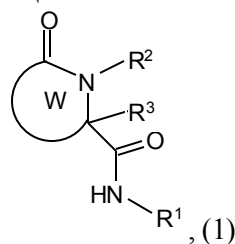


1. Анеловані карбамойлазгетероцикли загальної формули 1

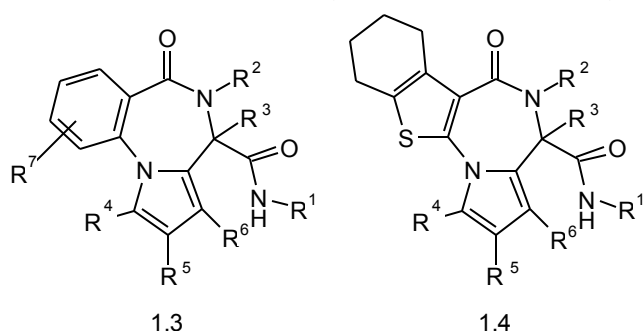
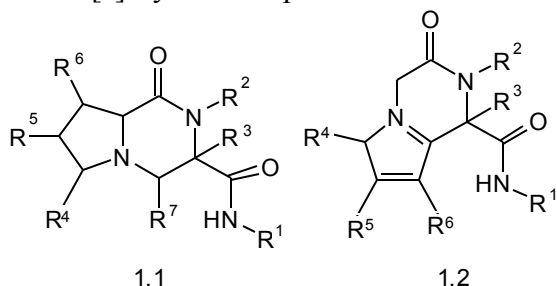


де: W являє собою 6-оксопіперазиновий, [1,4]діазепановий, [1,4]тіазепановий або [1,4]оксазепановий цикл, анелований принаймні з одним необов'язково заміщеним і необов'язково конденсованим гетероциклом Q;

R¹, R² і R³ представляють незалежно один від одного атом водню, інертний замісник, необов'язково заміщений C₁-C₆алкіл, необов'язково заміщений C₃-C₈циклоалкіл, необов'язково заміщений феніл, необов'язково заміщений арил, необов'язково заміщений гетероциклі;

Q являє собою пірольний, піразольний, імідазольний, тіазольний, піролідиновий, індольний, бензофурановий, 4,5,6,7-тетрагідробензотіофеновий, тієно[3,2-b]пірольний, фуо[3,2-b]пірольний, тієно[2,3-b]пірольний, бензімідазольний, піридиновий, хіноліновий або 1,2,3,4-тетрагідроізохіноліновий цикл.

2. Сполуки за п. 1, що являють собою заміщені 1-оксо-1,2,3,4-тетрагідропіроло[1,2-a]піразин-3-карбоксаміди загальної формули 1.1 і 3-оксо-2,3,4,6-тетрагідро-1H-піроло[1,2-a]піразин-1-карбоксаміди загальної формули 1.2, 6-оксо-5,6-дигідро-4H-бензо[f]піроло[1,2-a][1,4]діазепін-4-карбоксаміди загальної формули 1.3, 5-оксо-1,3,4,5,6,7,8,9-октагідро-2H-10-тіа-6,9-дізабензо[a]-циклопента[е]азулен-7-карбоксаміди загальної формули 1.4

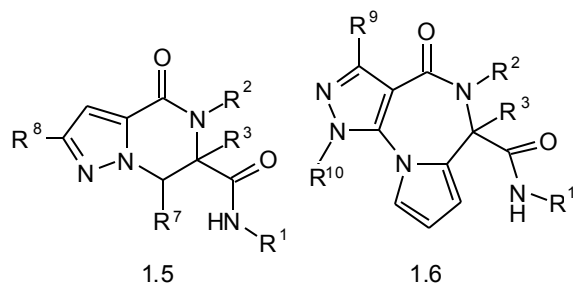


де: R¹, R² і R³ мають вищевказане значення;

R⁴, R⁵ і R⁶ незалежно один від одного представляють атом водню, інертний замісник, необов'язково заміщений C₁-C₆алкіл, необов'язково заміщений C₃-C₈циклоалкіл, необов'язково заміщений феніл, необов'язково заміщений арил, необов'язково заміщений гетероциклі;

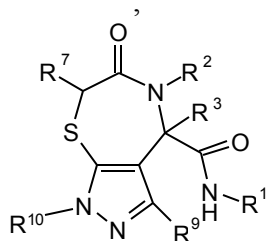
R⁷ представляє атом водню або необов'язково заміщений C₁-C₆алкіл.

3. Сполуки за п. 1, що являють собою заміщені 4-оксо-4,5,6,7-тетрагідропіразоло[1,5-a]піразин-6-карбоксаміди загальної формули 1.5, 4-оксо-1,4,5,6-тетрагідро-1,2,5,9а-тетрааза-циклопента[е]азулен-6-карбоксаміди загальної формули 1.6 і 6-оксо-4,5,6,7-тетрагідро-1H-8-тіа-1,2,5-триазазулен-4-карбоксаміди загальної формули 1.7



1.5

1.6



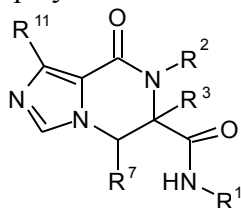
1.7

де: R^1 , R^2 , R^3 , і R^7 мають вищевказане значення;

R^8 і R^9 незалежно один від одного представляють атом водню, карбоксіалкіл, карбокси, необов'язково заміщений карбамоїл;

R^8 , R^9 і R^{10} незалежно один від одного представляють інертний замісник, необов'язково заміщений C_1 - C_6 алкіл, необов'язково заміщений C_3 - C_8 циклоалкіл, необов'язково заміщений феніл, необов'язково заміщений арил, необов'язково заміщений гетероциклі.

4. Сполуки за п. 1, що являють собою заміщені 8-оксо-5,6,7,8-тетрагідроїмідазо[1,5-а]піразин-6-карбоксаміди загальної формули 1.8

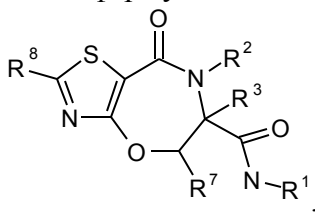


1.8

де: R^1 , R^2 , R^3 і R^7 мають вищевказане значення;

R^{11} являє собою атом водню, карбоксіалкіл, карбокси, необов'язково заміщений карбамоїл.

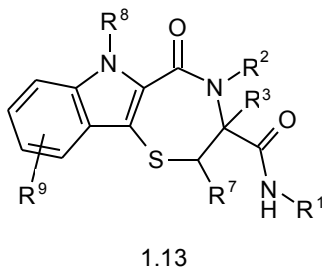
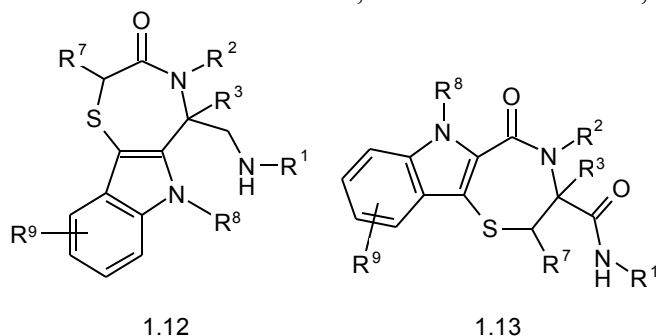
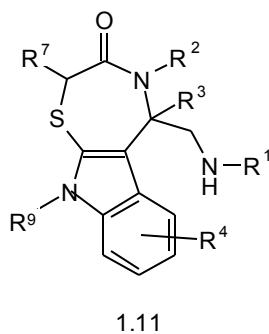
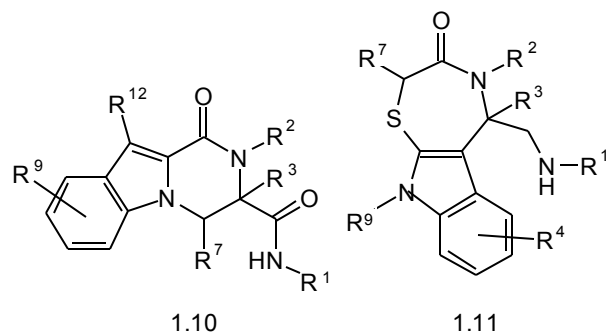
5. Сполуки за п. 1, що являють собою заміщені 8-оксо-5,6,7,8-тетрагідро-4-окса-1-тіа-3,7-діазаазулен-6-карбоксаміди загальної формули 1.9



1.9

де: R^1 , R^2 , R^3 , R^7 і R^8 мають вищевказане значення.

6. Сполуки за п. 1, що являють собою заміщені 1-оксо-1,2,3,4-тетрагідропіразино[1,2-а]індол-3-карбоксаміди загальної формули 1.10, 7-оксо-5,7,8,10-тетрагідро-6H-9-тіа-6,10-діазабензо[а]азулен-5-карбоксаміди загальної формули 1.11, 7-окса-7,8,9,10-тетрагідро-6H-5-тіа-8,10-діазабензо[а]азулен-9-карбоксаміди загальної формули 1.12 і 9-оксо-7,8,9,10-тетрагідро-6H-5-тіа-8,10-діазабензо[а]азулен-6-карбоксаміди загальної формули 1.13



де: R^1, R^2, R^3, R^7, R^8 і R^9 мають вищевказане значення;

7. Сполуки за п. 1, що являють собою заміщені 9-оксо-6,7,8,9-тетрагідро-10-окса-5-тіа-8-азабензо[а]зулен-7-карбоксаміди загальної формули 1.14

1.14

де: R^1, R^2, R^3, R^7 і R^8 мають вищевказане значення.

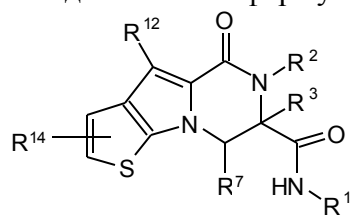
1.15

де: R^1, R^2, R^3, R^7 і R^8 мають вищевказане значення.

1.16 (Y=S), 1.17 (Y=O)

де: R^1, R^2, R^3, R^7 і R^{12} мають вищевказане значення;

10. Сполуки за п. 1, що являють собою заміщені 7-оксо-4,5,6,7-тетрагідро-3-тіа-3b,6-діазаціклопента[а]інден-5-карбоксаміди загальної формули 1.18

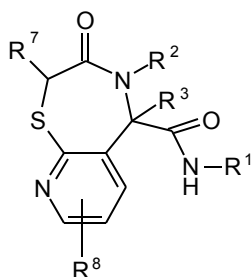


1.18

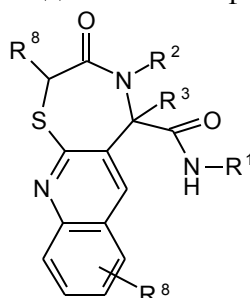
де: R^1 , R^2 , R^3 , R^7 і R^{12} мають вищевказане значення;

R^{14} представляє атом водню або необов'язково заміщений C_1 - C_6 алкіл.

11. Сполуки за п. 1, що являють собою заміщені 7-оксо-5,6,7,8-тетрагідро-9-тіа-1,6-діазабензоциклопептан-5-карбоксаміди загальної формули 1.19 і 8-оксо-7,8,9,10-тетрагідро-6-тіа-5,9-діазаціклопента[б]нафталін-10-карбоксаміди загальної формули 1.20



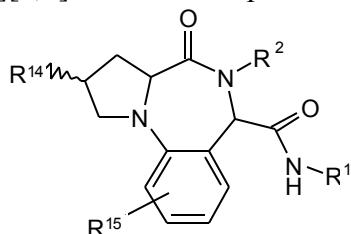
1.19



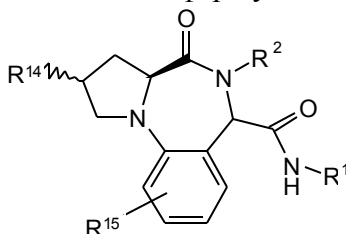
1.20

де: R^1 , R^2 , R^3 , R^7 і R^8 мають вищевказане значення.

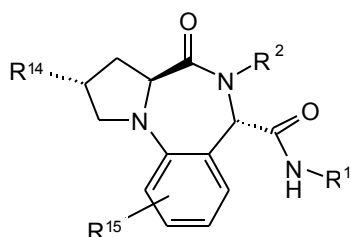
12. Сполуки за п. 1, що являють собою заміщені 4-оксо-2,3,3a,4,5,6-гексагідро-1H-бензо[f]піроло[1,2-a][1,4]діазепін-6-карбоксаміди загальної формули 1.21, (3a)-4-оксо-2,3,3a,4,5,6-гексагідро-1H-бензо[f]піроло[1,2-a][1,4]діазепін-6-карбоксаміди загальної формули 1.22, (3a,6S)-4-оксо-2,3,3a,4,5,6-гексагідро-1H-бензо[f]піроло[1,2-a][1,4]діазепін-6-карбоксаміди загальної формули 1.22a і (3a,6S)-4-оксо-2,3,3a,4,5,6-гексагідро-1H-бензо[f]піроло[1,2-a][1,4]діазепін-6-карбоксаміди загальної формули 1.22b



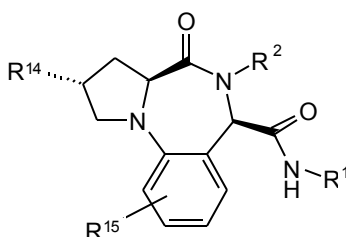
1.21



1.22



1.22a



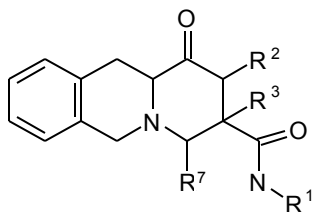
1.22b

де: R^1 і R^2 мають вищевказане значення;

R^{14} являє собою атом водню або необов'язково заміщену гідроксигрупу;

R^{15} атом водню, NO^2 , CF^3 , CN , карбоксилкіл, карбокси, необов'язково заміщений карбамоїл, необов'язково заміщена аміногрупа.

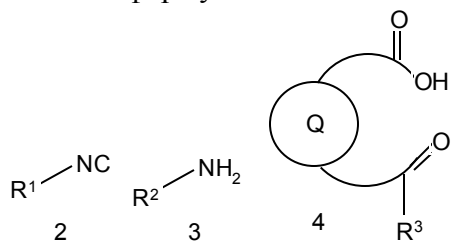
13. Сполуки за п. 1, що являють собою заміщені 1-оксо-1,3,4,6,11,11a-гексагідро-2H-піразино[1,2-b]ізохінолін-3-карбоксаміди загальної формули 1.23



1.23

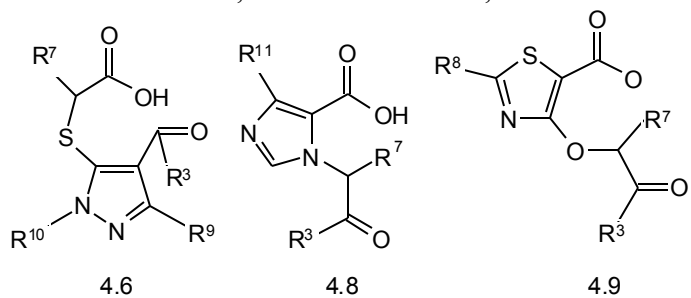
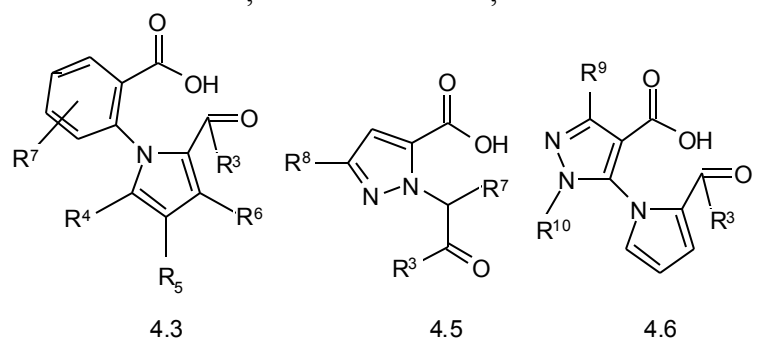
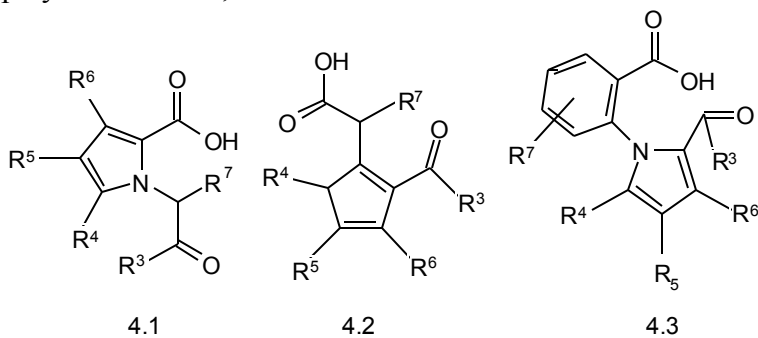
де: R^1 , R^2 , R^3 і R^7 мають вищевказане значення.

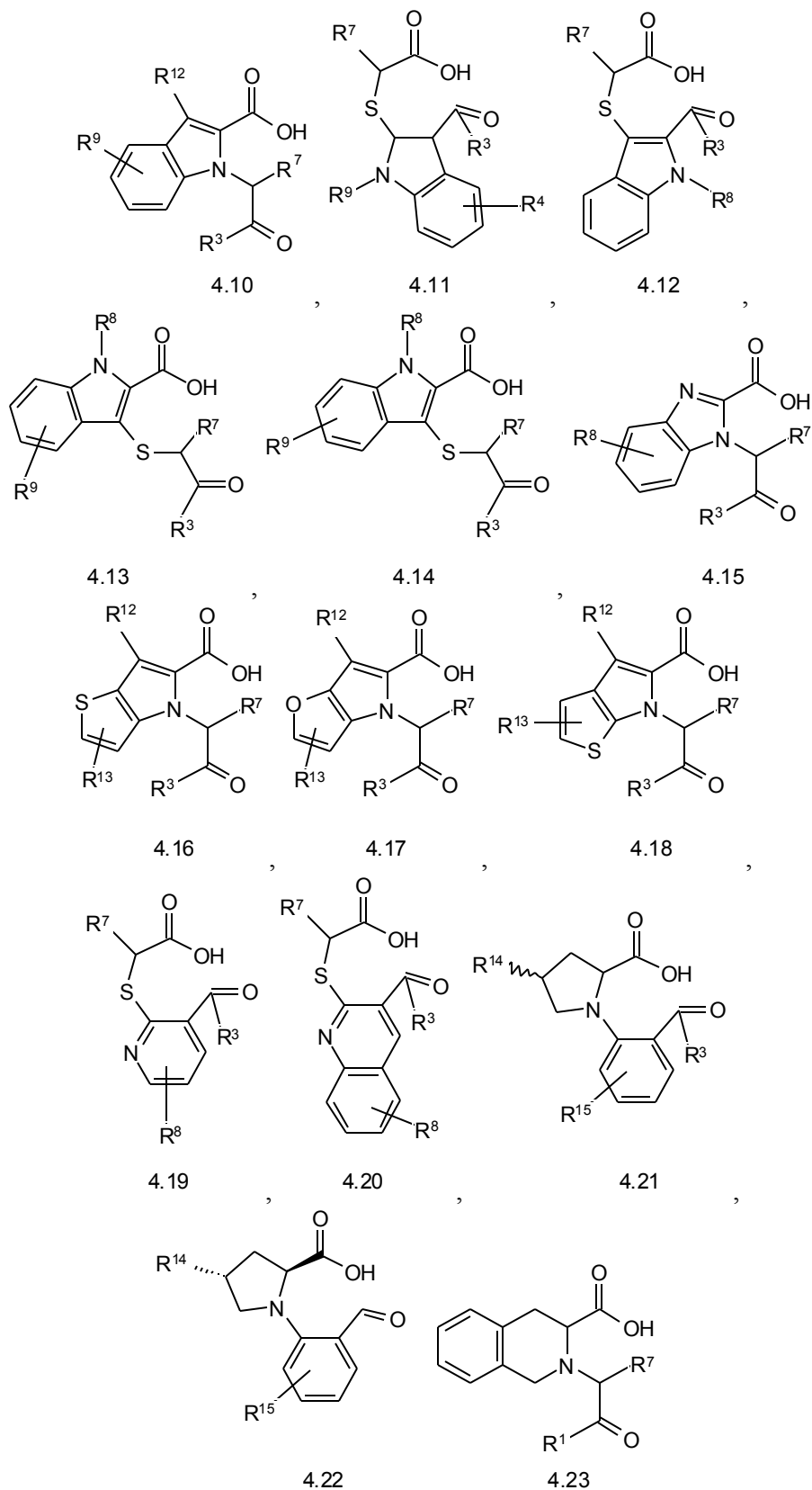
14. Спосіб одержання анелованих карбамойлазгетероциклів загальної формули 1 шляхом трикомпонентної конденсації відповідного ізонітрилу загальної формули 2, відповідного первинного аміну загальної формули 3 і відповідного гетероциклічного біфункціонального реагенту загальної формули 4



де: Q, R^1 , R^2 і R^3 мають вищевказане значення.

15. Спосіб одержання сполук за п. 14, який **відрізняється** тим, що як біфункціональні реагенти 4 використовують гетероциклічні сполуки, що містять карбоксильну і карбонільну групи загальної формули 4.01-4.23,





де R³-R¹⁵ мають вказані в пп. 2-12 значення.

16. Фокусована бібліотека для визначення сполук-лідерів, яка містить принаймні одну сполуку загальної формули 1 за п. 1.

17. Фармацевтична композиція, яка має антиканцерну активність, що містить принаймні одну анеловану карбамойлазгетероциклічну сполуку загальної формули 1 за п. 1 або її фармацевтично прийнятну сіль.