



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА  
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ

(12) **ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ**

(21)(22) Заявка: 2011116447/04, 05.11.2009

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:

06.11.2008 US 61/111,786

18.05.2009 US 61/179,088

19.05.2009 US 61/179,459

(43) Дата публикации заявки: 20.12.2012 Бюл. № 35

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на национальной фазе: 06.06.2011

(86) Заявка РСТ:

SE 2009/051251 (05.11.2009)

(87) Публикация заявки РСТ:

WO 2010/053438 (14.05.2010)

Адрес для переписки:

191036, Санкт-Петербург, а/я 24,  
"НЕВИНПАТ"

(71) Заявитель(и):

АстраЗенека АБ (SE)

(72) Автор(ы):

ФОРСБЛОМ Рикард (SE),

ПАУЛСЕН Ким (SE),

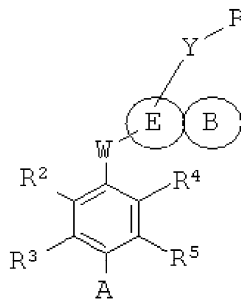
РОТТИЧЧИ Дидье (SE),

САНТАНДЖЕЛО Эллен (SE),

ВАЛЬДМАН Магнус (SE)

(54) **МОДУЛЯТОРЫ АМИЛОИДА БЕТА**(57) **Формула изобретения**

## 1. Соединение формулы (I)



(I)

где

E представляет собой



где X и V независимо выбраны из азота или СН, и где

по меньшей мере один из X или V представляет собой азот;

W представляет собой  $-C(R^6)_2-$ ,  $-O-$  или  $-N(R^6)-$ ;

$R^6$  представляет собой водород,  $C_{1-4}$ алкил или  $C_{1-4}$ алкокси, где указанный  $C_{1-4}$ алкил замещен галогеном, циано, гидроксидом, аминами, группой  $NHC_{1-4}$ алкил,  $N(C_{1-4}$ алкил) $_2$ , гетероциклическим,  $NC(O)C_{1-4}$ алкил,  $C(O)C_{1-4}$ алкокси или  $SO_2C_{1-6}$ алкил;

Y представляет собой  $-C(R^{12})(R^{13})-$ ,  $-N(R^8)-$  или  $-O-$ ;

$R^{12}$  и  $R^{13}$  независимо выбраны из водорода, галогена,  $C_{1-6}$ алкила, групп  $C_{1-6}$ алкилОС $_{1-6}$ алкил, карбоциклического, гетероциклического и  $C_{1-6}$ алкокси, где указанный  $C_{1-6}$ алкил,  $C_{1-6}$ алкилОС $_{1-6}$ алкил, карбоциклический, гетероциклический или  $C_{1-6}$ алкокси возможно замещен одним или более заместителями, выбранными из галогена, циано, гидроксидом, гетероциклического, групп  $N(C_{0-4}$ алкил) $_2$ ,  $NC(O)C_{1-4}$ алкил;

или

$R^{12}$  и  $R^{13}$  могут образовывать вместе с атомом углерода, к которому они присоединены, насыщенную, частично ненасыщенную или насыщенную кольцевую систему, где указанная кольцевая система может содержать один или более гетероатомов, выбранных из N, O и S, и где, когда указанная кольцевая система содержит атом азота, тогда этот азот может возможно быть замещен группой, выбранной из групп  $C_{1-6}$ алкил и  $C(O)C_{1-6}$ алкил, и где указанное кольцо возможно замещено одной или более группами, выбранными из галогена, циано, гидроксидом;

или

$R^{12}$  и  $R^7$  могут вместе образовывать насыщенную, частично ненасыщенную или насыщенную бициклическую кольцевую систему, где указанная бициклическая кольцевая система может содержать от нуля до трех гетероатомов, выбранных из N, O и S, и где указанная бициклическая кольцевая система возможно замещена заместителями в количестве от одного до трех, выбранными из галогена, циано, гидроксидом,  $C_{1-6}$ алкокси, аминами, групп  $NHC_{1-4}$ алкил,  $N(C_{1-6}$ алкил) $_2$ ,  $NC(O)C_{1-6}$ алкил,  $SO_2C_{1-6}$ алкил и гетероциклического, и где, когда указанная бициклическая кольцевая система содержит атом азота, тогда этот азот может возможно быть замещен группой, выбранной из групп  $C_{1-6}$ алкил и  $C(O)C_{1-6}$ алкил;

$R^8$  выбран из водорода,  $C_{1-6}$ алкила, групп  $C_{1-6}$ алкилОС $_{1-6}$ алкил,  $C(O)C_{1-6}$ алкил,  $C(O)$ циклоалкил, гетероциклического, карбоциклического,  $C(O)$ гетероциклического или  $SO_2C_{1-6}$ алкил, где указанный  $C_{1-6}$ алкил, гетероциклический, карбоциклический или  $C_{1-6}$ алкилОС $_{1-6}$ алкил возможно замещен заместителями в количестве от одного до трех, выбранными из галогена, циано, гидроксидом, аминами, групп  $NHC_{1-4}$ алкил,  $N(C_{1-6}$ алкил) $_2$ ,  $NC(O)C_{1-6}$ алкил,  $C(O)C_{1-6}$ алкокси,  $SO_2C_{1-6}$ алкил и гетероциклического;

$R^7$  выбран из водорода, арила, гетероарила, групп  $C_{1-4}$ алкиларил,  $C_{1-4}$ алкилгетероарил,  $C_{1-4}$ алкилкарбоциклического,  $C_{1-4}$ алкилгетероциклического и карбоциклического, где указанный арил, гетероарил,  $C_{1-4}$ алкилкарбоциклический,  $C_{1-4}$ алкилгетероциклический,  $C_{1-4}$ алкиларил, карбоциклический или  $C_{1-4}$ алкилгетероарил возможно замещен одним или более заместителями, выбранными из галогена, циано, гидроксидом, нитро,  $C_{1-6}$ алкила,  $C_{1-6}$ алкокси, карбоциклического, гетероциклического,  $CF_3$ ,  $OCF_3$ , групп  $OC_{1-6}$ алкил,  $C(O)C_{1-6}$ алкил,  $C_{1-6}$ алкилОС $_{1-6}$ алкил,  $SO_2C_{1-6}$ алкил,  $SO_2NHC_{1-6}$ алкил,  $SO_2N(C_{1-6}$ алкил) $_2$ ,  $SO_2N$ -гетероциклического,  $C(O)NH_2$ ,  $C(O)NHC_{1-6}$ алкил,  $C(O)N(C_{1-6}$ алкил) $_2$ ,  $C(O)N$ -гетероциклического,  $C_{2-6}$ алкенил и  $C_{2-6}$ алкинил, где указанный  $C_{1-6}$ алкил,  $C_{1-6}$ алкокси,  $C_{1-6}$ алкилОС $_{1-6}$ алкил, гетероциклический, карбоциклический,  $C_{2-6}$ алкенил или  $C_{2-6}$ алкинил возможно замещен циано, гидроксидом, метокси, галогеном, группой  $SO_2C_{1-4}$ алкил, аминами,  $NHC_{1-4}$ алкил,  $N(C_{1-4}$ алкил) $_2$ , гетероциклического или арил;

или

$R^8$  и  $R^7$  могут, когда  $Y$  представляет собой  $NR^8$ , возможно образовывать вместе с атомом азота насыщенную, частично насыщенную или ненасыщенную кольцевую систему, где указанная кольцевая система возможно замещена одной или более группами, выбранными из галогена, гидроксид, циано, групп  $C_{1-4}$ алкилОС $_{1-4}$ алкил и  $C_{1-4}$ алкил, где указанный  $C_{1-4}$ алкилОС $_{1-4}$ алкил или  $C_{1-4}$ алкил возможно замещен галогеном, циано, гидроксид;

$R^1$  выбран из водорода,  $C_{1-6}$ алкила,  $C_{1-6}$ алкокси,  $C_{2-6}$ алкенила,  $C_{2-6}$ алкинила, карбоциклила, гетероциклила,  $C(O)R^9$ ,  $C(O)N(R^9)_2$ ,  $C(O)CH_2N(R^9)_2$ , групп  $C(O)$ гетероциклил,  $C(O)$ карбоциклил,  $C(O)OR^9$ ,  $SO_2R^9$ ,  $SO_2$ гетероциклил,  $SO_2$ карбоциклил и  $SO_2N(R^9)_2$ , где указанный  $C_{1-6}$ алкил,  $C_{1-6}$ алкокси,  $C_{2-6}$ алкенил,  $C_{2-6}$ алкинил, карбоциклил или гетероциклил возможно замещен одним или более заместителями, выбранными из галогена, гидроксид, циано, амина,  $C(O)OR^9$ , групп  $NHC_{1-6}$ алкил,  $NHC_{1-6}$ алкокси,  $N(C_{1-6}$ алкил) $_2$ ,  $N(C_{1-6}$ алкокси) $_2$ ,  $SC_{1-6}$ алкил,  $SOC_{1-6}$ алкил,  $SO_2C_{1-6}$ алкил,  $C_{1-6}$ алкил,  $C_{1-6}$ алкокси, гетероциклил и карбоциклил;

$R^9$  выбран из водорода, гидроксид, галогена, циано,  $C_{1-6}$ алкила,  $C_{1-6}$ алкокси, карбоциклила и гетероциклила, где указанный  $C_{1-6}$ алкил,  $C_{1-6}$ алкокси, циклоалкил или гетероциклил возможно замещен одним или более заместителями, выбранными из галогена, циано, гидроксид или метокси;

$R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^3$  и  $R^2$  независимо выбраны из водорода, циано,  $C_{1-4}$ алкила,  $C_{1-4}$ алкокси, галогена,  $OCH_3$ ,  $OCF_3$ ,  $OCF_2H$ ,  $OCFH_2$  и гидроксид;

$A$  представляет собой 5-7-членный гетероарил, где по меньшей мере один из образующих кольцо атомов выбран из азота, а остальные образующие кольцо атомы выбраны из углерода, азота, серы и кислорода, и где указанный  $A$  возможно замещен одним или более заместителями, выбранными из галогена,  $C_{1-4}$ алкила,  $SR^{10}$ ,  $NR^{10}R^{11}$ ,  $OR^{10}$ ,  $C_{2-4}$ алкенила и  $C_{2-4}$ алкинила, и где указанный  $C_{1-4}$ алкил,  $C_{2-4}$ алкенил или  $C_{2-4}$ алкинил возможно замещен галогеном, гидроксид, циано или  $C_{1-4}$ алкокси;

$R^{10}$  и  $R^{11}$  независимо выбраны из водорода,  $C_{1-4}$ алкила,  $CF_3$ ,  $CF_2H$  и  $CFH_2$ ;

$B$  представляет собой 5-7-членное неароматическое кольцо, где один из образующих кольцо атомов выбран из  $-N(R^1)-$ ,  $-C(R^9)-$ ,  $-S(O)_n-$  или  $-O-$ , а другие образующие кольцо атомы представляют собой углерод, где одна группа  $-CH_2-$  возможно может быть заменена группой  $-C(O)-$ , и где указанное кольцо возможно замещено заместителями в количестве от одного до трех, выбранными из галогена, циано, гидроксид, амина,  $C_{1-4}$ алкила,  $C_{1-4}$ алкокси, групп  $NHC_{1-6}$ алкил,  $NHC_{1-6}$ алкилОС $_{1-6}$ алкил,  $N(C_{1-6}$ алкил) $_2$ ,  $N(C_{1-6}$ алкилОС $_{1-6}$ алкил) $_2$ , карбоциклил и гетероциклил, где указанный  $C_{1-4}$ алкил,  $C_{1-4}$ алкокси,  $NHC_{1-6}$ алкил,  $NHC_{1-6}$ алкилОС $_{1-6}$ алкил,  $N(C_{1-6}$ алкил) $_2$ ,  $N(C_{1-6}$ алкилОС $_{1-6}$ алкил) $_2$ , карбоциклил или гетероциклил возможно замещен одним или более заместителями, выбранными из галогена, гидроксид или циано;

$n$  выбран из 0, 1, 2;

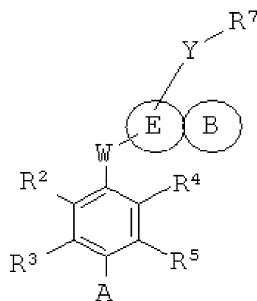
$E$  и  $B$  вместе образуют бициклическую кольцевую систему;

при условии, что исключены следующие соединения:

соединение формулы (I), где  $V$  и  $X$  представляют собой  $N$ ,  $Y$  представляет собой  $NR^8$ ;  $B$  содержит группировку  $-N(R^1)-$ ,  $R^8$  представляет собой водород, алкил или циклоалкил, и  $R^7$  представляет собой арилалкил, возможно замещенный группой, содержащей линкер, выбранный из  $O$  или  $S$ ;


в виде свободного основания или его фармацевтически приемлемой соли.

2. Соединение формулы (I)



( I )

где

Е представляет собой  где X и V независимо выбраны из азота или СН, и где

по меньшей мере один из X или V представляет собой азот;

W представляет собой  $-C(R^6)_2-$ ,  $-O-$  или  $-N(R^6)-$ ;

$R^6$  представляет собой водород,  $C_{1-4}$ алкил или  $C_{1-4}$ алкокси, где указанный  $C_{1-4}$ алкил замещен галогеном, циано, гидроксигруппой, аминогруппой, группой  $NHC_{1-4}$ алкил,  $N(C_{1-4}$ алкил) $_2$ , гетероциклическим,  $NC(O)C_{1-4}$ алкил,  $C(O)C_{1-4}$ алкокси или  $SO_2C_{1-6}$ алкил;

Y представляет собой  $-C(R^{12})(R^{13})-$ ,  $-N(R^8)-$  или  $-O-$ ;

$R^{12}$  и  $R^{13}$  независимо выбраны из водорода, галогена,  $C_{1-6}$ алкила, групп  $C_{1-6}$ алкилОС $_{1-6}$ алкил, карбоциклического, гетероциклического и  $C_{1-6}$ алкокси, где указанный  $C_{1-6}$ алкил,  $C_{1-6}$ алкилОС $_{1-6}$ алкил, карбоциклический, гетероциклический или  $C_{1-6}$ алкокси возможно замещен одним или более заместителями, выбранными из галогена, циано, гидроксигруппы, гетероциклической, групп  $N(C_{0-4}$ алкил) $_2$ ,  $NC(O)C_{1-4}$ алкил;

или

$R^{12}$  и  $R^{13}$  могут образовывать вместе с атомом углерода, к которому они присоединены, насыщенную, частично ненасыщенную или насыщенную кольцевую систему, где указанная кольцевая система может содержать один или более гетероатомов, выбранных из N, O и S, и где, когда указанная кольцевая система содержит группировку  $-NH-$ , тогда этот азот может возможно быть замещен группой, выбранной из групп  $C_{1-6}$ алкил и  $C(O)C_{1-6}$ алкил, и где указанное кольцо возможно замещено одной или более группами, выбранными из галогена, циано, гидроксигруппы;

или

$R^{12}$  и  $R^7$  могут вместе образовывать насыщенную, частично ненасыщенную или насыщенную бициклическую кольцевую систему, где указанная бициклическая кольцевая система может содержать от нуля до трех гетероатомов, выбранных из N, O и S, и где указанная бициклическая кольцевая система возможно замещена заместителями в количестве от одного до трех, выбранными из галогена, циано, гидроксигруппы,  $C_{1-6}$ алкокси, аминогруппы, групп  $NHC_{1-4}$ алкил,  $N(C_{1-6}$ алкил) $_2$ ,  $NC(O)C_{1-6}$ алкил,  $SO_2C_{1-6}$ алкил и гетероциклического, и где, когда указанная бициклическая кольцевая система содержит группировку  $-NH-$ , тогда этот азот может возможно быть замещен группой, выбранной из групп  $C_{1-6}$ алкил и  $C(O)C_{1-6}$ алкил;

$R^8$  выбран из водорода,  $C_{1-6}$ алкила, групп  $C_{1-6}$ алкилОС $_{1-6}$ алкил,  $C(O)C_{1-6}$ алкил,  $C(O)$ циклоалкил, гетероциклического, карбоциклического,  $C(O)$ гетероциклического или  $SO_2C_{1-6}$ алкил, где указанный  $C_{1-6}$ алкил, гетероциклический, карбоциклический или  $C_{1-6}$ алкилОС $_{1-6}$ алкил возможно замещен заместителями в количестве от одного до трех, выбранными из галогена, циано, гидроксигруппы, аминогруппы, групп  $NHC_{1-4}$ алкил,  $N(C_{1-6}$ алкил) $_2$ ,  $NC(O)C_{1-6}$ алкил,

$C(O)C_{1-6}$ алкокси,  $SO_2C_{1-6}$ алкил и гетероцикл;л;

$R^7$  выбран из водорода, арила, гетероарила,  $C_{1-4}$ алкиларила,  $C_{1-4}$ алкилгетероарила,  $C_{1-4}$ алкилкарбоциклила,  $C_{1-4}$ алкилгетероциклила и карбоциклила, где указанный арил, гетероарил,  $C_{1-4}$ алкилкарбоцикл;л,  $C_{1-4}$ алкилгетероцикл;л,  $C_{1-4}$ алкиларил, карбоцикл;л или  $C_{1-4}$ алкилгетероарил возможно замещен одним или более заместителями, выбранными из галогена, циано, гидрокс;и, нитро,  $C_{1-6}$ алкила,  $C_{1-6}$ алкокси, карбоциклила, гетероциклила,  $CF_3$ ,  $OCF_3$ , групп  $OC_{1-6}$ алкил,  $C(O)C_{1-6}$ алкил,  $C_{1-6}$ алкил $OC_{1-6}$ алкил,  $SO_2C_{1-6}$ алкил,  $SO_2NHC_{1-6}$ алкил,  $SO_2N(C_{1-6}$ алкил) $_2$ ,  $SO_2N$ -гетероцикл;л,  $C(O)NH_2$ ,  $C(O)NHC_{1-6}$ алкил,  $C(O)N(C_{1-6}$ алкил) $_2$ ,  $C(O)N$ -гетероцикл;л,  $C_{2-6}$ алкенил и  $C_{2-6}$ алкинил, где указанный  $C_{1-6}$ алкил,  $C_{1-6}$ алкокси,  $C_{1-6}$ алкил $OC_{1-6}$ алкил, гетероцикл;л, карбоцикл;л,  $C_{2-6}$ алкенил или  $C_{2-6}$ алкинил возможно замещен циано, гидрокс;и, метокси, галогеном, группой  $SO_2C_{1-4}$ алкил, амина,  $NHC_{1-4}$ алкил,  $N(C_{1-4}$ алкил) $_2$ , гетероцикл;л или арил; или

$R^8$  и  $R^7$  могут, когда  $Y$  представляет собой  $NR^8$ , возможно образовывать вместе с атомом азота насыщенную, частично насыщенную или ненасыщенную кольцевую систему, где указанная кольцевая система возможно замещена одной или более группами, выбранными из галогена, гидрокс;и, циано, групп  $C_{1-4}$ алкил $OC_{1-4}$ алкил и  $C_{1-4}$ алкил, где указанный  $C_{1-4}$ алкил $OC_{1-4}$ алкил или  $C_{1-4}$ алкил возможно замещен галогеном, циано, гидрокс;и;

$R^1$  выбран из водорода,  $C_{1-6}$ алкила,  $C_{1-6}$ алкокси,  $C_{2-6}$ алкенила,  $C_{2-6}$ алкинила, карбоциклила, гетероциклила,  $C(O)R^9$ ,  $C(O)N(R^9)_2$ ,  $C(O)CH_2N(R^9)_2$ , групп  $C(O)$ гетероцикл;л,  $C(O)$ карбоцикл;л,  $C(O)OR^9$ ,  $SO_2R^9$ ,  $SO_2$  гетероцикл;л,  $SO_2$ карбоцикл;л и  $SO_2N(R^9)_2$ , где указанный  $C_{1-6}$ алкил,  $C_{1-6}$ алкокси,  $C_{2-6}$ алкенил,  $C_{2-6}$ алкинил, карбоцикл;л или гетероцикл;л возможно замещен одним или более заместителями, выбранными из галогена, гидрокс;и, циано, амина,  $C(O)OR^9$ , групп  $NHC_{1-6}$ алкил,  $NHC_{1-6}$ алкокси,  $N(C_{1-6}$ алкил) $_2$ ,  $N(C_{1-6}$ алкокси) $_2$ ,  $SC_{1-6}$ алкил,  $SOC_{1-6}$ алкил,  $SO_2C_{1-6}$ алкил,  $C_{1-6}$ алкил,  $C_{1-6}$ алкокси, гетероцикл;л и карбоцикл;л;

$R^9$  выбран из водорода, гидрокс;и, галогена, циано,  $C_{1-6}$ алкила,  $C_{1-6}$ алкокси, карбоциклила и гетероциклила, где указанный  $C_{1-6}$ алкил,  $C_{1-6}$ алкокси, циклоалкил или гетероцикл;л возможно замещен одним или более заместителями, выбранными из галогена, циано, гидрокс;и или метокси;

$R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^3$  и  $R^2$  независимо выбраны из водорода, циано,  $C_{1-4}$ алкила,  $C_{1-4}$ алкокси, галогена,  $ONH_3$ ,  $OCF_3$ ,  $OCF_2H$ ,  $OCFH_2$  и гидрокс;и;

$A$  представляет собой 5-7-членный гетероарил, где по меньшей мере один из образующих кольцо атомов выбран из азота, а остальные образующие кольцо атомы выбраны из углерода, азота, серы и кислорода, и где указанный  $A$  возможно замещен одним или более заместителями, выбранными из галогена,  $C_{1-4}$ алкила,  $SR^{10}$ ,  $NR^{10}R^{11}$ ,  $OR^{10}$ ,  $C_{2-4}$ алкенила и  $C_{2-4}$ алкинила, и где указанный  $C_{1-4}$ алкил,  $C_{2-4}$ алкенил или  $C_{2-4}$ алкинил возможно замещен галогеном, гидрокс;и, циано или  $C_{1-4}$ алкокси;

$R^{10}$  и  $R^{11}$  независимо выбраны из водорода,  $C_{1-4}$ алкила,  $CF_3$ ,  $CF_2H$  и  $CFH_2$ ;

$V$  представляет собой 5-7-членное неароматическое кольцо, где один из образующих кольцо атомов выбран из  $-N(R^1)-$ ,  $-C(R^9)-$ ,  $-S(O)_n-$  или  $-O-$ , а другие образующие кольцо атомы представляют собой углерод, где одна группа  $-CH_2-$  возможно может быть заменена группой  $-C(O)-$ , и где указанное кольцо возможно замещено заместителями в количестве от одного до трех, выбранными из галогена, циано, гидрокс;и, амина,  $C_{1-4}$ алкила,  $C_{1-4}$ алкокси, групп  $NHC_{1-6}$ алкил,

$\text{NHC}_{1-6}\text{алкилOC}_{1-6}\text{алкил}$ ,  $\text{N}(\text{C}_{1-6}\text{алкил})_2$ ,  $\text{N}(\text{C}_{1-6}\text{алкилOC}_{1-6}\text{алкил})_2$ , карбоциклил и гетероциклил, где указанный  $\text{C}_{1-4}\text{алкил}$ ,  $\text{C}_{1-4}\text{алкокси}$ ,  $\text{NHC}_{1-6}\text{алкил}$ ,  $\text{NHC}_{1-6}\text{алкилOC}_{1-6}\text{алкил}$ ,  $\text{N}(\text{C}_{1-6}\text{алкил})_2$ ,  $\text{N}(\text{C}_{1-6}\text{алкилOC}_{1-6}\text{алкил})_2$ , карбоциклил или гетероциклил возможно замещен одним или более заместителями, выбранными из галогена, гидроксид или циано;

n выбран из 0, 1, 2;

E и B вместе образуют бициклическую кольцевую систему;

при условии, что исключены следующие соединения:

соединение формулы (I), где V и X представляют собой N; Y представляет собой  $\text{NR}^8$ ;  $\text{R}^8$  представляет собой водород, алкил или циклоалкил, и  $\text{R}^7$  представляет собой арилалкил, возможно замещенный группой, содержащей линкер, выбранный из O или S, и B содержит группировку  $-\text{N}(\text{R}^1)-$ , и

соединение формулы (I), где V и X представляют собой N; Y представляет собой  $\text{NR}^8$ ;  $\text{R}^8$  представляет собой водород, алкил или циклоалкил, и  $\text{R}^7$  представляет собой арилалкил, и где  $\text{R}^7$  и  $\text{R}^8$  вместе образуют кольцо, причем указанное кольцо представляет собой пиперидил, пиперазинил или морфолинил и оно возможно замещено гидроксид, оксо или группой, содержащей  $-\text{C}(\text{O})$ , а B содержит группировку  $-\text{N}(\text{R}^1)-$ ;

в виде свободного основания или его фармацевтически приемлемой соли.

3. Соединение по п.1 или 2, где X и V представляют собой азот.

4. Соединение по п.1 или 2, где W представляет собой  $\text{NR}^6$ .

5. Соединение по п.1 или 2, где Y представляет собой  $-\text{N}(\text{R}^8)-$ .

6. Соединение по п.5, где  $\text{R}^8$  и  $\text{R}^7$  образуют вместе с атомом азота частично насыщенную или ненасыщенную кольцевую систему, где указанная кольцевая система возможно замещена одной или более группами, выбранными из галогена, гидроксид, циано, групп  $\text{C}_{1-4}\text{алкилOC}_{1-4}\text{алкил}$  и  $\text{C}_{1-4}\text{алкил}$ , где указанный  $\text{C}_{1-4}\text{алкилOC}_{1-4}\text{алкил}$  или  $\text{C}_{1-4}\text{алкил}$  возможно замещен гидроксид.

7. Соединение по п.1 или 2, где  $\text{R}^2$  и  $\text{R}^4$  представляют собой водород.

8. Соединение по п.1 или 2, где  $\text{R}^3$  выбран из водорода, циано,  $\text{C}_{1-4}\text{алкила}$ , галогена и  $\text{C}_{1-4}\text{алкокси}$ .

9. Соединение по п.1 или 2, где  $\text{R}^5$  выбран из водорода, циано,  $\text{C}_{1-4}\text{алкила}$ , галогена и  $\text{C}_{1-4}\text{алкокси}$ .

10. Соединение по п.1 или 2, где A выбран из оксазолила, имидазолила, пиразолила, изоксазолила, оксадиазолила, пиридинила, пиримидинила, пиррилла, тиазолила, триазазолила и тиадиазолила.

11. Соединение по п.1 или 2, где B представляет собой неароматическое 6-членное кольцо, где один из образующих кольцо атомов представляет собой  $\text{N}(\text{R}^1)$ , а пять образующих кольцо атомов представляют собой углерод.

12. Соединение по п.1 или 2, где B представляет собой неароматическое 6-членное кольцо, где один из образующих кольцо атомов представляет собой O, а пять образующих кольцо атомов представляют собой углерод.

13. Соединение по п.1 или 2, где B представляет собой неароматическое 6-членное кольцо, где один из образующих кольцо атомов представляет собой  $\text{C}(\text{R}^9)$ , а пять образующих кольцо атомов представляют собой углерод, и где  $\text{R}^9$  выбран из водорода и  $\text{C}_{1-4}\text{алкила}$ , где указанный  $\text{C}_{1-4}\text{алкил}$  возможно замещен одним или более заместителями, выбранными из галогена.

14. Соединение по п.1 или 2, где кольцевая система, образованная E и B, выбрана из 5,6,7,8-тетрагидропиридо[4,3-d]пиримидина;

5,6,7,8-тетрагидропиридо[3,4-d]пиримидина;  
 6,7-дигидро-5Н-пирроло[3,4-d]пиримидина;  
 6,7,8,9-тетрагидро-5Н-пиримидо[4,5-d]азепина;  
 6,7,8,9-тетрагидро-5Н-пиримидо[4,5-c]азепина;  
 6,7,8,9-тетрагидро-5Н-пиримидо[5,4-c]азепина;  
 5,6,7,8-тетрагидропиридо[2,3-d]пиримидина;  
 5,6,7,8-тетрагидрохиназолина;  
 7,8-дигидро-5Н-тиопирано[4,3-d]пиримидин-6-оксида;  
 7,8-дигидро-5Н-пирано[4,3-d]пиримидина и  
 6,7-дигидро-5Н-пирроло[2,3-d]пиримидина.

15. Соединение по п.1, где

Е представляет собой



W представляет собой  $-N(R^6)-$ ;

$R^6$  представляет собой водород;

Y представляет собой  $-C(R^{12})(R^{13})-$ ,  $-N(R^8)-$  или  $-O-$ ;

$R^{12}$  и  $R^{13}$  независимо выбраны из водорода, галогена,  $C_{1-6}$ алкила, групп  $C_{1-6}$ алкилОС $_{1-6}$ алкил, карбоцикллил и гетероцикллил, где указанный  $C_{1-6}$ алкил,  $C_{1-6}$ алкилОС $_{1-6}$ алкил, карбоцикллил или гетероцикллил возможно замещен одним или более заместителями, выбранными из галогена, циано, гидрокси, гетероциклила, групп  $N(C_{0-4}$ алкил) $_2$ ,  $NC(O)C_{1-4}$ алкил;

$R^8$  выбран из водорода,  $C_{1-6}$ алкила, групп  $C_{1-6}$ алкилОС $_{1-6}$ алкил,  $C(O)C_{1-6}$ алкил,  $C(O)$ циклоалкил, гетероцикллил, карбоцикллил и  $C(O)$ гетероцикллил, где указанный  $C_{1-6}$ алкил, гетероцикллил, карбоцикллил или  $C_{1-6}$ алкилОС $_{1-6}$ алкил возможно замещен заместителями в количестве от одного до трех, выбранными из галогена, циано, гидрокси, amino, групп  $NHC_{1-4}$ алкил,  $N(C_{1-6}$ алкил) $_2$ ,  $NC(O)C_{1-6}$ алкил,  $C(O)C_{1-6}$ алкокси,  $SO_2C_{1-6}$ алкил и гетероцикллил;

$R^7$  выбран из водорода, арила, гетероарила,  $C_{1-4}$ алкиларила,  $C_{1-4}$ алкилгетероарила,  $C_{1-4}$ алкилкарбоциклила,  $C_{1-4}$ алкилгетероциклила и карбоциклила, где указанный арил, гетероарил,  $C_{1-4}$ алкилкарбоцикллил,  $C_{1-4}$ алкилгетероцикллил,  $C_{1-4}$ алкиларил, карбоцикллил или  $C_{1-4}$ алкилгетероарил возможно замещен одним или более заместителями, выбранными из галогена, циано, гидрокси, нитро,  $C_{1-6}$ алкила,  $C_{1-6}$ алкокси, карбоциклила, гетероциклила,  $CF_3$ ,  $OCF_3$ , групп  $OC_{1-6}$ алкил,  $C(O)C_{1-6}$ алкил,  $C_{1-6}$ алкилОС $_{1-6}$ алкил,  $SO_2C_{1-6}$ алкил,  $SO_2NHC_{1-6}$ алкил,  $SO_2N(C_{1-6}$ алкил) $_2$ ,  $SO_2N$ -гетероцикллил,  $C(O)NH_2$ ,  $C(O)NHC_{1-6}$ алкил,  $C(O)N(C_{1-6}$ алкил) $_2$ ,  $C(O)N$ -гетероцикллил,  $C_{2-6}$ алкенил и  $C_{2-6}$ алкинил, где указанный  $C_{1-6}$ алкил,  $C_{1-6}$ алкокси,  $C_{1-6}$ алкилОС $_{1-6}$ алкил, гетероцикллил, карбоцикллил,  $C_{2-6}$ алкенил или  $C_{2-6}$ алкинил возможно замещен циано, гидрокси, метокси, галогеном, группой  $SO_2C_{1-4}$ алкил, amino,  $NHC_{1-4}$ алкил,  $N(C_{1-4}$ алкил) $_2$ , гетероцикллил или арил;

или

$R^8$  и  $R^7$  могут, когда Y представляет собой  $NR^8$ , возможно образовывать вместе с атомом азота насыщенную, частично насыщенную или ненасыщенную кольцевую систему, где указанная кольцевая система возможно замещена одной или более группами, выбранными из галогена, гидрокси, циано, групп  $C_{1-4}$ алкилОС $_{1-4}$ алкил и  $C_{1-4}$ алкил, где указанный  $C_{1-4}$ алкилОС $_{1-4}$ алкил или  $C_{1-4}$ алкил возможно замещен галогеном, циано, гидрокси;

$R^1$  выбран из водорода,  $C_{1-6}$ алкила,  $C_{1-6}$ алкокси, карбоциклила, гетероциклила,

$C(O)R^9$ ,  $C(O)N(R^9)_2$ ,  $C(O)CH_2N(R^9)_2$ , групп  $C(O)$ гетероцикл,  $C(O)$ карбоцикл,  $C(O)OR^9$ ,  $SO_2R^9$ , где указанный  $C_{1-6}$ алкил,  $C_{1-6}$ алкокси, карбоцикл или гетероцикл возможно замещен одним или более заместителями, выбранными из галогена, гидрокси, циано, amino,  $C(O)OR^9$ , групп  $NHC_{1-6}$ алкил,  $NHC_{1-6}$ алкокси,  $N(C_{1-6}$ алкил) $_2$ ,  $N(C_{1-6}$ алкокси) $_2$ ,  $SC_{1-6}$ алкил,  $SOC_{1-6}$ алкил,  $SO_2C_{1-6}$ алкил,  $C_{1-6}$ алкил,  $C_{1-6}$ алкокси, гетероцикл и карбоцикл;

$R^9$  выбран из водорода, гидрокси, галогена, циано,  $C_{1-6}$ алкила,  $C_{1-6}$ алкокси, карбоцикла и гетероцикла, где указанный  $C_{1-6}$ алкил,  $C_{1-6}$ алкокси, циклоалкил или гетероцикл возможно замещен одним или более заместителями, выбранными из галогена, циано, гидрокси или метокси;

$R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^3$  и  $R^2$  независимо выбраны из водорода,  $C_{1-4}$ алкила,  $C_{1-4}$ алкокси, галогена и гидрокси;

A представляет собой 5-членный гетероарил, где по меньшей мере один из образующих кольцо атомов выбран из азота, а остальные образующие кольцо атомы выбраны из углерода, азота и кислорода, и где указанный A возможно замещен одним или более заместителями, выбранными из галогена или  $C_{1-4}$ алкила, и где указанный  $C_{1-4}$ алкил возможно замещен галогеном, гидрокси, циано или  $C_{1-4}$ алкокси;

B представляет собой 6-членное неароматическое кольцо, где один из образующих кольцо атомов выбран из  $-N(R^1)-$  или  $-O-$ , а другие образующие кольцо атомы представляют собой углерод, где указанное кольцо возможно замещено заместителями в количестве от одного до трех, выбранными из галогена, циано, гидрокси, amino,  $C_{1-4}$ алкила,  $C_{1-4}$ алкокси, групп  $NHC_{1-6}$ алкил,  $NHC_{1-6}$ алкил $OC_{1-6}$ алкил,  $N(C_{1-6}$ алкил) $_2$ ,  $N(C_{1-6}$ алкил $OC_{1-6}$ алкил) $_2$ , карбоцикл и гетероцикл.

16. Соединение по п.1, где

E представляет собой  где X и V представляют собой азот;

W представляет собой  $-O-$  или  $-N(R^6)-$ ;

$R^6$  представляет собой водород;

Y представляет собой  $-C(R^{12})(R^{13})-$ ,  $-N(R^8)-$  или  $-O-$ ;

$R^{12}$  и  $R^{13}$  независимо выбраны из водорода,  $C_{1-6}$ алкила, групп  $C_{1-6}$ алкил $OC_{1-6}$ алкил, где указанный  $C_{1-6}$ алкил или  $C_{1-6}$ алкил $OC_{1-6}$ алкил возможно замещен одним или более заместителями, выбранными из галогена, циано, гидрокси, гетероцикла, групп  $N(C_{0-4}$ алкил) $_2$ ,  $NC(O)C_{1-4}$ алкил;

$R^8$  выбран из водорода,  $C_{1-6}$ алкила и карбоцикла, где указанный  $C_{1-6}$ алкил возможно замещен заместителями в количестве от одного до трех, выбранными из циано, гидрокси и гетероцикла;

$R^7$  выбран из водорода, арила,  $C_{1-4}$ алкиларила,  $C_{1-4}$ алкилгетероарила,  $C_{1-4}$ алкилкарбоцикла,  $C_{1-4}$ алкилгетероцикла и карбоцикла, где указанный арил,  $C_{1-4}$ алкилкарбоцикл,  $C_{1-4}$ алкилгетероцикл,  $C_{1-4}$ алкиларил, карбоцикл или  $C_{1-4}$ алкилгетероарил возможно замещен одним или более заместителями, выбранными из гидрокси, галогена,  $C_{1-6}$ алкила, группы  $C(O)C_{1-6}$ алкил, где указанный  $C_{1-6}$ алкил возможно замещен гидрокси;

или

$R^8$  и  $R^7$  могут, когда Y представляет собой  $NR^8$ , возможно образовывать вместе с атомом азота насыщенную, частично насыщенную или ненасыщенную кольцевую



систему, где указанная кольцевая система возможно замещена одной или более группами, выбранными из групп C<sub>1-4</sub>алкилОС<sub>1-4</sub>алкил и C<sub>1-4</sub>алкил, где указанный C<sub>1-4</sub>алкилОС<sub>1-4</sub>алкил или C<sub>1-4</sub>алкил возможно замещен гидрокси;

R<sup>1</sup> выбран из водорода, C<sub>1-6</sub>алкила, C(O)R<sup>9</sup>, C(O)N(R<sup>9</sup>)<sub>2</sub>, C(O)CH<sub>2</sub>N(R<sup>9</sup>)<sub>2</sub>, C(O)OR<sup>9</sup> и SO<sub>2</sub>R<sup>9</sup>, где указанный C<sub>1-6</sub>алкил возможно замещен одним гидрокси или гетероциклилом;

R<sup>9</sup> выбран из C<sub>1-6</sub>алкила и карбоциклила, где указанный C<sub>1-6</sub>алкил возможно замещен одним или более заместителями, выбранными из галогена, циано, гидрокси или метокси;

R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>3</sup> и R<sup>2</sup> независимо выбраны из водорода и C<sub>1-4</sub>алкокси;

A представляет собой 5-членный гетероарил, где по меньшей мере один из образующих кольцо атомов выбран из азота, а остальные образующие кольцо атомы выбраны из углерода, азота и кислорода, и где указанный A возможно замещен одним или более заместителями, выбранными из галогена, C<sub>1-4</sub>алкила, SR<sup>10</sup>, NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>, OR<sup>10</sup>, C<sub>2-4</sub>алкенила и C<sub>2-4</sub>алкинила, и где указанный C<sub>1-4</sub>алкил, C<sub>2-4</sub>алкенил или C<sub>2-4</sub>алкинил возможно замещен галогеном, гидрокси, циано или C<sub>1-4</sub>алкокси;

B представляет собой 6-членное неароматическое кольцо, где один из образующих кольцо атомов выбран из -N(R<sup>1</sup>)-, -C(R<sup>9</sup>)-, -S(O)<sub>n</sub>- или -O-, а другие образующие кольцо атомы представляют собой углерод, где одна группа -CH<sub>2</sub>- возможно может быть заменена группой -C(O)-, и где указанное кольцо возможно замещено заместителями в количестве от одного до трех, выбранными из галогена, циано, гидрокси, amino, C<sub>1-4</sub>алкила, C<sub>1-4</sub>алкокси, групп NHC<sub>1-6</sub>алкил, NHC<sub>1-6</sub>алкилОС<sub>1-6</sub>алкил, N(C<sub>1-6</sub>алкил)<sub>2</sub>, N(C<sub>1-6</sub>алкилОС<sub>1-6</sub>алкил)<sub>2</sub>, карбоциклил и гетероциклил, где указанный C<sub>1-4</sub>алкил, C<sub>1-4</sub>алкокси, NHC<sub>1-6</sub>алкил, NHC<sub>1-6</sub>алкилОС<sub>1-6</sub>алкил, N(C<sub>1-6</sub>алкил)<sub>2</sub>, N(C<sub>1-6</sub>алкилОС<sub>1-6</sub>алкил)<sub>2</sub>, карбоциклил или гетероциклил возможно замещен одним или более заместителями, выбранными из галогена, гидрокси и циано;

n равно 1.

17. Соединение по п.16, где

E представляет собой  где X и V представляют собой азот;

W представляет собой -O- или -N(R<sup>6</sup>)-;

R<sup>6</sup> представляет собой водород;

Y представляет собой -C(R<sup>12</sup>)(R<sup>13</sup>)-, -N(R<sup>8</sup>)- или -O-;

R<sup>12</sup> и R<sup>13</sup> независимо выбраны из водорода, C<sub>1-4</sub>алкила, C<sub>1-4</sub>алкилалкокси;

R<sup>8</sup> выбран из водорода, C<sub>1-6</sub>алкила и карбоциклила, где указанный C<sub>1-6</sub>алкил возможно замещен заместителями в количестве от одного до трех, выбранными из циано, гидрокси и гетероциклила;

R<sup>7</sup> выбран из водорода, арила, C<sub>1-4</sub>алкиларила, C<sub>1-4</sub>алкилгетероарила, C<sub>1-4</sub>алкилкарбоциклила, C<sub>1-4</sub>алкилгетероциклила и карбоциклила, где указанный арил, C<sub>1-4</sub>алкилкарбоциклил, C<sub>1-4</sub>алкилгетероциклил, C<sub>1-4</sub>алкиларил, карбоциклил или C<sub>1-4</sub>алкилгетероарил возможно замещен одним или более заместителями, выбранными из гидрокси, галогена, C<sub>1-6</sub>алкила, группы C(O)C<sub>1-6</sub>алкил, где указанный C<sub>1-6</sub>алкил возможно замещен гидрокси;

или

R<sup>8</sup> и R<sup>7</sup> могут, когда Y представляет собой NR<sup>8</sup>, возможно образовывать вместе с атомом азота насыщенную, частично насыщенную или ненасыщенную кольцевую

систему, где указанная кольцевая система возможно замещена одной или более группами, выбранными из групп C<sub>1-4</sub>алкилОС<sub>1-4</sub>алкил и C<sub>1-4</sub>алкил, где указанный C<sub>1-4</sub>алкилОС<sub>1-4</sub>алкил или C<sub>1-4</sub>алкил возможно замещен гидроксидом;

R<sup>1</sup> выбран из водорода, C<sub>1-6</sub>алкила, C(O)R<sup>9</sup>, C(O)N(R<sup>9</sup>)<sub>2</sub>, C(O)CH<sub>2</sub>N(R<sup>9</sup>)<sub>2</sub>, C(O)OR<sup>9</sup> и SO<sub>2</sub>R<sup>9</sup>, где указанный C<sub>1-6</sub>алкил возможно замещен одним гидроксидом или гетероциклом;

R<sup>9</sup> выбран из C<sub>1-6</sub>алкила и карбоцикла, где указанный C<sub>1-6</sub>алкил возможно замещен одним или более заместителями, выбранными из гидроксидом или метокси;

R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>3</sup> и R<sup>2</sup> независимо выбраны из водорода и C<sub>1-4</sub>алкокси;

R<sup>14</sup> представляет собой водород или C<sub>1-4</sub>алкил, где указанный C<sub>1-4</sub>алкил возможно замещен одним или более заместителями, выбранными из галогена;

A представляет собой 5-членный гетероарил, где по меньшей мере один из образующих кольцо атомов выбран из азота, а остальные образующие кольцо атомы выбраны из углерода, азота и кислорода, и где указанный A возможно замещен одним C<sub>1-4</sub>алкилом,

B представляет собой 6-членное неароматическое кольцо, где один из образующих кольцо атомов выбран из -N(R<sup>1</sup>)-, -O-, -S(O)-, -C(R<sup>14</sup>)-, а другие образующие кольцо атомы представляют собой углерод, и где указанное кольцо возможно замещено заместителями в количестве от одного до трех, выбранными из C<sub>1-4</sub>алкила.

18. Соединение по п.1, где

E представляет собой  где X и V представляют собой азот;

W представляет собой -O- или -N(R<sup>6</sup>)-;

R<sup>6</sup> представляет собой водород;

Y представляет собой -C(R<sup>12</sup>)(R<sup>13</sup>)-, -N(R<sup>8</sup>)- или -O-;

R<sup>12</sup> и R<sup>13</sup> представляют собой водород;

R<sup>8</sup> выбран из водорода, C<sub>1-6</sub>алкила и карбоцикла, где указанный C<sub>1-6</sub>алкил возможно замещен заместителями в количестве от одного до трех, выбранными из циано, гидроксидом и гетероцикла;

R<sup>7</sup> выбран из водорода, арила, C<sub>1-4</sub>алкиларила, C<sub>1-4</sub>алкилгетероарила, C<sub>1-4</sub>алкилгетероцикла и карбоцикла, где указанный арил, C<sub>1-4</sub>алкиларил или карбоцикл возможно замещен одним заместителем, выбранным из гидроксидом, C<sub>1-6</sub>алкила и группы C(O)C<sub>1-6</sub>алкил, где указанный C<sub>1-6</sub>алкил возможно замещен гидроксидом;

или

R<sup>8</sup> и R<sup>7</sup> могут, когда Y представляет собой NR<sup>8</sup>, возможно образовывать вместе с атомом азота насыщенную, частично насыщенную или ненасыщенную кольцевую систему, где указанная кольцевая система возможно замещена одной или более группами, выбранными из C<sub>1-4</sub>алкила, где указанный C<sub>1-4</sub>алкил возможно замещен гидроксидом;

R<sup>1</sup> выбран из водорода, C<sub>1-6</sub>алкила, C(O)R<sup>9</sup>, C(O)N(R<sup>9</sup>)<sub>2</sub>, C(O)CH<sub>2</sub>N(R<sup>9</sup>)<sub>2</sub>, C(O)OR<sup>9</sup> и SO<sub>2</sub>R<sup>9</sup>, где указанный C<sub>1-6</sub>алкил возможно замещен одним гидроксидом или гетероциклом;

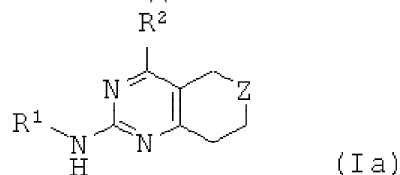
R<sup>9</sup> представляет собой C<sub>1-6</sub>алкил или карбоцикл, где указанный C<sub>1-6</sub>алкил возможно замещен одним заместителем, выбранным из гидроксидом или метокси;

R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>3</sup> и R<sup>2</sup> независимо выбраны из водорода и C<sub>1-4</sub>алкокси;

А представляет собой 5-членный гетероарил, где по меньшей мере один из образующих кольцо атомов выбран из азота, а остальные образующие кольцо атомы выбраны из углерода, азота и кислорода, и где указанный А возможно замещен одним C<sub>1-4</sub>алкилом,

В представляет собой 6-членное неароматическое кольцо, где один из образующих кольцо атомов выбран из -O- или -N(R<sup>1</sup>)-, а другие образующие кольцо атомы представляют собой углерод.

19. Соединение или соль по п.1 формулы (Ia)



где R<sup>1</sup> выбран из фенила, замещенного в пара-положении гетероарильной группой, и где эти фенильная группа и гетероарильная группа возможно и независимо замещены группами R' в количестве от одной до трех;

R<sup>2</sup> представляет собой Y-R<sup>7</sup>;

Y представляет собой -C(R<sup>12</sup>)(R<sup>13</sup>)-, -N(R<sup>8</sup>)-, -O-, -C(R<sup>12</sup>)(R<sup>13</sup>)-N(R<sup>8</sup>)-, -N(R<sup>8</sup>)-C(R<sup>12</sup>)(R<sup>13</sup>)-, -C(R<sup>12</sup>)(R<sup>13</sup>)-O- или -O-C(R<sup>12</sup>)(R<sup>13</sup>)-;

R' выбран из галогена, C<sub>1-6</sub>алкила, галогенированного C<sub>1-6</sub>алкила, C<sub>1-6</sub>алкокси, галогенированного C<sub>1-6</sub>алкокси;

R<sup>8</sup> выбран из водорода, C<sub>1-6</sub>алкила, галогенированного C<sub>1-6</sub>алкила и C<sub>3-6</sub>карбоциклила, где указанный C<sub>1-6</sub>алкил возможно замещен заместителями в количестве от одного до трех, выбранными из циано, гидрокси и гетероциклила;

R<sup>7</sup> выбран из водорода, арила, гетероарила, C<sub>1-4</sub>алкиларила, C<sub>1-4</sub>алкилгетероарила, C<sub>1-4</sub>алкилгетероциклила, галогенированного C<sub>1-6</sub>алкила, C<sub>1-6</sub>алкила и C<sub>3-6</sub>карбоциклила, где указанный арил, гетероарил, C<sub>1-6</sub>алкил или карбоциклил возможно и независимо замещены в количестве от одной до трех группами R', фторо, гидрокси, алкокси, циано, гидроксильный или C(O)C<sub>1-6</sub>алкил, где указанный C<sub>1-6</sub>алкил возможно замещен гидрокси; или

R<sup>8</sup> и R<sup>7</sup> могут, когда Y представляет собой NR<sup>8</sup>, возможно образовывать вместе с атомом азота насыщенную, частично насыщенную или ненасыщенную кольцевую систему, где указанная кольцевая система возможно и независимо замещена группами R' в количестве от одной до трех;

R<sup>12</sup> и R<sup>13</sup> независимо выбраны из C<sub>1-4</sub>алкила, галогенированного C<sub>1-4</sub>алкила, C<sub>1-4</sub>алкокси, галогенированного C<sub>1-4</sub>алкокси;

Z выбран из CH-(R<sup>3a</sup>), N-(R<sup>3b</sup>), O, S, S(O) и S(O)<sub>2</sub>;

R<sup>3a</sup> выбран из C<sub>1-6</sub>алкила и галогенированного C<sub>1-6</sub>алкила; и

R<sup>3b</sup> выбран из водорода; C<sub>1-6</sub>алкила; C<sub>1-6</sub>алкила, замещенного циано; галогенированного C<sub>1-6</sub>алкила; C<sub>1-6</sub>алканоила; C<sub>1-6</sub>алканоила, замещенного гидрокси; C<sub>1-6</sub>алканоила; замещенного диалкиламино; C<sub>1-6</sub>алканоила, замещенного C<sub>1-6</sub>алкокси; групп C<sub>3-6</sub>карбоциклил-карбонил, (C<sub>1-6</sub>алкил)<sub>2</sub>карбамоил, C<sub>1-6</sub>алкилсульфонил и C<sub>1-6</sub>алкоксикарбонил,

при условии, что исключены следующие соединения:

соединение формулы (Ia), где Y представляет собой NR<sup>8</sup>; Z представляет собой N-(R<sup>3b</sup>), R<sup>8</sup> представляет собой водород, алкил или циклоалкил, и R<sup>7</sup> представляет собой арилалкил.

20. Соединение или соль по п.19, где  $R^1$  выбран из фенила, замещенного в параположении гетероарильной группой, и где эта фенильная группа и эта гетероарильная группа возможно и независимо замещены группами  $R'$  в количестве от одной до трех;

$R^2$  представляет собой  $Y-R^7$ ;

$Y$  представляет собой  $-C(R^{12})(R^{13})-$ ,  $-N(R^8)-$ ,  $-C(R^{12})(R^{13})-N(R^8)-$ ,  $-N(R^8)-C(R^{12})(R^{13})-$ ,  $-C(R^{12})(R^{13})-O-$  или  $-O-C(R^{12})(R^{13})-$ ;

$R'$  выбран из галогена,  $C_{1-6}$ алкила, галогенированного  $C_{1-6}$ алкила,  $C_{1-6}$ алкокси, галогенированного  $C_{1-6}$ алкокси;

$R^8$  выбран из водорода,  $C_{1-6}$ алкила, галогенированного  $C_{1-6}$ алкила и  $C_{3-6}$ карбоциклила, где указанный  $C_{1-6}$ алкил возможно замещен заместителями в количестве от одного до трех, выбранными из циано, гидрокси и гетероциклила;

$R^7$  выбран из водорода, арила, гетероарила, групп  $C_{1-4}$ алкиларил,  $C_{1-4}$ алкилгетероарил,  $C_{1-4}$ алкилгетероциклил,  $C_{1-6}$ алкил, галогенированный  $C_{1-6}$ алкил и  $C_{3-6}$ карбоциклил, где указанный арил, гетероарил,  $C_{1-6}$ алкил или карбоциклил возможно и независимо замещен в количестве от одной до трех группами  $R'$ , фторо, гидрокси, алкокси, циано, гидроксиалкил или  $C(O)C_{1-6}$ алкил, где указанный  $C_{1-6}$ алкил возможно замещен гидрокси;

или

$R^8$  и  $R^7$  могут, когда  $Y$  представляет собой  $NR^8$ , возможно образовывать вместе с атомом азота насыщенную, частично насыщенную или ненасыщенную кольцевую систему, где указанная кольцевая система возможно и независимо замещена группами  $R'$  в количестве от одной до трех;

$R^{12}$  и  $R^{13}$  независимо выбраны из  $C_{1-4}$ алкила, галогенированного  $C_{1-4}$ алкила,  $C_{1-4}$ алкокси, галогенированного  $C_{1-4}$ алкокси;

$Z$  выбран из  $CH-(R^{3a})$ ,  $N-(R^{3b})$ ,  $O$ ,  $S$ ,  $S(O)$  и  $S(O)_2$ ;

$R^{3a}$  выбран из  $C_{1-6}$ алкила и галогенированного  $C_{1-6}$ алкила; и

$R^{3b}$  выбран из водорода;  $C_{1-6}$ алкила;  $C_{1-6}$ алкила, замещенного циано;  $C_{1-6}$ алканоила;  $C_{1-6}$ алканоила, замещенного гидрокси;  $C_{1-6}$ алканоила, замещенного amino;  $C_{1-6}$ алканоила, замещенного  $C_{1-6}$ алкокси; групп  $C_{3-6}$ карбоциклил-карбонил,  $(C_{1-6}алкил)_2$ карбамоил,  $C_{1-6}$ алкилсульфонил и  $C_{1-6}$ алкоксикарбонил;

при условии, что исключены следующие соединения:

соединение формулы (Ia), где  $Y$  представляет собой  $NR^8$ ,  $Z$  представляет собой  $N-(R^{3b})$ ,  $R^8$  представляет собой водород, алкил или циклоалкил, и  $R^7$  представляет собой арилалкил.

21. Соединение или соль по п.19, где  $R^1$  выбран из фенила, замещенного в параположении гетероарильной группой, и эта фенильная группа дополнительно возможно замещена группой  $C_{1-4}$ алкокси или галогенированной группой  $C_{1-4}$ алкокси, а эта гетероарильная группа возможно замещена  $C_{1-4}$ алкильной группой или галогенированной  $C_{1-4}$ алкильной группой;

$R^2$  представляет собой  $Y-R^7$ ;

$Y$  представляет собой  $-C(R^{12})(R^{13})-$  или  $C(R^{12})(R^{13})-O-$ ;

$R^7$  выбран из водорода, арила, гетероарила, групп  $C_1$ алкиларил,  $C_1$ алкилгетероарил,  $C_1$ алкилгетероциклил,  $C_{1-6}$ алкил, галогенированный  $C_{1-6}$ алкил и  $C_{3-6}$ карбоциклил, где указанный арил, гетероарил,  $C_{1-4}$ алкиларил,  $C_{1-6}$ алкил, галогенированный  $C_{1-6}$ алкил или карбоциклил возможно замещен одним

заместителем, выбранным из гидроксид, алкокси, циано, C<sub>1-6</sub>алкила, галогенированного C<sub>1-6</sub>алкила и группы C(O)C<sub>1-6</sub>алкил, где указанный C<sub>1-6</sub>алкил возможно замещен гидроксид;

R<sup>12</sup> и R<sup>13</sup> независимо выбраны из C<sub>1-4</sub>алкила, галогенированного C<sub>1-4</sub>алкила, C<sub>1-4</sub>алкокси, галогенированного C<sub>1-4</sub>алкокси;

Z выбран из CH-(R<sup>3a</sup>), N-(R<sup>3b</sup>) и O;

R<sup>3a</sup> выбран из C<sub>1-6</sub>алкила и галогенированного C<sub>1-6</sub>алкила; и

R<sup>3b</sup> выбран из водорода; C<sub>1-6</sub>алкила; C<sub>1-6</sub>алкила, замещенного циано; C<sub>1-6</sub>алканоила; C<sub>1-6</sub>алканоила, замещенного гидроксид; C<sub>1-6</sub>алканоила, замещенного амина; C<sub>1-6</sub>алканоила, замещенного C<sub>1-6</sub>алкокси; групп C<sub>3-6</sub>карбоцикл-карбонил, (C<sub>1-6</sub>алкил)<sub>2</sub>карбамоил, C<sub>1-6</sub>алкилсульфонил и C<sub>1-6</sub>алкоксикарбонил.

22. Соединение или соль по п.19, где R<sup>1</sup> выбран из групп 3-метокси-4-(4-метилимидазол-1-ил)фенил, 4-(1-метилпиразол-4-ил)фенил, 4-(2-метилимидазол-1-ил)фенил или 4-оксазол-5-илфенил;

R<sup>2</sup> выбран из групп [2-фтор-1-(фторметил)этокси]метил, (2-фторфенил)метил, (2-гидрокси-2-фенил-этил)-метил-амино, (2R)-2-(гидроксиметил)индолин-1-ил, (2S)-2-(гидроксиметил)индолин-1-ил, (3-ацетил-фенил)амино, (3-метоксифенил)метил, (4-фторфенил)метил, (4-фторфенил)-метил-амино, [(2R)-норборнан-2-ил]амино, [(2R)-тетрагидрофуран-2-ил]метиламино, [(2S)-тетрагидрофуран-2-ил]метиламино, [1-(гидроксиметил)циклопентил]амино, [2-(гидроксиметил)фенил]метил-метил-амино, [3-(гидроксиметил)фенил]амино, 1-(3,5-диметилпиразол-1-ил)этил, 1-гидрокси-1-метил-этил, 1-фенилэтил, 2-(2-оксопирролидин-1-ил)этил, 2-(3-фторфенил)этил, 2-(гидроксиметил)-1-пиперидил, 2-цианоэтил-циклопропил-амино, 2-циклогексилэтил, 2-гидроксиэтил-фенил-амино, 2-тетрагидрофуран-2-илэтил, 3-(гидроксиметил)-1-пиперидил, 4,4-дифтор-1-пиперидил, бензил, бензил-(2-гидроксиэтил)амино, бензиламино, бензилокси, циклогексиламино, циклогексил-метил-амино, циклопентоксиметил, циклопентилметил, этил-(тетрагидрофуран-2-илметил)амино, индолин-1-ил, метокси-фенил-метил, метил-(2-пиридилметил)амино, метил-(3-пиридилметил)амино, п-толилметил, тетрагидропиран-4-илметил и тетрагидропиран-4-илметиламино;

Z выбран из CH-(R<sup>3a</sup>), N-(R<sup>3b</sup>) и O;

R<sup>3a</sup> представляет собой трифторметил; и

R<sup>3b</sup> выбран из водорода, групп (2S)-2-гидроксипропаноил, 2-диметиламиноацетил, 2-гидроксиацетил, 2-гидроксиэтил, 2-метоксиацетил, ацетил, цианометил, циклопропанкарбонил, диметилкарбамоил, этоксикарбонил, этилсульфонил, метоксикарбонил, метил, метилсульфонил, пропаноил и пропил.

23. Соединение или соль по п.19, где R<sup>1</sup> выбран из групп 3-метокси-4-(4-метилимидазол-1-ил)фенил, 4-(1-метилпиразол-4-ил)фенил, 4-(2-метилимидазол-1-ил)фенил или 4-оксазол-5-илфенил;

R<sup>2</sup> выбран из групп [2-фтор-1-(фторметил)этокси]метил, (2-фторфенил)метил, (2-гидрокси-2-фенил-этил)-метил-амино, (2R)-2-(гидроксиметил)индолин-1-ил, (2S)-2-(гидроксиметил)индолин-1-ил, (3-ацетил-фенил)амино, (3-метоксифенил)метил, (4-фторфенил)метил, (4-фторфенил)-метил-амино, [(2R)-норборнан-2-ил]амино, [(2R)-тетрагидрофуран-2-ил]метиламино, [(2S)-тетрагидрофуран-2-ил]метиламино, [1-(гидроксиметил)циклопентил]амино, [2-(гидроксиметил)фенил]метил-метил-амино, [3-(гидроксиметил)фенил]амино, 1-(3,5-диметилпиразол-1-ил)этил, 1-гидрокси-1-метил-этил, 1-фенилэтил, 2-(2-оксопирролидин-1-ил)этил, 2-(3-фторфенил)этил, 2-(гидроксиметил)-1-пиперидил, 2-цианоэтил-циклопропил-амино, 2-циклогексилэтил, 2-

гидроксиэтил-фенил-амино, 2-тетрагидрофуран-2-илэтил, 3-(гидроксиметил)-1-пиперидил, 4,4-дифтор-1-пиперидил, бензил, бензил-(2-гидроксиэтил)амино, бензиламино, бензилокси, циклогексиламино, циклогексил-метил-амино, циклопентоксиметил, циклопентилметил, этил-(тетрагидрофуран-2-илметил)амино, индолин-1-ил, метокси-фенил-метил, метил-(2-пиридилметил)амино, метил-(3-пиридилметил)амино, п-толилметил, тетрагидропиран-4-илметил и тетрагидропиран-4-илметиламино;

Z выбран из  $\text{CH-R}^{3a}$ ,  $\text{N-R}^{3b}$ , O и S;

$\text{R}^{3a}$  представляет собой трифторметил; и

$\text{R}^{3b}$  выбран из водорода, групп (2S)-2-гидроксипропаноил, 2-диметиламиноацетил, 2-гидроксиацетил, 2-гидроксиэтил, 2-метоксиацетил, ацетил, цианометил, циклопропанкарбонил, диметилкарбамоил, этоксикарбонил, этилсульфонил, метоксикарбонил, метил, метилсульфонил, пропаноил и пропил.

24. Соединение, выбранное из

2-((2-(4-(оксазол-5-ил)фениламино)-5,6,7,8-тетрагидропиридо[4,3-d]пиримидин-4-ил)(фенил)амино)этанола;

2-((6-метил-2-(4-(оксазол-5-ил)фениламино)-5,6,7,8-тетрагидропиридо[4,3-d]пиримидин-4-ил)(фенил)амино)этанола;

N2-(4-(оксазол-5-ил)фенил)-N4-фенил-5,6,7,8-тетрагидропиридо[4,3-d]пиримидин-2,4-диамина;

6-метил-N2-(4-(оксазол-5-ил)фенил)-N4-фенил-5,6,7,8-тетрагидропиридо[4,3-d]пиримидин-2,4-диамина;

N4-бензил-N2-(4-(оксазол-5-ил)фенил)-5,6,7,8-тетрагидропиридо[3,4-d]пиримидин-2,4-диамина;

N4-бензил-N2-(4-(оксазол-5-ил)фенил)-5,6,7,8-тетрагидропиридо[4,3-d]пиримидин-2,4-диамина;

N2-(3-метокси-4-(4-метил-1H-имидазол-1-ил)фенил)-N4-фенил-5,6,7,8-тетрагидропиридо[4,3-d]пиримидин-2,4-диамина;

2-(2-(3-метокси-4-(4-метил-1H-имидазол-1-ил)фениламино)-4-(фениламино)-7,8-дигидропиридо[4,3-d]пиримидин-6(5H)-ил)этанола;

(S)-(1-(6-метил-2-(4-(2-метил-1H-имидазол-1-ил)фениламино)-5,6,7,8-тетрагидропиридо[4,3-d]пиримидин-4-ил)индолин-2-ил)метанола;

N4-((2R)-бицикло[2.2.1]гептан-2-ил)-6-метил-N2-(4-(2-метил-1H-имидазол-1-ил)фенил)-5,6,7,8-тетрагидропиридо[4,3-d]пиримидин-2,4-диамина;

N4-циклогексил-N4,6-диметил-N2-(4-(2-метил-1H-имидазол-1-ил)фенил)-5,6,7,8-тетрагидропиридо[4,3-d]пиримидин-2,4-диамина;

4-(бензилокси)-N-(4-(оксазол-5-ил)фенил)-5,6,7,8-тетрагидропиридо[4,3-d]пиримидин-2-амина;

(R)-(1-(6-метил-2-(4-(2-метил-1H-имидазол-1-ил)фениламино)-5,6,7,8-тетрагидропиридо[4,3-d]пиримидин-4-ил)индолин-2-ил)метанола;

2-((2-(4-(оксазол-5-ил)фениламино)-6-пропил-5,6,7,8-тетрагидропиридо[4,3-d]пиримидин-4-ил)(фенил)амино)этанола;

1-(4-((2-гидроксиэтил)(фенил)амино)-2-(4-(оксазол-5-ил)фениламино)-7,8-дигидропиридо[4,3-d]пиримидин-6(5H)-ил)пропанI-она;

циклопропил(4-((2-гидроксиэтил)(фенил)амино)-2-(4-(оксазол-5-ил)фениламино)-7,8-дигидропиридо[4,3-d]пиримидин-6(5H)-ил)метанола;

2-(диметиламино)-1-(4-((2-гидроксиэтил)(фенил)амино)-2-(4-(оксазол-5-ил)фениламино)-7,8-дигидропиридо[4,3-d]пиримидин-6(5H)-ил)этанола;

1-(4-((2-гидроксиэтил)(фенил)амино)-2-(4-(оксазол-5-ил)фениламино)-7,8-

- дигидропиридо[4,3-d]пиримидин-6(5Н)-ил)-2-метоксиэтанона;  
 2-гидрокси-1-(4-((2-гидроксиэтил)(фенил)амино)-2-(4-(оксазол-5-ил)фениламино)-7,8-дигидропиридо[4,3-d]пиримидин-6(5Н)-ил)этанона;  
 (S)-2-гидрокси-1-(4-((2-гидроксиэтил)(фенил)амино)-2-(4-(оксазол-5-ил)фениламино)-7,8-дигидропиридо[4,3-d]пиримидин-6(5Н)-ил)пропан-1-она;  
 2-((6-(метилсульфонил)-2-(4-(оксазол-5-ил)фениламино)-5,6,7,8-тетрагидропиридо[4,3-d]пиримидин-4-ил)(фенил)амино)этанол;  
 2-((6-(этилсульфонил)-2-(4-(оксазол-5-ил)фениламино)-5,6,7,8-тетрагидропиридо[4,3-d]пиримидин-4-ил)(фенил)амино)этанол;  
 метил-4-((2-гидроксиэтил)(фенил)амино)-2-(4-(оксазол-5-ил)фениламино)-7,8-дигидропиридо[4,3-d]пиримидин-6(5Н)-карбоксилата;  
 этил-4-((2-гидроксиэтил)(фенил)амино)-2-(4-(оксазол-5-ил)фениламино)-7,8-дигидропиридо[4,3-d]пиримидин-6(5Н)-карбоксилата;  
 4-((2-гидроксиэтил)(фенил)амино)-N,N-диметил-2-(4-(оксазол-5-ил)фениламино)-7,8-дигидропиридо[4,3-d]пиримидин-6(5Н)-карбоксамид;  
 1-(4-(циклогексиламино)-2-(4-(оксазол-5-ил)фениламино)-7,8-дигидропиридо[4,3-d]пиримидин-6(5Н)-ил)этанона;  
 (S)-1-(2-(4-(оксазол-5-ил)фениламино)-4-((тетрагидрофуран-2-ил)метиламино)-7,8-дигидропиридо[4,3-d]пиримидин-6(5Н)-ил)этанона;  
 1-(4-((2-гидроксиэтил)(фенил)амино)-2-(4-(оксазол-5-ил)фениламино)-7,8-дигидропиридо[4,3-d]пиримидин-6(5Н)-ил)этанона;  
 1-(4-(3-(гидроксиметил)фениламино)-2-(4-(оксазол-5-ил)фениламино)-7,8-дигидропиридо[4,3-d]пиримидин-6(5Н)-ил)этанона;  
 (S)-1-(4-(2-(гидроксиметил)индолин-1-ил)-2-(4-(оксазол-5-ил)фениламино)-7,8-дигидропиридо[4,3-d]пиримидин-6(5Н)-ил)этанона;  
 3-((6-ацетил-2-(4-(оксазол-5-ил)фениламино)-5,6,7,8-тетрагидропиридо[4,3-d]пиримидин-4-ил)(циклопропил)амино)пропаннитрила;  
 1-(4-(бензил(2-гидроксиэтил)амино)-2-(4-(оксазол-5-ил)фениламино)-7,8-дигидропиридо[4,3-d]пиримидин-6(5Н)-ил)этанона;  
 1-(3-(6-ацетил-2-(4-(оксазол-5-ил)фениламино)-5,6,7,8-тетрагидропиридо[4,3-d]пиримидин-4-иламино)фенил)этанона;  
 1-(4-((2-гидрокси-2-фенилэтил)(метил)амино)-2-(4-(оксазол-5-ил)фениламино)-7,8-дигидропиридо[4,3-d]пиримидин-6(5Н)-ил)этанона;  
 1-(4-(1-(гидроксиметил)циклопентиламино)-2-(4-(оксазол-5-ил)фениламино)-7,8-дигидропиридо[4,3-d]пиримидин-6(5Н)-ил)этанона;  
 1-(4-(метил(пиримидин-3-илметил)амино)-2-(4-(оксазол-5-ил)фениламино)-7,8-дигидропиридо[4,3-d]пиримидин-6(5Н)-ил)этанона;  
 (R)-1-(4-(2-(гидроксиметил)индолин-1-ил)-2-(4-(оксазол-5-ил)фениламино)-7,8-дигидропиридо[4,3-d]пиримидин-6(5Н)-ил)этанона;  
 2-((6-метил-2-(4-(1-метил-1Н-пиразол-4-ил)фениламино)-5,6,7,8-тетрагидропиридо[4,3-d]пиримидин-4-ил)(фенил)амино)этанол;  
 2-((2-(4-(1-метил-1Н-пиразол-4-ил)фениламино)-6-пропил-5,6,7,8-тетрагидропиридо[4,3-d]пиримидин-4-ил)(фенил)амино)этанол;  
 2-(4-бензил-2-(4-(2-метил-1Н-имидазол-1-ил)фениламино)-7,8-дигидропиридо[4,3-d]пиримидин-6(5Н)-ил)этанол;  
 4-бензил-6-метил-N-(4-(2-метил-1Н-имидазол-1-ил)фенил)-5,6,7,8-тетрагидропиридо[4,3-d]пиримидин-2-амин;  
 4-бензил-N-(3-метокси-4-(4-метил-1Н-имидазол-1-ил)фенил)-7,8-дигидро-5Н-пирано[4,3-d]пиримидин-2-амин;  
 4-(4-фторбензил)-N-[3-метокси-4-(4-метил-1Н-имидазол-1-ил)фенил]-7,8-дигидро-5Н-

тиопирано[4,3-d]пиримидин-2-амин-6-оксида;

4-бензил-N-(4-(2-метил-1H-имидазол-1-ил)фенил)-7,8-дигидро-5H-пирано[4,3-d]пиримидин-2-амин-6-оксида;

N-(4-(2-метил-1H-имидазол-1-ил)фенил)-4-((тетрагидро-2H-пиран-4-ил)метил)-7,8-дигидро-5H-тиопирано[4,3-d]пиримидин-2-амин-6-оксида;

2-(4-(2-циклогексилэтил)-2-(4-(2-метил-1H-имидазол-1-ил)фениламино)-7,8-дигидропиридо[4,3-d]пиримидин-6(5H)-ил)этанол-1-ол;

2-(2-(4-(2-метил-1H-имидазол-1-ил)фениламино)-4-(4-метилбензил)-7,8-дигидропиридо[4,3-d]пиримидин-6(5H)-ил)этанол-1-ол;

2-(4-(3-фторфенетил)-2-(4-(2-метил-1H-имидазол-1-ил)фениламино)-7,8-дигидропиридо[4,3-d]пиримидин-6(5H)-ил)этанол-1-ол;

6-метил-N-(4-(2-метил-1H-имидазол-1-ил)фенил)-4-(4-метилбензил)-5,6,7,8-тетрагидропиридо[4,3-d]пиримидин-2-амин-6-оксида;

4-(3-фторфенетил)-6-метил-N-(4-(2-метил-1H-имидазол-1-ил)фенил)-5,6,7,8-тетрагидропиридо[4,3-d]пиримидин-2-амин-6-оксида;

4-(2-фторбензил)-6-метил-N-(4-(2-метил-1H-имидазол-1-ил)фенил)-5,6,7,8-тетрагидропиридо[4,3-d]пиримидин-2-амин-6-оксида;

4-(3-метоксибензил)-6-метил-N-(4-(2-метил-1H-имидазол-1-ил)фенил)-5,6,7,8-тетрагидропиридо[4,3-d]пиримидин-2-амин-6-оксида;

4-(2-циклогексилэтил)-6-метил-N-(4-(2-метил-1H-имидазол-1-ил)фенил)-5,6,7,8-тетрагидропиридо[4,3-d]пиримидин-2-амин-6-оксида;

4-(циклопентилметил)-6-метил-N-(4-(2-метил-1H-имидазол-1-ил)фенил)-5,6,7,8-тетрагидропиридо[4,3-d]пиримидин-2-амин-6-оксида;

2-(4-(2-фторбензил)-2-(4-(2-метил-1H-имидазол-1-ил)фениламино)-7,8-дигидропиридо[4,3-d]пиримидин-6(5H)-ил)этанол-1-ол;

2-(4-(3-метоксибензил)-2-(4-(2-метил-1H-имидазол-1-ил)фениламино)-7,8-дигидропиридо[4,3-d]пиримидин-6(5H)-ил)этанол-1-ол;

1-(4-(2-циклогексилэтил)-2-(4-(2-метил-1H-имидазол-1-ил)фениламино)-7,8-дигидропиридо[4,3-d]пиримидин-6(5H)-ил)этанол-1-ол;

1-(2-(4-(2-метил-1H-имидазол-1-ил)фениламино)-4-(4-метилбензил)-7,8-дигидропиридо[4,3-d]пиримидин-6(5H)-ил)этанол-1-ол;

1-(4-(3-фторфенетил)-2-(4-(2-метил-1H-имидазол-1-ил)фениламино)-7,8-дигидропиридо[4,3-d]пиримидин-6(5H)-ил)этанол-1-ол;

6-метил-N-(4-(2-метил-1H-имидазол-1-ил)фенил)-4-((тетрагидро-2H-пиран-4-ил)метил)-5,6,7,8-тетрагидропиридо[4,3-d]пиримидин-2-амин-6-оксида;

2-(2-(4-(2-метил-1H-имидазол-1-ил)фениламино)-4-((тетрагидро-2H-пиран-4-ил)метил)-7,8-дигидропиридо[4,3-d]пиримидин-6(5H)-ил)этанол-1-ол;

1-(2-(4-(2-метил-1H-имидазол-1-ил)фениламино)-4-((тетрагидро-2H-пиран-4-ил)метил)-7,8-дигидропиридо[4,3-d]пиримидин-6(5H)-ил)этанол-1-ол;

4-(4-фторбензил)-N-[4-(2-метил-1H-имидазол-1-ил)фенил]-7,8-дигидро-5H-тиопирано[4,3-d]пиримидин-2-амин-6-оксида;

4-(метокси(фенил)метил)-N-(4-(2-метил-1H-имидазол-1-ил)фенил)-7,8-дигидро-5H-пирано[4,3-d]пиримидин-2-амин-6-оксида;

4-[метокси(фенил)метил]-N-[4-(2-метил-1H-имидазол-1-ил)фенил]-7,8-дигидро-5H-тиопирано[4,3-d]пиримидин-2-амин-6,6-диоксида;

N-(4-(2-метил-1H-имидазол-1-ил)фенил)-4-((тетрагидро-2H-пиран-4-ил)метил)-7,8-дигидро-5H-пирано[4,3-d]пиримидин-2-амин-6-оксида;

4-бензил-N-(3-метокси-4-(4-метил-1H-имидазол-1-ил)фенил)-6-метил-5,6,7,8-тетрагидропиридо[4,3-d]пиримидин-2-амин-6-оксида;

N4-циклогексил-6-метил-N2-(4-(2-метил-1H-имидазол-1-ил)фенил)-5,6,7,8-



- тетрагидропиридо[4,3-d]пиримидин-2,4-диамина;  
6-метил-N-(4-(2-метил-1H-имидазол-1-ил)фенил)-4-(1-фенилэтил)-5,6,7,8-тетрагидропиридо[4,3-d]пиримидин-2-амина;  
6-метил-N-(4-(2-метил-1H-имидазол-1-ил)фенил)-4-(1-фенилэтил)-5,6,7,8-тетрагидропиридо[4,3-d]пиримидин-2-амина;  
(S)-(1-(6-метил-2-(метил(4-(2-метил-1H-имидазол-1-ил)фенил)амино)-5,6,7,8-тетрагидропиридо[4,3-d]пиримидин-4-ил)индолин-2-ил)метанола;  
(S)-6-метил-N2-(4-(2-метил-1H-имидазол-1-ил)фенил)-N4-((тетрагидрофуран-2-ил)метил)-5,6,7,8-тетрагидропиридо[4,3-d]пиримидин-2,4-диамина;  
(R)-6-метил-N2-(4-(2-метил-1H-имидазол-1-ил)фенил)-N4-((тетрагидрофуран-2-ил)метил)-5,6,7,8-тетрагидропиридо[4,3-d]пиримидин-2,4-диамина;  
2-(4-бензил-2-(3-метокси-4-(4-метил-1H-имидазол-1-ил)фениламино)-7,8-дигидропиридо[4,3-d]пиримидин-6(5H)-ил)этанолола;  
2-(бензил(6-метил-2-(4-(2-метил-1H-имидазол-1-ил)фениламино)-5,6,7,8-тетрагидропиридо[4,3-d]пиримидин-4-ил)амино)этанолола;  
2-(4-(этил((тетрагидрофуран-2-ил)метил)амино)-2-(4-(2-метил-1H-имидазол-1-ил)фениламино)-7,8-дигидропиридо[4,3-d]пиримидин-6(5H)-ил)этанолола;  
3-(циклопропил(6-метил-2-(4-(2-метил-1H-имидазол-1-ил)фениламино)-5,6,7,8-тетрагидропиридо[4,3-d]пиримидин-4-ил)амино)пропаннитрила;  
6-метил-N2-(4-(2-метил-1H-имидазол-1-ил)фенил)-N4-((тетрагидро-2H-пиран-4-ил)метил)-5,6,7,8-тетрагидропиридо[4,3-d]пиримидин-2,4-диамина;  
(R)-2-(2-(4-(оксазол-5-ил)фениламино)-4-((тетрагидрофуран-2-ил)метиламино)-7,8-дигидропиридо[4,3-d]пиримидин-6(5H)-ил)этанолола;  
2-(4-(этил((тетрагидрофуран-2-ил)метил)амино)-2-(4-(оксазол-5-ил)фениламино)-7,8-дигидропиридо[4,3-d]пиримидин-6(5H)-ил)этанолола;  
N4-этил-6-метил-N2-(4-(оксазол-5-ил)фенил)-N4-((тетрагидрофуран-2-ил)метил)-5,6,7,8-тетрагидропиридо[4,3-d]пиримидин-2,4-диамина;  
(S)-6-метил-N2-(4-(оксазол-5-ил)фенил)-N4-((тетрагидрофуран-2-ил)метил)-5,6,7,8-тетрагидропиридо[4,3-d]пиримидин-2,4-диамина;  
(R)-6-метил-N2-(4-(оксазол-5-ил)фенил)-N4-((тетрагидрофуран-2-ил)метил)-5,6,7,8-тетрагидропиридо[4,3-d]пиримидин-2,4-диамина;  
6-метил-N2-(4-(оксазол-5-ил)фенил)-N4-((тетрагидро-2H-пиран-4-ил)метил)-5,6,7,8-тетрагидропиридо[4,3-d]пиримидин-2,4-диамина;  
2-(2-(4-(оксазол-5-ил)фениламино)-4-((тетрагидро-2H-пиран-4-ил)метиламино)-7,8-дигидропиридо[4,3-d]пиримидин-6(5H)-ил)этанолола;  
4-метил-N-(4-(2-метил-1H-имидазол-1-ил)фенил)-6-(1-фенилэтил)пиримидин-2-амина;  
1-(4-(циклогексил(метил)амино)-2-(4-(оксазол-5-ил)фениламино)-7,8-дигидропиридо[4,3-d]пиримидин-6(5H)-ил)этанона;  
1-(4-((4-фторфенил)(метил)амино)-2-(4-(оксазол-5-ил)фениламино)-7,8-дигидропиридо[4,3-d]пиримидин-6(5H)-ил)этанона;  
1-(4-(индолин-1-ил)-2-(4-(оксазол-5-ил)фениламино)-7,8-дигидропиридо[4,3-d]пиримидин-6(5H)-ил)этанона;  
1-(4-((2-(гидроксиметил)бензил)(метил)амино)-2-(4-(оксазол-5-ил)фениламино)-7,8-дигидропиридо[4,3-d]пиримидин-6(5H)-ил)этанона;  
1-(4-(метил(пиридин-2-илметил)амино)-2-(4-(оксазол-5-ил)фениламино)-7,8-дигидропиридо[4,3-d]пиримидин-6(5H)-ил)этанона;  
1-(4-(3-(гидроксиметил)пиперидин-1-ил)-2-(4-(оксазол-5-ил)фениламино)-7,8-дигидропиридо[4,3-d]пиримидин-6(5H)-ил)этанона;  
1-(4-(2-(гидроксиметил)пиперидин-1-ил)-2-(4-(оксазол-5-ил)фениламино)-7,8-дигидропиридо[4,3-d]пиримидин-6(5H)-ил)этанона;

N-(3-метокси-4-(4-метил-1H-имидазол-1-ил)фенил)-4-(3-метоксибензил)-6-метил-5,6,7,8-тетрагидропиридо[4,3-d]пиримидин-2-амина;

1-(2-(3-метокси-4-(4-метил-1H-имидазол-1-ил)фениламино)-4-(3-метоксибензил)-7,8-дигидропиридо[4,3-d]пиримидин-6(5H)-ил)этанона;

1-(4-(3-метоксибензил)-2-(4-(2-метил-1H-имидазол-1-ил)фениламино)-7,8-дигидропиридо[4,3-d]пиримидин-6(5H)-ил)этанона;

1-(4-(2-фторбензил)-2-(4-(2-метил-1H-имидазол-1-ил)фениламино)-7,8-дигидропиридо[4,3-d]пиримидин-6(5H)-ил)этанона;

4-(4-фторбензил)-N-(4-(2-метил-1H-имидазол-1-ил)фенил)-6-(трифторметил)-5,6,7,8-тетрагидрохиназолин-2-амина;

N-(3-метокси-4-(4-метил-1H-имидазол-1-ил)фенил)-4-(3-метоксибензил)-7,8-дигидро-5H-пирано[4,3-d]пиримидин-2-амина;

4-(метокси(фенил)метил)-N-(3-метокси-4-(4-метил-1H-имидазол-1-ил)фенил)-7,8-дигидро-5H-пирано[4,3-d]пиримидин-2-амина;

N-(3-метокси-4-(4-метил-1H-имидазол-1-ил)фенил)-4-(2-(тетрагидрофуран-2-ил)этил)-7,8-дигидро-5H-пирано[4,3-d]пиримидин-2-амина;

2-(2-(3-метокси-4-(4-метил-1H-имидазол-1-ил)фениламино)-7,8-дигидро-5H-пирано[4,3-d]пиримидин-4-ил)пропан-2-ола;

4-(1-(3,5-диметил-1H-пиразол-1-ил)этил)-N-(3-метокси-4-(4-метил-1H-имидазол-1-ил)фенил)-7,8-дигидро-5H-пирано[4,3-d]пиримидин-2-амина;

2-(4-бензил-2-(3-метокси-4-(4-метил-1H-имидазол-1-ил)фениламино)-7,8-дигидропиридо[4,3-d]пиримидин-6(5H)-ил)ацетонитрила;

4-бензил-N-(3-метокси-4-(4-метил-1H-имидазол-1-ил)фенил)-5,6,7,8-тетрагидропиридо[4,3-d]пиримидин-2-амина;

1-(4-бензил-2-(3-метокси-4-(4-метил-1H-имидазол-1-ил)фениламино)-7,8-дигидропиридо[4,3-d]пиримидин-6(5H)-ил)этанона;

1-(4-(1-(3,5-диметил-1H-пиразол-1-ил)этил)-2-(3-метокси-4-(4-метил-1H-имидазол-1-ил)фениламино)-7,8-дигидропиридо[4,3-d]пиримидин-6(5H)-ил)этанона;

4-(циклопентилоксиметил)-N-(3-метокси-4-(4-метил-1H-имидазол-1-ил)фенил)-7,8-дигидро-5H-пирано[4,3-d]пиримидин-2-амина;

1-(2-(2-(3-метокси-4-(4-метил-1H-имидазол-1-ил)фениламино)-7,8-дигидро-5H-пирано[4,3-d]пиримидин-4-ил)этил)пирролидин-2-она;

1-(2-(3-метокси-4-(4-метил-1H-имидазол-1-ил)фениламино)-4-(2-(тетрагидрофуран-2-ил)этил)-7,8-дигидропиридо[4,3-d]пиримидин-6(5H)-ил)этанона;

N-(3-метокси-4-(4-метил-1H-имидазол-1-ил)фенил)-6-метил-4-(2-(тетрагидрофуран-2-ил)этил)-5,6,7,8-тетрагидропиридо[4,3-d]пиримидин-2-амина;

4-((1,3-дифторпропан-2-илокси)метил)-N-(3-метокси-4-(4-метил-1H-имидазол-1-ил)фенил)-7,8-дигидро-5H-пирано[4,3-d]пиримидин-2-амина и

4-бензил-N-[4-(2-метил-1H-имидазол-1-ил)фенил]-7,8-дигидро-5H-тиопирано[4,3-d]пиримидин-2-амин-6-оксида;

в виде свободного основания или его фармацевтически приемлемой соли.

25. Фармацевтическая композиция, содержащая в качестве активного ингредиента терапевтически эффективное количество соединения по любому из пп.1-24 или его фармацевтически приемлемой соли вместе с фармацевтически приемлемыми эксципиентами, носителями или разбавителями.

26. Соединение по любому из пп.1, 2 или 24 или его фармацевтически приемлемая соль для применения в качестве лекарственного средства.

27. Соединение по любому из пп.1, 2 или 24 или его фармацевтически приемлемая соль для применения в лечении или предупреждении  $\text{A}\beta$ -ассоциированной патологии.

28. Способ лечения или предупреждения  $\text{A}\beta$ -ассоциированной патологии у

млекопитающего, включающий введение указанному пациенту терапевтически эффективного количества соединения по любому из пп.1-24 или его фармацевтически приемлемой соли.

29. Способ лечения или предупреждения A $\beta$ -ассоциированной патологии у млекопитающего, включающий введение указанному пациенту терапевтически эффективного количества соединения по любому из пп.1-24 и по меньшей мере одного агента, усиливающего когнитивные функции, агента, улучшающего память, ингибитора ацетилхолинэстеразы, противовоспалительных агентов или атипичных антипсихотических агентов.

30. Способ по п.28 или 29, где указанная A $\beta$ -ассоциированная патология представляет собой синдром Дауна,  $\beta$ -амилоидную ангиопатию, церебральную амилоидную ангиопатию, наследственную церебральную геморрагию, расстройство, ассоциированное с когнитивным нарушением, MCI ("умеренное когнитивное нарушение"), болезнь Альцгеймера, потерю памяти, симптомы дефицита внимания, ассоциированные с болезнью Альцгеймера, нейродегенерацию, ассоциированную с болезнью Альцгеймера, деменцию смешанного сосудистого происхождения, деменцию дегенеративного происхождения, предсенильную деменцию, сенильную деменцию и деменцию, ассоциированную с болезнью Паркинсона, прогрессирующий супрануклеарный паралич или кортикобазальную дегенерацию.

A  
7  
4  
4  
9  
1  
1  
1  
1  
0  
2  
RU

RU  
2  
0  
1  
1  
1  
1  
6  
4  
4  
7  
A