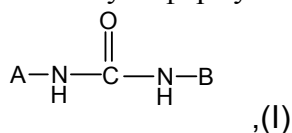
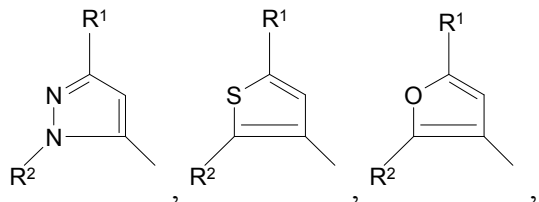


# 1. Сполука формули I та її фармацевтично прийнятні солі



де А являє собою гетероарил, що його вибирають з групи, до якої належать



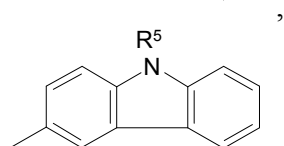
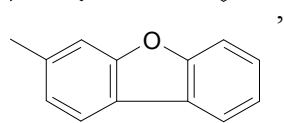
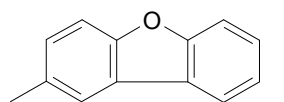
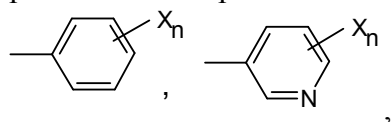
де R<sup>1</sup> вибирають з групи, до якої належать C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> алкіл, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> циклоалкіл, аж до пергалозаміщеного C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> алкілу і аж до пергалозаміщеного C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> циклоалкілу, В являє собою заміщений або незаміщений аж до трициклічного арилу або гетероарилу з кількістю атомів вуглецю до 30 з принаймні однією 5- або 6-членною ароматичною структурою, що містить 0-4 члени з групи, до якої належать азот, кисень та сірка, в якій, якщо В являє собою заміщену групу, її заміщають одним або кількома замісниками, що їх незалежно вибирають з групи, до якої належать галоген, аж до пергалозаміщення, а також X<sub>n</sub>, де n дорівнює 0-3 і кожний Х незалежно вибирають з групи, до якої належать -CN, -CO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>, -C(O)NR<sup>5</sup>R<sup>5'</sup>, -C(O)R<sup>5</sup>, -NO<sub>2</sub>, -OR<sup>5</sup>, -SR<sup>5</sup>, -NR<sup>5</sup>R<sup>5'</sup>, -NR<sup>5</sup>C(O)OR<sup>5'</sup>, -NR<sup>5</sup>C(O)R<sup>5'</sup>, C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> алкіл, C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub> алкеніл, C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> алкокси, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> циклоалкіл, C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub> арил, C<sub>7</sub>-C<sub>24</sub> алкарил, C<sub>3</sub>-C<sub>13</sub> гетероарил, C<sub>4</sub>-C<sub>23</sub> алкгетероарил, заміщений C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> алкіл, заміщений C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub> алкеніл, заміщений C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> алкоксил, заміщений C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> циклоалкіл, заміщений C<sub>4</sub>-C<sub>23</sub> алкгетероарил та -Y-Ag, якщо Х являє собою заміщену групу, її заміщають одним або кількома замісниками, що їх незалежно вибирають з групи, до якої належать -CN, -CO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>, -C(O)R<sup>5</sup>, -C(O)NR<sup>5</sup>R<sup>5'</sup>, -OR<sup>5</sup>, -SR<sup>5</sup>, -NR<sup>5</sup>R<sup>5'</sup>, -NO<sub>2</sub>, -NR<sup>5</sup>C(O)R<sup>5'</sup>, -NR<sup>5</sup>C(O)OR<sup>5'</sup> та галоген аж до пергалозаміщення, де R<sup>5</sup> та R<sup>5'</sup> незалежно вибирають з таких радикалів, як Н, C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> алкіл, C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub> алкеніл, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> циклоалкіл, C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub> арил, C<sub>3</sub>-C<sub>13</sub> гетероарил, C<sub>7</sub>-C<sub>24</sub> алкарил, C<sub>4</sub>-C<sub>23</sub> алкгетероарил, аж до пергалозаміщеного C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> алкілу, аж до пергалозаміщеного C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub> алкенілу, аж до пергалозаміщеного C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> циклоалкілу, аж до пергалозаміщеного C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub> арилу і аж до пергалозаміщеного C<sub>3</sub>-C<sub>13</sub> гетероарилу, де Y являє собою -O-, -S-, -N(R<sup>5</sup>)-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-, -C(O)-, -CH(OH)-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>O-, -NR<sup>5</sup>C(O)NR<sup>5</sup>R<sup>5'</sup>-, -NR<sup>5</sup>C(O)-, -C(O)NR<sup>5</sup>-, -O(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>S-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>N(R<sup>5</sup>)-, -O(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-, -CHX<sup>a</sup>-, -CX<sup>a</sup><sub>2</sub>-, -S-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>- та -N(R<sup>5</sup>)(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-, m = 1-3, а також X<sup>a</sup> являє собою галоген, і Ag являє собою 5-10-членну ароматичну структуру, що містить 0-2 члени з групи, до якої належать азот, кисень та сірка, яка незаміщена або заміщена галогеном аж до пергалозаміщення і як варіант заміщена Z<sub>n1</sub>, де n1 дорівнює від 0 до 3 і кожний радикал Z незалежно вибирають з групи, до якої належать -CN, -CO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>, -C(O)NR<sup>5</sup>R<sup>5'</sup>, -C(O)NR<sup>5</sup>, -NO<sub>2</sub>, -OR<sup>5</sup>, -SR<sup>5</sup>, -NR<sup>5</sup>R<sup>5'</sup>, -NR<sup>5</sup>C(O)OR<sup>5'</sup>, -C(O)R<sup>5</sup>, -NR<sup>5</sup>C(O)R<sup>5'</sup>, C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> алкіл, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> циклоалкіл, C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub> арил, C<sub>3</sub>-C<sub>13</sub> гетероарил, C<sub>7</sub>-C<sub>24</sub> алкарил, C<sub>4</sub>-C<sub>23</sub> алкгетероарил, заміщений C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> алкіл, заміщений C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> циклоалкіл, заміщений C<sub>7</sub>-C<sub>24</sub> алкарил та заміщений C<sub>4</sub>-C<sub>23</sub> алкгетероарил, де якщо Z являє собою заміщену групу, її заміщають одним або кількома замісниками, що їх незалежно вибирають з групи, до якої належать -CN, -CO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>, -C(O)NR<sup>5</sup>R<sup>5'</sup>, -OR<sup>5</sup>, -SR<sup>5</sup>, -NO<sub>2</sub>, -NR<sup>5</sup>R<sup>5'</sup>, -NR<sup>5</sup>C(O)R<sup>5'</sup> та -NR<sup>5</sup>C(O)OR<sup>5'</sup> і де R<sup>2</sup> являє собою C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub> арил, C<sub>3</sub>-C<sub>14</sub> гетероарил, заміщений C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub> арил або заміщений C<sub>3</sub>-C<sub>14</sub> гетероарил, де якщо R<sup>2</sup> являє собою заміщену групу, її заміщають одним або кількома замісниками, що їх незалежно вибирають з групи, до якої належать галоген, аж до пергалозаміщення, і V<sub>n</sub>, де n = 0-3 і кожний радикал V незалежно вибирають з групи, до якої належать -CN, -CO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>, -C(O)NR<sup>5</sup>R<sup>5'</sup>, -OR<sup>5</sup>, -SR<sup>5</sup>, -NR<sup>5</sup>R<sup>5'</sup>, -C(O)R<sup>5</sup>, -OC(O)NR<sup>5</sup>R<sup>5'</sup>, -NR<sup>5</sup>C(O)OR<sup>5'</sup>, -SO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>, -SOR<sup>5</sup>, -NR<sup>5</sup>C(O)OR<sup>5'</sup>, -NO<sub>2</sub>, C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> алкіл, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> циклоалкіл, C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub> арил, C<sub>3</sub>-C<sub>13</sub> гетероарил, C<sub>7</sub>-C<sub>24</sub> алкарил, C<sub>4</sub>-C<sub>24</sub> алкгетероарил, заміщений C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> алкіл, заміщений C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> циклоалкіл,

заміщений  $C_6-C_{14}$  арил, заміщений  $C_3-C_{13}$  гетероарил, заміщений  $C_7-C_{24}$  алкарил та заміщений  $C_4-C_{24}$  алкгетероарил, де якщо V являє собою заміщену групу, її заміщають одним або кількома замісниками, що їх незалежно вибирають з групи, до якої належать галоген, аж до пергалозаміщення,  $-CN$ ,  $-CO_2R^5$ ,  $-C(O)R^5$ ,  $-C(O)NR^5R^{5'}$ ,  $-NR^5R^{5'}$ ,  $-OR^5$ ,  $-SR^5$ ,  $-NR^5C(O)R^{5'}$ ,  $-NR^5C(O)OR^{5'}$  та  $-NO_2$ , де кожний з радикалів  $R^5$  та  $R^{5'}$  незалежно є таким, як описано вище.

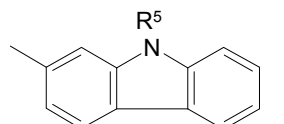
2. Сполука по п. 1, яка **відрізняється** тим, що  $R^2$  являє собою заміщений або незаміщений феніл або піридиніл, а замісники  $R^2$  вибирають з групи, до якої належать галоген, аж до пергалозаміщення, і  $V_n$ , де  $n = 0-3$ , а кожний радикал V незалежно вибирають з групи, до якої належать заміщений та незаміщений  $C_1-C_6$  алкіл,  $C_3-C_{10}$  циклоалкіл,  $C_6-C_{10}$  арил,  $-NO_2$ ,  $-NH_2$ ,  $-C(O)-C_{1-6}$  алкіл,  $-C(O)N-(C_{1-6}$  алкіл) $_2$ ,  $-C(O)NH-C_{1-6}$  алкіл,  $-O-C_{1-6}$  алкіл,  $-NHC(O)H$ ,  $-NHC(O)OH$ ,  $-N(C_{1-6}$  алкіл) $C(O)-C_{1-6}$  алкіл,  $-N-(C_{1-6}$  алкіл) $C(O)-C_{1-6}$  алкіл,  $-NHC(O)-C_{1-6}$  алкіл,  $-OC(O)NHC_{6-14}$  арил,  $-NHC(O)O-C_{1-6}$  алкіл,  $-S(O)-C_{1-6}$  алкіл та  $-SO_2-C_{1-6}$  алкіл,

де якщо V являє собою заміщену групу, її заміщають одним або кількома галогенами, аж до пергалозаміщення.

3. Сполука по п. 2, яка **відрізняється** тим, що радикал В буває у вигляді аж до структури трициклічного ароматичного кільця, що її вибирають з групи, до якої належать



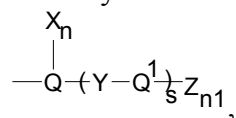
та



заміщена або незаміщена галогеном, аж до пергалозаміщення, і де  $n = 0-3$  і кожний з радикалів X незалежно вибирають з групи, до якої належать  $-CN$ ,  $-C(O)_2R^5$ ,  $-C(O)NR^5R^{5'}$ ,  $-C(O)R^5$ ,  $-NO_2$ ,  $-OR^5$ ,  $-SR^5$ ,  $-NR^5R^{5'}$ ,  $-NR^5C(O)OR^{5'}$ ,  $-NR^5C(O)R^{5'}$ ,  $C_1-C_{10}$  алкіл,  $C_2-C_{10}$  алкеніл,  $C_1-C_{10}$  алкокси,  $C_3-C_{10}$  циклоалкіл,  $C_6-C_{14}$  арил,  $C_7-C_{24}$  алкарил,  $C_3-C_{13}$  гетероарил,  $C_4-C_{23}$  алкгетероарил, а також заміщений  $C_1-C_{10}$  алкіл, заміщений  $C_2-C_{10}$  алкеніл, заміщений  $C_1-C_{10}$  алкокси, заміщений  $C_3-C_{10}$  циклоалкіл, заміщений  $C_4-C_{23}$  алкгетероарил та  $Y-Ar$ ; де якщо X являє собою заміщену групу, її заміщають одним або кількома замісниками, що їх незалежно вибирають з групи, до якої належать  $-CN$ ,  $-CO_2R^5$ ,  $-C(O)R^5$ ,  $-C(O)NR^5R^{5'}$ ,  $-OR^5$ ,  $-SR^5$ ,  $-NR^5R^{5'}$ ,  $-NO_2$ ,  $-NR^5C(O)R^{5'}$ ,  $-NR^5C(O)OR^{5'}$  та галоген аж до пергалозаміщення, де  $R^5$  та  $R^{5'}$  незалежно вибирають з таких радикалів, як H,  $C_1-C_{10}$  алкіл,  $C_2-C_{10}$  алкеніл,  $C_3-C_{10}$  циклоалкіл,  $C_6-C_{14}$  арил,  $C_3-C_{13}$  гетероарил,  $C_7-C_{24}$  алкарил,  $C_4-C_{23}$  алкгетероарил, аж до пергалозаміщеного  $C_1-C_{10}$  алкілу, аж до пергалозаміщеного  $C_2-C_{10}$  алкенілу, аж до пергалозаміщеного  $C_3-C_{10}$  циклоалкілу, аж до пергалозаміщеного  $C_6-C_{14}$  арилу і аж до пергалозаміщеного  $C_3-C_{13}$  гетероарилу, де Y являє собою  $-O-$ ,  $-S-$ ,  $-N(R^5)-$ ,  $-(CH_2)_m-$ ,  $-C(O)-$ ,  $-CH(OH)-$ ,  $-(CH_2)_mO-$ ,  $-NR^5C(O)NR^5R^{5'}$ ,  $-NR^5C(O)-$ ,  $-C(O)NR^5-$ ,  $-(CH_2)_mS-$ ,  $-(CH_2)_mN(R^5)-$ ,  $-O(CH_2)_m-$ ,  $-CHX^a-$ ,  $-CX^a_2-$ ,  $-S-(CH_2)_m-$  та  $-N(R^5)(CH_2)_m-$ ,  $m = 1-3$ , а  $X^a$  являє

собою галоген, Ag являє собою 5-10-членну ароматичну структуру, що містить 0-2 члени з групи, до якої належать азот, кисень та сірка, яку не заміщують або заміщують галогеном аж до пергалозаміщення і як варіант заміщена  $Z_{n1}$ , де  $n1$  дорівнює від 0 до 3 і кожний радикал  $Z$  незалежно вибирають з групи, до якої належать  $-CN$ ,  $-CO_2R^5$ ,  $-C(O)NR^5R^{5'}$ ,  $-C(O)R^5$ ,  $-NO_2$ ,  $-OR^5$ ,  $-SR^5$ ,  $-NR^5R^{5'}$ ,  $-NR^5C(O)OR^{5'}$ ,  $-NR^5C(O)R^{5'}$ ,  $C_1-C_{10}$  алкіл,  $C_3-C_{10}$  циклоалкіл,  $C_6-C_{14}$  арил,  $C_3-C_{13}$  гетероарил,  $C_7-C_{24}$  алкарил,  $C_4-C_{23}$  алкгетероарил, заміщений  $C_1-C_{10}$  алкіл, заміщений  $C_3-C_{10}$  циклоалкіл, заміщений  $C_7-C_{24}$  алкарил та заміщений  $C_4-C_{23}$  алкгетероарил; де якщо  $Z$  являє собою заміщену групу, її заміщають одним або кількома замісниками, що їх незалежно вибирають з групи, до якої належать  $-CN$ ,  $-CO_2R^5$ ,  $-C(O)NR^5R^{5'}$ ,  $-OR^5$ ,  $-SR^5$ ,  $-NO_2$ ,  $-NR^5R^{5'}$ ,  $-NR^5C(O)R^{5'}$  та  $-NR^5C(O)OR^{5'}$ .

4. Сполука по п. 1, яка **відрізняється** тим, що  $B$  являє собою



де  $Y$  вибирають з групи, до якої належать  $-O-$ ,  $-S-$ ,  $-CH_2-$ ,  $-SCH_2-$ ,  $-CH_2S-$ ,  $-CH(OH)-$ ,  $-C(O)-$ ,  $-CX^a_2$ ,  $-CX^aH-$ ,  $-CH_2O-$  та  $-OCH_2-$ ,  $X^a$  являє собою галоген,  $Q$  являє собою шестичленну ароматичну структуру, що містить 0-2 атоми азоту, заміщену або незаміщену галогеном, аж до пергалозаміщення,  $Q^1$  являє собою моно- або біциклічну ароматичну структуру з 3-10 атомами вуглецю і 0-4 членами групи, до якої належать  $N$ ,  $O$  та  $S$ , незаміщений або заміщений галогеном, аж до пергалозаміщення,  $X$ ,  $Z$ ,  $n$  та  $n1$  є по п. 1, а  $s = 0$  або 1.

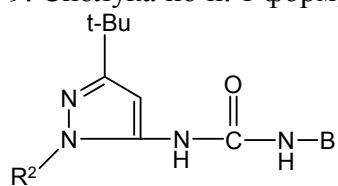
5. Сполука по п. 4, яка **відрізняється** тим, що  $Q$  являє собою феніл або піридиніл, заміщений або незаміщений галогеном, аж до пергалозаміщення,  $Q^1$  вибирають з групи, до якої належать феніл, піридиніл, нафтил, піримідиніл, хінолін, ізохінолін, імідазол та бензотіазоліл, заміщений або незаміщений галогеном, аж до пергалозаміщення, або  $Y-Q^1$  являє собою фталімідиніл, заміщений або незаміщений галогеном, аж до пергалозаміщення, і  $Z$  та  $X$  незалежно вибирають з групи, до якої належать  $-R^6$ ,  $-OR^6$  та  $-NHR^7$ , де  $R^6$  являє собою водень,  $C_1-C_{10}$  алкіл або  $C_3-C_{10}$  циклоалкіл і  $R^7$  вибирають з групи, до якої належать водень,  $C_3-C_{10}$  алкіл,  $C_3-C_6$ -циклоалкіл та  $C_6-C_{10}$ -арил, де  $R^6$  та  $R^7$  або заміщають галогеном, або заміщають аж до пергалозаміщення.

6. Сполука по п. 1, яка **відрізняється** тим, що  $R^1$  являє собою  $t$ -бутил і  $R^2$  являє собою незаміщений або заміщений феніл.

7. Сполука по п. 4, яка **відрізняється** тим, що  $Q$  являє собою феніл,  $Q^1$  являє собою феніл або піридиніл,  $Y$  являє собою  $-O-$ ,  $-S-$  або  $-CH_2-$  і  $X$  та  $Z$  незалежно являють собою  $Cl$ ,  $F$ ,  $NO_2$  або  $CF_3$ .

8. Сполука по п. 7, яка **відрізняється** тим, що  $R^1$  являє собою  $t$ -бутил.

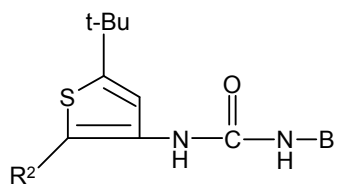
9. Сполука по п. 1 формули



яка **відрізняється** тим, що  $B$  та  $R^2$  є по п. 1.

10. Сполука по п. 9, в якій  $R^2$  вибирають із заміщених та незаміщених членів групи, до якої належать феніл та піридиніл, яка **відрізняється** тим, що якщо  $R^2$  являє собою заміщену групу, її заміщають одним або кількома замісниками, що їх вибирають з групи, до якої належать галоген та  $W_n$ , де  $n = 0-3$ , і  $W$  вибирають з групи, до якої належать  $-NO_2$ ,  $-C_{1-3}$  алкіл,  $-NH(O)CH_3$ ,  $-CF_3$ ,  $-OCH_3$ ,  $-F$ ,  $-Cl$ ,  $-NH_2$ ,  $-OC(O)NH-$  аж до пергалозаміщеного фенілу,  $-SO_2CH_3$ , піридиніл, феніл, аж до пергалозаміщеного фенілу, і заміщений  $C_1-C_6$  алкілом феніл.

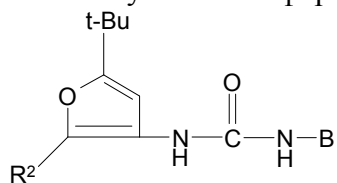
11. Сполука по п. 1 формули



де В та  $R^2$  є по п. 1.

12. Сполука по п. 11, в якій  $R^2$  вибирають із заміщених та незаміщених членів групи, до якої належать феніл та піридиніл, яка **відрізняється** тим, що якщо  $R^2$  являє собою заміщену групу, її заміщають одним або кількома замісниками, що їх вибирають з групи, до якої належать галоген та  $W_n$ , де  $n = 0-3$ , і  $W$  вибирають з групи, до якої належать  $-\text{NO}_2$ ,  $-\text{C}_{1-3}$  алкіл,  $-\text{NH}(\text{O})\text{CH}_3$ ,  $-\text{CF}_3$ ,  $-\text{OCH}_3$ ,  $-\text{F}$ ,  $-\text{Cl}$ ,  $-\text{NH}_2$ ,  $-\text{SO}_2\text{CH}_3$ , піридиніл, феніл, аж до пергалозаміщеного фенілу, і заміщений  $\text{C}_1\text{-C}_6$  алкілом феніл.

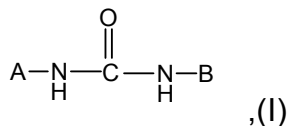
13. Сполука по п. 1 формули



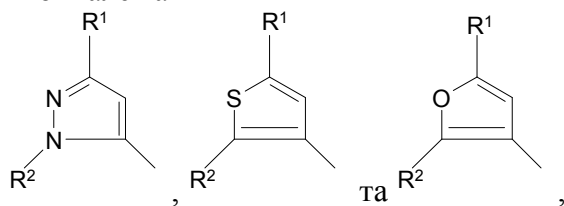
яка **відрізняється** тим, що В та  $R^2$  є по п. 1.

14. Сполука по п. 13, в якій  $R^2$  вибирають із заміщених та незаміщених членів групи, до якої належать феніл та піридиніл, яка **відрізняється** тим, що якщо  $R^2$  являє собою заміщену групу, її заміщають одним або кількома замісниками, що їх вибирають з групи, до якої належать галоген та  $W_n$ , де  $n = 0-3$ , і  $W$  вибирають з групи, до якої належать  $-\text{NO}_2$ ,  $-\text{C}_{1-3}$  алкіл,  $-\text{NH}(\text{O})\text{CH}_3$ ,  $-\text{CF}_3$ ,  $-\text{OCH}_3$ ,  $-\text{F}$ ,  $-\text{Cl}$ ,  $-\text{NH}_2$ ,  $-\text{SO}_2\text{CH}_3$ , піридиніл, феніл, аж до пергалозаміщеного фенілу, і заміщений  $\text{C}_1\text{-C}_6$  алкілом феніл.

15. Спосіб лікування захворювання, спричиненого кіназою RAF, який полягає у тому, що включає введення сполуки формули I або її фармацевтично прийнятної солі:



який **відрізняється** тим, що А являє собою гетероарил, що його вибирають з групи, до якої належать



де  $R^1$  вибирають з групи, до якої належать  $\text{C}_3\text{-C}_{10}$  алкіл,  $\text{C}_3\text{-C}_{10}$  циклоалкіл, аж до пергалозаміщеного  $\text{C}_1\text{-C}_6$  алкілу і аж до пергалозаміщеного  $\text{C}_3\text{-C}_{10}$  циклоалкілу;

В являє собою заміщений або незаміщений, аж до трициклічного, арил або гетероарил з кількістю атомів вуглецю до 30 і з принаймні однією 5- або 6-членною ароматичною структурою, що містить 0-4 члени групи, до якої належать азот, кисень та сірка, де якщо В являє собою заміщену групу, її заміщають одним або кількома замісниками, що їх незалежно вибирають з групи, до якої належать галоген, аж до пергалозаміщення, а також  $X_n$ , де  $n$  дорівнює 0-3 і кожний з радикалів  $X$  незалежно вибирають із групи, до якої належать  $-\text{CN}$ ,  $-\text{CO}_2R^5$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^5R^{5'}$ ,  $-\text{C}(\text{O})R^5$ ,  $-\text{NO}_2$ ,  $-\text{OR}^5$ ,  $-\text{SR}^5$ ,  $-\text{NR}^5R^{5'}$ ,  $-\text{NR}^5\text{C}(\text{O})\text{OR}^{5'}$ ,  $-\text{NR}^5\text{C}(\text{O})R^{5'}$ ,  $\text{C}_1\text{-C}_{10}$  алкіл,  $\text{C}_{2-10}$  алкеніл,  $\text{C}_{1-10}$  алкокси,  $\text{C}_3\text{-C}_{10}$  циклоалкіл,  $\text{C}_6\text{-C}_{14}$  арил,  $\text{C}_7\text{-C}_{24}$  алкарил,  $\text{C}_3\text{-C}_{13}$  гетероарил,  $\text{C}_4\text{-C}_{23}$  алкгетероарил, заміщений  $\text{C}_1\text{-C}_{10}$  алкіл, заміщений  $\text{C}_2\text{-C}_{10}$  алкеніл, заміщений  $\text{C}_1\text{-C}_{10}$  алкокси, заміщений  $\text{C}_3\text{-C}_{10}$  циклоалкіл, заміщений  $\text{C}_4\text{-C}_{23}$  алкгетероарил та  $-\text{Y-Ag}$ , де  $X$  являє собою заміщену групу, її заміщають одним або

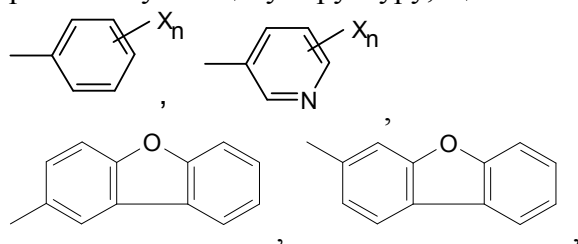
кількома замісниками, що їх незалежно вибирають з групи, до якої належать  $-\text{CN}$ ,  $-\text{CO}_2\text{R}^5$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{R}^5$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^5\text{R}^{5'}$ ,  $-\text{OR}^5$ ,  $-\text{SR}^5$ ,  $-\text{NR}^5\text{R}^{5'}$ ,  $-\text{NO}_2$ ,  $-\text{NR}^5\text{C}(\text{O})\text{R}^{5'}$ ,  $-\text{NR}^5\text{C}(\text{O})\text{OR}^{5'}$  та галоген аж до пергалозаміщення, де  $\text{R}^5$  та  $\text{R}^{5'}$  незалежно вибирають з таких радикалів, як  $\text{H}$ ,  $\text{C}_1\text{-C}_{10}$  алкіл,  $\text{C}_{2-10}$  алкеніл,  $\text{C}_3\text{-C}_{10}$  циклоалкіл,  $\text{C}_6\text{-C}_{14}$  арил,  $\text{C}_3\text{-C}_{13}$  гетероарил,  $\text{C}_7\text{-C}_{24}$  алкарил,  $\text{C}_4\text{-C}_{23}$  алкгетероарил, аж до пергалозаміщеного  $\text{C}_1\text{-C}_{10}$  алкілу, аж до пергалозаміщеного  $\text{C}_2\text{-C}_{10}$  алкенілу, аж до пергалозаміщеного  $\text{C}_3\text{-C}_{10}$  циклоалкілу, аж до пергалозаміщеного  $\text{C}_6\text{-C}_{14}$  арилу і аж до пергалозаміщеного  $\text{C}_3\text{-C}_{13}$  гетероарилу, де  $\text{Y}$  являє собою  $-\text{O}-$ ,  $-\text{S}-$ ,  $-\text{N}(\text{R}^5)-$ ,  $-(\text{CH}_2)_m-$ ,  $-\text{C}(\text{O})-$ ,  $-\text{CH}(\text{OH})-$ ,  $-(\text{CH}_2)_m\text{O}-$ ,  $-(\text{CH}_2)_m\text{S}-$ ,  $-(\text{CH}_2)_m\text{N}(\text{R}^5)-$ ,  $-\text{O}(\text{CH}_2)_m-$ ,  $-\text{CHX}^a-$ ,  $-\text{CX}^a_2-$ ,  $-\text{S}-(\text{CH}_2)_m-$  та  $-\text{N}(\text{R}^5)(\text{CH}_2)_m-$ ,  $m = 1-3$ , і  $\text{X}^a$  являє собою галоген;

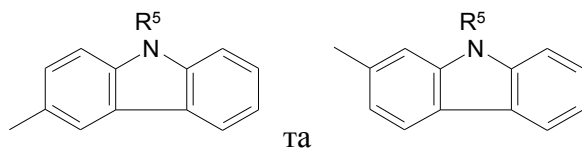
і

$\text{Ag}$  являє собою 5- або 6-членну ароматичну структуру, що містить 0-2 члени групи, до якої належать азот, кисень та сірка, яку не заміщають або заміщають галогеном аж до пергалозаміщення і як варіант заміщають  $\text{Z}_{n1}$ , де  $n1$  дорівнює від 0 до 3 і кожний радикал  $\text{Z}$  незалежно вибирають з групи, до якої належать  $-\text{CN}$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{R}^5$ ,  $-\text{CO}_2\text{R}^5$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^5\text{R}^{5'}$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^5$ ,  $-\text{NO}_2$ ,  $-\text{OR}^5$ ,  $-\text{SR}^5$ ,  $-\text{NR}^5\text{R}^{5'}$ ,  $-\text{NR}^5\text{C}(\text{O})\text{OR}^{5'}$ ,  $-\text{NR}^5\text{C}(\text{O})\text{R}^{5'}$ ,  $\text{C}_1\text{-C}_{10}$  алкіл,  $\text{C}_3\text{-C}_{10}$  циклоалкіл,  $\text{C}_6\text{-C}_{14}$  арил,  $\text{C}_3\text{-C}_{13}$  гетероарил,  $\text{C}_7\text{-C}_{24}$  алкарил,  $\text{C}_4\text{-C}_{23}$  алкгетероарил, заміщений  $\text{C}_1\text{-C}_{10}$  алкіл, заміщений  $\text{C}_3\text{-C}_{10}$  циклоалкіл, заміщений  $\text{C}_7\text{-C}_{24}$  алкарил та заміщений  $\text{C}_4\text{-C}_{23}$  алкгетероарил, де якщо  $\text{Z}$  являє собою заміщену групу, її заміщають одним або кількома замісниками, що їх незалежно вибирають з групи, до якої належать  $-\text{CN}$ ,  $-\text{CO}_2\text{R}^5$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^5\text{R}^{5'}$ ,  $-\text{OR}^5$ ,  $-\text{SR}^5$ ,  $-\text{NO}_2$ ,  $-\text{NR}^5\text{R}^{5'}$ ,  $-\text{NR}^5\text{C}(\text{O})\text{R}^{5'}$  та  $-\text{NR}^5\text{C}(\text{O})\text{OR}^{5'}$ , і де  $\text{R}^2$  являє собою  $\text{C}_6\text{-C}_{14}$  арил,  $\text{C}_3\text{-C}_{14}$  гетероарил, заміщений  $\text{C}_6\text{-C}_{14}$  арил або заміщений  $\text{C}_3\text{-C}_{14}$  гетероарил, де якщо  $\text{R}^2$  являє собою заміщену групу, її заміщають одним або кількома замісниками, що їх незалежно вибирають з групи, до якої належать галоген, аж до пергалозаміщення, і  $\text{V}_n$ , де  $n = 0-3$  і кожний радикал  $\text{V}$  незалежно вибирають з групи, до якої належать  $-\text{CN}$ ,  $-\text{CO}_2\text{R}^5$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^5\text{R}^{5'}$ ,  $-\text{OR}^5$ ,  $-\text{SR}^5$ ,  $-\text{NR}^5\text{R}^{5'}$ ,  $-\text{OC}(\text{O})\text{NR}^5\text{R}^{5'}$ ,  $-\text{NR}^5\text{C}(\text{O})\text{OR}^{5'}$ ,  $-\text{NR}^5\text{C}(\text{O})\text{OR}^{5'}$ ,  $-\text{SO}_2\text{R}^5$ ,  $-\text{SOR}^5$ ,  $-\text{NR}^5\text{C}(\text{O})\text{R}^{5'}$ ,  $-\text{NO}_2$ ,  $\text{C}_1\text{-C}_{10}$  алкіл,  $\text{C}_3\text{-C}_{10}$  циклоалкіл,  $\text{C}_6\text{-C}_{14}$  арил,  $\text{C}_3\text{-C}_{13}$  гетероарил,  $\text{C}_7\text{-C}_{24}$  алкарил,  $\text{C}_4\text{-C}_{24}$  алкгетероарил, заміщений  $\text{C}_1\text{-C}_{10}$  алкіл, заміщений  $\text{C}_3\text{-C}_{10}$  циклоалкіл, заміщений  $\text{C}_6\text{-C}_{14}$  арил, заміщений  $\text{C}_3\text{-C}_{13}$  гетероарил, заміщений  $\text{C}_7\text{-C}_{24}$  алкарил та заміщений  $\text{C}_4\text{-C}_{24}$  алкгетероарил, де  $\text{V}$  являє собою заміщену групу, її заміщають одним або кількома замісниками, що їх незалежно вибирають з групи, до якої належать галоген, аж до пергалозаміщення,  $-\text{CN}$ ,  $-\text{CO}_2\text{R}^5$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{R}^5$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^5\text{R}^{5'}$ ,  $-\text{NR}^5\text{R}^{5'}$ ,  $-\text{OR}^5$ ,  $-\text{SR}^5$ ,  $-\text{NR}^5\text{C}(\text{O})\text{R}^{5'}$ ,  $-\text{NR}^5\text{C}(\text{O})\text{OR}^{5'}$  та  $-\text{NO}_2$ , де кожний з радикалів  $\text{R}^5$  та  $\text{R}^{5'}$  незалежно є таким, як описано вище.

16. Спосіб по п. 15, який **відрізняється** тим, що  $\text{R}^2$  вибирають із заміщених або незаміщених членів групи, до якої належать феніл та піридиніл, а замісники  $\text{R}^2$  вибирають з групи, до якої належать галоген, аж до пергалозаміщення, і  $\text{V}_n$ , де  $n = 0-3$ , а кожний з радикалів  $\text{V}$  незалежно вибирають із групи, до якої належать заміщений та незаміщений  $\text{C}_1\text{-C}_6$  алкіл,  $\text{C}_3\text{-C}_{10}$  циклоалкіл,  $\text{C}_6\text{-C}_{10}$  арил,  $-\text{NO}_2$ ,  $-\text{NH}_2$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{-C}_{1-6}$  алкіл,  $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{C}_{1-6}\text{ алкіл})_2$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{NH-C}_{1-6}$  алкіл,  $-\text{O-C}_{1-6}$  алкіл,  $-\text{NHC}(\text{O})\text{H}$ ,  $-\text{NHC}(\text{O})\text{OH}$ ,  $-\text{N}(\text{C}_{1-6}\text{ алкіл})\text{C}(\text{O})\text{-C}_{1-6}$  алкіл,  $-\text{N}(\text{C}_{1-6}\text{ алкіл})\text{C}(\text{O})\text{-C}_{1-6}$  алкіл,  $-\text{NHC}(\text{O})\text{-C}_{1-6}$  алкіл,  $-\text{NHC}(\text{O})\text{O-C}_{1-6}$  алкіл,  $-\text{S}(\text{O})\text{-C}_{1-6}$  алкіл та  $-\text{SO}_2\text{-C}_{1-6}$  алкіл, який **відрізняється** тим, що якщо  $\text{V}$  являє собою заміщену групу, її заміщають одним або кількома галогенами, аж до пергалозаміщення.

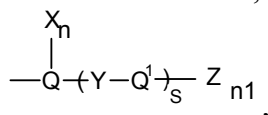
17. Спосіб по п. 15, який **відрізняється** тим, що  $\text{V}$  являє собою максимум трициклічну ароматичну кільцеву структуру, що її вибирають з групи, до якої належать





яку заміщають або не заміщають галогеном, аж до пергалозаміщення, і де  $n = 0-3$  і кожний з радикалів  $X$  незалежно вибирають з групи, до якої належать  $-\text{CN}$ ,  $-\text{CO}_2\text{R}^5$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^5\text{R}^{5'}$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{R}^5$ ,  $-\text{NO}_2$ ,  $-\text{OR}^5$ ,  $-\text{SR}^5$ ,  $-\text{NR}^5\text{R}^{5'}$ ,  $-\text{NR}^5\text{C}(\text{O})\text{OR}^{5'}$ ,  $-\text{NR}^5\text{C}(\text{O})\text{R}^{5'}$ ,  $\text{C}_1\text{-C}_{10}$  алкіл,  $\text{C}_2\text{-C}_{10}$  алкеніл,  $\text{C}_1\text{-C}_{10}$  алкокси,  $\text{C}_3\text{-C}_{10}$  циклоалкіл,  $\text{C}_6\text{-C}_{14}$  арил,  $\text{C}_7\text{-C}_{24}$  алкаріл,  $\text{C}_3\text{-C}_{13}$  гетероарил,  $\text{C}_4\text{-C}_{23}$  алкгетероарил, а також заміщений  $\text{C}_1\text{-C}_{10}$  алкіл, заміщений  $\text{C}_2\text{-C}_{10}$  алкеніл, заміщений  $\text{C}_1\text{-C}_{10}$  алкокси, заміщений  $\text{C}_3\text{-C}_{10}$  циклоалкіл, заміщений  $\text{C}_4\text{-C}_{23}$  алкгетероарил і  $\text{Y-Ag}$ ; де якщо  $X$  являє собою заміщену групу, її заміщають одним або кількома замісниками, що їх незалежно вибирають з групи, до якої належать  $-\text{CN}$ ,  $-\text{CO}_2\text{R}^5$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{R}^5$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^5\text{R}^{5'}$ ,  $-\text{OR}^5$ ,  $-\text{SR}^5$ ,  $-\text{NR}^5\text{R}^{5'}$ ,  $-\text{NO}_2$ ,  $-\text{NR}^5\text{C}(\text{O})\text{R}^{5'}$ ,  $-\text{NR}^5\text{C}(\text{O})\text{OR}^{5'}$  та галоген аж до пергалозаміщення, де  $\text{R}^5$  та  $\text{R}^{5'}$  незалежно вибирають з таких радикалів, як  $\text{H}$ ,  $\text{C}_1\text{-C}_{10}$  алкіл,  $\text{C}_2\text{-C}_{10}$  алкеніл,  $\text{C}_3\text{-C}_{10}$  циклоалкіл,  $\text{C}_6\text{-C}_{14}$  арил,  $\text{C}_3\text{-C}_{13}$  гетероарил,  $\text{C}_7\text{-C}_{24}$  алкаріл,  $\text{C}_4\text{-C}_{23}$  алкгетероарил, аж до пергалозаміщеного  $\text{C}_1\text{-C}_{10}$  алкілу, аж до пергалозаміщеного  $\text{C}_2\text{-C}_{10}$  алкенілу, аж до пергалозаміщеного  $\text{C}_3\text{-C}_{10}$  циклоалкілу, аж до пергалозаміщеного  $\text{C}_6\text{-C}_{14}$  арилу і аж до пергалозаміщеного  $\text{C}_3\text{-C}_{13}$  гетероарили, де  $\text{Y}$  являє собою  $-\text{O}-$ ,  $-\text{S}-$ ,  $-\text{N}(\text{R}^5)-$ ,  $-(\text{CH}_2)_m-$ ,  $-\text{C}(\text{O})-$ ,  $-\text{CH}(\text{OH})-$ ,  $-(\text{CH}_2)_m\text{O}-$ ,  $-\text{NR}^5\text{C}(\text{O})\text{NR}^5\text{R}^{5'}$ ,  $-\text{NR}^5\text{C}(\text{O})-$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^5-$ ,  $-(\text{CH}_2)_m\text{S}-$ ,  $-(\text{CH}_2)_m\text{N}(\text{R}^5)-$ ,  $-\text{O}(\text{CH}_2)_m-$ ,  $-\text{CHX}^a-$ ,  $-\text{CX}^a_2-$ ,  $-\text{S}(\text{CH}_2)_m-$  та  $-\text{N}(\text{R}^5)(\text{CH}_2)_m-$ ,  $m = 1-3$ , а  $\text{X}^a$  являє собою галоген; і  $\text{Ag}$  являє собою 5-10-членну ароматичну структуру, що містить 0-2 члени групи, до якої належать азот, кисень та сірка, який незаміщений або заміщений галогеном аж до пергалозаміщення і як варіант заміщений  $\text{Z}_{n1}$ , де  $n1$  дорівнює від 0 до 3 і кожний із радикалів  $\text{Z}$  незалежно вибирають з групи, до якої належать  $-\text{CN}$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{R}^5$ ,  $-\text{CO}_2\text{R}^5$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^5\text{R}^{5'}$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{R}^5$ ,  $-\text{NO}_2$ ,  $-\text{OR}^5$ ,  $-\text{SR}^5$ ,  $-\text{NR}^5\text{R}^{5'}$ ,  $-\text{NR}^5\text{C}(\text{O})\text{OR}^{5'}$ ,  $-\text{NR}^5\text{C}(\text{O})\text{R}^{5'}$ ,  $\text{C}_1\text{-C}_{10}$  алкіл,  $\text{C}_3\text{-C}_{10}$  циклоалкіл,  $\text{C}_6\text{-C}_{14}$  арил,  $\text{C}_3\text{-C}_{13}$  гетероарил,  $\text{C}_7\text{-C}_{24}$  алкаріл,  $\text{C}_4\text{-C}_{23}$  алкгетероарил, заміщений  $\text{C}_1\text{-C}_{10}$  алкіл, заміщений  $\text{C}_3\text{-C}_{10}$  циклоалкіл, заміщений  $\text{C}_7\text{-C}_{24}$  алкаріл та заміщений  $\text{C}_4\text{-C}_{23}$  алкгетероарил; де якщо  $\text{Z}$  являє собою заміщену групу, її заміщають одним або кількома замісниками, що їх незалежно вибирають з групи, до якої належать  $-\text{CN}$ ,  $-\text{CO}_2\text{R}^5$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^5\text{R}^{5'}$ ,  $-\text{OR}^5$ ,  $-\text{SR}^5$ ,  $-\text{NO}_2$ ,  $-\text{NR}^5\text{R}^{5'}$ ,  $-\text{NR}^5\text{C}(\text{O})\text{R}^{5'}$  та  $-\text{NR}^5\text{C}(\text{O})\text{OR}^{5'}$ .

18. Спосіб по п. 15, який відрізняється тим, що  $\text{B}$  являє собою

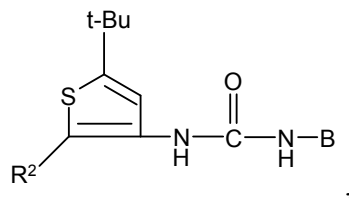
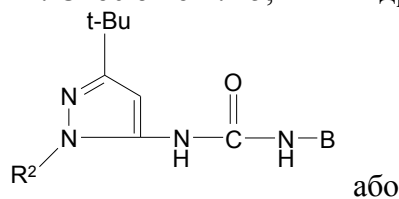


де  $\text{Y}$  вибирають з групи, до якої належать  $-\text{O}-$ ,  $-\text{S}-$ ,  $-\text{CH}_2-$ ,  $-\text{SCH}_2-$ ,  $-\text{CH}_2\text{S}-$ ,  $-\text{CH}(\text{OH})-$ ,  $-\text{C}(\text{O})-$ ,  $-\text{CX}^a_2-$ ,  $-\text{CX}^a\text{H}-$ ,  $-\text{CH}_2\text{O}-$  та  $-\text{OCH}_2-$ ,  $\text{X}^a$  являє собою галоген,  $\text{Q}$  є шестичленною ароматичною структурою, що містить 0-2 атоми азоту, заміщеного або незаміщеного галогеном, аж до пергалозаміщення,  $\text{Q}^1$  є моно- або біциклічною ароматичною структурою з 3-10 атомами вуглецю і 0-4 членами групи, до якої належать  $\text{N}$ ,  $\text{O}$  та  $\text{S}$ , незаміщеними або заміщеними галогеном аж до пергалозаміщення,  $\text{X}$ ,  $\text{Z}$ ,  $n$  та  $n1$  є по п. 15, а  $s = 0$  або  $1$ .

19. Спосіб по п. 18, який відрізняється тим, що  $\text{Q}$  являє собою феніл або піридиніл, заміщений або незаміщений галогеном, аж до пергалозаміщення,  $\text{Q}^1$  вибирають з групи, до якої належать феніл, піридиніл, нафтил, піримідиніл, хінолін, ізохінолін, імідазол та бензотіазоліл, заміщений або незаміщений галогеном, аж до пергалозаміщення, або  $\text{Y-Q}^1$  являє собою фталімідиніл, заміщений або незаміщений галогеном аж до пергалозаміщення, і  $\text{Z}$  та  $\text{X}$  незалежно вибирають з групи, до якої належать  $-\text{R}^6$ ,  $-\text{OR}^6$  та  $-\text{NHR}^7$ , де  $\text{R}^6$  являє собою водень,  $\text{C}_1\text{-C}_{10}$  алкіл або  $\text{C}_3\text{-C}_{10}$  циклоалкіл та  $\text{R}^7$  вибирають з групи, до якої належать водень,  $\text{C}_3\text{-C}_{10}$  алкіл,  $\text{C}_3\text{-C}_6$  циклоалкіл та  $\text{C}_6\text{-C}_{10}$  арил, де  $\text{R}^6$  та  $\text{R}^7$  або заміщені галогеном, або заміщені аж до пергалозаміщення.

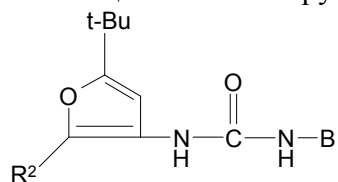
20. Спосіб по п. 18, який **відрізняється** тим, що Q являє собою феніл, Q<sup>1</sup> являє собою феніл або піридиніл, Y являє собою -O-, -S- або -CH<sub>2</sub>-, а X та Z незалежно являють собою Cl, F, NO<sub>2</sub> або CF<sub>3</sub>.

21. Спосіб по п. 15, який **відрізняється** тим, що включає введення сполуки одної з формул



де B та R<sup>2</sup> є по п. 15.

22. Спосіб по п. 21, який **відрізняється** тим, що R<sup>2</sup> вибирають із заміщених та незаміщених членів групи, до якої належать феніл або піридиніл, де якщо R<sup>2</sup> являє собою



заміщену групу, її заміщають одним або кількома замісниками, що їх вибирають з групи, до якої належать галоген та W<sub>n</sub>, де n = 0-3, і W вибирають з групи, до якої належать -NO<sub>2</sub>, -C<sub>1-3</sub> алкіл, -NH(O)CH<sub>3</sub>, -CF<sub>3</sub>, -OCH<sub>3</sub>, -F, -Cl, -NH<sub>2</sub>, -OC(O)NH- аж до пергалозаміщеного фенілу, -SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, піридиніл, феніл, аж до пергалозаміщеного фенілу, і заміщений C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкілом феніл.

23. Спосіб по п. 15, який **відрізняється** тим, що включає введення кількості сполуки формули I, ефективною для інгібування gaI.

24. Фармацевтична композиція, яка **відрізняється** тим, що містить сполуку по п. 1 та фармацевтично прийнятний носій.

25. Фармацевтична композиція, яка **відрізняється** тим, що містить сполуку по п. 2 та фармацевтично прийнятний носій.