]-4-(аминометил)-транс-циклогексанкарбоксамида,
(S)-N-[1-[4-(3-амино-1H-индазол-6-ил)-1H-имидазол-2-ил]-3,3-диметилбугил]-4-(аминометил)-транс-циклогексанкарбоксамида,
(R)-N-[1-[4-(3-амино-1H-индазол-6-ил)-1H-имидазол-2-ил]-2-(фенилметокси)этил]-4-(аминометил)-амино-циклогексанкарбоксамида,
(R)-N-[1-[4-(3-амино-1H-индазол-6-ил)-1H-имидазол-2-ил]-2-[(фенилметил)тио]этил]-4-(аминометил)-транс-циклогексанкарбоксамида,
(S)-N-[1-[4-(3-амино-4-фтор-1H-индазол-6-ил)-5-хлор-1H-имидазол-2-ил]-2-фенилэтил]-4-(аминометил)-амино-циклогексанкарбоксамида,
(S)-N-[1-[4-(3-амино-5-фтор-1H-индазол-6-ил)-5-хлор-1H-имидазол-2-ил]-2-фенилэтил]-4-(аминометил)-транс-циклогексанкарбоксамида,
3-[2-[4-[4-(аминокарбонил)фенил]-1H-имидазол-2-ил]-2-[[[транс-4-(аминометил)циклогексанкарбоксамидо]этил]-бензойной кислоты метилового эфира,
N-[1-[4-(3-амино-1H-индазол-6-ил)-5-хлор-1H-имидазол-2-ил]-2-[3-(дифторметокси)фенил]этил]-4-(аминометил)-транс-циклогексанкарбоксамида,

(S)-3-амино-N-[1-[4-(4-(карбамимидаил)фенил)-1H-имидазол-2-ил]-2-фенилэтил]-1H-индазол-5-карбоксамида,

3-[2-[4-[4-(аминокарбонил)фенил]-1H-имидазол-2-ил]-2-[[транс-4-(аминометил)циклогексанкарбоксамидо]этил]-бензойной кислоты,

(S)-3-Амино-N-{1-[4-(4-карбамимидаилфенил)-1H-имидазол-2-ил]-2-фенилэтил}-1H-индазол-6-карбоксамида,

(S)-N-{1-[4-(4-карбамимидаилфенил)-1H-имидазол-2-ил]-2-фенилэтил}-1H-индазол-6-карбоксамида,

(S)-N-{1-[4-(4-карбамимидаилфенил)-1H-имидазол-2-ил]-2-фенилэтил}-1H-индол-6-карбоксамида,

(S)-N-{1-[4-(4-карбамимидаилфенил)-1-этил-1H-имидазол-2-ил]-2-фенилэтил}-бензамида,

N¹-(S)-1-[4-(3-амино-1H-индазол-6-ил)-5-хлор-1H-имидазол-2-ил]-2-фенилэтил)-2-фтор-терефталамида,

N¹-(S)-1-[4-(4-аминохиназолин-7-ил)-5-хлор-1H-имидазол-2-ил]-2-фенилэтил)-2-фтор-терефталамида,

1-амино-N-[(1S)-1-[4-(3-амино-1H-индазол-6-ил)-5-хлор-1H-имидазол-2-ил]-2-фенилэтил]-5,6,7,8-тетрагидро-(6R)-6-изоизохинолинкарбоксамида,

(S)-1-амино-N-{1-[4-(4-аминохиноли-7-ил)-5-хлор-1H-имидазол-2-ил]-2-фенилэтил}-5,6,7,8-тетрагидроизохинолин-6-карбоксамида,

(S)-1-амино-N-{1-[4-(3-амино-1H-индазол-6-ил)-5-хлор-7H-имидазол-2-ил]-2-фенилэтил}-3-метил-изохинолине-6-карбоксамида,

4-(2-{1-[4-(аминометил-транс-циклогексанкарбоамидо)-2-[3-(пиперидин-1-карбонил)-фенил]-этил]-1H-имидазол-4-ил)-бензамида,

4-(2-{1-[4-(аминометил-транс-циклогексанкарбоамидо)-2-[3-(о-толилкарбамоил)-фенил]-этил]-1H-имидазол-4-ил)-бензамида,

4-(2-{1-[4-(аминометил-транс-циклогексанкарбоамидо)-2-[3-(метилфенилкарбамоил)-фенил]-этил]-1H-имидазол-4-ил)-бензамида,

4-(2-{1-[4-(аминометил-транс-циклогексанкарбоамидо)-2-[3-(бензилкарбамоил)-фенил]-этил]-1H-имидазол-4-ил)-бензамида,

(S)-N-{1-[4-(3-амино-7-фтор-1H-индазол-6-ил)-5-хлор-1H-имидазол-2-ил]-2-фенилэтил}-4-аминометил-транс-циклогексанкарбоксамида,

(S)-N-{1-[4-(3-амино-1H-индазол-5-ил)-1H-имидазол-2-ил]-2-фенилэтил}-4-аминометил-транс-циклогексанкарбоксамида,

(S)-N-{1-[4-(3-гидрокси-1H-индазол-5-ил)-1H-имидазол-2-ил]-2-фенилэтил}-4-аминометил-транс-циклогексанкарбоксамида,

(S)-4-аминометил-N[1-(4-бифенил-4-ил-1H-имидазол-2-ил)-2-фенилэтил]-транс-циклогексанкарбоксамида,

(S)-4-аминометил-N[1-(4-бензо[1,3]диоксол-5-ил-1H-имидазол-2-ил)-2-фенилэтил]-циклогексанкарбоксамида,

(S)-4-аминометил-N[1-(4-нафталин-2-ил-1H-имидазол-2-ил)-2-фенилэтил]-транс-циклогексанкарбоксамида,

N⁴-(S)-1-[4-(3-амино-1H-индазол-6-ил)-5-хлор-1H-имидазол-2-ил]-2-фенилэтил)-2-метокситерефталамида,

(S)-4-аминометил-N-{1-[4-(3-аминофенил)-1H-имидазол-2-ил]-2-фенилэтил}-циклогексанкарбоксамида,

4-(2-{1-[4-(аминометил-транс-циклогексанкарбоамидо)-2-[3-изобутилкарбамоилфенил]-этил]-1H-имидазол-4-ил)-бензамида,

4-(2-{1-[4-(аминометил-транс-циклогексанкарбоамидо)-2-[3-(3-метилбутилкарбамоил)-фенил]-этил]-1H-имидазол-4-ил)-бензамида,

4-(2-{1-[4-(аминометил-транс-циклогексанкарбоамидо)-2-[3-трет-бутилкарбамоилфенил]-этил]-1H-имидазол-4-ил)-бензамида,

4-(2-{1-[4-(аминометил-транс-циклогексанкарбоамидо)-2-[3-(4-хлорбензилкарбамоил)-фенил]-этил]-1H-имидазол-4-ил)-бензамида,

4-(2-{1-[4-(аминометил-транс-циклогексанкарбоамидо)-2-[3-(4-хлорбензилкарбамоил)-фенил]-этил]-1H-имидазол-4-ил)-бензамида,

- 4-(2-{1-[(4-аминометил-транс-циклогексанкарбоамидо]-2-[3-(4-метоксибензилкарбамоил)-фенил]-этил}-1H-имидазол-4-ил)-бензамида,
- 4-(2-{1-[(4-аминометил-транс-циклогексанкарбоамидо]-2-[3-фенэтилкарбамоилфенил]-этил}-1H-имидазол-4-ил)-бензамида,
- 4-(2-{1-[(4-аминометил-транс-циклогексанкарбоамидо]-2-[3-[2-(4-хлорфенил)-этилкарбамоил]-фенил]-этил}-1H-имидазол-4-ил)-бензамида,
- 4-(2-{1-[(4-аминометил-транс-циклогексанкарбоамидо]-2-[3-[2-(4-метоксифенил)-этилкарбамоил]-фенил]-этил}-1H-имидазол-4-ил)-бензамида,
- 4-(2-{1-[(4-аминометил-транс-циклогексанкарбоамидо]-2-[3-(3-фенилпропилкарбамоил)-фенил]-этил}-1H-имидазол-4-ил)-бензамида,
- 4-(2-{1-[(4-аминометил-транс-циклогексанкарбоамидо]-2-[3-(бензилметилкарбамоил)-фенил]-этил}-1H-имидазол-4-ил)-бензамида,
- 4-(2-{1-[(4-аминометил-транс-циклогексанкарбоамидо]-2-[3-(метилфенэтилкарбамоил)-фенил]-этил}-1H-имидазол-4-ил)-бензамида,
- 4-(2-{1-[(4-аминометил-транс-циклогексанкарбоамидо]-2-[3-m-толилкарбамоилфенил]-этил}-1H-имидазол-4-ил)-бензамида,
- 4-(2-{1-[(4-аминометил-транс-циклогексанкарбоамидо]-2-[3-p-толилкарбамоилфенил]-этил}-1H-имидазол-4-ил)-бензамида,
- 4-(2-{1-[(4-аминометил-транс-циклогексанкарбоамидо]-2-[3-(4-фторфенилкарбамоил)-фенил]-этил}-1H-имидазол-4-ил)-бензамида,
- 4-(2-{1-[(4-аминометил-транс-циклогексанкарбоамидо]-2-[3-(нафталин-1-илкарбамоил)-фенил]-этил}-1H-имидазол-4-ил)-бензамида,
- 4-(2-{1-[(4-аминометил-транс-циклогексанкарбоамидо]-2-[3-(4-фенилпиперидин-1-карбонил)-фенил]-этил}-1H-имидазол-4-ил)-бензамида,
- 4-(2-{1-[(4-аминометил-транс-циклогексанкарбоамидо]-2-[3-(3,4-дигидро-1H-изохинолин-2-карбонил)-фенил]-этил}-1H-имидазол-4-ил)-бензамида,
- (S)-N-[1-[4-(3-амино-1H-индазол-6-ил)-5-хлор-1H-имидазол-2-ил]-2-(3-бензолсульфониламинофенил)-этил]-4-аминометил-транс-циклогексанкарбоксамида,
- (S)-N-{1-[4-(4-бензилоксифенил)-1H-имидазол-2-ил]-2-фенилэтил}-4-аминометил-транс-циклогексанкарбоксамида,
- (S)-N-{1-[4-3-амино-1H-индазол-6-ил)-5-хлор-1H-имидазол-2-ил]-2-фенилэтил}-1-оксо-1,2-дигидроизохинолин-6-карбоксамида,
- (S)-N-{1-[5-хлор-4-(2,4-диаминохиназолин-7-ил)-1H-имидазол-2-ил]-2-фенилэтил}-4-аминометил-транс-циклогексанкарбоамида,
- (S)-N-{1-[4-(3-амино-1H-индазол-6-ил)-5-хлор-1H-имидазол-2-ил]-2-фенилэтил}-3-амино-1H-индазол-5-карбоксамида,
- 4-(2-{(S)-1-[4-(4-аминометил-транс-циклогексанкарбонил)-амино]-2-фенилэтил}-5-бром-1H-имидазол-4-ил)-2-фторбензамида,
- 4-(2-{(S)-1-[4-(4-аминометил-транс-циклогексанкарбонил)-амино]-2-фенилэтил}-5-хлор-1H-имидазол-4-ил)-2-фторбензамида,
- (S)-N-(1-[4-(3-амино-1H-индазол-6-ил)-5-хлор-1H-имидазол-2-ил]-2-фенилэтил)-1-оксо-1,2,3,4-тетрагидроизохинолин-6-карбоксамида,
- (S)-N-[1-(5-метил-4-фенил-1H-имидазол-2-ил)-2-фенилэтил]-4-аминометил-транс-циклогексанкарбоксамида,
- 4-(2-{(S)-1-[4-(4-аминометил-транс-циклогексанкарбонил)-амино]-2-фенилэтил}-5-метил-1H-имидазол-4-ил)-бензамида,
- (S)-N-(1-[4-(3-амино-1H-индазол-6-ил)-5-метил-1H-имидазол-2-ил]-2-фенилэтил)-4-аминометил-транс-циклогексанкарбоксамида,
- 1-амино-N-[(S)-1-[4-(4-карбамоилфенил)-5-хлор-1H-имидазол-2-ил]-2-фенилэтил]-5,6,7,8-тетрагидроизохинолин-6-карбоксамида,
- 1-амино-N-[(S)-1-[4-(4-карбамоилфенил)-5-хлор-1H-имидазол-2-ил]-2-фенилэтил]-5,6,7,8-тетрагидроизохинолин-6-карбоновой кислоты,
- 1-амино-N-[(S)-1-[4-(4-карбамоилфенил)-5-хлор-1H-имидазол-2-ил]-2-фенилэтил]-5,6,7,8-тетрагидроизохинолин-6-карбоксамида,
- 1-амино-N-[(S)-1-[4-(4-карбамоилфенил)-5-хлор-1H-имидазол-2-ил]-2-фенилэтил]-

5,6,7,8-тетрагидроизохинолин-6-карбоновой кислоты,
 4-аминометил-N-[(S)-1-[4-(6-аминопиридин-3-ил)-5-метил-1H-имидазол-2-ил]-2-фенилэтил]-транс-циклогексанкарбоксамида,
 4-аминометил-N-[(S)-1-[4-(3-хлорфенил)-5-метил-1H-имидазол-2-ил]-2-фенилэтил]-транс-циклогексанкарбоксамида,
 5-(2-[(S)-1-[4-аминометилциклогексанкарбоксамидо]-2-фенилэтил]-5-метил-1H-имидазол-4-ил)-тиофен-2-карбоновой кислоты,
 5-(2-[(S)-1-[4-аминометилциклогексанкарбоксамидо]-2-фенилэтил]-5-метил-1H-имидазол-4-ил)-тиофен-2-карбоксамида,
 N⁴-[(S)-1-[4-(3-амино-1H-индазол-6-ил)-5-хлор-1H-имидазол-2-ил]-2-фенилэтил]-2-феноксиметилтерефталамида,
 N-[(S)-1-[4-(3-амино-1H-индазол-6-ил)-5-хлор-1H-имидазол-2-ил]-2-фенил-этил]-4-аминометил-2-бензил-бензамида,
 6(S)-1-амино-N-[(S)-1-[5-хлор-4-(4-цианофенил)-1H-имидазол-2-ил]-2-фенилэтил]-5,6,7,8-тетрагидроизохинолин-6-карбоксамида,
 6(N)-1-амино-N-[(S)-1-[5-хлор-4-(4-цианофенил)-1H-имидазол-2-ил]-2-фенилэтил]-5,6,7,8-тетрагидроизохинолин-6-карбоксамида,
 N-[(S)-1-[4-(3-амино-1H-индазол-6-ил)-5-хлор-1H-имидазол-2-ил]-2-фенилэтил]-4-метилбензамида,
 4-(2-[(S)-2-(3-ацетиламинофенил)-1-[4-аминометилциклогексанкарбоксамидо]-этил]-5-хлор-1H-имидазол-4-ил)-бензамида,
 4-аминометил-N-[(S)-1-[5-(3-амино-1H-индазол-6-ил)-1H-имидазол-2-ил]-3-[(5-метилпиразин-2-илметил)-карбамоил]-пропил]-циклогексанкарбоксамида,
 4-аминометил-N-[(S)-1-[5-(3-амино-1H-индазол-6-ил)-1H-имидазол-2-ил]-3-(бензилметилкарбамоил)-пропил]-циклогексанкарбоксамида,
 4-аминометил-N-[(S)-1-[5-(3-амино-1H-индазол-6-ил)-1H-имидазол-2-ил]-3-(бензилкарбамоил)-пропил]-циклогексанкарбоксамида,
 4-(2-{1-[4-аминометилциклогексанкарбоксамидо]-2-[3-(этилметилкарбамоил)-фенил]-этил}-5-хлор-1H-имидазол-4-ил)-бензамида,
 4-(2-{1-[4-аминометилциклогексанкарбоксамидо]-2-[3-(изопропилметилкарбамоил)-фенил]-этил}-5-хлор-1H-имидазол-4-ил)-бензамида,
 4-(2-{1-[4-аминометилциклогексанкарбоксамидо]-2-[3-(изобутилметилкарбамоил)-фенил]-этил}-5-хлор-1H-имидазол-4-ил)-бензамида,
 4-(2-{1-[4-аминометилциклогексанкарбоксамидо]-2-[3-(метилфенилкарбамоил)-фенил]-этил}-5-хлор-1H-имидазол-4-ил)-бензамида,
 4-(2-{1-[4-аминометилциклогексанкарбоксамидо]-2-[3-(метилфенилкарбамоил)-фенил]-этил}-5-хлор-1H-имидазол-4-ил)-бензамида,
 4-(2-{1-[4-аминометилциклогексанкарбоксамидо]-2-[3-(метил-*m*-толилкарбамоил)-фенил]-этил}-5-хлор-1H-имидазол-4-ил)-бензамида,
 4-(2-{1-[4-аминометилциклогексанкарбоксамидо]-2-[3-(метил-*p*-толилкарбамоил)-фенил]-этил}-5-хлор-1H-имидазол-4-ил)-бензамида,
 4-[2-(1-[4-аминометилциклогексанкарбоксамидо]-2-{3-[(3-хлорбензил)-метилкарбамоил]-фенил}-этил)-5-хлор-1H-имидазол-4-ил]-бензамида,
 4-[2-(1-[4-аминометилциклогексанкарбоксамидо]-2-{3-[(4-хлорбензил)-метилкарбамоил]-фенил}-этил)-5-хлор-1H-имидазол-4-ил]-бензамида,
 4-[2-(1-[4-аминометилциклогексанкарбоксамидо]-2-{3-[2-(2-хлорфенил)этилкарбамоил]-фенил}-этил)-5-хлор-1H-имидазол-4-ил]-илбензамида,
 4-[2-(1-[4-аминометилциклогексанкарбоксамидо]-2-{3-[2-(3-хлорфенил)этилкарбамоил]-фенил}-этил)-5-хлор-1H-имидазол-4-ил]-бензамида,
 4-[2-(1-[4-аминометилциклогексанкарбоксамидо]-2-{3-[2-(4-хлорфенил)этилкарбамоил]-фенил}-этил)-5-хлор-1H-имидазол-4-ил]-бензамида,
 4-аминометил-N-[(S)-1-[4-(4-метансульфониламинофенил)-5-метил-1H-имидазол-2-ил]-2-фенилэтил]-транс-циклогексанкарбоксамида,
 4-аминометил-N-[(S)-1-[5-(3-амино-1H-индазол-6-ил)-1H-имидазол-2-ил]-3-(циклопропилметилкарбамоил)-пропил]-транс-циклогексанкарбоксамида,

4-аминометил-N-[(S)-1-[5-(3-амино-1H-индазол-6-ил)-1H-имидазол-2-ил]-3-(2-(фенил)этилкарбамоил)-пропил]-транс-циклогексанкарбоксамида,
4-аминометил-1N-[(S)-1-[4-(4-ацетиламинофенил)-5-метил-1H-имидазол-2-ил]-2-фенилэтил]-транс-циклогексанкарбоксамида,
4-аминометил-N-[(S)-1-[4-(4-гидроксифенил)-5-метил-1H-имидазол-2-ил]-2-фенилэтил]-транс-циклогексанкарбоксамида,
4-[2-(1-[4-аминометилциклогексанкарбоксамидо]-2-(3-[метил-(2-пиридин-2-илэтил)-карбамоил]-фенил)-этил]-5-хлор-1H-имидазол-4-ил)-бензамида,
4-(2-{1-[4-аминометилциклогексанкарбоксамидо]-2-[3-(2,3-дигидроиндол-1-карбонил)-фенил]-этил}-5-хлор-1H-имидазол-4-ил)-бензамида,
4-(2-{1-[4-аминометилциклогексанкарбоксамидо]-2-[3-(1,3-дигидро-изоиндол-2-карбонил)-фенил]-этил}-5-хлор-1H-имидазол-4-ил)-бензамида,
4-(2-{1-[4-аминометилциклогексанкарбоксамидо]-2-[3-(2,3-дигидро-1,4-бензоксазин-4-карбонил)-фенил]-этил}-5-хлор-1H-имидазол-4-ил)-бензамида,
4-(2-{1-[4-аминометилциклогексанкарбоксамидо]-2-[3-(6-метил-3,4-дигидро-2H-хинолин-1-карбонил)-фенил]-этил}-5-хлор-1H-имидазол-4-ил)-бензамида,
4-аминометил-N-[(S)-1-[4-(1H-индазол-6-ил)-5-метил-1H-имидазол-2-ил]-2-фенилэтил]-транс-циклогексанкарбоксамида,
1-амино-N-[(S)-1-[4-(3-амино-7-фтор-1H-индазол-6-ил)-5-хлор-1H-имидазол-2-ил]-2-фенилэтил]-транс-5,6,7,8-тетрагидроизохинолин-6-карбоксамида,
4-аминометил-N-{1-[4-(1H-индазол-6-ил)-5-метил-1H-имидазол-2-ил]-2-фенилэтил}-транс-циклогексанкарбоксамида,
4-аминометил-N-{1-[4-(3-ацетиламинофенил)-5-метил-1H-имидазол-2-ил]-2-фенилэтил}-транс-циклогексанкарбоксамида,
5-(2-{1-[транс-4-аминометилциклогексанкарбоксамидо]-2-фенилэтил}-5-хлор-1H-имидазол-4-ил)-тиофен-2-карбоновой кислоты,
N1-{1-[4-(3-амино-1H-индазол-6-ил)-5-хлор-1H-имидазол-2-ил]-2-фенилэтил}-2-хлор-терефаламида,
4-аминометил-N-{1-[4-(3-амино-1H-индазол-6-ил)-5-хлор-1H-имидазол-2-ил]-3-[(тиазол-2-илметил)-карбамоил]-пропил}-транс-циклогексанкарбоксамида,
4-аминометил-N-{1-[4-(3-амино-1H-индазол-6-ил)-5-хлор-1H-имидазол-2-ил]-3-[(пиридин-2-илметил)-карбамоил]-пропил}-транс-циклогексанкарбоксамида,
4-аминометил-N-{1-[5-метил-4-(3-оксо-2,3-дигидро-1H-изоиндол-5-ил)-1H-имидазол-2-ил]-2-фенилэтил}-транс-циклогексанкарбоксамида,
[4-(2-{1-[транс-4-аминометилциклогексанкарбоксамидо]-2-фенилэтил}-5-метил-1H-имидазол-4-ил)-фенил]-карбаминовой кислоты метилового эфира,
4-(2-{1-транс-4-аминометилциклогексанкарбоксамидо]-2-[3-(метилфенилсульфамоил)-фенил]-этил}-5-хлор-1H-имидазол-4-ил)-бензамида,
4-{2-[1-[транс-4-аминометилциклогексанкарбоксамидо]-2-(3-бензолсульфонилметил-аминофенил)-этил]-5-хлор-1H-имидазол-4-ил}-бензамида,
4-(2-{1-[транс-4-аминометилциклогексанкарбоксамидо]-2-[3-(бензоилметиламино)-фенил]-этил}-5-хлор-1H-имидазол-4-ил)-бензамида,
4-аминометил-N-{1-[4-(1-имино-4-оксо-1,2,3,4-тетрагидрофталазин-6-ил)-5-метил-1H-имидазол-2-ил]-2-фенилэтил}-транс-циклогексанкарбоксамида,
4-аминометил-N-{1-[5-метил-4-[3-(2H-тетразол-5-ил)-фенил]-1H-имидазол-2-ил]-2-фенилэтил}-транс-циклогексанкарбоксамида,
N-{1-[4-(3-амино-1H-индазол-6-ил)-5-хлор-1H-имидазол-2-ил]-2-фенилэтил}-2-фтор-4-метил-бензамида,
или их стереоизомеров, таутомеров, фармацевтически приемлемых солей или сольватов.

29. Фармацевтическая композиция, содержащая фармацевтически приемлемый носитель и терапевтически эффективное количество соединения по любому из пп.1-28.

30. Способ лечения тромбэмболического или воспалительного расстройства, включающий введение пациенту, нуждающемуся в этом, терапевтически эффективного количества соединения по любому из пп.1-28.

31. Способ лечения по п.30, отличающийся тем, что тромбэмболическое расстройство выбрано из группы, состоящей из артериального сердечно-сосудистого тромбэмболического расстройства, венозного сердечно-сосудистого тромбэмболического расстройства и тромбэмболического расстройства в камере сердца.

32. Способ по п.31, отличающийся тем, что тромбэмболическое расстройство выбрано из непостоянной ангины, острого коронарного синдрома, фибрилляции предсердий, первичного инфаркта миокарда, текущего инфаркта миокарда, внезапной смерти от ишемии, преходящего ишемического нарушения, инсульта, атеросклероза, периферической обтурирующей артериальной болезни, венозного тромбоза, глубокого тромбоза вены, тромбоза, церебрального артериального тромбоза, церебральной эмболии, почечной эмболии, легочной эмболии, и тромбоза, вытекающего из (а) искусственных клапанов или других имплантатов, (b) постоянных катетеров, (с) стентов, (d) искусственного кровообращения, (е) гемодиализа или (f) других процедур, в которых кровь оставляют незащищенной на искусственной поверхности, что вызывает тромбоз.

33. Соединение по любому из пп.1-28 для применения в терапии.

34. Применение соединения по любому из пп.1-28 для получения медицинского препарата для лечения тромбэмболического или воспалительного расстройства.