



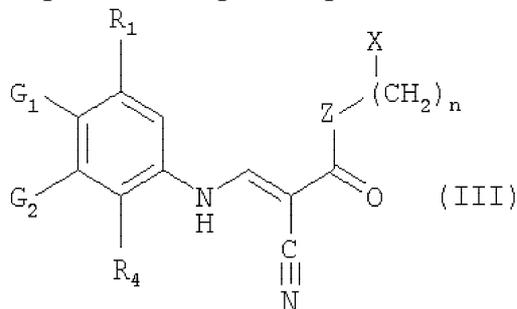
ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ,
ПАТЕНТАМ И ТОВАРНЫМ ЗНАКАМ

(12) **ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ**(21), (22) Заявка: **2007139544/04, 27.04.2006**(30) Конвенционный приоритет:
25.05.2005 US 60/684,683(43) Дата публикации заявки: **27.06.2009** Бюл. № 18(85) Дата перевода заявки РСТ на национальную
фазу: **25.12.2007**(86) Заявка РСТ:
US 2006/016019 (27.04.2006)(87) Публикация РСТ:
WO 2006/127205 (30.11.2006)

Адрес для переписки:
**190068, Санкт-Петербург, ул. Садовая, 51,
офис 303, ООО "ПАТЕНТИКА", пат.пов.
М.И.Ниловой**

(71) Заявитель(и):
ВАЙЕТ (US)(72) Автор(ы):
**ЧУ Варен (СА),
ПАПАМИЧЕЛАКИС Мария (СА)**(54) **СПОСОБ ПОЛУЧЕНИЯ 3-ЦИАНОХИНОЛИНОВ И ПРОМЕЖУТОЧНЫЕ СОЕДИНЕНИЯ,
ПОЛУЧЕННЫЕ СОГЛАСНО ДАННОМУ СПОСОБУ**(57) **Формула изобретения**

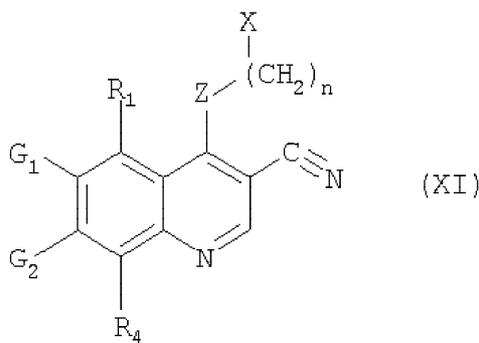
1. Способ получения замещенного 3-цианохинолина, включающий стадию
обработки N-арил-2-пронена общей формулы III:



POCl₃ с образованием 3-цианохинолина общей формулы XI:

A
4
4
5
6
3
1
7
0
0
2
RU

RU
2
0
0
7
1
3
9
5
4
4
A



где X представляет собой бициклический арил или бициклический гетероарил, содержащий от 8 до 12 атомов, где бициклический гетероарил содержит от 1 до 4 гетероатомов, выбранных из N, O и S, при условии, что указанный бициклический гетероарил не содержит связей O-O, S-S или S-O, и где указанные бициклический арил или бициклический гетероарил могут содержать один, два, три или четыре заместителя, выбранных из группы, включающей галоген, оксо, тию, алкил, содержащий 1-6 атомов углерода, алкенил с 2-6 атомами углерода, алкинил с 2-6 атомами углерода, азидо, гидроксиалкил с 1-6 атомами углерода, галогенметил, алкоксиметил с 2-7 атомами углерода, алканоилоксиметил с 2-7 атомами углерода, алкокси с 1-6 атомами углерода, алкилтио с 1-6 атомами углерода, гидрокси, трифторметил, циано, нитро, карбокси, карбоалкокси с 2-7 атомами углерода, карбоалкил с 2-7 атомами углерода, фенокси, фенил, тиофенокси, бензоил, бензил, amino, алкиламино с 1-6 атомами углерода, диалкиламино с 2-12 атомами углерода, фениламино, бензиламино, алканоиламино с 1-6 атомами углерода, алкеноиламино с 3-8 атомами углерода, алкиноиламино с 3-8 атомами углерода, карбоксиалкил с 2-7 атомами углерода, карбоалкоксиалкил с 3-8 атомами углерода, аминоалкил с 1-5 атомами углерода, N-алкиламиноалкил с 2-9 атомами углерода, N,N-диалкиламиноалкил с 3-10 атомами углерода, N-алкиламиноалкокси с 2-9 атомами углерода, N,N-диалкиламиноалкокси с 3-10 атомами углерода, меркапто и бензоиламино или;

X представляет собой циклоалкил, содержащий от 3 до 7 атомов углерода, который может содержать один или более алкильный заместитель, содержащий от 1 до 6 атомов углерода, или X представляет собой пиридинил, пиримидинил или фенил; при этом указанные пиридинил, пиримидинил или фенил могут содержать один, два или три заместителя, выбранных из группы, включающей галоген, алкил, содержащий от 1 до 6 атомов углерода, алкенил с 2-6 атомами углерода, алкинил с 2-6 атомами углерода, азидо, гидроксиалкил с 1-6 атомами углерода, галогенметил, алкоксиметил с 2-7 атомами углерода, алканоилоксиметил с 2-7 атомами углерода, алкокси с 1-6 атомами углерода, алкилтио с 1-6 атомами углерода, гидрокси, трифторметил, циано, нитро, карбокси, карбоалкокси с 2-7 атомами углерода, карбоалкил с 2-7 атомами углерода, фенокси, фенил, тиофенокси, бензоил, бензил, amino, алкиламино с 1-6 атомами углерода, диалкиламино с 2-12 атомами углерода, фениламино, бензиламино, алканоиламино с 1-6 атомами углерода, алкеноиламино с 3-8 атомами углерода, алкиноиламино с 3-8 атомами углерода и бензоиламино;

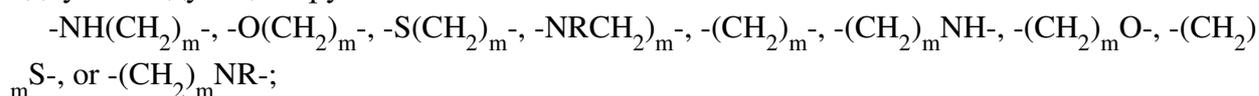
или

X представляет собой радикал формулы A-T-L

где A представляет собой пиридинил, пиримидинил или фенил; при этом указанные пиридинил, пиримидинил или фенил могут содержать один или два заместителя, выбранных из группы, включающей галоген, алкил, содержащий от 1 до 6 атомов углерода, алкенил с 2-6 атомами углерода, алкинил с 2-6 атомами углерода, азидо, гидроксиалкил с 1-6 атомами углерода, галогенметил, алкоксиметил с 2-7 атомами

углерода, алканоилоксиметил с 2-7 атомами углерода, алкокси с 1-6 атомами углерода, алкилтио с 1-6 атомами углерода, гидроксид, трифторметил, циано, нитро, карбокси, карбоалкокси с 2-7 атомами углерода, карбоалкил с 2-7 атомами углерода, фенокси, фенил, тиофенокси, бензоил, бензил, amino, алкиламино с 1-6 атомами углерода, диалкиламино с 2-12 атомами углерода, фениламино, бензиламино, алканоиламино с 1-6 атомами углерода, алкеноиламино с 3-8 атомами углерода, алкиноиламино с 3-8 атомами углерода, карбоксиалкил с 2-7 атомами углерода, карбоалкоксиалкил с 3-8 атомами углерода, аминоалкил с 1-5 атомами углерода, N-алкиламиноалкил с 2-9 атомами углерода, N,N-диалкиламиноалкил с 3-10 атомами углерода, N-алкиламиноалкокси с 2-9 атомами углерода, N,N-диалкиламиноалкокси с 3-10 атомами углерода, меркапто и бензоиламино;

T связан с атомом углерода, входящим в состав группы A и представляет собой одну из следующих групп:



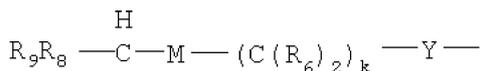
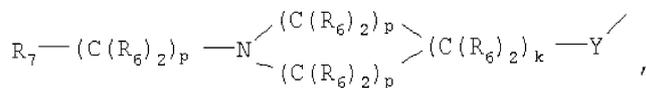
L представляет собой незамещенное фенильное кольцо или фенильное кольцо, содержащее один, два или три заместителя, выбранных из группы, включающей галоген, алкил с 1-6 атомами углерода, алкенил с 2-6 атомами углерода, алкинил с 2-6 атомами углерода, азидо, гидроксид, алкил с 1-6 атомами углерода, галогенметил, алкоксиметил с 2-7 атомами углерода, алканоилоксиметил с 2-7 атомами углерода, алкокси с 1-6 атомами углерода, алкилтио с 1-6 атомами углерода, гидроксид, трифторметил, циано, нитро, карбокси, карбоалкокси с числом атомов углерода 2-7, карбоалкил с 2-7 атомами углерода, фенокси, фенил, тиофенокси, бензоил, бензил, amino, алкиламино с 1-6 атомами углерода, диалкиламино с 2-12 атомами углерода, фениламино, бензиламино, алканоиламино с 1-6 атомами углерода, алкеноиламино с 3-8 атомами углерода, алкиноиламино с 3-8 атомами углерода, карбоксиалкил с 2-7 атомами углерода, карбоалкоксиалкил с 3-8 атомами углерода, аминоалкил с 1-5 атомами углерода, N-алкиламиноалкил с 2-9 атомами углерода, N,N-диалкиламиноалкил с 3-10 атомами углерода, N-алкиламиноалкокси с 2-9 атомами углерода, N,N-диалкиламиноалкокси с 3-10 атомами углерода, меркапто и бензоиламино; при условии, что L может представлять собой незамещенное фенильное кольцо только в случае, когда $m > 0$, а T не является $\text{CH}_2\text{NH}-$ или $-\text{CH}_2\text{O}-$; или

L представляет собой 5- или 6-членный гетероарил, содержащий от 1 до 3 гетероатомов, выбранных из N, O и S, при условии, что указанный гетероарил не содержит связей O-O, S-S или S-O, и где указанный гетероарил может содержать один или два заместителя, выбранных из группы, включающей галоген, оксо, тио, алкил с 1-6 атомами углерода, алкенил с 2-6 атомами углерода, алкинил с 2-6 атомами углерода, азидо, гидроксид, алкил с 1-6 атомами углерода, галогенметил, алкоксиметил с 2-7 атомами углерода, алканоилоксиметил с 2-7 атомами углерода, алкокси с 1-6 атомами углерода, алкилтио с 1-6 атомами углерода, гидроксид, трифторметил, циано, нитро, карбокси, карбоалкокси с 2-7 атомами углерода, карбоалкил с 2-7 атомами углерода, фенокси, фенил, тиофенокси, бензоил, бензил, amino, алкиламино с 1-6 атомами углерода, диалкиламино с 2-12 атомами углерода, фениламино, бензиламино, алканоиламино с 1-6 атомами углерода, алкеноиламино с 3-8 атомами углерода, алкиноиламино с 3-8 атомами углерода, карбоксиалкил с 2-7 атомами углерода, карбоалкоксиалкил с 3-8 атомами углерода, аминоалкил с 1-5 атомами углерода, N-алкиламиноалкил с 2-9 атомами углерода, N,N-диалкиламиноалкил с 3-10 атомами углерода, N-алкиламиноалкокси с 2-9 атомами углерода, N,N-диалкиламиноалкокси с 3-10 атомами углерода, меркапто и бензоиламино;

Z представляет собой -NH-, -O-, -S-, или -NR-;

R представляет собой алкил, содержащий от 1 до 6 атомов углерода или карбоалкил, содержащий от 2 до 7 атомов углерода;

Каждый из G_1 , G_2 , R_1 , и R_4 независимо представляет собой водород, галоген, алкил с 1-6 атомами углерода, алкенил с 2-6 атомами углерода, алкинил с 2-6 атомами углерода, алкенилокси с 2-6 атомами углерода, алкинилокси с 2-6 атомами углерода, гидроксиметил, галогенметил, алканоилокси с 1-6 атомами углерода, алкеноилокси с 3-8 атомами углерода, алкиноилокси с 3-8 атомами углерода, алканоилоксиметил с 2-7 атомами углерода, алкеноилоксиметил с 4-9 атомами углерода, алкиноилоксиметил с 4-9 атомами углерода, алкоксиметил с 2-7 атомами углерода, алкокси с 1-6 атомами углерода, алкилтио с 1-6 атомами углерода, алкилсульфинил с 1-6 атомами углерода, алкилсульфонил с 1-6 атомами углерода, алкилсульфонамидо с 1-6 атомами углерода, алкенилсульфонамидо с 2-6 атомами углерода, алкинилсульфонамидо с 2-6 атомами углерода, гидрокси, трифторметил, трифторметокси, циано, нитро, карбокси, карбоалкокси с 2-7 атомами углерода, карбоалкил с 2-7 атомами углерода, фенокси, фталимид, фенил, тиофенокси, бензил, amino, гидроксамино, алкоксиамино с 1-4 атомами углерода, алкиламино с 1-6 атомами углерода, диалкиламино с 2-12 атомами углерода, N-алкилкарбамоил, N,N-диалкилкарбамоил, N-алкил-N-алкениламино с 4-12 атомами углерода, N,N-диалкениламино с 6-12 атомами углерода, фениламино, бензиламино,



$R_7 - (C(R_6)_2)_g - Y -$, $R_7 - (C(R_6)_2)_p - M - (C(R_6)_2)_k - Y -$, или $Het - (C(R_6)_2)_q - W - (C(R_6)_2)_k - Y -$; или G_1 , и/или G_2 независимо могут быть выбраны из группы, включающей защищенную аминогруппу или $R_2 - NH -$;

или, если любые из заместителей R_1 , G_1 , G_2 , или R_4 расположены у соседних атомов углерода, то они могут совместно представлять собой двухвалентный радикал $-O - C(R_6)_2 - O -$;

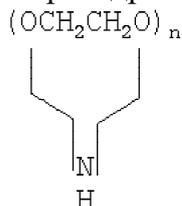
Y представляет собой двухвалентный радикал, выбранный из группы, включающей $-(CH_2)_a -$, $-O -$, и $\begin{matrix} R_6 \\ -N - \end{matrix}$;

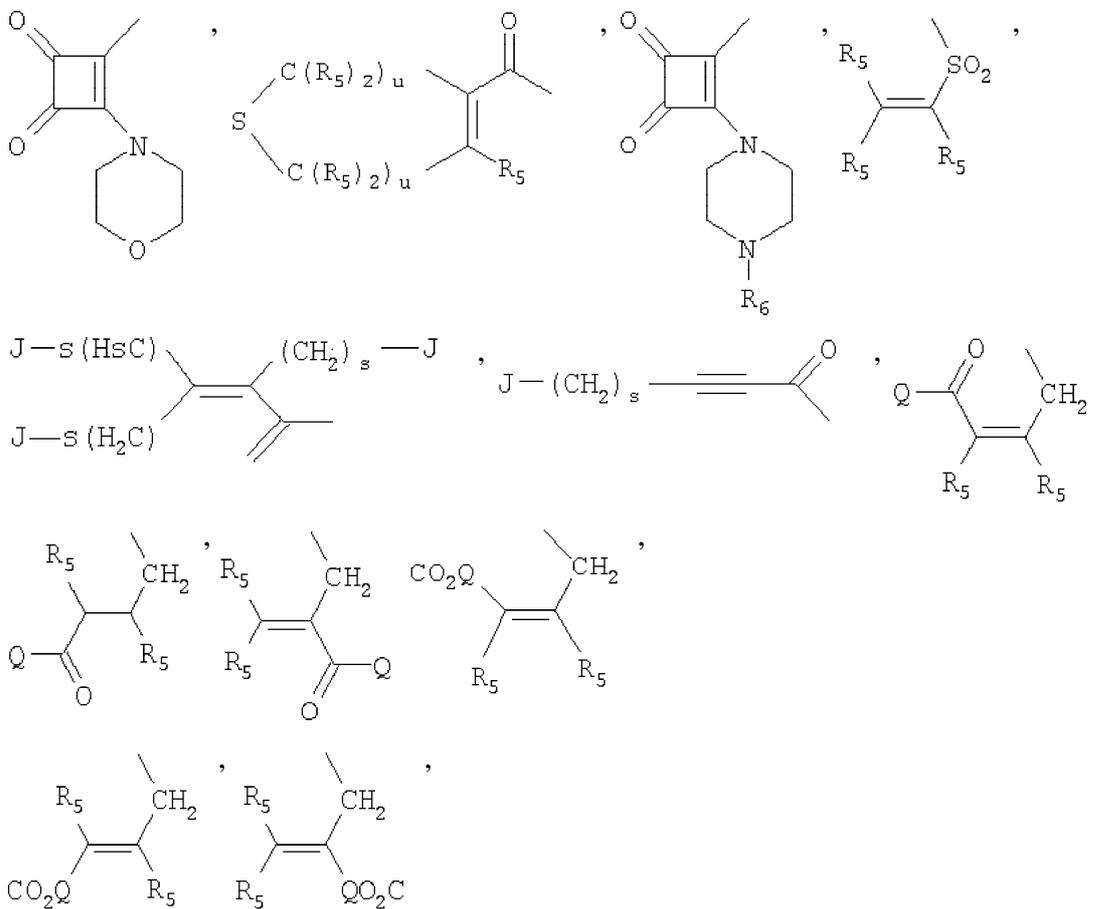
R_7 представляет собой $-NR_6 R_7$, $-OR_6$, $-J$, $-N(R_6)_3^+$, или $-NR_7(OR_6)$;

M представляет собой $>NR_6$, $-O -$, $>N - (C(R_6)_2)_p NR_6 R_6$, или $>N - (C(R_6)_2)_p - OR_6$;

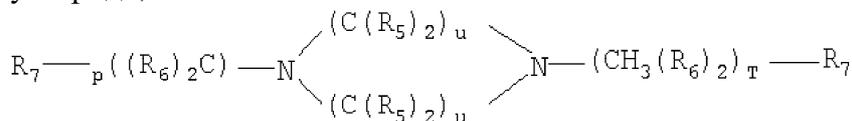
W представляет собой $>NR_6$, $-O -$ или связь;

Het выбран из группы, включающей морфолин, тиоморфолин, тиоморфолин S-оксид, тиоморфолин S,S-диоксид, пиперидин, пирролидин, азиридин, пиридин, имидазол, 1,2,3-триазол, 1,2,4-триазол, тиазол, тиазолидин, тетразол, пиперазин, фуран, тиофен, тетрагидротиофен, тетрагидрофуран, диоксан, 1,3-диоксолан, тетрагидропиран и



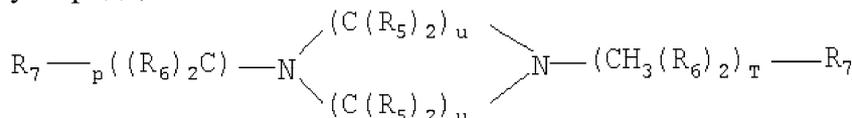


R^3 представляет собой независимо водород, алкил с 1-6 атомами углерода, карбокси, карбоалкокси с 1-6 атомами углерода, фенил, карбоалкил с 2-7 атомами углерода,



$R_7-(C(R_6)_2)_s-$, $R_7-(C(R_6)_2)_p-M-(C(R_7)_2)_r-$, $R_8R_9-CH-M-(C(R_6)_2)_r-$, или $Het-(C(R_6)_2)_q-W-(C(R_6)_2)_r-$; аминоалкил с 1-6 атомами углерода, N-алкиламиноалкил с 2-9 атомами углерода, N,N-диалкиламиноалкил с 3-12 атомами углерода, N-циклоалкиламиноалкил с 4-12 атомами углерода, N-циклоалкил-N-алкиламиноалкил с 5-18 атомами углерода, N,N-дициклоалкиламиноалкил с 7-18 атомами углерода, морфолино-N-алкил, где алкильная группа содержит от 1 до 6 атомов углерода, пиперидино-N-алкил, где алкильная группа содержит от 1 до 6 атомов углерода, N-алкилпиперидино-N-алкил, где каждая из алкильных групп содержит от 1 до 6 атомов углерода;

R_5 представляет собой независимо водород, алкил с 1-6 атомами углерода, карбокси, карбоалкокси с 1-6 атомами углерода, фенил, карбоалкил с 2-7 атомами углерода,



$R_7-(C(R_6)_2)_s-$, $R_7-(C(R_6)_2)_p-M-(C(R_6)_2)_r-$, $R_8R_9-CH-M-(C(R_6)_2)_r-$, или $Het-(C(R_6)_2)_q-W-(C(R_6)_2)_r-$;

Каждый из R_8 , и R_9 независимо представляет собой $-(C(R_6)_2)_rNR_6R_6$, или $-(C(R_6)_2)_rOR_6$;

J представляет собой независимо водород, атом хлора, фтора или бром;

Q представляет собой алкил, содержащий от 1 до 6 атомов углерода или водород;

a=0 или 1;

g=1-6;

k=0-4;

n=0-1;

m=0-3;

p=2-4;

q=0-4;

r=1-4;

s=1-6;

u=0-4 и v=0-4, где сумма u+v составляет от 2 до 4;

или фармацевтически приемлемая соль указанного соединения, при условии, что:

если R₆ представляет собой алкенил с 2-7 атомами углерода или алкинил с 2

атомами углерода, то указанные алкенильный или алкинидный фрагменты связан с атомом кислорода или азота через насыщенный атом углерода;

если Y представляет собой -NR₆- и R₇ представляет собой -NR₆R₆-N(R₆)₃⁺, или NR₆(OR₆), то g=2-6;

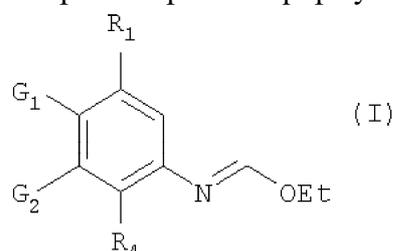
если M представляет собой -O- и R₇ представляет собой -OR₆, то p=1-4;

если Y представляет собой -NR₆-, то k=2-4;

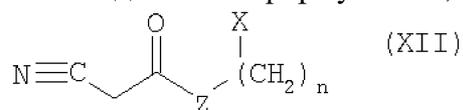
если Y представляет собой -O- и M или W представляет собой -O-, то k=1-4;

если W не является связью в случае, когда Het связан с W через атом азота, то q=2-4, и если W представляет собой связь в случае, когда Het связан с W через атом азота и Y представляет собой -O- или -NR₆-, то k=2-4.

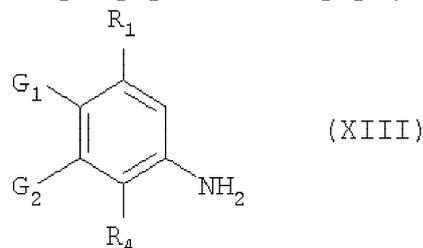
2. Способ по п.1, дополнительно включающий стадию образования N-арил-2-пропена формулы III путем конденсации N-арилформимидата формулы I:



с соединением формулы XII, содержащим активные метиленовые группы:

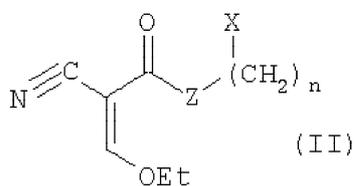


3. Способ по п.2, дополнительно включающий стадию образования указанного N-арилформимидата формулы I путем взаимодействия ариламина формулы XIII:

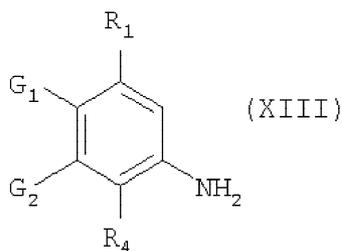


СSH(OEt)₃.

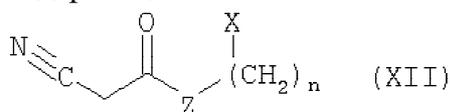
4. Способ по п.1, дополнительно включающий стадию образования указанного N-арил-2-пропена формулы III путем взаимодействия производного алкоксиметилена формулы II:



с ариламином формулы XIII:



5. Способ по п.4, дополнительно включающий стадию образования алкоксиметилена формулы II путем конденсации соединения формулы XII, содержащего активные метиленовые группы:



с $\text{CH}(\text{OEt})_3$.

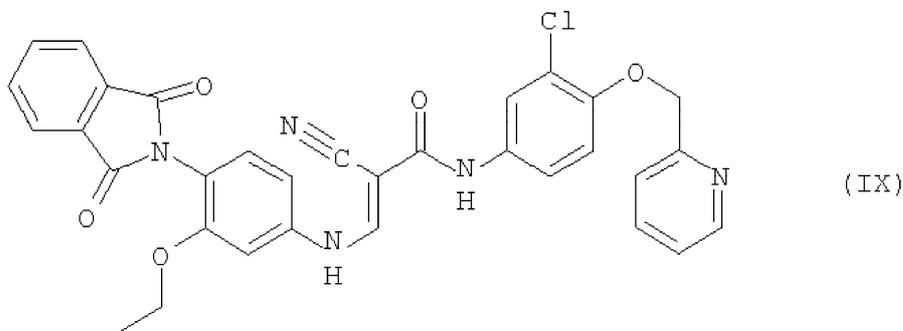
6. Способ по любому из пп.1-4 или 5, отличающийся тем, что Z выбран из группы, включающей NH, O и S.

7. Способ по любому из пп.1-4 или 5, отличающийся тем, что G_1 представляет собой защищенную аминогруппу, выбранную из следующих групп: ацетамиды, бензамиды, циклические имиды, пирролы, трет-бутоксикарбониламин и бензилоксикарбониламид.

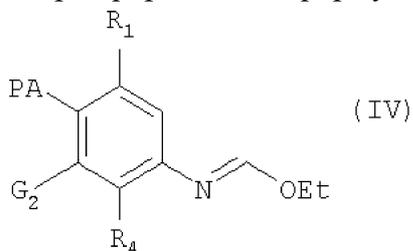
8. Способ по п.7, отличающийся тем, что G_1 представляет собой фталимидную группу.

9. Способ по любому из пп.1-4 или 5, отличающийся тем, что X представляет собой циклоалкил, содержащий от 3 до 7 атомов углерода, который может содержать в качестве заместителей одну или более алкильную группу, содержащую от 1 до 6 атомов углерода, или X представляет собой пиридинил, пиримидинил или фенил, при этом указанные пиридинил, пиримидинил или фенил могут содержать один, два или три заместителя, выбранных из группы, включающей галоген, алкил с 1-6 атомами углерода, алкенил с 2-6 атомами углерода, алкинил с 2-6 атомами углерода, азидо, гидроксиалкил с 1-6 атомами углерода, галогенметил, алкоксиметил с 2-7 атомами углерода, алканоилоксиметил с 2-7 атомами углерода, алкокси с 1-6 атомами углерода, алкилтио с 1-6 атомами углерода, гидрокси, трифторметил, циано, нитро, карбокси, карбоалкокси с 2-7 атомами углерода, карбоалкил с 2-7 атомами углерода, фенокси, фенил, тиофенокси, бензоил, бензил, amino, алкиламино с 1-6 атомами углерода, диалкиламино с 2-12 атомами углерода, фениламино, бензиламино, алканоиламино с 1-6 атомами углерода, алкеноиламино с 3-8 атомами углерода, алкиноиламино с 3-8 атомами углерода и бензоиламино.

10. Способ по любому из пп.1-4 или 5, отличающийся тем, что указанный N-арил-2-пропен формулы III представляет собой соединение формулы IX:

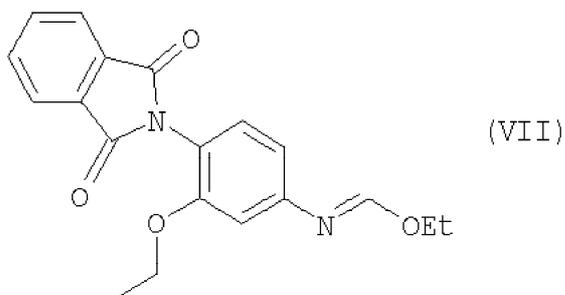


11. Способ по любому из п.2 или 3, отличающийся тем, что указанный N-арилформимидат формулы I представляет собой соединение формулы IV:

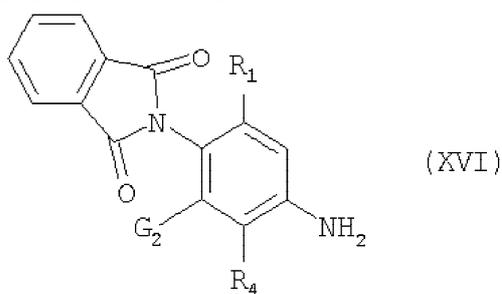


где PA представляет собой защищенную аминогруппу.

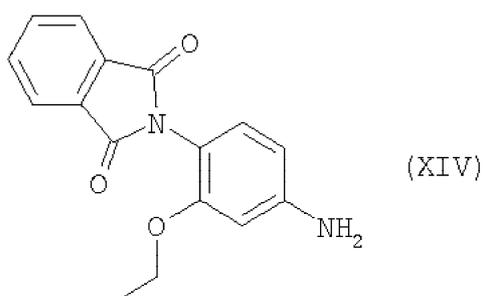
12. Способ по п.11, отличающийся тем, что указанный N-арилформимидат формулы IV представляет собой соединение формулы VII:



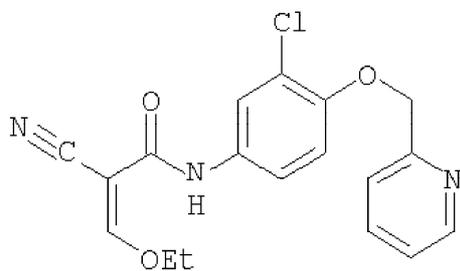
13. Способ по любому из пп.3, 4 или 5, отличающийся тем, что указанный ариламин формулы XIII представляет собой соединение формулы XVI:



14. Способ по п.13, отличающийся тем, что указанный ариламин формулы XVI представляет собой соединение формулы XIV:

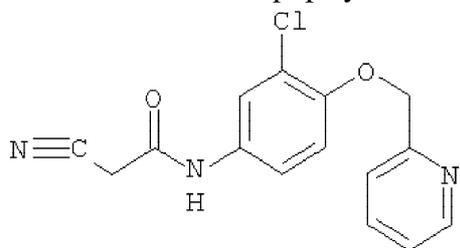


15. Способ по любому из пп.4 или 5, отличающийся тем, что указанный алкоксиметилен формулы II представляет собой соединение формулы VIII:



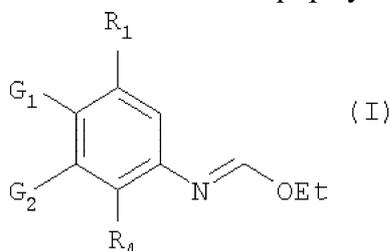
(VIII)

16. Способ по любому из пп.2, 3 или 5, отличающийся тем, что указанное соединение формулы XII, содержащее активные метиленовые группы, представляет собой соединение формулы XV:



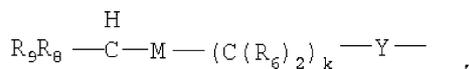
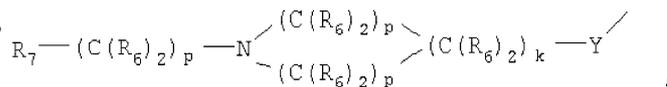
(XV)

17. Соединение формулы I:



(I)

где каждый из G_1 , G_2 , R_1 , и R_4 независимо представляет собой водород, галоген, алкил с 1-6 атомами углерода, алкенил с 2-6 атомами углерода, алкинил с 2-6 атомами углерода, алкенилокси с 2-6 атомами углерода, алкинилокси с 2-6 атомами углерода, гидроксиметил, галогенметил, алканоилокси с 1-6 атомами углерода, алкеноилокси с 3-8 атомами углерода, алкиноилокси с 3-8 атомами углерода, алканоилоксиметил с 2-7 атомами углерода, алкеноилоксиметил с 4-9 атомами углерода, алкиноилоксиметил с 4-9 атомами углерода, алкоксиметил с 2-7 атомами углерода, алкокси с 1-6 атомами углерода, алкилтио с 1-6 атомами углерода, алкилсульфинил с 1-6 атомами углерода, алкилсульфонил с 1-6 атомами углерода, алкилсульфонамидо с 1-6 атомами углерода, алкенилсульфонамидо с 2-6 атомами углерода, алкинилсульфонамидо с 2-6 атомами углерода, гидроксид, трифторметил, трифторметокси, циано, нитро, карбокси, карбоалкокси с 2-7 атомами углерода, карбоалкил с 2-7 атомами углерода, фенокси, фталимид, фенил, тиофенокси, бензил, amino, гидроксаминно, алкоксаминно с 1-4 атомами углерода, алкиламино с 1-6 атомами углерода, диалкиламино с 2-12 атомами углерода, N-алкилкарбамоил, N,N-диалкилкарбамоил, N-алкил-N-алкениламино с 4-12 атомами углерода, N,N-диалкениламино с 6-12 атомами углерода, фениламино, бензиламино,



$R_7 - (C(R_6)_2)_g - Y$, $R_7 - (C(R_6)_2)_p - M - (C(R_6)_2)_k - Y$, или $Het - (C(R_6)_2)_q - W - (C(R_6)_2)_k - Y$; или G_1 , и/или G_2 независимо могут быть выбраны из группы, включающей защищенную аминогруппу и $R_2 - NH$;

или в случае, если любые из заместителей R_1 , G_1 , G_2 , или R_4 находятся у соседних

атомов углерода, они могут представлять собой двухвалентный радикал $-O-C(R_6)_2-O-$;

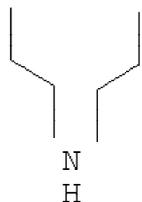
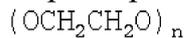
Y представляет собой двухвалентный радикал, выбранный из группы, включающей $-(CH_2)_a-$, $-O-$, и $\begin{matrix} R_6 \\ | \\ -N- \end{matrix}$;

R_7 представляет собой $-NR_6R_7$, $-OR_6$, $-J$, $-N(R_6)_3^+$, или $-NR_7R_6(OR_6)$;

M представляет собой $>NR_6$, $-O-$, $>N-(C(R_6)_2)_p NR_6R_6$, или $>N-(C(R_6)_2)_p -OR_6$;

W представляет собой $>NR_6$, $-O-$ или связь;

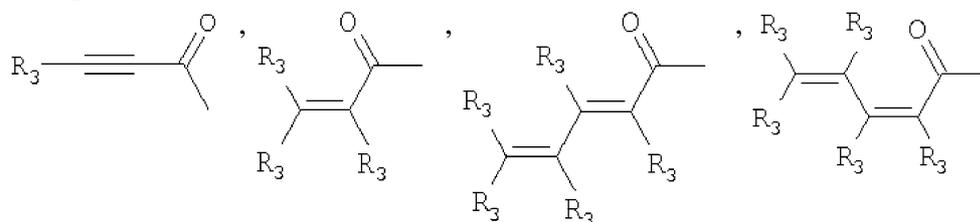
Нет выбран из группы, включающей морфолин, тиоморфолин, тиоморфолин S-оксид, тиоморфолин S,S-диоксид, пиперидин, пирролидин, азиридин, пиридин, имидазол, 1,2,3-триазол, 1,2,4-триазол, триазол, триазолидин, тетразол, пиперазин, фуран, тиофен, тетрагидротиофен, тетрагидрофуран, диоксан, 1,3-диоксолан, тетрагидропиран и

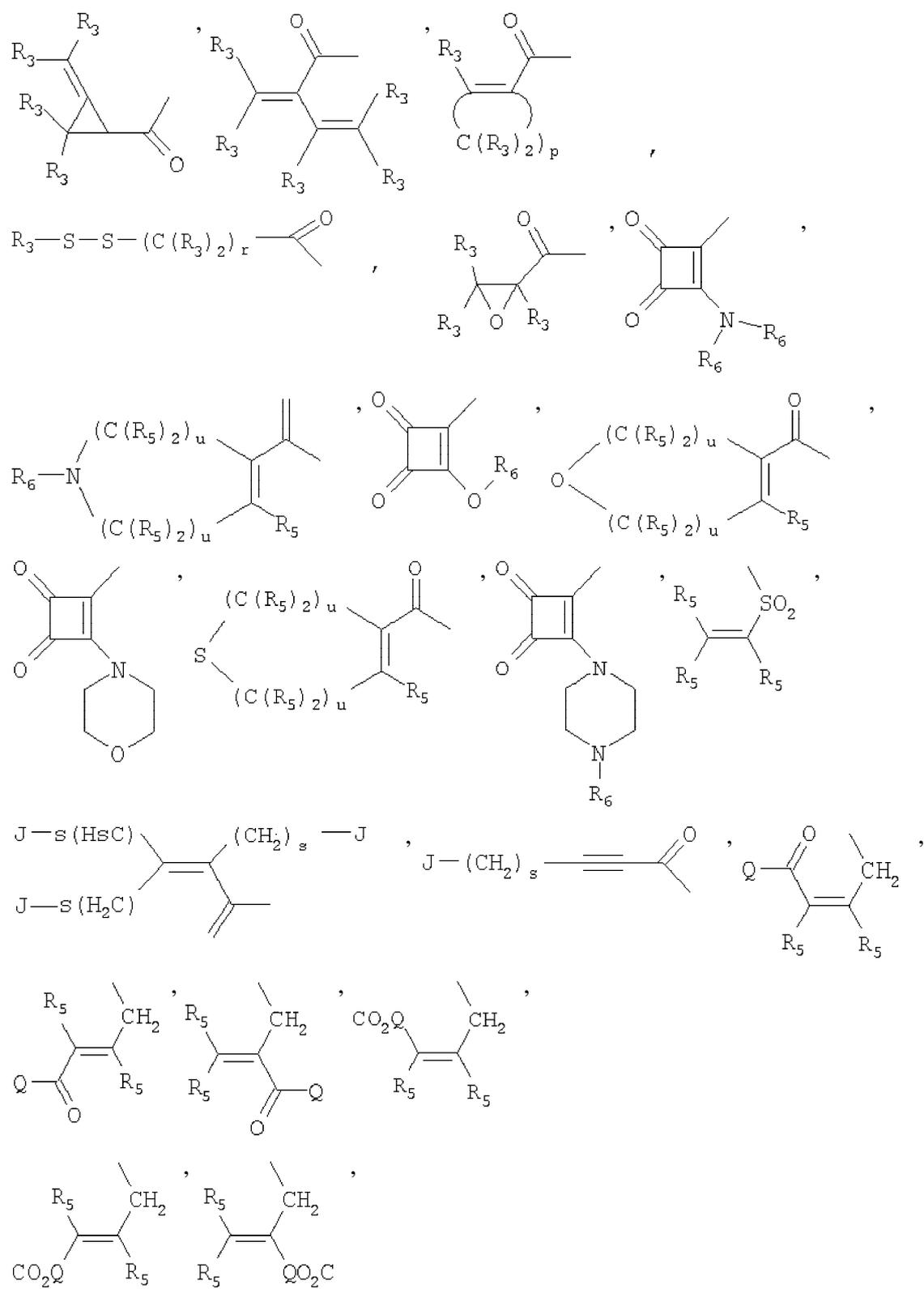


где Нет может содержать: один или два заместителя R_6 у атомов азота или углерода, может содержать у атома углерода одну или две гидроксигруппы, $-N(R_6)_2$ или $-OR_6$, может содержать у атома углерода один или два одновалентных радикала $-(C(R_6)_2)_s OR_6$ или $-(C(R_6)_2)_s N(R_6)_2$, и может содержать один или два заместителя $-O-$ или $-O(C(R_6)_2)_s O-$ у насыщенного атома углерода;

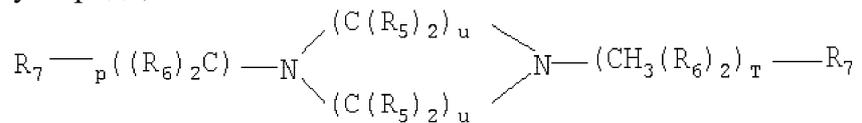
R_6 представляет собой водород, алкил с 1-6 атомами углерода, алкенил с 2-6 атомами углерода, алкинил с 2-6 атомами углерода, циклоалкил с 1-6 атомами углерода, карбоалкил с 2-7 атомами углерода, карбоксиалкил с 2-7 атомами углерода, фенил или фенил, который может содержать в качестве заместителей один или более атом галогена, алкокси с 1-6 атомами углерода, трифторметил, амино, алкиламино с 1-3 атомами углерода, диалкиламино с 2-6 атомами углерода, нитро, циано, азидо, галогенметил, алкоксиметил с 2-7 атомами углерода, алканоилоксиметил с 2-7 атомами углерода, алкилтио с 1-6 атомами углерода, гидрокси, карбоксил, карбоалкокси с 2-7 атомами углерода, фенокси, фенил, тиофенокси, бензоил, бензил, фениламино, бензиламино, алканоиламино с 1-6 атомами углерода или алкил с 1-6 атомами углерода при условии, что алкенильная или алкинильная группы связаны с атомом азота или кислорода через насыщенный атом углерода;

R_2 выбран из группы, включающей:





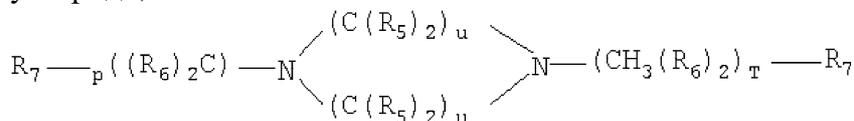
R_3 независимо представляет собой водород, алкил с 1-6 атомами углерода, карбокси, карбоалкокси с 1-6 атомами углерода, фенил, карбоалкил с 2-7 атомами углерода,



$R_7(C(R_6)_2)_s$ -, $R_7(C(R_6)_2)_p$ -M-($C(R_7)_2$)_r-, R_8R_9 -CH-M-($C(R_6)_2$)_r-,
 Нет-($C(R_6)_2$)_q-W-($C(R_6)_2$)_r-; аминалкил с 1-6 атомами углерода, N-алкиламиноалкил с 2-9 атомами углерода, N,N-диалкиламиноалкил с 3-12 атомами углерода,

N-циклоалкиламиноалкил с 4-12 атомами углерода, N-циклоалкил-N-алкиламиноалкил с 5-18 атомами углерода, N,N-дициклоалкиламиноалкил с 7-18 атомами углерода, морфолино-N-алкил, где алкильная группа содержит 1-6 атомов углерода, N-алкилпиперидино-N-алкил, где каждая из алкильных групп содержит 1-6 атомов углерода;

R₅ представляет собой независимо водород, алкил с 1-6 атомами углерода, карбоксы, карбоалкокси с 1-6 атомами углерода, фенил, карбоалкил с 2-7 атомами углерода,



R₇(C(R₆)₂)_s-, R₇-(C(R₆)₂)_p-M-(C(R₆)₂)_r-, R₈R₉-CH-M-(C(R₆)₂)_r-, или Het-(C(R₆)₂)_q-W(C(R₆)₂)_r-;

каждый из R₈, и R₉ независимо представляет собой -(C(R₆)₂)_rNR₆R₆, или -(C(R₆)_rOR₆);

J представляет собой независимо водород, хлор, фтор или бром;

Q представляет собой алкил, содержащий от 1 до 6 атомов углерода или водород;

a=0 или 1;

g=1-6;

k=0-4;

n=0-1;

m=0-3;

p=2-4;

q=0-4;

r=1-4;

s=1-6;

u=0-4 и v=0-4, где сумма u+v составляет от 2 до 4; или фармацевтически приемлемую соль указанного соединения, при условии, что:

если R₆ представляет собой алкенил с 2-7 атомами углерода или алкинил с 2-7 атомами углерода, то указанные алкенил или алкинил связаны с азотом или кислородом через насыщенный атом углерода;

а также при условии, что:

если Y представляет собой -NR₆- и R₇ представляет собой -NR₆R₆-N(R₆)₃⁺, или -NR₆(OR₆), то g=2-6;

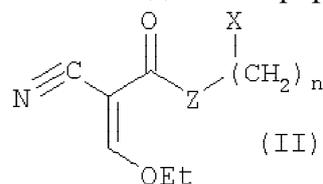
если M представляет собой -O- и R₇ представляет собой -OR₆, то p=1-4;

если Y представляет собой -NR₆-, то k=2-4;

если Y представляет собой -O- и M или W представляет собой -O-, то k=1-4;

если W не является связью в случае, когда Het связан с W через атом азота, то q=2-4, и если W представляет собой связь в случае, когда Het связан с W через атом азота и Y представляет собой -O- или -NR₆-, то k=2-4.

18. Соединение формулы II:



где X представляет собой бициклический арил или бициклический гетероарил, содержащий от 8 до 12 атомов, где бициклический гетероарил содержит от 1 до 4 гетероатомов, выбранных из N, O и S, при условии, что указанный бициклический

гетероарил не содержит связей О-О, S-S или S-O, и где указанный бициклический арил или бициклический гетероарил может содержать один, два, три или четыре заместителя, выбранных из группы, включающей галоген, оксо, тио, алкил, содержащий от 1 до 6 атомов углерода, алкенил с числом атомов углерода 2-6, алкинил с 2-6 атомами углерода, азидо, гидроксипалкил с 1-6 атомами углерода, галогенметил, алкоксиметил с 2-7 атомами углерода, алканоилоксиметил с 2-7 атомами углерода, алкокси с 1-6 атомами углерода, алкилтио с 1-6 атомами углерода, гидроксип, трифторметил, циано, нитро, карбокси, карбоалкокси с 2-7 атомами углерода, карбоалкил с 2-7 атомами углерода, фенокси, фенил, тиофенокси, бензоил, бензил, амина, алкиламина с 1-6 атомами углерода, диалкиламина с 2-12 атомами углерода, фениламина, бензиламина, алканоиламина с 1-6 атомами углерода, алкеноиламина с числом атомов углерода 3-8, алкиноиламина с 3-8 атомами углерода, карбоксиалкил с 2-7 атомами углерода, карбоалкоксиалкил с 3-8 атомами углерода, аминалкил с 1-5 атомами углерода, N-алкиламиналкил с 2-9 атомами углерода, N,N-диалкиламиналкил с 3-10 атомами углерода, N-алкиламиналкокси с 2-9 атомами углерода, N,N-диалкиламиналкокси с 3-10 атомами углерода, меркапто и бензоиламина; или

X представляет собой циклоалкил, содержащий от 3 до 7 атомов углерода, который может содержать в качестве заместителей один или более алкил, содержащий от 1 до 6 атомов углерода, или X представляет собой пиридинил, пиримидинил или фенил, где указанные пиридинил, пиримидинил или фенил могут содержать один, два или три заместителя, выбранных из группы, включающей галоген, алкил, содержащий от 1 до 6 атомов углерода, алкенил с 2-6 атомами углерода, алкинил с 2-6 атомами углерода, азидо, гидроксипалкил с 1-6 атомами углерода, галогенметил, алкоксиметил с 2-7 атомами углерода, алканоилоксиметил с 2-7 атомами углерода, алкокси с 1-6 атомами углерода, алкилтио с 1-6 атомами углерода, гидроксип, трифторметил, циано, нитро, карбокси, карбоалкокси с 2-7 атомами углерода, карбоалкил с 2-7 атомами углерода, фенокси, фенил, тиофенокси, бензоил, бензил, амина, алкиламина с числом атомов углерода 1-6, диалкиламина с 2-12 атомами углерода, фениламина, бензиламина, алканоиламина с 1-6 атомами углерода, алкеноиламина с 3-8 атомами углерода, алкиноиламина с 3-8 атомами углерода и бензоиламина; или

X представляет собой радикал формулы: ---A---T---L

где A представляет собой пиридинил, пиримидинил или фенил, при этом указанные пиридинил, пиримидинил или фенил могут содержать один или два заместителя, выбранных из группы, включающей галоген, алкил с числом атомов углерода 1-6, алкенил с 2-6 атомами углерода, алкинил с 2-6 атомами углерода, азидо, гидроксипалкил с 1-6 атомами углерода, галогенметил, алкоксиметил с 2-7 атомами углерода, алканоилоксиметил с 2-7 атомами углерода, алкокси с 1-6 атомами углерода, алкилтио с 1-6 атомами углерода, гидроксип, трифторметил, циано, нитро, карбокси, карбоалкокси с 2-7 атомами углерода, карбоалкил с 2-7 атомами углерода, фенокси, фенил, тиофенокси, бензоил, бензил, амина, алкиламина с 1-6 атомами углерода, диалкиламина с 2-12 атомами углерода, фениламина, бензиламина, алканоиламина с 1-6 атомами углерода, алкеноиламина с 3-8 атомами углерода, алкиноиламина с 3-8 атомами углерода, карбоксиалкил с 2-7 атомами углерода, карбоалкоксиалкил с 3-8 атомами углерода, аминалкил с 1-5 атомами углерода, N-алкиламиналкил с 2-9 атомами углерода, N,N-диалкиламиналкил с 3-10 атомами углерода, N-алкиламиналкокси с 2-9 атомами углерода, N,N-диалкиламиналкокси с 3-10 атомами углерода, меркапто и бензоиламина:

T связан с атомом углерода, входящим в состав группы A и может представлять

собой:

$-\text{NH}(\text{CH}_2)_m-$, $-\text{O}(\text{CH}_2)_m-$, $-\text{S}(\text{CH}_2)_m-$, $-\text{NR}(\text{CH}_2)_m-$, $-(\text{CH}_2)_m-$, $-(\text{CH}_2)_m\text{NH}-$, $-(\text{CH}_2)_m\text{O}-$, $-(\text{CH}_2)_m\text{S}-$, или $-(\text{CH}_2)_m\text{NR}-$;

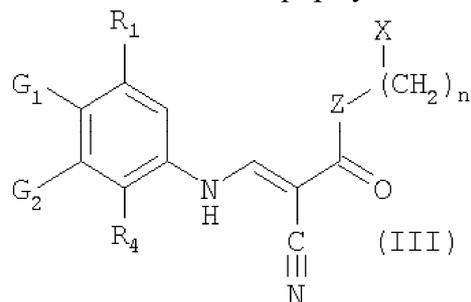
L представляет собой незамещенное фенильное кольцо или фенильное кольцо, содержащее один, два или три заместителя, выбранных из группы, включающей галоген, алкил с 1-6 атомами углерода, алкенил с 2-6 атомами углерода, алкинил с 2-6 атомами углерода, азидо, гидроксильный алкил с 1-6 атомами углерода, галогенметил, алкоксиметил с 2-7 атомами углерода, алканоилоксиметил с 2-7 атомами углерода, алкокси с 1-6 атомами углерода, алкилтио с 1-6 атомами углерода, гидрокси, трифторметил, циано, нитро, карбокси, карбоалкокси с числом атомов углерода 2-7, карбоалкил с 2-7 атомами углерода, фенокси, фенил, тиофенокси, бензоил, бензил, amino, алкиламино с 1-6 атомами углерода, диалкиламино с 2-12 атомами углерода, фениламино, бензиламино, алканоиламино с 1-6 атомами углерода, алкеноиламино с 3-8 атомами углерода, алкиноиламино с 3-8 атомами углерода, карбоксиалкил с 2-7 атомами углерода, карбоалкоксиалкил с 3-8 атомами углерода, аминоалкил с 1-5 атомами углерода, N-алкиламиноалкил с 2-9 атомами углерода, N,N-диалкиламиноалкил с 3-10 атомами углерода, N-алкиламиноалкокси с 2-9 атомами углерода, N,N-диалкиламиноалкокси с 3-10 атомами углерода, меркапто и бензоиламино, при условии, что L может представлять собой незамещенное фенильное кольцо только в случае, если $m > 0$, то T не является $\text{CH}_2\text{NH}-$ или $-\text{CH}_2\text{O}-$; или

L представляет собой 5- или 6-членный гетероарил, содержащий от 1 до 3 гетероатомов, выбранных из N, O и S, при условии, что указанный гетероарил не содержит связей O-O, S-S или S-O, и где указанный гетероарил может содержать один или два заместителя, выбранных из группы, включающей галоген, оксо, тио, алкил с 1-6 атомами углерода, алкенил с 2-6 атомами углерода, алкинил с 2-6 атомами углерода, азидо, гидроксильный алкил с 1-6 атомами углерода, галогенметил, алкоксиметил с 2-7 атомами углерода, алканоилоксиметил с 2-7 атомами углерода, алкокси с 1-6 атомами углерода, алкилтио с 1-6 атомами углерода, гидрокси, трифторметил, циано, нитро, карбокси, карбоалкокси с 2-7 атомами углерода, карбоалкил с 2-7 атомами углерода, фенокси, фенил, тиофенокси, бензоил, бензил, amino, алкиламино, с 1-6 атомами углерода, диалкиламино с 2-12 атомами углерода, фениламино, бензиламино, алканоиламино с 1-6 атомами углерода, алкеноиламино с 3-8 атомами углерода, алкиноиламино с 3-8 атомами углерода, карбоксиалкил с 2-7 атомами углерода, карбоалкоксиалкил с 3-8 атомами углерода, аминоалкил с 1-5 атомами углерода, N-алкиламиноалкил с 2-9 атомами углерода, N,N-диалкиламиноалкил с 3-10 атомами углерода, N-алкиламиноалкокси с 2-9 атомами углерода, N,N-диалкиламиноалкокси с 3-10 атомами углерода, меркапто и бензоиламино;

Z представляет собой $-\text{NH}-$, $-\text{O}-$, $-\text{S}-$, или $-\text{NR}-$;

R представляет собой алкил, содержащий от 1 до 6 атомов углерода или карбоалкил, содержащий от 2 до 7 атомов углерода;

19. Соединения формулы III:



где X представляет собой бициклический арил или бициклический гетероарил, содержащий от 8 до 12 атомов, где указанный бициклическое гетероарил содержит от 1 до 4 гетероатомов, выбранных из N, O и S, при условии, что указанный бициклический гетероарил не содержит связей O-O, S-S или S-O, и где указанные бициклический арил или бициклический гетероарил может содержать один, два, три или четыре заместителя, выбранных из группы, включающей галоген, оксо, тио, алкил, содержащий от 1 до 6 атомов углерода, алкенил, содержащий от 2 до 6 атомов углерода, алкинил с 2-6 атомами углерода, азидо, гидроксикал с 1-6 атомами углерода, галогенметил, алкоксиметил с 2-7 атомами углерода, алканоилоксиметил с 2-7 атомами углерода, алкокси с 1-6 атомами углерода, алкилтио с 1-6 атомами углерода, гидрокси, трифторметил, циано, нитро, карбокси, карбоалкокси с 2-7 атомами углерода, карбоалкил с 2-7 атомами углерода, фенокси, фенил, тиофенокси, бензоил, бензил, amino, алкиламино с 1-6 атомами углерода, диалкиламино с 2-12 атомами углерода, фениламино, бензиламино, алканоиламино с 1-6 атомами углерода, алкеноиламино с числом атомов углерода 3-8, алкиноиламино с 3-8 атомами углерода, карбоксиалкил с 2-7 атомами углерода, карбоалкоксиалкил с 3-8 атомами углерода, аминокал с 1-5 атомами углерода, N-алкиламиноалкил с 2-9 атомами углерода, N,N-диалкиламиноалкил с 3-10 атомами углерода, N-алкиламиноалкокси с 2-9 атомами углерода, N,N-диалкиламиноалкокси с 3-10 атомами углерода, меркапто и бензоиламино; или X представляет собой циклоалкил, содержащий от 3 до 7 атомов углерода, который может содержать в качестве заместителя одну или более алкильную группу, содержащую от 1 до 6 атомов углерода, или X представляет собой пиридинил, пиримидинил или фенил, при этом указанный пиридинил, пиримидинил или фенил может содержать один, два или три заместителя, выбранных из группы, включающей галоген, алкил, содержащий от 1 до 6 атомов углерода, алкенил с 2-6 атомами углерода, алкинил с 2-6 атомами углерода, азидо, гидроксикал с 1-6 атомами углерода, галогенметил, алкоксиметил с 2-7 атомами углерода, алканоилоксиметил с 2-7 атомами углерода, алкокси с 1-6 атомами углерода, алкилтио с 1-6 атомами углерода, гидрокси, трифторметил, циано, нитро, карбокси, карбоалкокси с 2-7 атомами углерода, карбоалкил с 2-7 атомами углерода, фенокси, фенил, тиофенокси, бензоил, бензил, amino, алкиламино с числом атомов углерода 1-6, диалкиламино с 2-12 атомами углерода, фениламино, бензиламино, алканоиламино с 1-6 атомами углерода, алкеноиламино с 3-8 атомами углерода, алкиноиламино с 3-8 атомами углерода и бензоиламино; или

X представляет собой радикал формулы: ---A---T---L

где A представляет собой пиридинил, пиримидинил или фенил, при этом указанный пиридинил, пиримидинил или фенил может содержать один или два заместителя, выбранных из группы, включающей галоген, алкил, содержащий от 1 до 6 атомов углерода, алкенил с 2-6 атомами углерода, алкинил с 2-6 атомами углерода, азидо, гидроксикал с 1-6 атомами углерода, галогенметил, алкоксиметил с 2-7 атомами углерода, алканоилоксиметил с 2-7 атомами углерода, алкокси с 1-6 атомами углерода, алкилтио с 1-6 атомами углерода, гидрокси, трифторметил, циано, нитро, карбокси, карбоалкокси с 2-7 атомами углерода, карбоалкил с 2-7 атомами углерода, фенокси, фенил, тиофенокси, бензоил, бензил, amino, алкиламино с 1-6 атомами углерода, диалкиламино с 2-12 атомами углерода, фениламино, бензиламино, алканоиламино с 1-6 атомами углерода, алкеноиламино с 3-8 атомами углерода, алкиноиламино с 3-8 атомами углерода, карбоксиалкил с 2-7 атомами углерода, карбоалкоксиалкил с 3-8 атомами углерода, аминокал с 1-5 атомами углерода, N-алкил аминокал с 2-9 атомами углерода, N,N-диалкиламиноалкил с 3-10 атомами

углерода, N-алкиламиноалкокси с 2-9 атомами углерода, N,N-диалкиламиноалкокси с 3-10 атомами углерода, меркапто и бензоиламино;

T связан с атомом углерода, входящим в состав группы A и представляет собой одну из следующих групп:

$-\text{NH}(\text{CH}_2)_m-$, $-\text{O}(\text{CH}_2)_m-$, $-\text{S}(\text{CH}_2)_m-$, $-\text{NRCH}_2-$, $-(\text{CH}_2)_m-$, $-(\text{CH}_2)_m\text{NH}-$, $-(\text{CH}_2)_m\text{O}-$, $-(\text{CH}_2)_m\text{S}-$, или $-(\text{CH}_2)_m\text{NR}-$;

L представляет собой незамещенное фенильное кольцо или фенильное кольцо, содержащее один, два или три заместителя, выбранных из группы, включающей галоген, алкил с 1-6 атомами углерода, алкенил с 2-6 атомами углерода, алкинил с 2-6 атомами углерода, азидо, гидроксиалкил с 1-6 атомами углерода, галогенметил, алкоксиметил с 2-7 атомами углерода, алканоилоксиметил с 2-7 атомами углерода, алкокси с 1-6 атомами углерода, алкилтио с 1-6 атомами углерода, гидрокси, трифторметил, циано, нитро, карбокси, карбоалкокси с числом атомов углерода 2-7, карбоалкил с 2-7 атомами углерода, фенокси, фенил, тиофенокси, бензоил, бензил, amino, алкиламино, с 1-6 атомами углерода, диалкиламино с 2-12 атомами углерода, фениламино, бензиламино, алканоиламино с 1-6 атомами углерода, алкеноиламино с 3-8 атомами углерода, алкиноиламино с 3-8 атомами углерода, карбоксиалкил с 2-7 атомами углерода, карбоалкоксиалкил с 3-8 атомами углерода, аминоалкил с 1-5 атомами углерода, N-алкиламиноалкил с 2-9 атомами углерода, N,N-диалкиламиноалкил с 3-10 атомами углерода, N-алкиламиноалкокси с 2-9 атомами углерода, N,N-диалкиламиноалкокси с 3-10 атомами углерода, меркапто и бензоиламино, при условии, что L может представлять собой незамещенное фенильное кольцо только в случае, если $m > 0$ и T не является $\text{CH}_2\text{NH}-$ или $-\text{CH}_2\text{O}-$; или

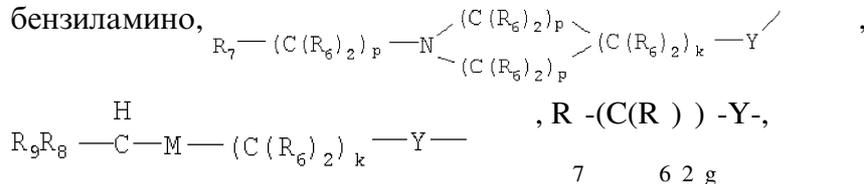
L представляет собой 5- или 6-членный гетероарил, содержащий от 1 до 3 гетероатомов, выбранных из N, O и S, при условии, что указанный гетероарил не содержит связей O-O, S-S или S-O, и где указанный гетероарил может содержать один или два заместителя, выбранных из группы, включающей галоген, оксо, тио, алкил с 1-6 атомами углерода, алкенил с 2-6 атомами углерода, алкинил с 2-6 атомами углерода, азидо, гидроксиалкил с 1-6 атомами углерода, галогенметил, алкоксиметил с 2-7 атомами углерода, алканоилоксиметил с 2-7 атомами углерода, алкокси с 1-6 атомами углерода, алкилтио с 1-6 атомами углерода, гидрокси, трифторметил, циано, нитро, карбокси, карбоалкокси с 2-7 атомами углерода, карбоалкил с 2-7 атомами углерода, фенокси, фенил, тиофенокси, бензоил, бензил, amino, алкиламино, с 1-6 атомами углерода, диалкиламино с 2-12 атомами углерода, фениламино, бензиламино, алканоиламино с 3-8 атомами углерода, алкеноиламино с 3-8 атомами углерода, алкиноиламино с 3-8 атомами углерода, карбоксиалкил с 2-7 атомами углерода, карбоалкоксиалкил с 3-8 атомами углерода, аминоалкил с 1-5 атомами углерода, N-алкиламиноалкил с 2-9 атомами углерода, N,N-диалкиламиноалкил с 3-10 атомами углерода, N-алкиламиноалкокси с 2-9 атомами углерода, N,N-диалкиламиноалкокси с 3-10 атомами углерода, меркапто и бензоиламино;

Z представляет собой -NH-, -O-, -S-, или -NR-;

R представляет собой алкил с 1-6 атомами углерода или карбоалкил с 2-7 атомами углерода;

Каждый из G_1 , G_2 , R_1 и R_4 независимо представляет собой водород, галоген, алкил с 1-6 атомами углерода, алкенил с 2-6 атомами углерода, алкинил с 2-6 атомами углерода, алкенилокси с 2-6 атомами углерода, алкинилокси с 2-6 атомами углерода, гидроксиметил, галогенметил, алканоилокси с 1-6 атомами углерода, алкеноилокси с 3-8 атомами углерода, алкиноилокси с 3-8 атомами углерода, алканоилоксиметил с 2-7 атомами углерода, алкеноилоксиметил с 4-9 атомами углерода, алкиноилоксиметил

с 4-9 атомами углерода, алкоксиметил с 2-7 атомами углерода, алкокси с 1-6 атомами углерода, алкилтио с 1-6 атомами углерода, алкилсульфинил с 1-6 атомами углерода, алкилсульфонил с 1-6 атомами углерода, алкилсульфонамидо с 1-6 атомами углерода, алкенилсульфонамидо с 2-6 атомами углерода, гидроксид, трифторметил, трифторметокси, циано, нитро, карбокси, карбоалкокси с 2-7 атомами углерода, карбоалкил с 2-7 атомами углерода, фенокси, фталимид, фенил, тиофенокси, бензил, amino, гидроксамино, алкоксамино с 1-4 атомами углерода, алкиламино с 1-6 атомами углерода, диалкиламино с 2-12 атомами углерода, N-алкилкарбамоил, N,N-диалкилкарбамоил, N-алкил-N-алкениламино с 4-12 атомами углерода, N,N-диалкениламино с 6-12 атомами углерода, фениламино, бензиламино,



$R_7 - (C(R_6)_2)_p - M - (C(R_6)_2)_k - Y -$, или $Het - (C(R_6)_2)_q - W - (C(R_6)_2)_r - Y -$; или G_1 , и/или G_2 могут представлять собой независимо защищенную аминогруппу или $R_2 - NH -$; или если любые из заместителей R_1 , G_1 , G_2 , или R_4 расположены у соседних атомов углерода, они могут представлять собой двухвалентный радикал $-O - C(R_6)_2 - O -$;

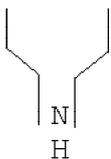
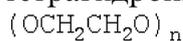
Y представляет собой двухвалентный радикал, выбранный из следующих групп:
 $-(CH_2)_a -$, $-O -$, и $\begin{matrix} R_6 \\ | \\ -N - \end{matrix}$;

R_7 представляет собой $-NR_6 R_7$, $-OR_6$, $-J$, $-N(R_6)_3^+$, или $-NR_7(OR_6)$;

M представляет собой $>NR_6$, $-O -$, $>N - C(R_6)_2)_p NR_6 R_6$, или $>N - (C(R_6)_2)_p - OR_6$;

W представляет собой $>NR_6$, $-O -$ или связь;

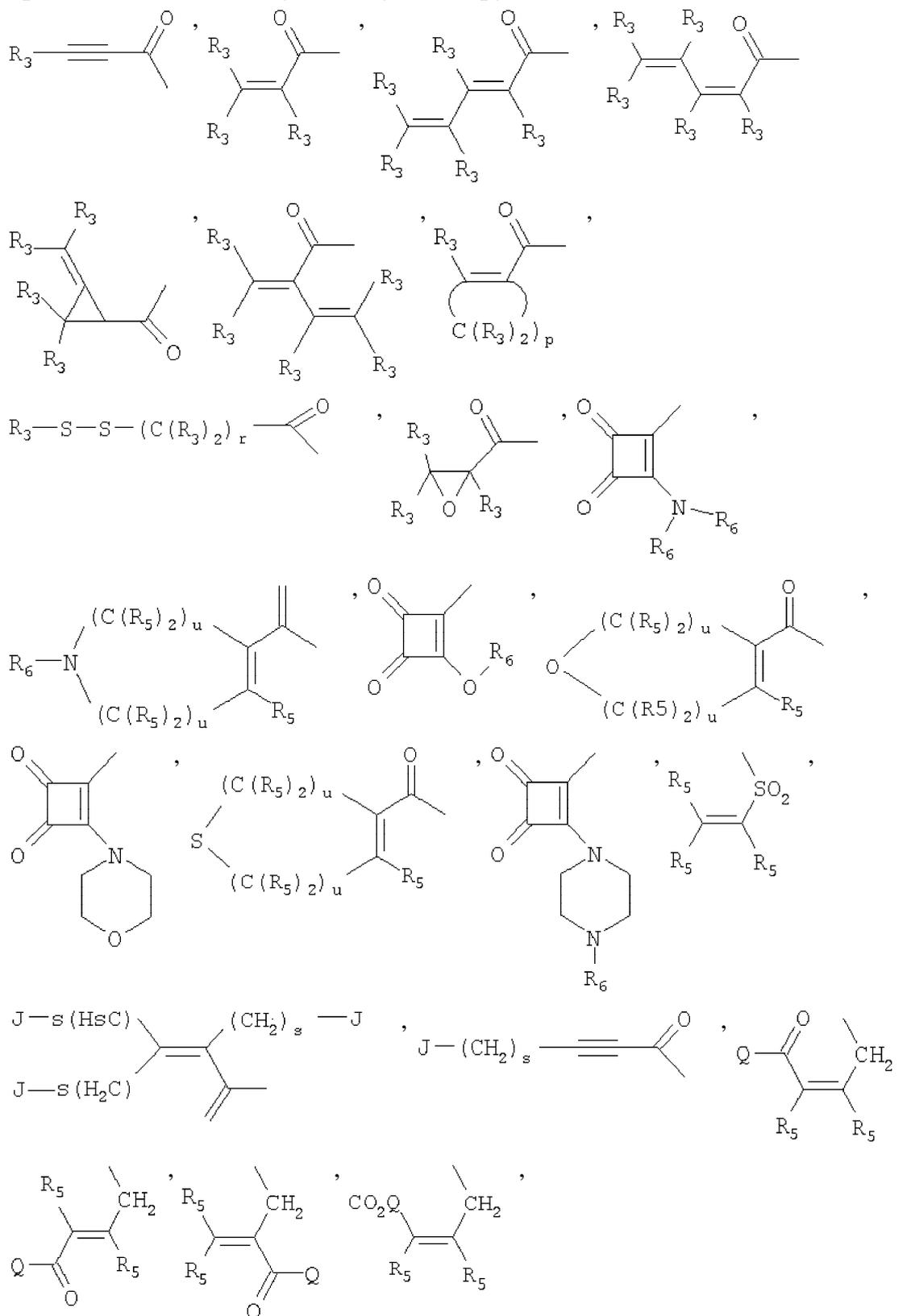
Het выбран из группы, включающей морфолин, тиоморфолин, тиоморфолин S-оксид, тиоморфолин S,S-диоксид, пиперидин, пирролидин, азиридин, пиридин, имидазол, 1,2,3-триазол, 1,2,4-триазол, тиазол, тиазолидин, тетразол, пиперазин, фуран, тиофен, тетрагидротиофен, тетрагидрофуран, диоксан, 1,3-диоксалан, тетрагидропиран, и



при этом Het может содержать один или два заместителя R_6 у атомов углерода или азота, может содержать в качестве заместителя у атома углерода один или два гидроксид, $N(R_6)_2$, или OR_6 , может содержать в качестве заместителя у атома углерода один или два одновалентных радикала $-(C(R_6)_2)_s OR_6$ или $-(C(R_6)_2)_s N(R_6)_2$ и может содержать в качестве заместителя у насыщенного атома углерода один или два двухвалентных радикала $-O -$ или $-O(C(R_6)_2)_s O -$;

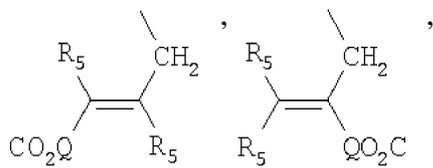
R_6 представляет собой водород, алкил с 1-6 атомами углерода, алкенил с 2-6 атомами углерода, алкинил с 2-6 атомами углерода, циклоалкил с 1-6 атомами углерода, карбоалкил с 2-7 атомами углерода, карбоксиалкил с 2-7 атомами углерода, фенил, фенил, который может содержать в качестве заместителей один или более атом галогена, алкокси с 1-6 атомами углерода, трифторметил, amino, алкиламино с 1-3 атомами углерода, диалкиламино с 2-6 атомами углерода, нитро, циано, азидо, галогенметил, алкоксиметил с 2-7 атомами углерода, алканоилоксиметил с 2-7

атомами углерода, алкилтио с 1-6 атомами углерода, гидроксил, карбоксил, карбоалкокси с 2-7 атомами углерода, фенокси, фенил, тиофенокси, бензоил, бензил, фениламино, бензиламино, алканоиламино с 1-6 атомами углерода или алкил с 1-6 атомами углерода, при условии, что алкенильные или алкинильные заместители связаны с атомом азота или кислорода через насыщенный атом углерода; R_2 ; представляет собой одну из следующих групп:

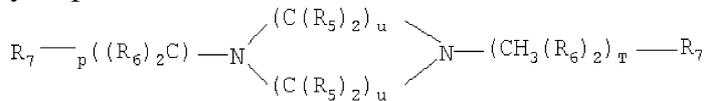


А 4456317002 RU

RU 2007139544 A

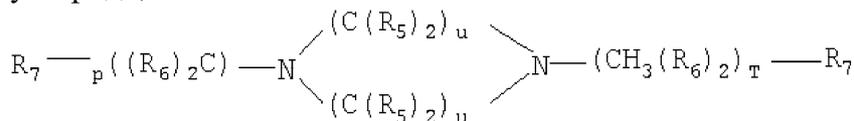


R_3 представляет собой независимо водород, алкил с 1-6 атомами углерода, карбокси, карбоалкокси с 1-6 атомами углерода, фенил, карбоалкил с 2-7 атомами углерода,



$R_7-(C(R_6)_2)_s$ -, $R_7-(C(R_6)_2)_P-M-(C(R_7)_2)_r$ -, $R_8R_9-CH-M-(C(R_6)_2)_r$ -,
 $Net-(C(R_6)_2)_q-W-(C(R_6)_2)_r$;- аминоалкил с 1-6 атомами углерода, N-алкиламиноалкил с 2-9 атомами углерода, N,N-диалкиламиноалкил с 3-12 атомами углерода, N-циклоалкиламиноалкил с 4-12 атомами углерода, N-циклоалкил-N-алкиламиноалкил с 5-18 атомами углерода, N,N-дициклоалкиламиноалкил с 7-18 атомами углерода, морфолино-N-алкил, где алкил может содержать от 1 до 6 атомов углерода, N-алкилпиперидино-N-алкил, где каждый алкил может содержать от 1 до 6 атомов углерода;

R_5 независимо представляет собой водород, алкил с 1-6 атомами углерода, карбокси, карбоалкокси с 1-6 атомами углерода, фенил, карбоалкил с 2-7 атомами углерода,



каждый из R_8 , и R_9 независимо представляет собой $-(C(R_6)_2)_rNR_6R_6$, или $-(C(R_6)_2)_rOR_6$;

J независимо представляет собой водород, хлор, фтор или бром;

Q представляет собой алкил с 1-6 с атомами углерода или водород;

a=0 или 1;

g=1-6;

k=0-4;

n=0-1;

m=0-3;

p=2-4;

q=0-4;

r=1-4;

s=1-6;

u=0-4 и v=0-4, где сумма u+v составляет от 2 до 4;

или фармацевтически приемлемую соль указанного соединения,; при условии, что: если R_6 представляет собой алкенил с 2-7 атомами углерода или алкинил с 2-7 атомами углерода, то указанные группы связаны с атомом кислорода или азота через насыщенный атом углерода;

если Y представляет собой $-NR_6$ - и R_7 представляет собой $-NR_6R_6-N(R_6)_3^+$, или $-NR_6COR_6$), то g=2-6;

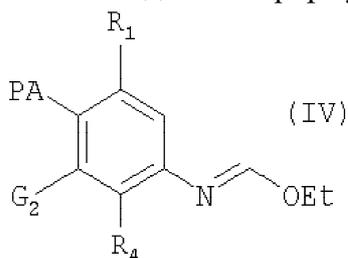
если M представляет собой -O- и R_7 представляет собой $-OR_6$, то p=1-4;

если Y представляет собой $-NR_6$ -, то k=2-4;

если Y представляет собой -O- и M или W представляет собой -O-, то k=1-4;

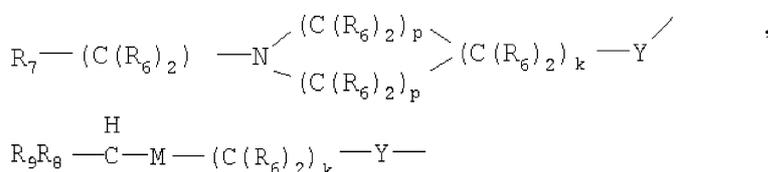
если W не является связью в случае, когда Het связан с W через атом азота, то q=2-4, и если W представляет собой связь в случае, когда Het связан с W через атом азота и Y представляет собой -O- или -NR₆-, то k=2-4.

20. Соединение формулы VI:



где PA представляет собой защищенную аминогруппу;

где каждый из G₂, R₁, и R₄ независимо представляет собой водород, галоген, алкил с 1-6 атомами углерода, алкенил с 2-6 атомами углерода, алкинил с 2-6 атомами углерода, алкенилокси с 2-6 атомами углерода, алкинилокси с 2-6 атомами углерода, гидроксиметил, галогенметил, алканоилокси с 1-6 атомами углерода, алкеноилокси с 3-8 атомами углерода, алкиноилокси с 3-8 атомами углерода, алканоилоксиметил с 2-7 атомами углерода, алкеноилоксиметил с 4-9 атомами углерода, алкиноилоксиметил с 4-9 атомами углерода, алкоксиметил с 2-7 атомами углерода, алкокси с 1-6 атомами углерода, алкилтио с 1-6 атомами углерода, алкилсульфинил с 1-6 атомами углерода, алкилсульфонил с 1-6 атомами углерода, алкилсульфонамидо с 1-6 атомами углерода, алкенилсульфонамидо с 2-6 атомами углерода, алкинилсульфонамидо с 2-6 атомами углерода, гидрокси, трифторметил, трифторметокси, циано, нитро, карбокси, карбоалкокси с 2-7 атомами углерода, карбоалкил с 2-7 атомами углерода, фенокси, фталимид, фенил, тиофенокси, бензил, amino, гидроксамино, алкоксиамино с 1-4 атомами углерода, алкиламино с 1-6 атомами углерода, диалкиламино с 2-12 атомами углерода, N-алкилкарбамоил, N,N-диалкилкарбамоил, N-алкил-N-алкениламино с 4-12 атомами углерода, N,N-диалкениламино с 6-12 атомами углерода, фениламино, бензиламино,



R₇-(C(R₆)₂)_g-Y-, R₇-(C(R₆)₂)_p-M-(C(R₆)₂)_k-Y-, или Het-(C(R₆)₂)_q-W-(C(R₆)₂)₂-Y-; или G₂ может представлять собой защищенную аминогруппу или R₂-NH-;

Y представляет собой двухвалентный радикал, выбранный из группы,

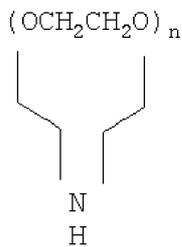
включающей: $-(CH_2)_a-$, $-O-$, или $\begin{matrix} R_6 \\ -N- \end{matrix}$;

R₇ представляет собой -NR₆R₇, -OR₆, -J, -N(R₆)₃⁺, или -NR₇R₆(OR₆);

M представляет собой >NR₆, -O-, >N-(C(R₆)₂)_pNR₆, или >N-(C(R₆)₂)_p-OR₆;

W представляет собой >NR₆, -O- или связь;

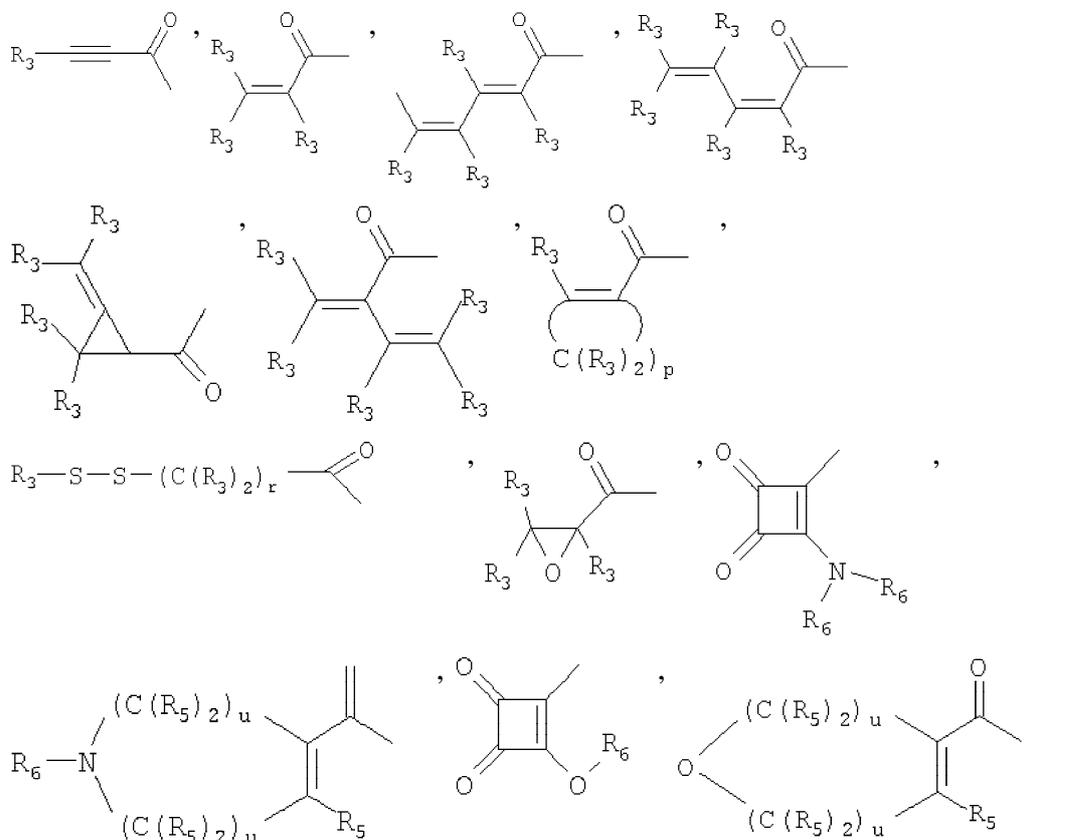
Het выбран из группы, включающей морфолин, тиоморфолин, тиоморфолин S-оксид, тиоморфолин S.S-диоксид, пиперидин, пирролидин, азиридин, пиридин, имидазол, 1,2,3-триазол, 1,2,4-триазол, тиазол, тиазолидин, тетразол, пиперазин, фуран, тиофен, тетрагидротиофен, тетрагидрофуран, диоксан, 1,3-диоксалан, тетрагидропиран, и

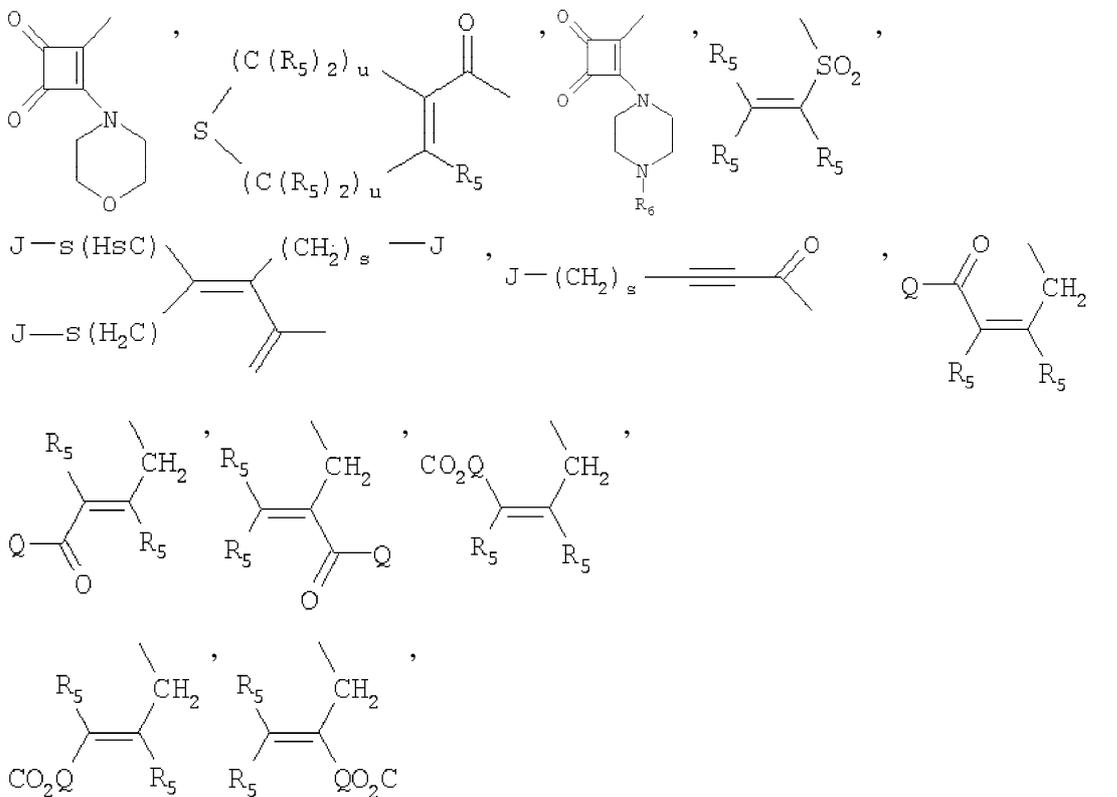


при этом Нет может содержать один или два заместителя R_6 у атомов углерода или азота, один или два заместителя $N(R_6)_2$, OR_6 или гидроксигруппу у атома углерода, может содержать в качестве заместителя у атома углерода один или два одновалентных радикала $-(C(R_6)_2)_s OR_6$ или $-(C(R_6)_2)_s N(R_6)_2$ и может содержать в качестве заместителя у насыщенного атома углерода один или два двухвалентных радикала $-O-$ или $-O(C(R_6)_2)_s O-$;

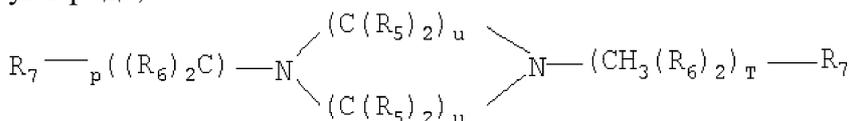
R_6 представляет собой водород, алкил с 1-6 атомами углерода, алкенил с 2-6 атомами углерода, алкинил с 2-6 атомами углерода, циклоалкил с 1-6 атомами углерода, карбоалкил с 2-7 атомами углерода, карбоксиалкил с 2-7 атомами углерода, фенил, фенил, который может содержать в качестве заместителей один или более атом галогена, алкокси с 1-6 атомами углерода, трифторметил, amino, алкиламино с 1-3 атомами углерода, диалкиламино с 2-6 атомами углерода, нитро, циано, азидо, галогенметил, алкоксиметил с 2-7 атомами углерода, алканоилоксиметил с 2-7 атомами углерода, алкилтио с 1-6 атомами углерода, гидрокси, карбоксил, карбоалкокси с 2-7 атомами углерода, фенокси, фенил, тиофенокси, бензоил, бензил, фениламино, бензиламино, алканоиламино с 1-6 атомами углерода или алкил с 1-6 атомами углерода, при условии, что алкенильные или алкинильные заместители связаны с атомом азота или кислорода через насыщенный атом углерода;

R_2 выбран из группы, включающей



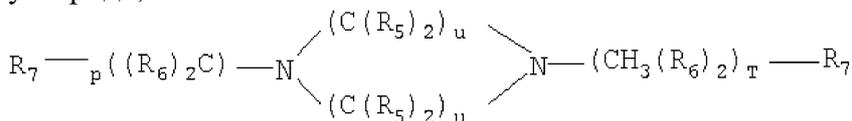


R_3 представляет собой независимо водород, алкил с 1-6 атомами углерода, карбокси, карбоалкокси с 1-6 атомами углерода, фенил, карбоалкил с 2-7 атомами углерода,



$R_7-(C(R_6)_2)_s-$, $R_7-(C(R_6)_2)_p-M-(C(R_7)_2)_r-$, $R_8R_9-CH-M-(C(R_6)_2)_q-$, $Het-(C(R_6)_2)_q-W-(C(R_6)_2)_r-$; аминалкил с 1-6 атомами углерода, N-алкиламиноалкил с 2-9 атомами углерода, N,N-диалкиламиноалкил с 3-12 атомами углерода, N-циклоалкиламиноалкил с 4-12 атомами углерода, N-циклоалкил-N-алкиламиноалкил с 5-18 атомами углерода, N,N-дициклоалкиламиноалкил с 7-18 атомами углерода, морфолино-N-алкил, где алкил может содержать от 1 до 6 атомов углерода, пиперидино-N-алкил, где алкил может содержать от 1 до 6 атомов углерода, N-алкилпиперидино-N-алкил, где каждый алкил может содержать от 1 до 6 атомов углерода;

R^5 независимо представляет собой водород, алкил с 1-6 атомами углерода, карбокси, карбоалкокси с 1-6 атомами углерода, фенил, карбоалкил с 2-7 атомами углерода,



$R_7-(C(R_6)_2)_s-$, $R_7-(C(R_6)_2)_p-M-(C(R_7)_2)_r-$, $R_8R_9-CH-M-(C(R_6)_2)_q-$, или $Het-(C(R_6)_2)_q-W-(C(R_6)_2)_r-$;

каждый из R_8 , и R_9 независимо представляет собой $-(C(R_6)_2)_rNR_6R_6$, или $-(C(R_6)_2)_rOR_6$;

J независимо представляет собой водород, хлор, фтор или бром; Q представляет собой алкил с 1-6 с атомами углерода или водород;

a=0 или 1;

g=1-6;

$k=0-4$;
 $n=0-1$;
 $m=0-3$;
 $p=2-4$;
 $q=0-4$;
 $r=1-4$;
 $s=1-6$;
 $u=0-4$ и $v=0-4$, где сумма $u+v$ составляет от 2 до 4;

или фармацевтически приемлемую соль указанного соединения, при условии, что: если R_6 представляет собой алкенил с 2-7 атомами углерода или алкинил с 2-7 атомами углерода, то указанная группа связана с атомом кислорода или азота через насыщенный атом углерода;

а также при условии, что:

если Y представляет собой $-NR_6-$ и R_7 представляет собой $-NR_6R_6-N(R_6)_3^0$ или $-NR_6(OR_6)$, то $g=2-6$;

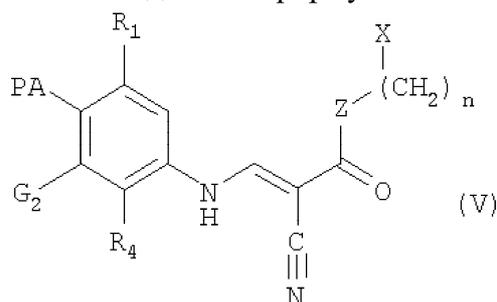
если M представляет собой $-O-$ и R_7 представляет собой $-OR_6$, то $p=1-4$;

если Y представляет собой $-NR_6-$, то $k=2-4$;

если Y представляет собой $-O-$ и M или W представляет собой $-O-$, то $k=1-4$;

если W не является связью в случае, когда Het связан с W через атом азота, то $q=2-4$, и если W представляет собой связь в случае, когда Het связан с W через атом азота и Y представляет собой $-O-$ или $-NR_6-$, то $k=2-4$.

21. Соединение формулы V:



где PA представляет собой защищенную аминогруппу;

где X представляет собой бициклический арил или бициклический гетероарил, содержащий от 8 до 12 атомов, где указанный бициклический гетероарил содержит от 1 до 4 гетероатомов, выбранных из N, O и S, при условии, что указанный бициклический гетероарил не содержит связей O-O, S-S или S-O, и где указанный бициклический арил или бициклический гетероарил может содержать один, два, три или четыре заместителя, выбранных из группы, включающей галоген, оксо, тио, алкил, содержащий от 1 до 6 атомов углерода, алкенил, содержащий от 2 до 6 атомов углерода, алкинил с 2-6 атомами углерода, азидо, гидроксильный алкил с 1-6 атомами углерода, галогенметил, алкоксиметил с 2-7 атомами углерода, алканоилоксиметил с 2-7 атомами углерода, алкокси с 1-6 атомами углерода, алкилтио с 1-6 атомами углерода, гидроксильный, трифторметил, циано, нитро, карбокси, карбоалкокси с 2-7 атомами углерода, карбоалкил с 2-7 атомами углерода, фенокси, фенил, тиофенокси, бензоил, бензил, амино, алкиламино с 1-6 атомами углерода, диалкиламино с 2-12 атомами углерода, фениламино, бензиламино, алканоиламино с 1-6 атомами углерода, алкеноиламино с числом атомов углерода 3-8, алкиноиламино с 3-8 атомами углерода, карбоксиалкил с 2-7 атомами углерода, карбоалкоксиалкил с 3-8 атомами углерода, аминоалкил с 1-5 атомами углерода, N-алкиламиноалкил с 2-9 атомами углерода, N,N-диалкиламиноалкил с 3-10 атомами углерода, N-алкиламиноалкокси с 2-

9 атомами углерода, N,N-диалкиламиноалкокси с 3-10 атомами углерода, меркапто и бензоиламино; или X представляет собой циклоалкил, содержащий от 3 до 7 атомов углерода, который может содержать в качестве заместителей одну или более алкильную группу, содержащую от 1 до 6 атомов углерода, или X представляет собой пиридинил, пиримидинил или фенил, при этом указанный пиридинил, пиримидинил или фенил могут содержать один, два или три заместителя, выбранных из группы, включающей галоген, алкил, содержащий от 1 до 6 атомов углерода, алкенил с 2-6 атомами углерода, алкинил с 2-6 атомами углерода, азидо, гидроксильный алкил с 1-6 атомами углерода, галогенметил, алкоксиметил с 2-7 атомами углерода, алканоилоксиметил с 2-7 атомами углерода, алкокси с 1-6 атомами углерода, алкилтио с 1-6 атомами углерода, гидроксильный, трифторметил, циано, нитро, карбокси, карбоалкокси с 2-7 атомами углерода, карбоалкил с 2-7 атомами углерода, фенокси, фенил, тиофенокси, бензоил, бензил, аминок, алкиламино с числом атомов углерода 1-6, диалкиламино с 2-12 атомами углерода, фениламино, бензиламино, алканоиламино с 1-6 атомами углерода, алкеноиламино с 3-8 атомами углерода, алкиноиламино с 3-8 атомами углерода и бензоиламино; или

X представляет собой радикал формулы: ---A---T---L

где A представляет собой пиридинил, пиримидинил или фенил, причем указанный пиридинил, пиримидинил или фенил может содержать один или два заместителя, выбранных из группы, включающей галоген, алкил с числом атомов углерода 1-6, алкенил с 2-6 атомами углерода, алкинил с 2-6 атомами углерода, азид, гидроксильный алкил с 1-6 атомами углерода, галогенметил, алкоксиметил с 2-7 атомами углерода, алканоилоксиметил с 2-7 атомами углерода, алкокси с 1-6 атомами углерода, алкилтио с 1-6 атомами углерода, гидроксильный, трифторметил, циано, нитро, карбокси, карбоалкокси с 2-7 атомами углерода, карбоалкил с 2-7 атомами углерода, фенокси, фенил, тиофенокси, бензоил, бензил, аминок, алкиламино с 1-6 атомами углерода, диалкиламино с 2-12 атомами углерода, фениламино, бензиламино, алканоиламино с 1-6 атомами углерода, алкеноиламино с 3-8 атомами углерода, алкиноиламино с 3-8 атомами углерода, карбоксиалкил с 2-7 атомами углерода, карбоалкоксиалкил с 3-8 атомами углерода, аминок алкил с 1-5 атомами углерода, N-алкиламиноалкил с 2-9 атомами углерода, N,N-диалкиламиноалкил с 3-10 атомами углерода, N-алкиламиноалкокси с 2-9 атомами углерода, N,N-диалкиламиноалкокси с 3-10 атомами углерода, меркапто и бензоиламино; T связан с атомом углерода, входящим в состав группы A и представляет собой:

$-\text{NH}(\text{CH}_2)_m-$, $-\text{O}(\text{CH}_2)_m-$, $-\text{S}(\text{CH}_2)_m-$, $-\text{NR}(\text{CH}_2)_m-$, $-(\text{CH}_2)_m-$, $-(\text{CH}_2)_m\text{NH}-$, $-(\text{CH}_2)_m\text{O}-$, $-(\text{CH}_2)_m\text{S}-$, или $-(\text{CH}_2)_m\text{NR}-$;

L представляет собой незамещенное фенильное кольцо или фенильное кольцо, содержащее один, два или три заместителя, выбранных из группы, включающей галоген, алкил с 1-6 атомами углерода, алкенил с 2-6 атомами углерода, алкинил с 2-6 атомами углерода, азидо, гидроксильный алкил с 1-6 атомами углерода, галогенметил, алкоксиметил с 2-7 атомами углерода, алканоилоксиметил с 2-7 атомами углерода, алкокси с 1-6 атомами углерода, алкилтио с 1-6 атомами углерода, гидроксильный, трифторметил, циано, нитро, карбокси, карбоалкокси с числом атомов углерода 2-7, карбоалкил с 2-7 атомами углерода, фенокси, фенил, тиофенокси, бензоил, бензил, аминок, алкиламино, с 1-6 атомами углерода, диалкиламино с 2-12 атомами углерода, фениламино, бензиламино, алканоиламино с 1-6 атомами углерода, алкеноиламино с 3-8 атомами углерода, алкиноиламино с 3-8 атомами углерода, карбоксиалкил с 2-7 атомами углерода, карбоалкоксиалкил с 3-8 атомами углерода, аминок алкил с 1-5 атомами углерода, N-алкиламиноалкил с 2-9 атомами углерода, N,N-диалкил

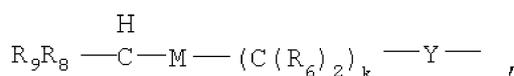
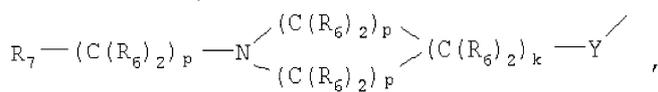
аминоалкил с 3-10 атомами углерода, N-алкиламиноалкокси с 2-9 атомами углерода, N,N-диалкиламиноалкокси с 3-10 атомами углерода, меркапто и бензоиламино, при условии, что L может представлять собой незамещенное фенильное кольцо только в случае, когда m>0 и T не является CH₂NH- или -CH₂O-; или

L представляет собой 5- или 6-членный гетероарил, содержащий от 1 до 3 гетероатомов, выбранных из N, O и S при условии, что указанный гетероцикл не содержит связей O-O, S-S или S-O, и где указанный гетероарил может содержать один или два заместителя, выбранных из группы, включающей галоген, оксо, тио, алкил с 1-6 атомами углерода, алкенил с 2-6 атомами углерода, алкинил с 2-6 атомами углерода, азидо, гидроксилалкил с 1-6 атомами углерода, галогенметил, алкоксиметил с 2-7 атомами углерода, алканоилоксиметил с 2-7 атомами углерода, алкокси с 1-6 атомами углерода, алкилтио с 1-6 атомами углерода, гидрокси, трифторметил, циано, нитро, карбокси, карбоалкокси с 2-7 атомами углерода, карбоалкил с 2-7 атомами углерода, фенокси, фенил, тиофенокси, бензоил, бензил, amino, алкиламино, с 1-6 атомами углерода, диалкиламино с 2-12 атомами углерода, фениламино, бензиламино, алканоиламино с 1-6 атомами углерода, алкеноиламино с 3-8 атомами углерода, алкиноиламино с 3-8 атомами углерода, карбоксиалкил с 2-7 атомами углерода, карбоалкоксиалкил с 3-8 атомами углерода, аминоалкил с 1-5 атомами углерода, N-алкиламиноалкил с 2-9 атомами углерода, N,N-диалкиламиноалкил с 3-10 атомами углерода, N-алкиламиноалкокси с 2-9 атомами углерода, N,N-диалкиламиноалкокси с 3-10 атомами углерода, меркапто и бензоиламино;

Z представляет собой -NH-, -O-, -S-, или -NR-;

R представляет собой алкил с 1-6 атомами углерода или карбоалкил с 2-7 атомами углерода;

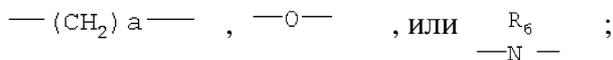
Каждый из G₂, R₁ и R₄ независимо представляет собой водород, галоген, алкил с 1-6 атомами углерода, алкенил с 2-6 атомами углерода, алкинил с 2-6 атомами углерода, алкенилокси с 2-6 атомами углерода, алкинилокси с 2-6 атомами углерода, гидроксиметил, галогенметил, алканоилокси с 1-6 атомами углерода, алкеноилокси с 3-8 атомами углерода, алкиноилокси с 3-8 атомами углерода, алканоилоксиметил с 2-7 атомами углерода, алкеноилоксиметил с 4-9 атомами углерода, алкоксиметил с 2-7 атомами углерода, алкокси с 1-6 атомами углерода, алкилтио с 1-6 атомами углерода, алкилсульфинил с 1-6 атомами углерода, алкилсульфонил с 1-6 атомами углерода, алкилсульфонамидо с 1-6 атомами углерода, алкенилсульфонамидо с 1-6 атомами углерода, алкинилсульфонамидо с 2-6 атомами углерода, гидрокси, трифторметил, трифторметокси, циано, нитро, карбокси, карбоалкокси с 2-7 атомами углерода, карбоалкил с 2-7 атомами углерода, фенокси, фталимид, фенил, тиофенокси, бензил, amino, гидроксиамино, алкоксиамино с 1-4 атомами углерода, алкиламино с 1-6 атомами углерода, диалкиламино с 2-12 атомами углерода, N-алкилкарбамоил, N,Ндиалкилкарбамоил, N-алкил-N-алкениламино с 4-12 атомами углерода, N,Ндиалкениламино с 6-12 атомами углерода, фениламино, бензиламино,



R₇-(C(R₆)₂)_g-Y-, R₇-(C(R₆)₂)_p-M-(C(R₆)₂)_k-Y-, или Het-(C(R₆)₂)_q-W-(C(R₆)₂)-Y-; или

G₂ может представлять собой аминогруппу или R₂-NH-;

Y представляет собой двухвалентный радикал, выбранный из группы, включающей

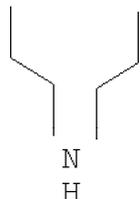


R₇ представляет собой -NR₆R₇, -OR₆, -J, -N(R₆)₃⁺, или -NR₇R₆(OR₆);

M представляет собой >NR₆, -O-, >N-(C(R₆)_p) NR₆R₆, или >N-(C(R₆)₂)_p-OR₆;

W представляет собой >NR₆, -O- или связь;

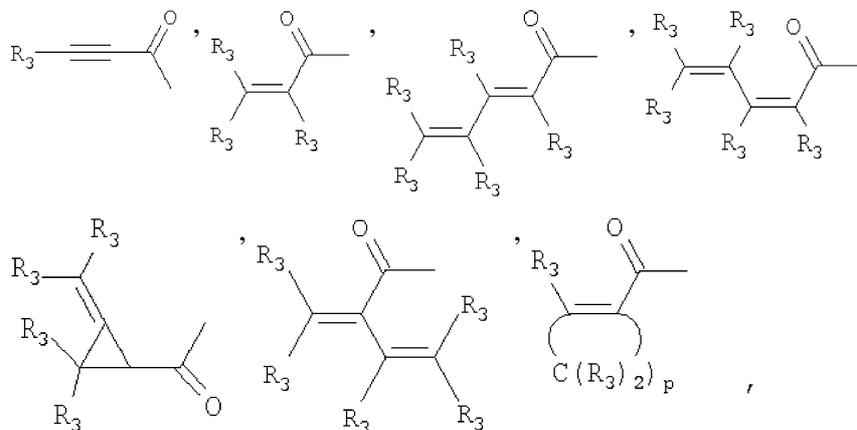
Нет выбран из группы, включающей морфолин, тиоморфолин, тиоморфолин S-оксид, тиоморфолин S,S-диоксид, пиперидин, пирролидин, азиридин, пиридин, имидазол, 1,2,3-триазол, 1,2,4-триазол, тиазол, тиазолидин, тетразол, пиперазин, фуран, тиофен, тетрагидротиофен, тетрагидрофуран, диоксан, 1,3-диоксалан, тетрагидропиран, и (OCH₂CH₂O)_n

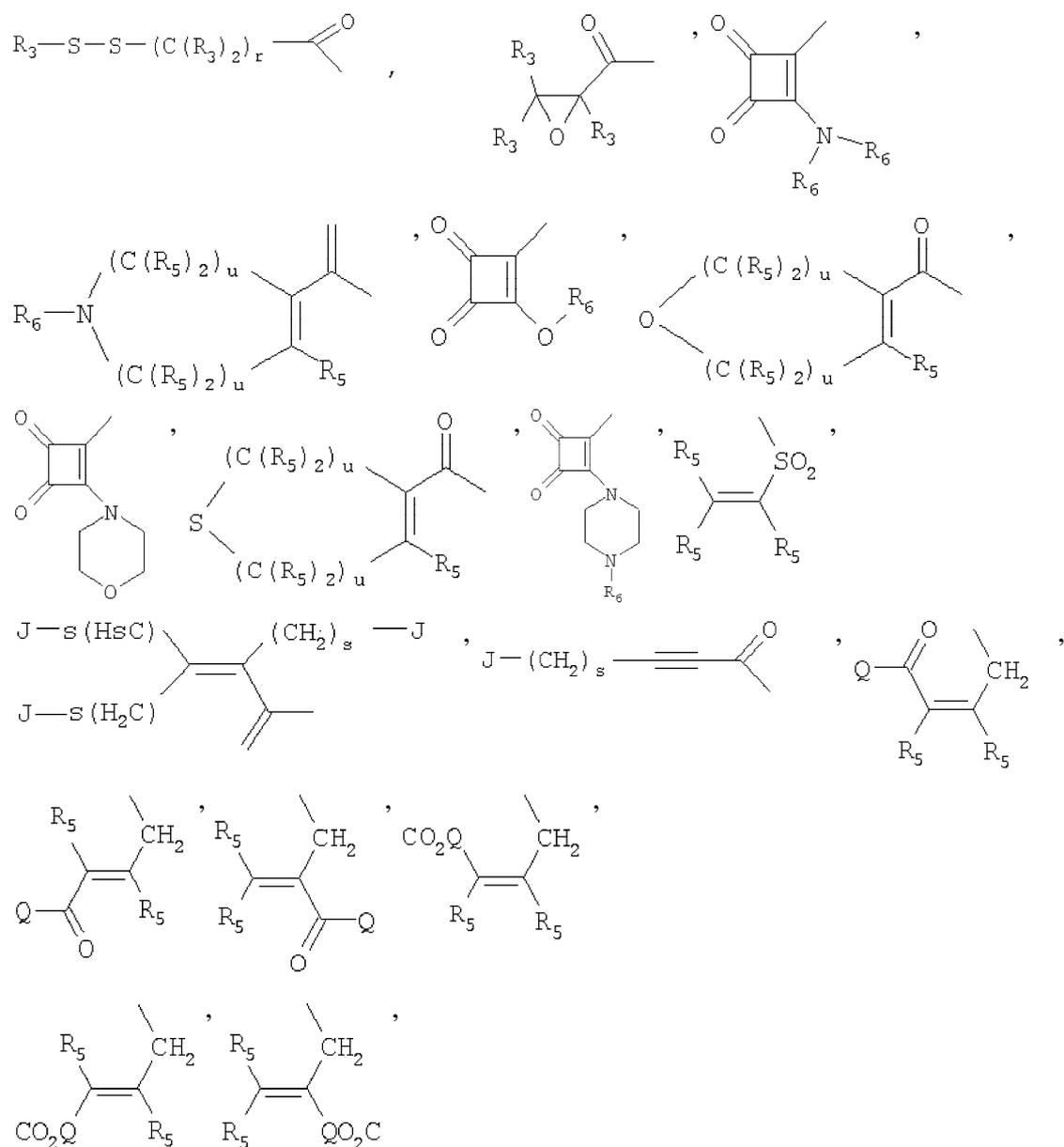


где Нет может содержать один или два заместителя у атомов углерода или азота, один или два заместителя N(R₆)₂, OR₆ или гидроксигруппу у атома углерода, может содержать в качестве заместителя у атома углерода один или два одновалентных радикала -(C(R₆)₂)_sOR₆ или -(C(R₆)₂)_sN(R₆)₂ и может содержать в качестве заместителя у насыщенного атома углерода один или два двухвалентных радикала -O- или -O(C(R₆)₂)_sO-;

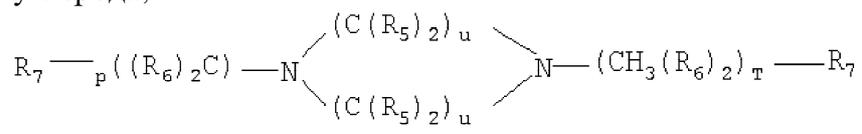
R₆ представляет собой водород, алкил с 1-6 атомами углерода, алкенил с 2-6 атомами углерода, алкинил с 2-6 атомами углерода, циклоалкил с 1-6 атомами углерода, карбоалкил с 2-7 атомами углерода, карбоксиалкил с 2-7 атомами углерода, фенил, фенил, который может содержать в качестве заместителей один или более атом галогена, алкокси с 1-6 атомами углерода, трифторметил, амино, алкиламино с 1-3 атомами углерода, диалкиламино с 2-6 атомами углерода, нитро, циано, азидо, галогенметил, алкоксиметил с 2-7 атомами углерода, алканоилоксиметил с 2-7 атомами углерода, алкилтио с 1-6 атомами углерода, гидроксид, карбоксил, карбоалкокси с 2-7 атомами углерода, фенокси, фенил, тиофенокси, бензоил, бензил, фениламино, бензиламино, алканоиламино с 1-6 атомами углерода или алкил с 1-6 атомами углерода, при условии, что алкенильные или алкинильные заместители связаны с атомом азота или кислорода через насыщенный атом углерода;

R₂, представляет собой одну из следующих групп:



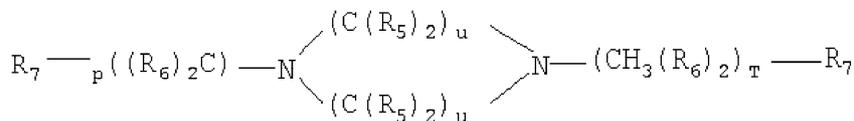


R₃ представляет собой независимо водород, алкил с 1-6 атомами углерода, карбокси, карбоалкокси с 1-6 атомами углерода, фенил, карбоалкил с 2-7 атомами углерода,



R₇-(C(R₆)₂)_s-, R₇-(C(R₆)₂)_p-M-(C(R₇)₂)_r-, R₈R₉-CH-M-(C(R₆)₂)_r-,
 Het-(C(R₆)₂)_q-W-(C(R₆)₂)_r-; аминалкил с 1-6 атомами углерода, N-алкиламиноалкил с 2-9 атомами углерода, N,N-диалкиламиноалкил с 3-12 атомами углерода, N-циклоалкиламиноалкил с 4-12 атомами углерода, N-циклоалкил-N-алкиламиноалкил с 5-18 атомами углерода, N,N-дициклоалкиламиноалкил с 7-18 атомами углерода, морфолино-N-алкил, где алкил содержит от 1 до 6 атомов углерода, пиперидино-N-алкил, где алкил содержит от 1 до 6 атомов углерода, N-алкилпиперидино-N-алкил, где каждый алкил содержит от 1 до 6 атомов углерода;

R₅ независимо представляет собой водород, алкил с 1-6 атомами углерода, карбокси, карбоалкокси с 1-6 атомами углерода, фенил, карбоалкил с 2-7 атомами углерода,



$R_7-(C(R_6)_2)_s$ -, $R_7-(C(R_6)_2)_p-M-(C(R_6)_2)_r$ -, $R_8R_9-CH-M-(C(R_6)_2)_r$ -, или $Het-(C(R_6)_2)_q-W-(C(R_6)_2)_r$ -;

каждый из R_8 , и R_9 независимо представляет собой $-(C(R_6)_2)_rNR_6R_6$, или $-(C(R_6)_2)_rOR_6$;

J независимо представляет собой водород, хлор, фтор или бром;

Q представляет собой алкил с 1-6 с атомами углерода или водород;

a=0 или 1;

g=1-6;

k=0-4;

n=0-1;

m=0-3;

p=2-4;

q=0-4;

r=1-4;

s=1-6;

u=0-4 и v=0-4, где сумма u+v составляет от 2 до 4;

или фармацевтически приемлемая соль указанного соединения, при условии, что:

если R_6 представляет собой алкенил с 2-7 атомами углерода или алкинил с 2-7

атомами углерода, то указанный алкенильный или алкинильный фрагменты связаны с атомом кислорода или азота через насыщенный атом углерода;

а также при условии, что:

если Y представляет собой $-NR_6$ - и R_7 представляет собой $-NR_6R_6-N(R_6)_3^+$, или $-NR_6(OR_6)$, то g=2-6;

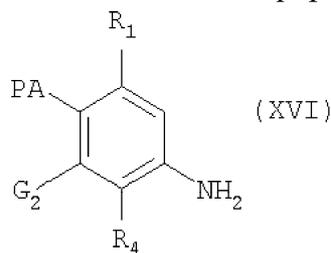
если M представляет собой -O- и R_7 представляет собой $-OR_6$ то p=1-4;

если Y представляет собой $-NR_6$ - то k=2-4;

если Y представляет собой -O- и M или W представляет собой -O- то k=1-4

если W не является связью в случае, когда Het связан с W через атом азота, то q=2-4, и если W представляет собой связь в случае, когда Het связан с W через атом азота и Y представляет собой -O- или $-NR_6$ -, то k=2-4.

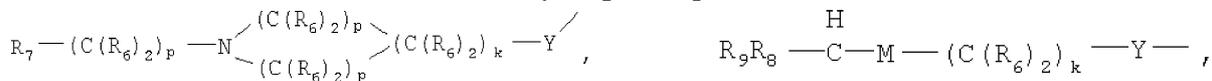
22. Соединение формулы XVI:



где PA представляет собой защищенную аминогруппу;

каждый из заместителей G_2 , R_1 и R_4 независимо представляет собой водород, галоген, алкил с 1-6 атомами углерода, алкенил с 2-6 атомами углерода, алкинил с 2-6 атомами углерода, алкенилокси с 2-6 атомами углерода, алкинилокси с 2-6 атомами углерода, гидроксиметил, галогенметил, алканоилокси с 1-6 атомами углерода, алкеноилокси с 3-8 атомами углерода, алкиноилокси с 3-8 атомами углерода, алканоилоксиметил с 2-7 атомами углерода, алкеноилоксиметил с 4-9 атомами углерода, алкиноилоксиметил с 4-9 атомами углерода, алкоксиметил с 2-7 атомами углерода, алкокси с 1-6 атомами углерода, алкилтио с 1-6 атомами углерода,

алкилсульфинил с 1-6 атомами углерода, алкилсульфонил с 1-6 атомами углерода, алкилсульфонамидо с 1-6 атомами углерода, алкенилсульфонамидо с 1-6 атомами углерода, алкинилсульфонамидо с 2-6 атомами углерода, гидроксид, трифторметил, трифторметокси, циано, нитро, карбокси, карбоалкокси с 2-7 атомами углерода, карбоалкил с 2-7 атомами углерода, фенокси, фталимид, фенил, иофенокси, бензил, amino, гидроксiamino, алкоксиамino с 1-4 атомами углерода, алкиламино с 1-6 атомами углерода, диалкиламино с 2-12 атомами углерода, N-алкилкарбамоил, N,N-диалкилкарбамоил, N-алкил-N-алкениламино с 4-12 атомами углерода, N,N-диалкениламино с 6-12 атомами углерода, фениламино, бензиламино,



$R_7 - (C(R_6)_2)_g - Y -$, $R_7 - (C(R_6)_2)_p - M - (C(R_6)_2)_k - Y -$, или $Het - (C(R_6)_2)_q - W - (C(R_6)_2)_2 - Y -$; или G_2 представляет собой аминогруппу или $R_2 - NH -$;

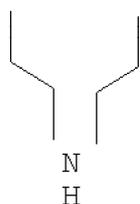
Y представляет собой двухвалентный радикал, выбранный из группы, включающей $-(CH_2)_a -$, $-O -$, или $\overset{R_6}{N} -$;

R_7 представляет собой $-NR_6 R_7$, $-OR_6$, $-J$, $-N(R_6)_3^+$, или $-NR_7 R_6 (OR_6)$;

M представляет собой $>NR_6$, $-O -$, $>N - (C(R_6)_2)_p NR_6 R_6$, или $>N - (C(R_6)_2)_p - OR_6$;

W представляет собой $>NR_6$, $-O -$ или связь;

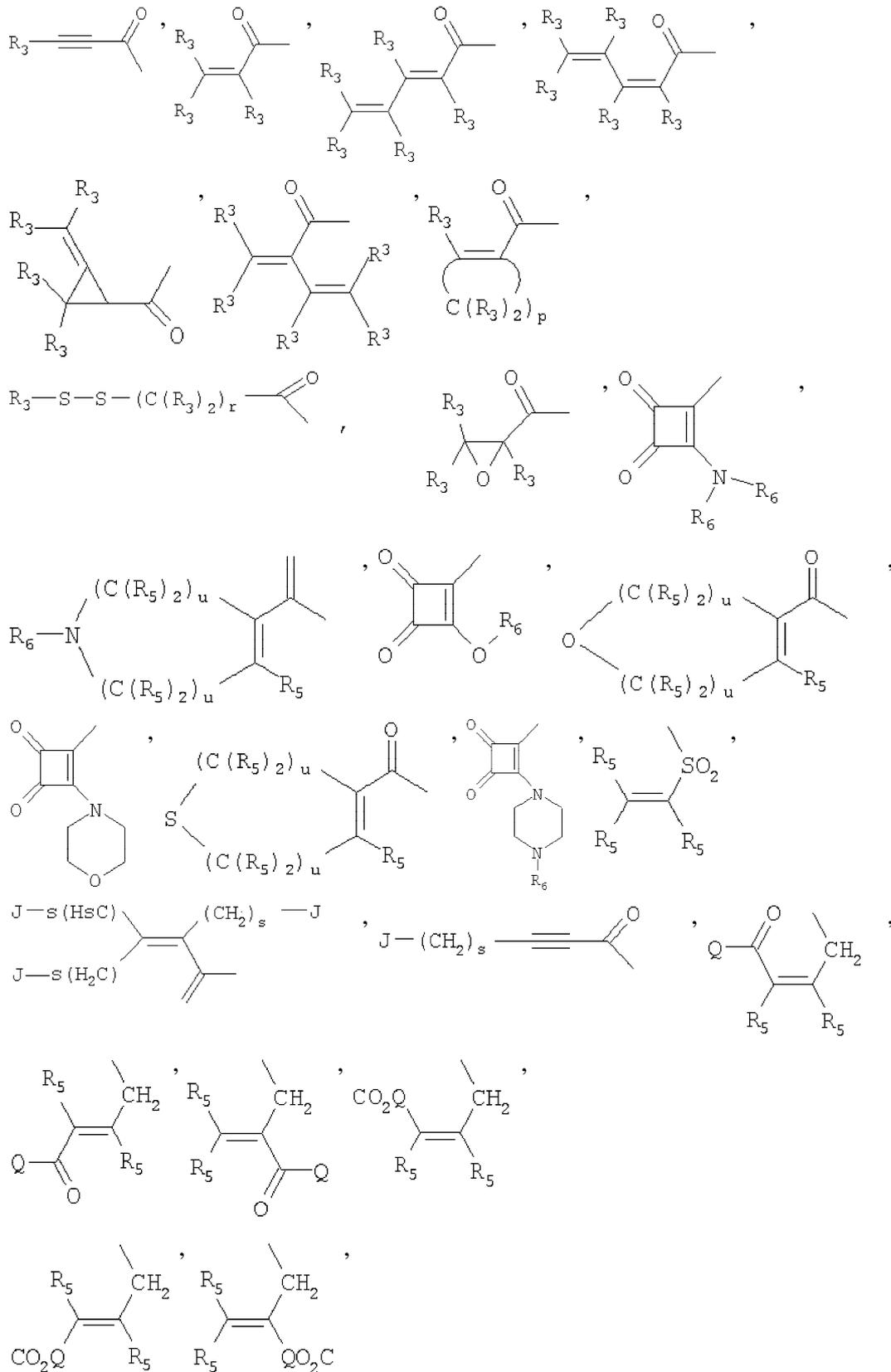
Het выбран из группы, включающей морфолин, тиоморфолин, тиоморфолин S-оксид, тиоморфолин S,S-диоксид, пиперидин, пирролидин, азиридин, пиридин, имидазол, 1,2,3-триазол, 1,2,4-триазол, тиазол, тиазолидин, тетразол, пиперазин, фуран, тиофен, тетрагидротиофен, тетрагидрофуран, диоксан, 1,3-диоксалан, тетрагидропиран, и $(OCH_2CH_2O)_n$



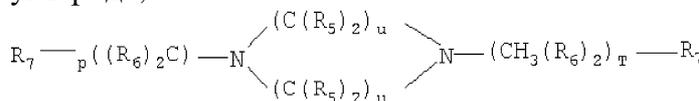
при этом Het может содержать один или два заместителя R_6 у атомов углерода или азота, один или два заместителя $N(R_6)_2$, OR_6 или гидроксигруппу у атома углерода, может содержать в качестве заместителя у атома углерода один или два одновалентных радикала $-(C(R_6)_2)_s OR_6$ или $-(C(R_6)_2)_s N(R_6)_2$ и может содержать в качестве заместителя у насыщенного атома углерода один или два двухвалентных радикала $-O -$ или $-O(C(R_6)_2)_s O -$;

R_6 представляет собой водород, алкил с 1-6 атомами углерода, алкенил с 2-6 атомами углерода, циклоалкил с 1-6 атомами углерода, карбоалкил с 2-7 атомами углерода, карбоксиалкил с 2-7 атомами углерода, фенил, фенил, который может содержать в качестве заместителей один или более атомов галогена, алкокси с 1-6 атомами углерода, трифторметил, amino, алкиламино с 1-3 атомами углерода, диалкиламино с 2-6 атомами углерода, нитро, циано, азидо, галогенметил, алкоксиметил с 2-7 атомами углерода, алканоилоксиметил с 2-7 атомами углерода, алкилтио с 1-6 атомами углерода, гидроксид, карбоксил, карбоалкокси с 2-7 атомами углерода, фенокси, фенил, тиофенокси, бензоил, бензил, фениламино, бензиламино, алканоиламино с 1-6 атомами углерода или алкил с 1-6 атомами углерода, при условии, что алкенильные или алкинильные заместители

связаны с атомом азота или кислорода через насыщенный атом углерода; R₂, выбран из группы, включающей:

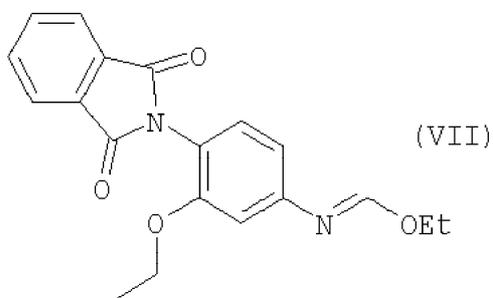


R₃ представляет собой независимо водород, алкил с 1-6 атомами углерода, карбокси, карбоалкокси с 1-6 атомами углерода, фенил, карбоалкил с 2-7 атомами углерода,

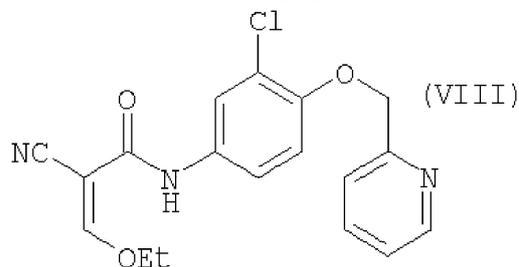


RU 2007139544 A

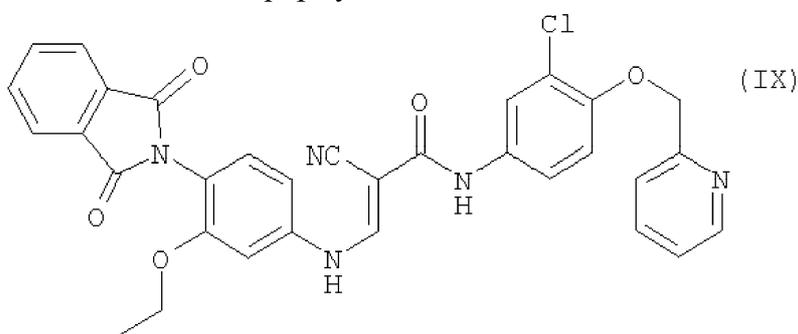
RU 2007139544 A



26. Соединение формулы VIII:

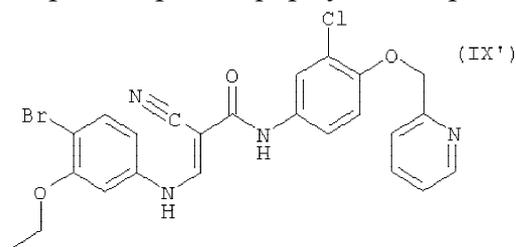


27. Соединение формулы IX:

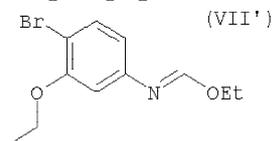


28. Способ по любому из пп.1-4 или 5, отличающийся тем, что G_1 представляет собой галоген, выбранный из F, Cl, Br или I.

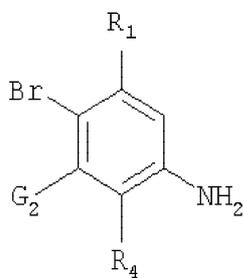
29. Способ по любому из пп.1-4 или 5, отличающийся тем, что указанный N-арил-2-пропен формулы III представляет собой соединение формулы IX':



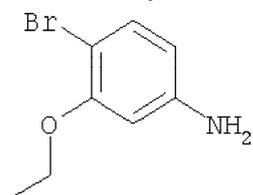
30. Способ по любому из пп.1-4 или 5, отличающийся тем, что указанный N-арилформимидат формулы I представляет собой соединение формулы VII':



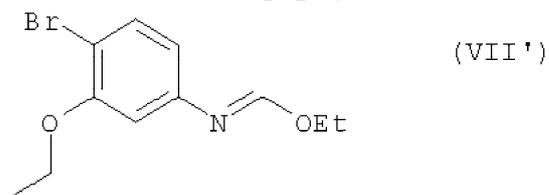
31. Способ по любому из пп.3, 4 или 5, отличающийся тем, что указанный ариламин формулы XIII представляет собой следующее соединение:



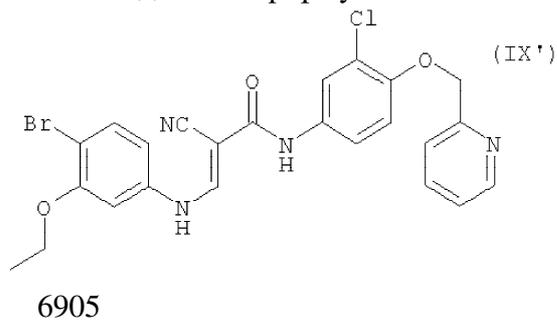
32. Способ по п.31, отличающийся тем, что указанный ариламин представляет собой следующее соединение:



33. Соединение формулы VII':



34. Соединение формулы DC:



A 4 4 5 6 3 1 7 0 0 2 RU

RU 2 0 0 7 1 3 9 5 4 4 A