

(19)



Евразийское
патентное
ведомство

(21) 202292560 (13) A1

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ЕВРАЗИЙСКОЙ ЗАЯВКЕ

(43) Дата публикации заявки
2023.01.02

(22) Дата подачи заявки
2021.04.08

(51) Int. Cl. C07D 401/14 (2006.01)
C07D 403/14 (2006.01)
C07D 413/14 (2006.01)
C07D 417/14 (2006.01)
C07D 471/04 (2006.01)
C07D 487/04 (2006.01)
C07D 491/04 (2006.01)
C07D 498/04 (2006.01)
C07D 513/04 (2006.01)
A61K 31/53 (2006.01)
A61P 25/28 (2006.01)

(54) СОЕДИНЕНИЯ ДЛЯ ЛЕЧЕНИЯ БОЛЕЗНИ ХАНТИНГТОНА

(31) 63/007,660; 63/007,650

(32) 2020.04.09

(33) US

(86) PCT/US2021/026316

(87) WO 2021/207453 2021.10.14

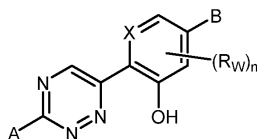
(71) Заявитель:
ПИТИСИ ТЕРАПЬЮТИКС, ИНК.
(US)

(72) Изобретатель:

Сидоренко Надя, Алам Рофул, Бабу
Суреш, Бхаттачарья Анурадха, Чэнь
Гуанмин, Чиэрчаи Маттео, Кэрп
Гари Митчелл, Луонг Том Туан,
Маццотти Энтони Р., Мун Ян-Чун,
Мсзар Николас Уолтер, Нарэсимхен
Джейна, Пэтель Джигар С., Рен
Хонгю, Ван Ган, Уолл Мэтью Дж.,
Чжан Наньцзин, Чжан Сяоянь (US)

(74) Представитель:
Медведев В.Н. (RU)

(57) Изобретение относится к соединениям формулы (I), их формам и фармацевтическим композициям, а также к способам применения таких соединений, их форм или композиций для лечения или облегчения болезни Хантингтона.



A1

202292560

202292560

A1

СОЕДИНЕНИЯ ДЛЯ ЛЕЧЕНИЯ БОЛЕЗНИ ХАНТИНГТОНА

ОБЛАСТЬ ТЕХНИКИ

Один из аспектов настоящего описания относится к соединениям, их формам и фармацевтическим композициям, а также к способам применения таких соединений, их форм или композиций, подходящих для лечения или облегчения болезни Хантингтона. В частности, другой аспект настоящего описания относится к замещенным моноциклическим и бициклическим гетероарильным соединениям, их формам и фармацевтическим композициям, а также к способам применения таких соединений, их форм или композиций для лечения или облегчения болезни Хантингтона.

УРОВЕНЬ ТЕХНИКИ

Болезнь Хантингтона (БХ) представляет собой прогрессирующее аутосомно-доминантное нейродегенеративное нарушение головного мозга, симптомы которого характеризуются непроизвольными движениями, когнитивными нарушениями и психическими расстройствами. Смерть, обычно вызванная пневмонией или ишемической болезнью сердца, обычно наступает через 13–15 лет после появления симптомов. Распространенность БХ составляет от трех до семи человек на 100 000 населения западноевропейского происхождения. Согласно подсчетам, в Северной Америке около 30 000 человек больны БХ, а еще 200 000 человек подвержены риску унаследовать болезнь от больного родителя. Заболевание вызывает экспансия непрерывных тринуклеотидных CAG-повторов в «мутантном» гене хантингтина (Htt), что приводит к продукции НТТ (белка Htt) с увеличенным полиглутаминовым (polyQ) отрезком, также известным как последовательность «CAG-повтора». В настоящее время не существует вариантов низкомолекулярной терапии, нацеленных на основную причину заболевания, что сохраняет высокую неудовлетворенную потребность в лекарственных средствах, которые можно применять для лечения или облегчения БХ. Следовательно, остается потребность в идентификации и обеспечении низкомолекулярных соединений для лечения или облегчения БХ.

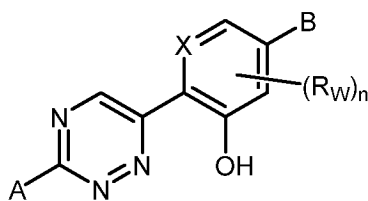
В публикации международной заявки № WO/2019/191229 A1 описаны триазиновые соединения, которые могут быть пригодны для лечения или облегчения болезни Хантингтона.

Однако, остается потребность в разработке новых соединений, которые более эффективны, что определяется показателем IC_{50} , и имеют улучшенные фармакокинетические свойства (ФК), которые измеряются такими параметрами, как эффлюкс-транспорт, воздействие на ткани, абсорбция, распределение, метаболизм, экскреция, время до максимальной концентрации в плазме (T_{max}), максимальная концентрация (C_{max}), концентрация через 24 часа (C_{24}), площадь под кривой зависимости концентрации от времени (AUC) и конечный период полувыведения ($t_{1/2}$).

Все другие документы, упомянутые в настоящем документе, включены в него посредством ссылки, как если бы они были полностью изложены в настоящем документе.

КРАТКОЕ ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ

Аспект настоящего описания включает соединения формулы (I):



(I)

или их формы, где A, B, X, R_W и n имеют значения, определенные в настоящем документе. B может представлять собой моноциклическую кольцевую структуру и/или бициклическую кольцевую структуру.

Аспект настоящего описания включает способ лечения или облегчения БХ у субъекта, нуждающегося в этом, включающий введение субъекту эффективного количества соединения Формулы (I) или его формы.

Один аспект настоящего описания включает способ применения соединения формулы (I) или его формы, или композиции для лечения или облегчения БХ у субъекта, нуждающегося в этом, включающий введение субъекту эффективного количества соединения формулы (I) или его формы, или композиции.

Один аспект настоящего описания включает применение соединения формулы (I) или его формы для лечения или облегчения БХ у субъекта, нуждающегося в этом, включающее введение субъекту эффективного количества соединения формулы (I) или его формы.

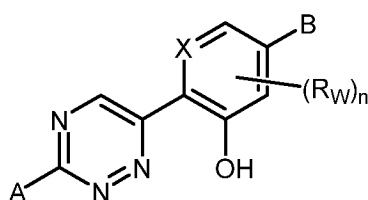
Один аспект настоящего описания включает применение соединения формулы (I) или его формы для производства лекарственного средства для лечения или

облегчения БХ у субъекта, нуждающегося в этом, включающее введение субъекту эффективного количества лекарственного средства.

Один аспект настоящего описания включает применение соединения формулы (I) или его формы в комбинированном продукте с одним или более терапевтическими агентами для лечения или облегчения БХ у субъекта, нуждающегося в этом, включающее введение субъекту эффективного количества соединения формулы (I) или его формы в комбинации с эффективным количеством одного или более агентов.

ПОДРОБНОЕ ОПИСАНИЕ

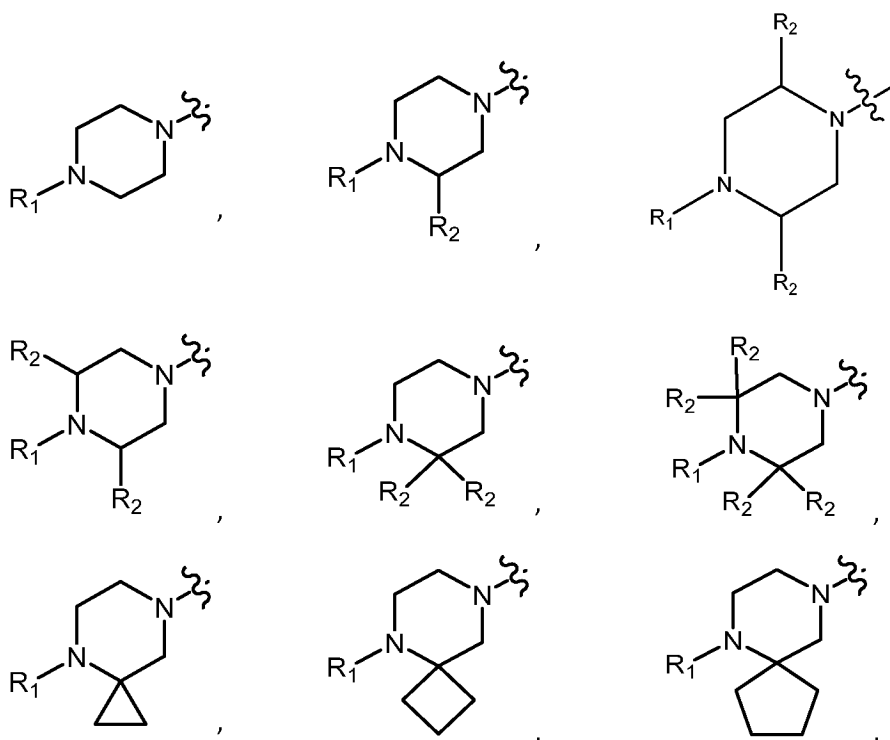
Раскрыто соединение формулы (I):

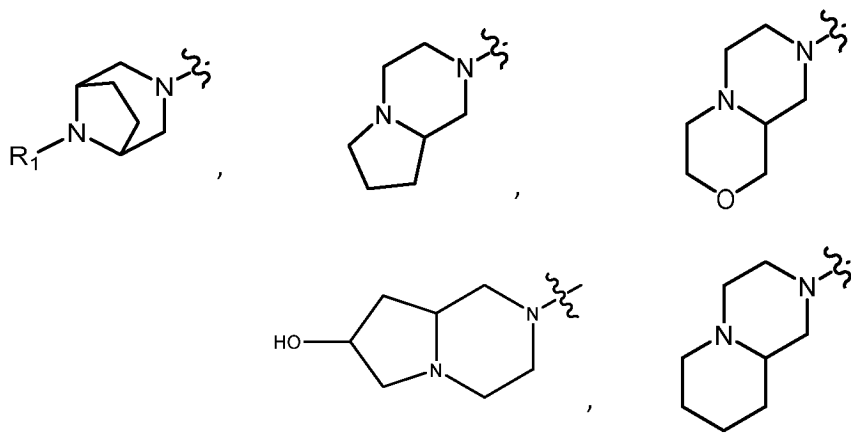


(I)

или его соль, сольват, гидрат, сложный эфир, пролекарство, энантиомер, стереоизомер, ротамер, таутомер, позиционный изомер или рацемат, причем:

A выбран из группы, состоящей из:





и любого их стереоизомера;

R₁ выбран из группы, состоящей из водорода, C₁₋₄алкила и C₃₋₆циклоалкила;

R₂ независимо выбран из группы, состоящей из галогена, C₁₋₄алкила, дейтеро-C₁₋₄алкила, галоген-C₁₋₄алкила, гидроксил-C₁₋₄алкила, C₁₋₄алкокси-C₁₋₄алкила, C₂₋₄алкенила, C₃₋₆циклоалкила, фенила, пиридинила и гетероциклила, причем гетероциклил представляет собой радикал с кольцевой структурой, состоящей из 3-6 атомов углерода, содержащий 1 или 2 гетероатомных члена в кольце, выбранных из N, O и S, и

причем в каждом случае C₁₋₄алкил, C₃₋₆циклоалкил, фенил, пиридинил и гетероциклил необязательно замещен одним или двумя заместителями R₃;

R₃ независимо выбран из группы, состоящей из галогена, гидроксила, C₁₋₄алкила, C₁₋₄алкокси и C₃₋₆циклоалкила;

B выбран из группы, состоящей из:

фенила, необязательно замещенного одним или двумя независимо выбранными заместителями R₄;

гетероарила, причем гетероарил представляет собой 5- или 6-членный моноциклический ароматический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 1, 2 или 3 гетероатома, выбранных из N, O и S, необязательно замещенный одним R₄ заместителем, или причем гетероарил представляет собой 9- или 10-членный бициклический ароматический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 1, 2, 3 или 4 гетероатомных члена в кольце, независимо выбранных из N, O или S, необязательно замещенный одним или двумя независимо выбранными R₄ заместителями; и

гетероциклила, причем гетероциклил представляет собой 8-10-членный бициклический ароматический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода,

содержащий 1, 2, 3 или 4 гетероатомных члена в кольце, независимо выбранных из N, O или S, необязательно замещенный одним или двумя независимо выбранными R₄ заместителями;

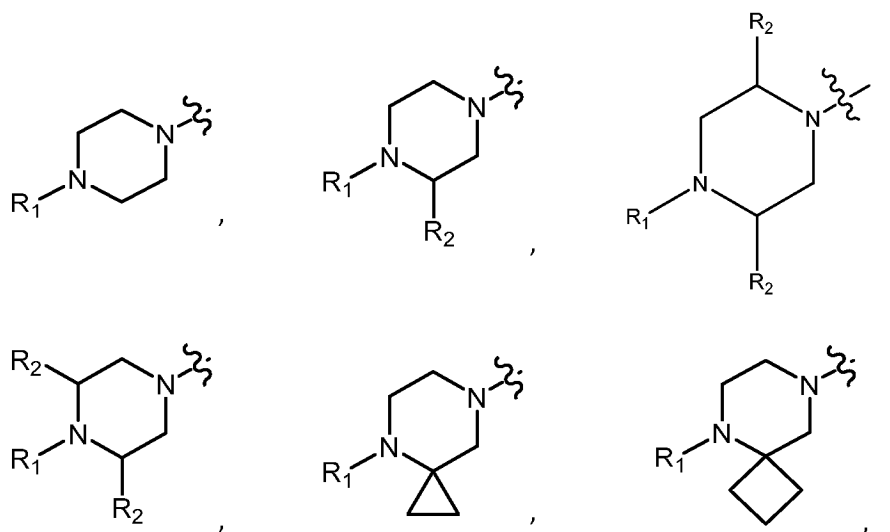
R₄ выбран из группы, состоящей из галогена, циано, C₁₋₄алкила, дейтеро-C₁₋₄алкила, галоген-C₁₋₄алкила, C₁₋₄алкокси, дейтеро-C₁₋₄алкокси, amino, C₁₋₄алкил-amino, (C₁₋₄алкил)₂-amino, C₃₋₆циклоалкила и гетероциклила, причем гетероциклил представляет собой 3-6-членный моноциклический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 1 или 2 гетероатомных члена в кольце, независимо выбранных из N, O или S;

X выбран из группы, состоящей из CH, CF и N;

R_w выбран из группы, состоящей из галогена, гидроксила, циано, C₁₋₄алкила, дейтеро-C₁₋₄алкила, галоген-C₁₋₄алкила, amino, C₁₋₄алкил-amino, (C₁₋₄алкил)₂-amino, C₁₋₄алкокси, и галоген-C₁₋₄алкокси; и

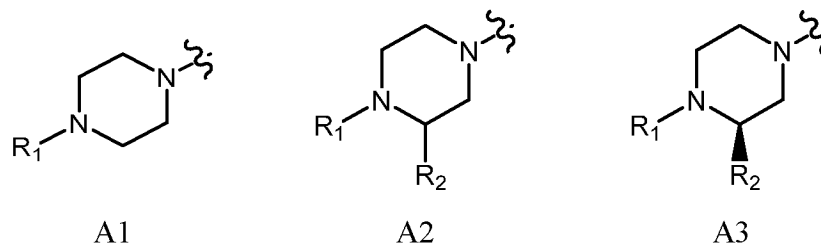
n выбран из группы, состоящей из 0 или 1.

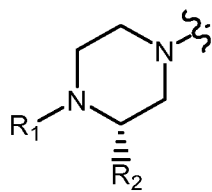
Один из аспектов включает в себя соединение Формулы (I), причем **A** выбран из группы, состоящей из:



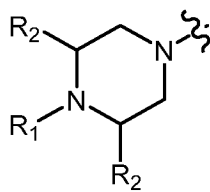
и любого их стереоизомера.

A выбран из группы, состоящей из:

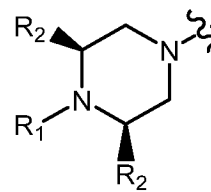




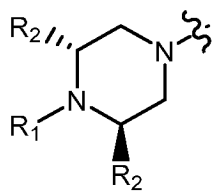
A4



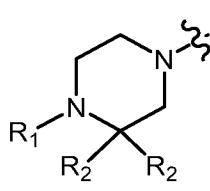
A5



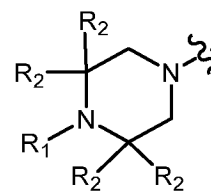
A6



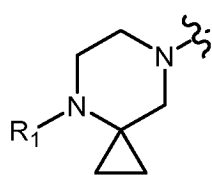
A7



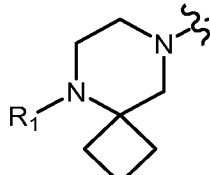
A8



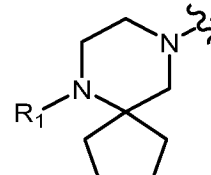
A9



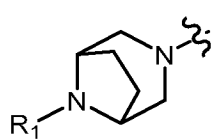
A10



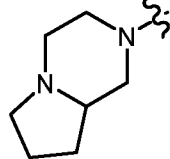
A11



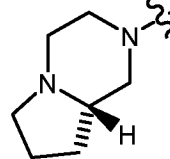
A12



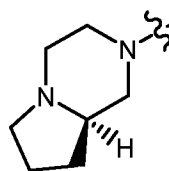
A13



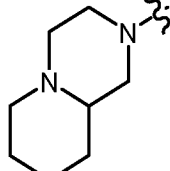
A14



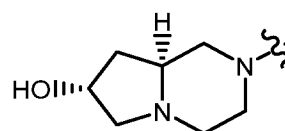
A15



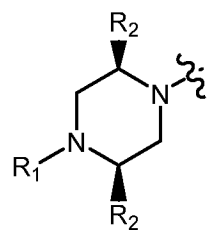
A16



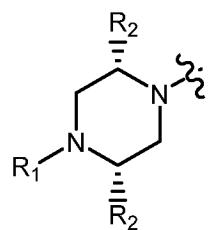
A17



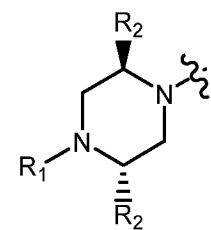
A18



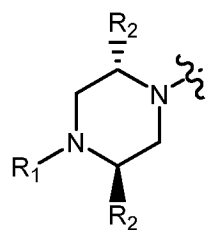
A19



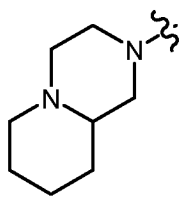
A20



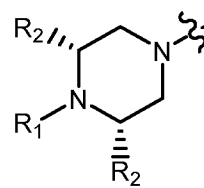
A21



A22

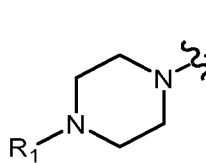


A23 и

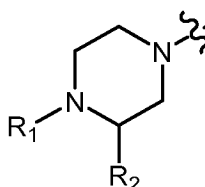


A24.

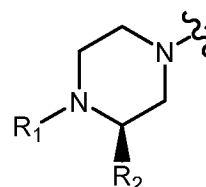
A может быть выбран из группы, состоящей из:



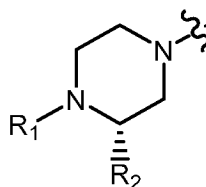
A1



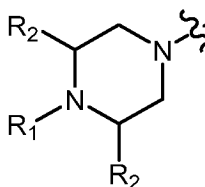
A2



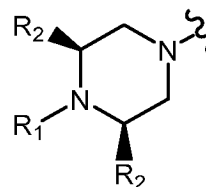
A3



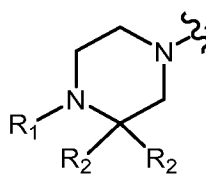
A4



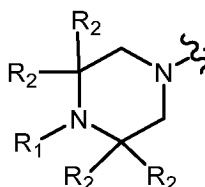
A5



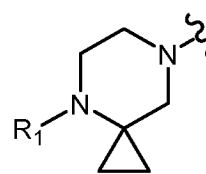
A6



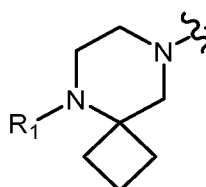
A8



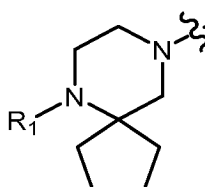
A9



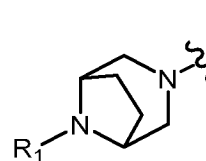
A10



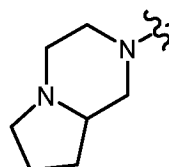
A11



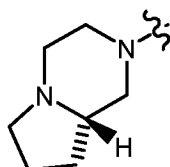
A12



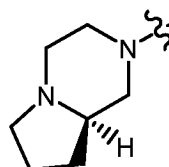
A13



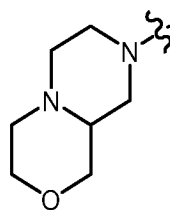
A14



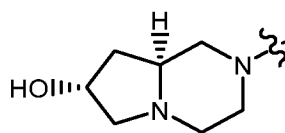
A15.



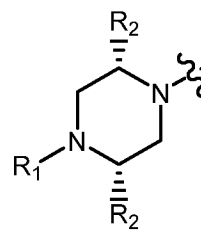
A16



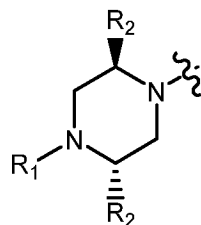
A17



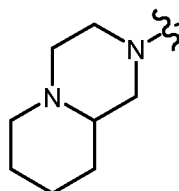
A18



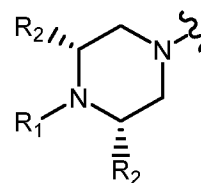
A20



A21

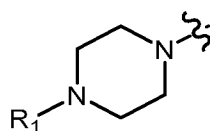


A23 и

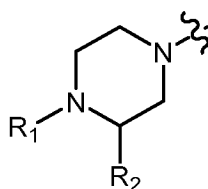


A24.

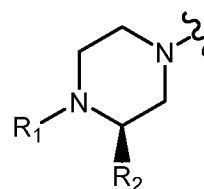
A может быть выбран из группы, состоящей из:



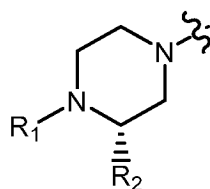
A1



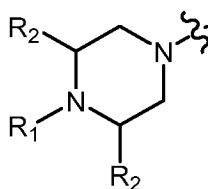
A2



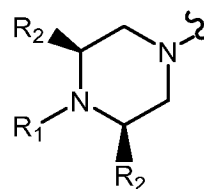
A3



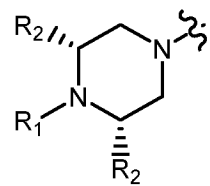
A4



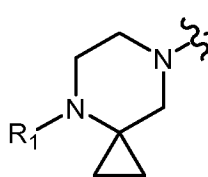
A5



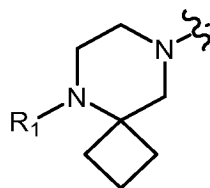
A6



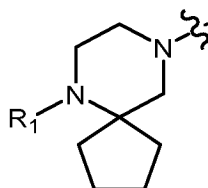
A24



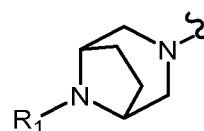
A10



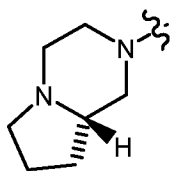
A11



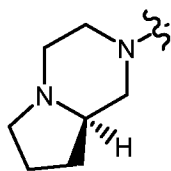
A12



A13

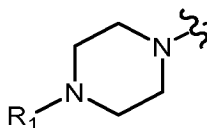


A15 и



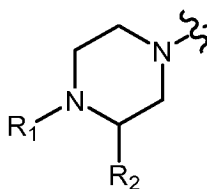
A16.

A может представлять собой

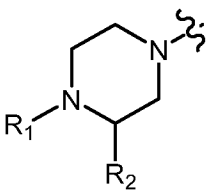


A1 или любой его стереоизомер.

A может представлять собой

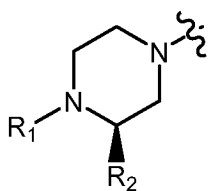


A2 или любой его стереоизомер.

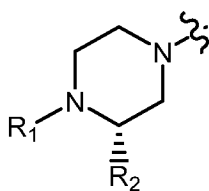


A может представлять собой , выбранный из группы, состоящей

из:

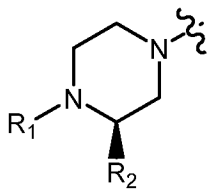


и



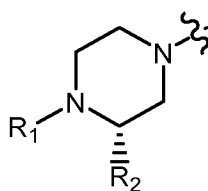
.

A может представлять собой



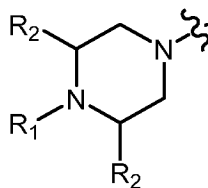
A3.

A может представлять собой

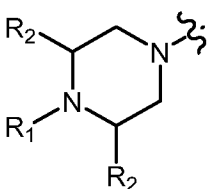


A4.

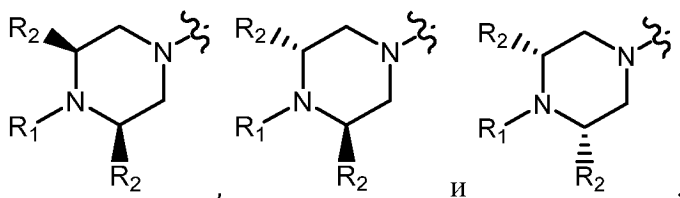
A может представлять собой



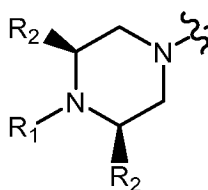
A5 или любой его стереоизомер.



A может представлять собой , выбранный из группы, состоящей из:

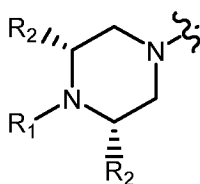


A может представлять собой



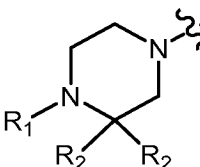
A6.

A может представлять собой



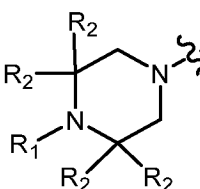
A24.

A может представлять собой



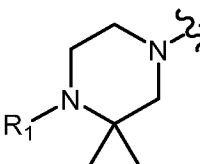
A8 или любой его стереоизомер.

A может представлять собой



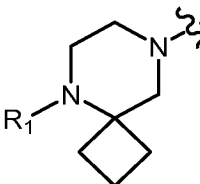
A9 или любой его стереоизомер.

A может представлять собой



A10 или любой его стереоизомер.

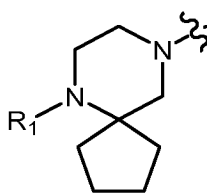
A может представлять собой



A11 или любой его

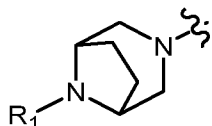
стереоизомер.

A может представлять собой



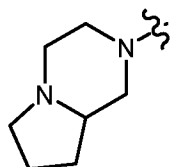
A12 или любой его стереоизомер.

A может представлять собой



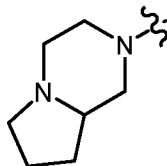
A13 или любой его стереоизомер.

A может представлять собой

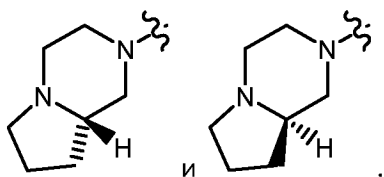


A14 или любой его стереоизомер.

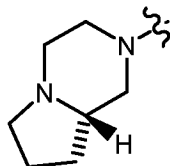
A может представлять собой



, выбранный из группы, состоящей из:

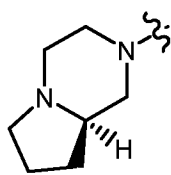


A может представлять собой



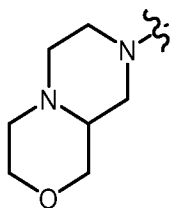
A15.

A может представлять собой



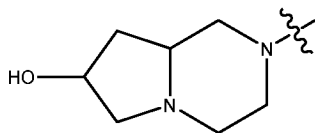
A16.

A может представлять собой

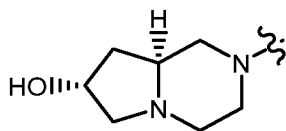


A17 или любой его стереоизомер.

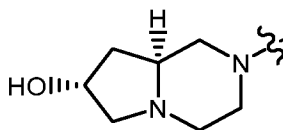
A может представлять собой
как, но не ограничиваясь,



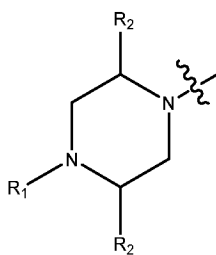
или его стереоизомер, такой



A может представлять собой

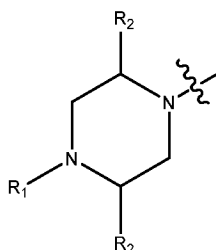


A18.



A может представлять собой

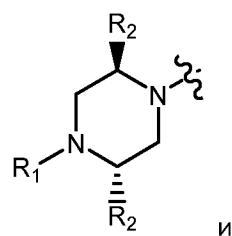
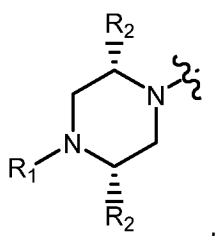
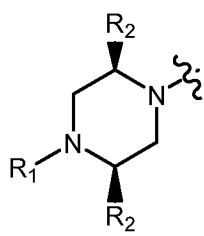
или любой его стереоизомер.



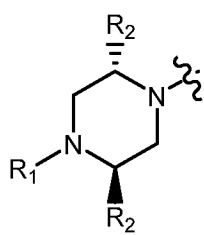
A может представлять собой

, выбранный из группы, состоящей

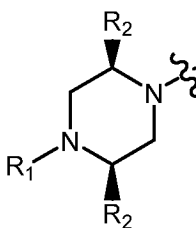
из:



и

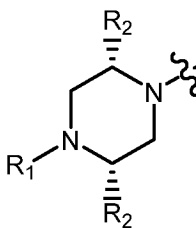


A может представлять собой



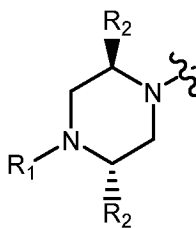
A19.

A может представлять собой



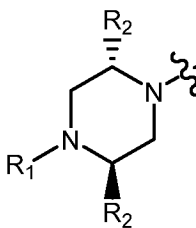
A20.

A может представлять собой



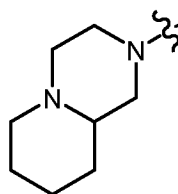
A21.

A может представлять собой



A22.

A может представлять собой



A23 или любой его стереоизомер.

Один аспект включает соединение формулы (I), в котором R_1 представляет собой водород или C_{1-4} алкил. R_1 может представлять собой водород. R_1 может представлять собой C_{1-4} алкил, выбранный из метила, этила, пропила, изопропила, бутила и трет-бутила. R_1 может представлять собой метил или этил. R_1 может представлять собой метил. R_1 может представлять собой этил.

Один аспект включает соединение формулы (I), в котором R_1 представляет собой C_{3-6} циклоалкил, выбранный из циклопропила, циклобутила, цикlopентила и

циклогексила. R_1 может представлять собой циклопропил.

Один аспект включает соединение формулы (I), в котором R_2 независимо выбран из группы, состоящей из C_{1-4} алкила, галоген- C_{1-4} алкила, гидроксил- C_{1-4} алкила, C_{1-4} алкокси- C_{1-4} алкила, C_{2-4} алкенила, C_{3-6} циклоалкила, фенила, пиридинила и гетероциклила, причем гетероциклил представляет собой представляет собой 3-6 членный радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 1 или 2 гетероатомных члена в кольце, выбранных из N, O и S, и причем в каждом случае C_{1-4} алкил, C_{3-6} циклоалкил, фенил, пиридинил и гетероциклил необязательно замещен одним или двумя R_3 заместителями.

Другой аспект включает соединение формулы (I), в котором R_2 независимо выбран из группы, состоящей из C_{1-4} алкила, гидроксил- C_{1-4} алкила, C_{3-6} циклоалкила, фенила, пиридинила и гетероциклила, причем гетероциклил представляет собой представляет собой 3-4 членный радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 1 гетероатомный член в кольце, выбранный из N и O, при этом каждый R_2 необязательно замещен одним R_3 заместителем.

Другой аспект включает соединение формулы (I), в котором R_2 независимо выбран из группы, состоящей из C_{1-4} алкила, гидроксил- C_{1-4} алкила и C_{3-6} циклоалкила, причем каждый R_2 необязательно замещен одним R_3 заместителем.

R_2 может представлять собой C_{1-4} алкил, выбранный из группы, состоящей из метила, этила, пропила, изопропила, бутила и трет-бутила. R_2 может представлять собой метил. R_2 может представлять собой этил. R_2 может представлять собой пропил. R_2 может представлять собой изопропил. R_2 может представлять собой бутил. R_2 может представлять собой трет-бутил.

R_2 может представлять собой гидроксил- C_{1-4} алкил, причем C_{1-4} алкил выбран из группы, состоящей из метила, этила, пропила, изопропила и бутила, частично или полностью замещенного одной или более гидроксильными группами, где это разрешено доступными валентностями. R_2 может представлять собой гидроксил- C_{1-4} алкил, причем C_{1-4} алкил выбран из метила и изопропила, замещенного одной гидроксильной группой. R_2 может представлять собой гидроксиметил. R_2 может представлять собой изопропил, замещенный одной гидроксильной группой. R_2 может представлять собой 2-гидроксипропан-2-ил.

R_2 может представлять собой галоген- C_{1-4} алкил, причем C_{1-4} алкил выбран из группы, состоящей из метила, этила, пропила, изопропила, бутила и трет-бутила, частично или полностью замещенного одним или более атомами галогена, где это

разрешено доступными валентностями. R_2 может представлять собой дифторэтил.

R_2 может представлять собой C_{1-4} алкокси- C_{1-4} алкил, причем C_{1-4} алкил выбран из группы, состоящей из метила, этила, пропила и бутила, частично или полностью замещенного одной или более C_{1-4} алкокси группами, выбранными из метокси, этокси, пропокси и буюкси, где это разрешено доступными валентностями. R_2 может представлять собой метоксиметил.

R_2 может представлять собой C_{2-4} алкенил, выбранный из этенила, пропенила и бутенила. R_2 может представлять собой этенил.

R_2 может представлять собой C_{3-6} циклоалкил, выбранный из циклопропила, циклобутила, цикlopентила и циклогексила, необязательно замещенного одним или двумя R_3 заместителями. R_2 может представлять собой C_{3-6} циклоалкил, выбранный из циклопропила и циклобутила, необязательно замещенного одним или двумя R_3 заместителями.

R_2 может представлять собой циклопропил, замещенный R_3 заместителями в количестве от нуля до двух. R_2 может представлять собой незамещенный циклопропил. R_2 может представлять собой циклопропил, незамещенный или замещенный одним R_3 заместителем, причем R_3 представляет собой галоген, гидроксил, C_{1-4} алкил или C_{1-4} алкокси. R_2 может представлять собой циклопропил, незамещенный или замещенный одним R_3 заместителем, причем R_3 представляет собой галоген, гидроксил, метил, этил, метокси или этокси.

R_2 может представлять собой циклобутил, необязательно замещенный одним или двумя R_3 заместителями. R_2 может представлять собой незамещенный циклобутил.

R_2 может представлять собой фенил, необязательно замещенный одним или двумя R_3 заместителями. R_2 может представлять собой незамещенный фенил.

R_2 может представлять собой пиридинил, необязательно замещенный одним или двумя R_3 заместителями. R_2 может представлять собой незамещенный пиридинил. R_2 может представлять собой незамещенный пиридин-4-ил.

R_2 может представлять собой C_{1-4} алкил, галоген- C_{1-4} алкил, гидроксил- C_{1-4} алкил, циклопропил, циклобутил, фенил или оксетанил, необязательно замещенный одним или двумя R_3 заместителями.

R_2 может представлять собой гетероциклил, выбранный из группы, состоящей из азиридила, озиранила, тирианила, азетидинила, оксетанила, тиетанила, пирролидинила, пиразолинила, тетрагидрофуранила, тилоланила, пиперидинила, пиперазинила, тетрагидро-2H-пиранила, 1,4-диоксанила, морфолинила и тианила,

причем в каждом случае гетероцикл ил обязательно замещен одним или двумя R_3 заместителями.

R_2 может представлять собой оксетанил, обязательно замещенный одним или двумя R_3 заместителями.

R_2 может представлять собой C_{1-4} алкил, галоген- C_{1-4} алкил, гидроксил- C_{1-4} алкил, циклопропил, циклобутил, фенил или оксетанил, обязательно замещенный одним или двумя R_3 заместителями. R_2 может представлять собой незамещенный C_{1-4} алкил, незамещенный галоген- C_{1-4} алкил, незамещенный гидроксил- C_{1-4} алкил, незамещенный циклопропил, незамещенный циклобутил, незамещенный фенил или незамещенный оксетанил.

Один аспект включает соединение формулы (I), в котором R_3 независимо выбран из группы, состоящей из галогена, гидроксила, C_{1-4} алкила, C_{1-4} алкокси и C_{3-6} циклоалкила. R_3 может быть независимо выбран из группы, состоящей из галогена, гидроксила, C_{1-4} алкила и C_{1-4} алкокси.

R_3 может представлять собой галоген, выбранный из группы, состоящей из брома, хлора, фтора и йода. R_3 может представлять собой фтор.

R_3 может представлять собой гидроксил.

R_3 может представлять собой C_{1-4} алкил, выбранный из группы, состоящей из метила, этила, пропила, изопропила, бутила и трет-бутила. R_3 может представлять собой метил или этил. R_3 может представлять собой метил.

R_3 может представлять собой C_{1-4} алкокси, выбранный из группы, состоящей из метокси, этокси, пропокси, изопропокси, бутокси и трет-бутокси. R_3 может представлять собой метокси. R_3 может представлять собой галоген, гидроксил, C_{1-4} алкил или метокси.

R_3 может представлять собой C_{3-6} циклоалкил, выбранный из группы, состоящей из циклопропила, циклобутила, циклопентила и циклогексила. R_3 может представлять собой циклопропил.

Один аспект включает соединение формулы (I), в котором В выбран из группы, состоящей из:

фенила, обязательно замещенного одним или двумя независимо выбранными заместителями R_4 ;

гетероарила, причем гетероарил представляет собой 5- или 6-членный моноциклический ароматический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 1, 2 или 3 гетероатома, выбранных из N, O и S, обязательно замещенный

одним R₄ заместителем, или причем гетероарил представляет собой 9- или 10-членный ароматический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 1, 2, 3 или 4 гетероатомных члена в кольце, независимо выбранных из N, O или S, необязательно замещенный одним или двумя независимо выбранными R₄ заместителями; и

гетероциклила, причем гетероциклил представляет собой 8-10-членный бициклический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 1, 2, 3 или 4 гетероатомных члена в кольце, независимо выбранных из N, O или S, необязательно замещенный одним или двумя независимо выбранными R₄ заместителями.

В может представлять собой фенил, необязательно замещенный одним или двумя независимо выбранными заместителями R₄. В может представлять собой незамещенный фенил или фенил, замещенный одним R₄ заместителем.

Один аспект включает соединение формулы (I), в котором В представляет собой гетероарил, причем гетероарил представляет собой 5- или 6-членный моноциклический ароматический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 1, 2 или 3 гетероатома, выбранных из N, O и S, необязательно замещенный одним R₄ заместителем. В может представлять собой гетероарил, причем гетероарил представляет собой 5- или 6-членный моноциклический ароматический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 1, 2 или 3 атома N, и необязательно второй гетероатом, выбранный из O и S, необязательно замещенный одним R₄ заместителем. В может представлять собой гетероарил, причем гетероарил представляет собой 5- или 6-членный моноциклический ароматический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 2 или 3 гетероатома, выбранных из N, O и S, необязательно замещенный одним R₄ заместителем. В может представлять собой гетероарил, причем гетероарил представляет собой 5- или 6-членный моноциклический ароматический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 2 или 3 атома N, и необязательно второй гетероатом, выбранный из O и S, необязательно замещенный одним R₄ заместителем.

В может представлять собой гетероарил, выбранный из группы, состоящей из фуридила, тиафенила, 1Н-пиразолила, 1Н-имидазолила, изоксазолила, 1,3-тиазолила, 1,3-оксазолила, тетразолила, 1Н-1,2,3-триазолила, 2Н-1,2,3-триазолила, 1,2,4-оксадиазолила, 1,3,4-оксадиазолила, 1,2,3-тиадиазолила, пиридинила, пиримидинила, пиазинила, пиридазинила, 1Н-1,2,4-триазолила, 1,2,4-тиадиазолила, 1,3,4-

оксадиазолила, изотиазолила, 1,2,5-тиадиазолила и 1,3,4-тиадиазолила, необязательно замещенного одним R₄ заместителем.

В может представлять собой гетероарил, выбранный из группы, состоящей из 1Н-пиразолила, 1Н-имидазолила, 1,3-тиазолила, 1,3-оксазолила, 1Н-1,2,3-триазолила, 2Н-1,2,3-триазолила, пиридинила, пиримидинила, пиразинила, 1Н-1,2,4-триазолила, 1,2,4-тиадиазолила, 1,3,4-оксадиазолила, изотиазолила, 1,2,5-тиадиазолила и 1,3,4-тиадиазолила, необязательно замещенного одним R₄ заместителем.

В может представлять собой гетероарил, выбранный из группы, состоящей из 1Н-пиразолила, 1Н-имидазолила, 1,3-тиазолила, 1,3-оксазолила, 1Н-1,2,3-триазолила, 2Н-1,2,3-триазолила, пиридинила, пиримидинила, пиразинила, 1Н-1,2,4-триазолила, 1,2,4-тиадиазолила, 1,3,4-оксадиазолила, изотиазолила, 1,2,5-тиадиазолила и 1,3,4-тиадиазолила, замещенного одним R₄ заместителем.

В может представлять собой гетероарил, выбранный из группы, состоящей из фуран-2-ила, фуран-3-ила, тиафен-2-ила, тиафен-3-ила, 1Н-пиразол-1-ила, 1Н-пиразол-3-ила, 1Н-пиразол-4-ила, 1Н-пиразол-5-ила, 1Н-имидазол-1-ила, 1Н-имидазол-4-ила, изоксазол-3-ила, изоксазол-4-ила, изоксазол-5-ила, 1,3-тиазол-2-ила, 1,3-тиазол-4-ила, 1,3-тиазол-5-ила, 1,3-оксазол-2-ила, 1,3-оксазол-4-ила, 1,3-оксазол-5-ила, тетразол-5-ила, 1Н-1,2,3-триазол-1-ила, 1Н-1,2,3-триазол-4-ила, 1Н-1,2,3-триазол-5-ила, 2Н-1,2,3-триазол-2-ила, 2Н-1,2,3-триазол-4-ила, 2Н-1,2,3-триазол-5-ила, 1,2,4-оксадиазол-3-ила, 1,3,4-оксадиазол-2-ила, 1,2,3-тиадиазол-4-ила, 1,2,3-тиадиазол-5-ила, пиридин-2-ила, пиридин-3-ила, пиридин-4-ила, пиримидин-4-ила, пиримидин-2-ила, пиразин-2-ила, пиридазин-3-ила, пиридазин-4-ила, 1Н-1,2,4-триазол-3-ила, 1Н-1,2,4-триазол-5-ила, 1,2,4-тиадиазол-3-ила, 1,2,4-тиадиазол-5-ила, 1,3,4-оксадиазол-2-ила, изотиазол-3-ила, изотиазол-4-ила, изотиазол-5-ила, 1,2,5-тиадиазол-3-ила, 1,3,4-тиадиазол-2-ила, необязательно замещенного одним R₄ заместителем.

В может представлять собой гетероарил, выбранный из группы, состоящей из 1Н-пиразол-4-ила, 1Н-имидазол-1-ила, 1,3-тиазол-2-ила, 1,3-тиазол-4-ила, 1,3-оксазол-2-ила, 1Н-1,2,3-триазол-4-ила, 1Н-1,2,3-триазол-5-ила, 2Н-1,2,3-триазол-2-ила, 2Н-1,2,3-триазол-4-ила, пиридин-3-ила, пиридин-4-ила, пиримидин-4-ила, пиримидин-2-ила, пиразин-2-ила, 1Н-1,2,4-триазол-3-ила, 1,2,4-тиадиазол-3-ила, 1,2,4-тиадиазол-5-ила, 1,3,4-оксадиазол-2-ила, изотиазол-3-ила, изотиазол-4-ила, изотиазол-5-ила, 1,2,5-тиадиазол-3-ила, 1,3,4-тиадиазол-2-ила, необязательно замещенного одним R₄ заместителем.

В может представлять собой гетероарил, выбранный из группы, состоящей из 1Н-пиразол-4-ила, 1Н-имидазол-1-ила, 1,3-тиазол-2-ила, 1,3-тиазол-4-ила, 1,3-оксазол-2-ила, 1Н-1,2,3-триазол-4-ила, 1Н-1,2,3-триазол-5-ила, 2Н-1,2,3-триазол-2-ила, 2Н-1,2,3-триазол-4-ила, пиридин-3-ила, пиридин-4-ила, пиримидин-4-ила, пиримидин-2-ила, пиразин-2-ила, 1Н-1,2,4-триазол-3-ила, 1,2,4-тиадиазол-3-ила, 1,2,4-тиадиазол-5-ила, 1,3,4-оксадиазол-2-ила, изотиазол-3-ила, изотиазол-4-ила, изотиазол-5-ила, 1,2,5-тиадиазол-3-ила, 1,3,4-тиадиазол-2-ила, замещенного одним R₄ заместителем.

Один аспект включает соединение формулы (I), где В представляет собой гетероарил, причем гетероарил представляет собой 9- или 10-членный ароматический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 1, 2, 3 или 4 гетероатомных члена в кольце, независимо выбранных из N, O или S, необязательно замещенный одним или двумя независимо выбранными R₄ заместителями. В может представлять собой гетероарил, причем гетероарил представляет собой 9- или 10-членный бициклический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий по меньшей мере один атом N в кольце, необязательно содержащий второй гетероатом в кольце, выбранный из O или S, и необязательно замещенный одним или двумя независимо выбранными R₄ заместителями. В может представлять собой гетероарил, причем гетероарил представляет собой 9- или 10-членный бициклический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 2, 3 или 4 атома N, необязательно содержащий второй гетероатом в кольце, выбранный из O или S, и необязательно замещенный одним или двумя независимо выбранными R₄ заместителями. В может представлять собой гетероарил, причем гетероарил представляет собой 9-членный бициклический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 2, 3 или 4 атома N, необязательно замещенный одним или двумя независимо выбранными R₄ заместителями. В может представлять собой гетероарил, причем гетероарил представляет собой 9-членный бициклический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 2, 3 или 4 N, необязательно содержащий второй гетероатом в кольце, выбранный из O или S, и необязательно замещенный одним или двумя независимо выбранными R₄ заместителями. В может представлять собой гетероарил, причем гетероарил представляет собой незамещенный 9-членный бициклический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 2, 3 или 4 N, необязательно содержащий второй гетероатом в кольце, выбранный из O или S. В может представлять собой гетероарил, причем гетероарил представляет собой 9-членный бициклический радикал с кольцевой структурой из

атомов углерода, содержащий 2, 3 или 4 N, необязательно содержащий второй гетероатом в кольце, выбранный из O или S, и незамещенный или замещенный одним R₄ заместителем.

В может представлять собой гетероарил, выбранный из группы, состоящей из 1H-индазолила, 2H-индазолила, индолизинила, бензофуранила, бензотиофенила, 1H-бензимидазолила, 1,3-бензоксазолила, 1,3-бензотиазолила, 1,3-бензодиоксолила, 1,2,3-бензотриазолила, 7H-пуридила, фуоро[3,2-b]пиридинила, фуоро[3,2-c]пиридинила, 1,3-оксазоло[5,4-b]пиридинила, тиено[3,2-c]пиридинила, тиено[2,3-d]пиримидинила, пирроло[1,2-a]пиримидинила, пирроло[1,2-a]пиразинила, пирроло[1,2-b]пиридазинила, пиразоло[1,5-a]пиридинила, 1H-пирроло[2,3-b]пиридинила, 5H-пирроло[2,3-b]пиразинила, 1H-пирроло[2,3-c]пиридинила, 1H-пиразоло[3,4-b]пиридинила, 2H-пиразоло[3,4-b]пиридинила, 1H-пиразоло[3,4-b]пиразинила, 1H-пиразоло[3,4-c]пиридинила, 1H-пиразоло[4,3-b]пиридинила, 2H-пиразоло[4,3-b]пиридинила, 2H-пиразоло[4,3-c]пиридинила, 1H-пиразоло[4,3-d]пиримидинила, пиразоло[1,5-a]пиразинила, имидазо[1,2-a]пиридинила, имидазо[1,2-a]пиримидинила, имидазо[1,2-a]пиразинила, имидазо[1,2-b]пиридазинила, имидазо[1,2-c]пиримидин-2-ила, 1H-имидазо[4,5-b]пиридинила, 3H-имидазо[4,5-b]пиридинила, имидазо[2,1-b][1,3]тиазолила, имидазо[2,1-b][1,3,4]тиадиазолила, [1,3]оксазоло[4,5-b]пиридинила, [1,2,3]триазоло[1,5-a]пиридинила, 1H-[1,2,3]триазоло[4,5-b]пиридинила, 3H-[1,2,3]триазоло[4,5-b]пиридинила, [1,2,4]триазоло[1,5-a]пиридинила, [1,2,4]триазоло[1,5-a]пиримидинила, [1,2,4]триазоло[1,5-a]пиразинила, [1,2,4]триазоло[1,5-b]пиридазинила, [1,2,4]триазоло[4,3-a]пиридинила, тетразоло[1,5-a]пиридинила, тетразоло[1,5-b]пиридазинила, тиазоло[4,5-b]пиразинила, тиазоло[5,4-c]пиридинила, хинолинила, изохинолинила, [1,2,5]тиадиазоло[3,4-b]пиридинила, 1H-пиразоло[3,4-d]пиримидинила, 1H-пирроло[3,2-b]пиридинила, 2H-[1,2,3]триазоло[4,5-b]пиридинила, 2H-[1,2,3]триазоло[4,5-c]пиридинила, 3H-[1,2,3]триазоло[4,5-b]пиридинила, 3H-[1,2,3]триазоло[4,5-c]пиридинила, бензо[с][1,2,5]тиадиазолила, имидазо[1,5-a]пиридинила, пиразоло[1,5-a]пиримидинила и тиазоло[5,4-b]пиридинила, необязательно замещенного одним или двумя независимо выбранными R₄ заместителями.

В может представлять собой гетероарил выбранный из группы, состоящей из 2H-индазолила, 7H-пуридила, фуоро[3,2-b]пиридинила, пиразоло[1,5-a]пиридинила, 2H-пиразоло[3,4-b]пиридинила, 1H-пиразоло[4,3-b]пиридинила, имидазо[1,2-a]пиридинила,

имидазо[1,2-а]пиразинила, имидазо[1,2-б]пиридазинила, [1,2,3]триазоло[1,5-а]пиридинила, 1Н-[1,2,3]триазоло[4,5-б]пиридинила, [1,2,4]триазоло[1,5-а]пиридинила, [1,2,4]триазоло[1,5-а]пиримидинила, [1,2,4]триазоло[1,5-а]пиразинила, [1,2,4]триазоло[1,5-б]пиридазинила, [1,2,4]триазоло[4,3-а]пиридинила, тиазоло[4,5-б]пиразинила, тиазоло[5,4-с]пиридинила, [1,2,5]тиадиазоло[3,4-б]пиридинила, 1Н-пиразоло[3,4-д]пиримидинила, 1Н-пирроло[3,2-б]пиридинила, 2Н-[1,2,3]триазоло[4,5-б]пиридинила, 2Н-[1,2,3]триазоло[4,5-с]пиридинила, 3Н-[1,2,3]триазоло[4,5-б]пиридинила, 3Н-[1,2,3]триазоло[4,5-с]пиридинила, бензо[с][1,2,5]тиадиазолила, имидазо[1,5-а]пиридинила, пиразоло[1,5-а]пиримидинила и тиазоло[5,4-б]пиридинила, необязательно замещенного одним или двумя независимо выбранными R₄ заместителями.

В может представлять собой гетероарил выбранный из группы, состоящей из 2Н-индазолила, 7Н-пуридила, фуоро[3,2-б]пиридинила, пиразоло[1,5-а]пиридинила, 2Н-пиразоло[3,4-б]пиридинила, 1Н-пиразоло[4,3-б]пиридинила, имидазо[1,2-а]пиридинила, имидазо[1,2-а]пиразинила, имидазо[1,2-б]пиридазинила, [1,2,3]триазоло[1,5-а]пиридинила, 1Н-[1,2,3]триазоло[4,5-б]пиридинила, [1,2,4]триазоло[1,5-а]пиридинила, [1,2,4]триазоло[1,5-а]пиримидинила, [1,2,4]триазоло[1,5-а]пиразинила, [1,2,4]триазоло[1,5-б]пиридазинила, [1,2,4]триазоло[4,3-а]пиридинила, тиазоло[4,5-б]пиразинила, тиазоло[5,4-с]пиридинила, [1,2,5]тиадиазоло[3,4-б]пиридинила, 1Н-пиразоло[3,4-д]пиримидинила, 1Н-пирроло[3,2-б]пиридинила, 2Н-[1,2,3]триазоло[4,5-б]пиридинила, 2Н-[1,2,3]триазоло[4,5-с]пиридинила, 3Н-[1,2,3]триазоло[4,5-б]пиридинила, 3Н-[1,2,3]триазоло[4,5-с]пиридинила, бензо[с][1,2,5]тиадиазолила, имидазо[1,5-а]пиридинила, пиразоло[1,5-а]пиримидинила и тиазоло[5,4-б]пиридинила, замещенного одним R₄ заместителем.

В может представлять собой гетероарил выбранный из группы, состоящей из 2Н-индазолила, 7Н-пуридила, фуоро[3,2-б]пиридинила, пиразоло[1,5-а]пиридинила, 2Н-пиразоло[3,4-б]пиридинила, 1Н-пиразоло[4,3-б]пиридинила, имидазо[1,2-а]пиридинила, имидазо[1,2-а]пиразинила, имидазо[1,2-б]пиридазинила, [1,2,3]триазоло[1,5-а]пиридинила, 1Н-[1,2,3]триазоло[4,5-б]пиридинила, [1,2,4]триазоло[1,5-а]пиридинила, [1,2,4]триазоло[1,5-а]пиримидинила, [1,2,4]триазоло[1,5-а]пиразинила, [1,2,4]триазоло[1,5-б]пиридазинила, [1,2,4]триазоло[4,3-а]пиридинила, тиазоло[4,5-б]пиразинила, тиазоло[5,4-с]пиридинила, [1,2,5]тиадиазоло[3,4-б]пиридинила, 1Н-пиразоло[3,4-д]пиримидинила, 1Н-пирроло[3,2-б]пиридинила, 2Н-[1,2,3]триазоло[4,5-б]пиридинила, 2Н-[1,2,3]триазоло[4,5-с]пиридинила, 3Н-[1,2,3]триазоло[4,5-

b]пиридинила, 3H-[1,2,3]триазоло[4,5-с]пиридинила, бензо[с][1,2,5]тиадиазолила, имидазо[1,5-а]пиридинила, пиразоло[1,5-а]пиримидинила и тиазоло[5,4-б]пиридинила, замещенного двумя независимо выбранными R₄ заместителями.

В может представлять собой гетероарил, выбранный из группы, состоящей из 1H-индазол-5-ила, 2H-индазол-5-ила, индолизин-2-ила, бензофуран-2-ила, бензофуран-5-ила, бензотиофен-2-ила, бензотиофен-3-ила, 1H-бензимидазол-2-ила, 1H-бензимидазол-5-ила, 1H-бензимидазол-6-ила, 1,3-бензоксазол-2-ила, 1,3-бензоксазол-5-ила, 1,3-бензоксазол-6-ила, 1,3-бензотиазол-2-ила, 1,3-бензотиазол-5-ила, 1,3-бензотиазол-6-ила, 1,3-бензодиоксол-5-ила, 1,2,3-бензотриазол-5-ила, 7H-пурин-2-ила, фуоро[3,2-б]пиридин-2-ила, фуоро[3,2-с]пиридин-2-ила, фуоро[2,3-с]пиридин-2-ила, 1,3-оксазоло[5,4-б]пиридин-5-ила, тиено[3,2-с]пиридин-2-ила, тиено[2,3-д]пиримидин-6-ила, пирроло[1,2-а]пиримидин-7-ила, пирроло[1,2-а]пиразин-7-ила, пирроло[1,2-б]пиридазин-2-ила, пиразоло[1,5-а]пиридин-2-ила, пиразоло[1,5-а]пиридин-3-ила, пиразоло[1,5-а]пиридин-5-ила, 1H-пирроло[2,3-б]пиридин-5-ила, 5H-пирроло[2,3-б]пиразин-2-ила, 1H-пирроло[2,3-с]пиридин-4-ила, 1H-пиразоло[3,4-б]пиридин-5-ила, 1H-пиразоло[3,4-б]пиридин-6-ила, 2H-пиразоло[3,4-б]пиридин-5-ила, 1H-пиразоло[3,4-б]пиразин-5-ила, 1H-пиразоло[3,4-с]пиридин-1-ила, 1H-пиразоло[3,4-с]пиридин-5-ила, 1H-пиразоло[4,3-б]пиридин-1-ила, 1H-пиразоло[4,3-б]пиридин-5-ила, 1H-пиразоло[4,3-б]пиридин-6-ила, 2H-пиразоло[4,3-б]пиридин-5-ила, 2H-пиразоло[4,3-с]пиридин-5-ила, 1H-пиразоло[4,3-д]пиримидин-5-ила, пиразоло[1,5-а]пиразин-2-ила, имидазо[1,2-а]пиридин-2-ила, имидазо[1,2-а]пиридин-6-ила, имидазо[1,2-а]пиримидин-2-ила, имидазо[1,2-а]пиримидин-6-ила, имидазо[1,2-а]пиразин-2-ила, имидазо[1,2-а]пиразин-6-ила, имидазо[1,2-б]пиридазин-2-ила, имидазо[1,2-б]пиридазин-6-ила, имидазо[1,2-с]пиримидин-2-ила, 1H-имидазо[4,5-б]пиридин-5-ила, 3H-имидазо[4,5-б]пиридин-5-ила, имидазо[2,1-б][1,3]тиазол-6-ила, имидазо[2,1-б][1,3,4]тиадиазол-6-ила, [1,3]оксазоло[4,5-б]пиридин-2-ила, [1,2,3]триазоло[1,5-а]пиридин-5-ила, [1,2,3]триазоло[1,5-а]пиридин-6-ила, 1H-[1,2,3]триазоло[4,5-б]пиридин-5-ила, 1H-[1,2,3]триазоло[4,5-б]пиридин-6-ила, 3H-[1,2,3]триазоло[4,5-б]пиридин-5-ила, [1,2,4]триазоло[1,5-а]пиридин-6-ила, [1,2,4]триазоло[1,5-а]пиримидин-2-ила, [1,2,4]триазоло[1,5-а]пиримидин-6-ила, [1,2,4]триазоло[1,5-а]пиразин-6-ила, [1,2,4]триазоло[1,5-б]пиридазин-6-ила, [1,2,4]триазоло[4,3-а]пиридин-6-ила, тетразоло[1,5-а]пиридин-7-ила, тетразоло[1,5-

b]пиридазин-7-ила, тиазоло[4,5-b]пиразин-2-ила, тиазоло[5,4-с]пиридин-2-ила, тетразоло[1,5-a]пиридин-7-ила, тетразоло[1,5-b]пиридазин-7-ила, хинолин-6-ила, изохинолин-6-ила, [1,2,5]тиадиазоло[3,4-b]пиридин-6-ила, 1Н-пиразоло[3,4-d]пиримидин-1-ила, 1Н-пирроло[3,2-b]пиридин-1-ила, 2Н-[1,2,3]триазоло[4,5-b]пиридин-5-ила, 2Н-[1,2,3]триазоло[4,5-b]пиридин-6-ила, 2Н-[1,2,3]триазоло[4,5-с]пиридин-6-ила, 2Н-[1,2,3]триазоло[4,5-b]пиридин-6-ила, 3Н-[1,2,3]триазоло[4,5-с]пиридин-6-ила, бензо[с][1,2,5]тиадиазол-5-ила, имидазо[1,5-a]пиридин-6-ила, имидазо[1,5-a]пиридин-7-ила, пиразоло[1,5-a]пиримидин-3-ила, тиазоло[5,4-b]пиридин-2-ила, необязательно замещенного одним или двумя независимо выбранными R₄ заместителями.

В может представлять собой гетероарил, выбранный из группы, состоящей из 1Н-индазол-5-ила, 7Н-пурин-2-ила, фуоро[3,2-b]пиридин-2-ила, пиразоло[1,5-a]пиридин-3-ила, 2Н-пиразоло[3,4-b]пиридин-5-ила, 1Н-пиразоло[4,3-b]пиридин-1-ила, имидазо[1,2-a]пиридин-6-ила, имидазо[1,2-a]пиразин-6-ила, имидазо[1,2-b]пиридазин-6-ила [1,2,3]триазоло[1,5-a]пиридин-6-ила, 1Н-[1,2,3]триазоло[4,5-b]пиридин-5-ила, 1Н-[1,2,3]триазоло[4,5-b]пиридин-6-ила, [1,2,4]триазоло[1,5-a]пиридин-6-ила, [1,2,4]триазоло[1,5-a]пиримидин-2-ила, [1,2,4]триазоло[1,5-a]пиримидин-6-ила, [1,2,4]триазоло[1,5-a]пиразин-6-ила, [1,2,4]триазоло[1,5-b]пиридазин-6-ила, [1,2,4]триазоло[4,3-a]пиридин-6-ила, тиазоло[4,5-b]пиразин-2-ила, тиазоло[5,4-с]пиридин-2-ила, [1,2,5]тиадиазоло[3,4-b]пиридин-6-ила, 1Н-пиразоло[3,4-d]пиримидин-1-ила, 1Н-пирроло[3,2-b]пиридин-1-ила, 2Н-[1,2,3]триазоло[4,5-b]пиридин-5-ила, 2Н-[1,2,3]триазоло[4,5-b]пиридин-6-ила, 2Н-[1,2,3]триазоло[4,5-с]пиридин-6-ила, 2Н-[1,2,3]триазоло[4,5-b]пиридин-6-ила, 3Н-[1,2,3]триазоло[4,5-с]пиридин-6-ила, бензо[с][1,2,5]тиадиазол-5-ила, имидазо[1,5-a]пиридин-6-ила, имидазо[1,5-a]пиридин-7-ила, пиразоло[1,5-a]пиримидин-3-ила, тиазоло[5,4-b]пиридин-2-ила, необязательно замещенного одним или двумя независимо выбранными R₄ заместителями.

В может представлять собой гетероарил, выбранный из группы, состоящей из 1Н-индазол-5-ила, 7Н-пурин-2-ила, фуоро[3,2-b]пиридин-2-ила, пиразоло[1,5-a]пиридин-3-ила, 2Н-пиразоло[3,4-b]пиридин-5-ила, 1Н-пиразоло[4,3-b]пиридин-1-ила, имидазо[1,2-a]пиридин-6-ила, имидазо[1,2-a]пиразин-6-ила, имидазо[1,2-b]пиридазин-6-ила [1,2,3]триазоло[1,5-a]пиридин-6-ила, 1Н-[1,2,3]триазоло[4,5-b]пиридин-5-ила, 1Н-[1,2,3]триазоло[4,5-b]пиридин-6-ила, [1,2,4]триазоло[1,5-a]пиридин-6-ила, [1,2,4]триазоло[1,5-a]пиримидин-2-ила,

[1,2,4]триазоло[1,5-а]пиримидин-6-ила, [1,2,4]триазоло[1,5-а]пиразин-6-ила, [1,2,4]триазоло[1,5-б]пиридазин-6-ила, [1,2,4]триазоло[4,3-а]пиридин-6-ила, тиазоло[4,5-б]пиразин-2-ила, тиазоло[5,4-с]пиридин-2-ила, [1,2,5]тиадиазоло[3,4-б]пиридин-6-ила, 1Н-пиразоло[3,4-д]пиримидин-1-ила, 1Н-пирроло[3,2-б]пиридин-1-ила, 2Н-[1,2,3]триазоло[4,5-б]пиридин-5-ила, 2Н-[1,2,3]триазоло[4,5-б]пиридин-6-ила, 2Н-[1,2,3]триазоло[4,5-с]пиридин-6-ила, 2Н-[1,2,3]триазоло[4,5-б]пиридин-6-ила, 3Н-[1,2,3]триазоло[4,5-с]пиридин-6-ила, бензо[с][1,2,5]тиадиазол-5-ила, имидазо[1,5-а]пиридин-6-ила, имидазо[1,5-а]пиридин-7-ила, пиразоло[1,5-а]пиримидин-3-ила, тиазоло[5,4-б]пиридин-2-ила, замещенного одним R₄ заместителем.

В может представлять собой гетероарил, выбранный из группы, состоящей из 1Н-индазол-5-ила, 7Н-пурин-2-ила, фуоро[3,2-б]пиридин-2-ила, пиразоло[1,5-а]пиридин-3-ила, 2Н-пиразоло[3,4-б]пиридин-5-ила, 1Н-пиразоло[4,3-б]пиридин-1-ила, имидазо[1,2-а]пиридин-6-ила, имидазо[1,2-а]пиразин-6-ила, имидазо[1,2-б]пиридазин-6-ила [1,2,3]триазоло[1,5-а]пиридин-6-ила, 1Н-[1,2,3]триазоло[4,5-б]пиридин-5-ила, 1Н-[1,2,3]триазоло[4,5-б]пиридин-6-ила, [1,2,4]триазоло[1,5-а]пиридин-6-ила, [1,2,4]триазоло[1,5-а]пиримидин-2-ила, [1,2,4]триазоло[1,5-а]пиримидин-6-ила, [1,2,4]триазоло[1,5-а]пиразин-6-ила, [1,2,4]триазоло[1,5-б]пиридазин-6-ила, [1,2,4]триазоло[4,3-а]пиридин-6-ила, тиазоло[4,5-б]пиразин-2-ила, тиазоло[5,4-с]пиридин-2-ила, [1,2,5]тиадиазоло[3,4-б]пиридин-6-ила, 1Н-пиразоло[3,4-д]пиримидин-1-ила, 1Н-пирроло[3,2-б]пиридин-1-ила, 2Н-[1,2,3]триазоло[4,5-б]пиридин-5-ила, 2Н-[1,2,3]триазоло[4,5-б]пиридин-6-ила, 2Н-[1,2,3]триазоло[4,5-с]пиридин-6-ила, 2Н-[1,2,3]триазоло[4,5-б]пиридин-6-ила, 3Н-[1,2,3]триазоло[4,5-с]пиридин-6-ила, бензо[с][1,2,5]тиадиазол-5-ила, имидазо[1,5-а]пиридин-6-ила, имидазо[1,5-а]пиридин-7-ила, пиразоло[1,5-а]пиримидин-3-ила, тиазоло[5,4-б]пиридин-2-ила, замещенного двумя независимо выбранными R₄ заместителями.

Один аспект включает соединение формулы (I), в котором В представляет собой гетероциклил, причем гетероциклил представляет собой 8-10-членный бициклический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 1, 2, 3 или 4 гетероатомных члена в кольце, независимо выбранных из N, O или S, необязательно замещенный одним или двумя независимо выбранными R₄ заместителями. В может представлять собой гетероциклил, причем гетероциклил представляет собой 8- или 9-членный бициклический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий по меньшей мере один N, необязательно замещенный одним или двумя

независимо выбранными R₄ заместителями. В может представлять собой гетероциклил, причем гетероциклил представляет собой 8- или 9-членный бициклический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 2, 3 или 4 N, необязательно замещенный одним или двумя независимо выбранными R₄ заместителями. В может представлять собой гетероциклил, причем гетероциклил представляет собой 9-членный бициклический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 2, 3 или 4 N, необязательно замещенный одним или двумя независимо выбранными R₄ заместителями, или гетероциклил представляет собой 8-членный бициклический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 2 или 3 N, необязательно замещенный одним или двумя независимо выбранными R₄ заместителями. В может представлять собой гетероциклил, причем гетероциклил представляет собой 8- или 9-членный бициклический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 2, 3 или 4 N, и необязательно содержащий второй гетероатомный член в кольце, выбранный из O или S, необязательно замещенный одним или двумя независимо выбранными R₄ заместителями. В может представлять собой гетероциклил, причем гетероциклил представляет собой 9-членный бициклический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 2, 3 или 4 N, и необязательно содержащий второй гетероатомный член в кольце, выбранный из O или S, необязательно замещенный одним или двумя независимо выбранными R₄ заместителями. В может представлять собой гетероциклил, причем гетероциклил представляет собой незамещенный 8- или 9-членный бициклический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 2, 3 или 4 N, необязательно содержащий второй гетероатомный член в кольце, выбранный из O или S. В может представлять собой гетероциклил, причем гетероциклил представляет собой 8- или 9-членный бициклический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 2, 3 или 4 N, необязательно содержащий второй гетероатомный член в кольце, выбранный из O или S, и незамещенный или замещенный одним R₄ заместителем.

В может представлять собой гетероциклил, выбранный из группы, состоящей из 5,6-дигидро-[1,2,4]триазоло[1,5-а]пиазин-7(8H)-ила, 2,3-дигидро-1H-имидазо[1,2-b]пиазолила, 5,6-дигидро-4H-пирроло[1,2-b]пиазолила, 4,5,6,7-тетрагидропиазоло[1,5-а]пиридирила, 5,6-дигидро-4H-пирроло[1,2-b]пиазолила, 6,7-дигидро-5H-пирроло[1,2-а]имидазолила, 5,6-дигидро-4H-пирроло[1,2-b]пиазолила и 5,6-дигидро-4H-пирроло[1,2-b]пиазолила, необязательно замещенного одним или

двумя независимо выбранными R₄ заместителями.

В может представлять собой гетероциклил, выбранный из группы, состоящей из 5,6-дигидро-[1,2,4]триазоло[1,5-а]пирозин-7(8Н)-ила, 2,3-дигидро-1Н-имидазо[1,2-б]пирозолила, 5,6-дигидро-4Н-пирроло[1,2-б]пирозолила, 4,5,6,7-тетрагидропирозоло[1,5-а]пиридинила, 5,6-дигидро-4Н-пирроло[1,2-б]пирозолила, 6,7-дигидро-5Н-пирроло[1,2-а]имидазолила, 5,6-дигидро-4Н-пирроло[1,2-б]пирозолила и 5,6-дигидро-4Н-пирроло[1,2-б]пирозолила, замещенного двумя независимо выбранными R₄ заместителями.

В может представлять собой гетероциклил, выбранный из группы, состоящей из 5,6-дигидро-[1,2,4]триазоло[1,5-а]пирозин-7(8Н)-ила, 2,3-дигидро-1Н-имидазо[1,2-б]пирозолила, 5,6-дигидро-4Н-пирроло[1,2-б]пирозолила, 4,5,6,7-тетрагидропирозоло[1,5-а]пиридинила, 5,6-дигидро-4Н-пирроло[1,2-б]пирозолила, 6,7-дигидро-5Н-пирроло[1,2-а]имидазолила, 5,6-дигидро-4Н-пирроло[1,2-б]пирозолила и 5,6-дигидро-4Н-пирроло[1,2-б]пирозолила, замещенного одним R₄ заместителем.

В может представлять собой гетероциклил, выбранный из группы, состоящей из 5,6-дигидро-[1,2,4]триазоло[1,5-а]пирозин-7(8Н)-ила, 2,3-дигидро-1Н-имидазо[1,2-б]пирозол-7-ила, 5,6-дигидро-4Н-пирроло[1,2-б]пирозол-3-ила, 4,5,6,7-тетрагидропирозоло[1,5-а]пиридин-3-ила, 5,6-дигидро-4Н-пирроло[1,2-б]пирозол-3-ила, 6,7-дигидро-5Н-пирроло[1,2-а]имидазол-3-ила, 5,6-дигидро-4Н-пирроло[1,2-б]пирозол-3-ила и 5,6-дигидро-4Н-пирроло[1,2-б]пирозол-3-ила, необязательно замещенного одним или двумя независимо выбранными R₄ заместителями.

В может представлять собой гетероциклил, выбранный из группы, состоящей из 5,6-дигидро-[1,2,4]триазоло[1,5-а]пирозин-7(8Н)-ила, 2,3-дигидро-1Н-имидазо[1,2-б]пирозол-7-ила, 5,6-дигидро-4Н-пирроло[1,2-б]пирозол-3-ила, 4,5,6,7-тетрагидропирозоло[1,5-а]пиридин-3-ила, 5,6-дигидро-4Н-пирроло[1,2-б]пирозол-3-ила, 6,7-дигидро-5Н-пирроло[1,2-а]имидазол-3-ила, 5,6-дигидро-4Н-пирроло[1,2-б]пирозол-3-ила и 5,6-дигидро-4Н-пирроло[1,2-б]пирозол-3-ила, замещенного одним R₄ заместителем.

В может представлять собой гетероциклил, выбранный из группы, состоящей из 5,6-дигидро-[1,2,4]триазоло[1,5-а]пирозин-7(8Н)-ила, 2,3-дигидро-1Н-имидазо[1,2-б]пирозол-7-ила, 5,6-дигидро-4Н-пирроло[1,2-б]пирозол-3-ила, 4,5,6,7-тетрагидропирозоло[1,5-а]пиридин-3-ила, 5,6-дигидро-4Н-пирроло[1,2-б]пирозол-3-ила, 6,7-дигидро-5Н-пирроло[1,2-а]имидазол-3-ила, 5,6-дигидро-4Н-пирроло[1,2-б]пирозол-3-ила и 5,6-дигидро-4Н-пирроло[1,2-б]пирозол-3-ила, замещенного двумя независимо

выбранными R₄ заместителями.

В может быть выбран из группы, состоящей из:

фенила, необязательно замещенного одним или двумя независимо выбранными заместителями R₄;

гетероарила,

причем гетероарил представляет собой 5- или 6-членный моноциклический ароматический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий по меньшей мере один атом N (или по меньшей мере два атома N), и необязательно второй гетероатом, выбранный из O и S, необязательно замещенный одним R₄ заместителем.

причем гетероарил представляет собой 9-членный бициклический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий по меньшей мере 2 атома N, необязательно содержащий второй гетероатомный член в кольце, выбранный из O или S, и необязательно замещенный одним или двумя независимо выбранными R₄ заместителями; и

гетероциклила,

причем гетероциклил представляет собой 8- или 9-членный бициклический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий по меньшей мере один атом N (или по меньшей мере 2 атома N), необязательно содержащий второй гетероатомный член в кольце, выбранный из O или S, и необязательно замещенный одним или двумя независимо выбранными R₄ заместителями.

В может быть выбран из группы, состоящей из:

фенила, незамещенного или замещенного одним R₄ заместителем;

гетероарила,

причем гетероарил представляет собой 5- или 6-членный моноциклический ароматический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 1, 2 или 3 атома N, и необязательно, когда кольцевая структура содержит 1 или 2 N, второй гетероатом, выбранный из O и S, необязательно замещенный одним R₄ заместителем, или

причем гетероарил представляет собой 9-членный бициклический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 2, 3 или 4 атома N, необязательно, когда кольцевая структура содержит 2 или 3 N, содержащий второй гетероатомный член в кольце, выбранный из O или S, и необязательно замещенный одним или двумя независимо выбранными R₄ заместителями; и

гетероциклила,

причем гетероциклил представляет собой 8- или 9-членный бициклический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 2, 3 или 4 атома N, и необязательно, когда кольцевая структура содержит 2 или 3 N, содержащий второй гетероатомный член в кольце, выбранный из O или S, необязательно замещенный одним или двумя независимо выбранными R₄ заместителями. В может представлять собой гетероарил или гетероцикл,

причем гетероарил представляет собой 5- или 6-членный моноциклический ароматический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 1, 2 или 3 атома N, и необязательно, когда кольцевая структура содержит 1 или 2 N, второй гетероатом, выбранный из O и S, необязательно замещенный одним R₄ заместителем, или

причем гетероарил представляет собой 9-членный бициклический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 2, 3 или 4 атома N, необязательно, когда кольцевая структура содержит 2 или 3 N, содержащий второй гетероатомный член в кольце, выбранный из O или S, и необязательно замещенный одним или двумя независимо выбранными R₄ заместителями; и

причем гетероциклил представляет собой 8- или 9-членный бициклический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 2, 3 или 4 атома N, и необязательно, когда кольцевая структура содержит 2 или 3 N, содержащий второй гетероатомный член в кольце, выбранный из O или S, необязательно замещенный одним или двумя независимо выбранными R₄ заместителями.

В может представлять собой гетероарил,

причем гетероарил представляет собой 5- или 6-членный моноциклический ароматический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 1, 2 или 3 атома N, и необязательно, когда кольцевая структура содержит 1 или 2 N, второй гетероатом, выбранный из O и S, необязательно замещенный одним R₄ заместителем, или

причем гетероарил представляет собой 9-членный бициклический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 2, 3 или 4 атома N, необязательно, когда кольцевая структура содержит 2 или 3 N, содержащий второй гетероатомный член в кольце, выбранный из O или S, и необязательно замещенный одним или двумя независимо выбранными R₄ заместителями.

Один аспект включает соединение Формулы (I), причем R₄ выбран из группы, состоящей из галогена, циано, C₁₋₄алкила, дейтеро-C₁₋₄алкила, галоген-C₁₋₄алкила,

C₁₋₄алкокси, дейтеро-C₁₋₄алкокси, amino, C₁₋₄алкил-amino, (C₁₋₄алкил)₂-amino, C₃₋₆циклоалкила и гетероциклила, причем гетероциклил представляет собой 3-6-членный моноциклический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 1 или 2 гетероатомных члена в кольце, независимо выбранных из N, O или S.

R₄ может быть выбран из группы, состоящей из галогена, циано, C₁₋₄алкила, дейтеро-C₁₋₄алкила, галоген-C₁₋₄алкила, C₁₋₄алкокси, дейтеро-C₁₋₄алкокси, C₁₋₄алкил-amino, C₃₋₆циклоалкила и гетероциклила.

R₄ может представлять собой галоген, выбранный из группы, состоящей из брома, хлора, фтора и йода. R₄ может представлять собой галоген, выбранный из группы, состоящей из хлора и фтора. R₄ может представлять собой хлор. R₄ может представлять собой фтор.

R₄ может представлять собой циано.

R₄ может представлять собой C₁₋₄алкил, выбранный из группы, состоящей из метила, этила, пропила, изопропила, бутила и трет-бутила. R₄ может представлять собой метил или этил. R₄ может представлять собой метил. R₄ может представлять собой этил.

R₄ может представлять собой дейтеро-C₁₋₄алкил, причем C₁₋₄алкил выбран из группы, состоящей из метила, этила, пропила, изопропила, бутила и трет-бутила, частично или полностью замещенного одним или более атомами дейтерия, где это разрешено доступными валентностями. R₄ может представлять собой (²H₃)метил.

R₄ может представлять собой галоген-C₁₋₄алкил, причем C₁₋₄алкил выбран из группы, состоящей из метила, этила, пропила, изопропила, бутила и трет-бутила, частично или полностью замещенного одним или более атомами галогена, где это разрешено доступными валентностями. R₄ может представлять собой галоген-C₁₋₄алкил, выбранный из группы, состоящей из дифторметила и трифторметила. R₄ может представлять собой дифторметил. R₄ может представлять собой трифторметил.

R₄ может представлять собой C₁₋₄алкокси, выбранный из группы, состоящей из метокси, этокси, пропокси, изопропокси, бутокси и трет-бутокси. R₄ может представлять собой метокси.

R₄ может представлять собой дейтеро-C₁₋₄алкокси, причем C₁₋₄алкокси выбран из группы, состоящей из метокси, этокси, пропокси, изопропокси, бутокси и трет-бутокси, частично или полностью замещенного одним или более атомами дейтерия, где это разрешено доступными валентностями. R₄ может представлять собой (²H₃)метокси.

R₄ может представлять собой C₃₋₆циклоалкил, выбранный из группы, состоящей

из циклопропила, циклобутила, циклопентила и циклогексила. R_4 может представлять собой циклопропил.

R_4 может представлять собой C_{1-4} алкил-амино, причем C_{1-4} алкил выбран из группы, состоящей из метила, этила, пропила, изопропила, бутила, изобутила, втор-бутила и трет-бутила. R_4 может представлять собой метиламино.

R_4 может представлять собой гетероциклил, причем гетероциклил представляет собой 3-4 членный моноциклический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 1 или 2 гетероатомных члена в кольце, независимо выбранных из N, O или S. R_4 может представлять собой гетероциклил, выбранный из группы, состоящей из азиридила, озиранила, тирианила, азетидинила, оксетанила, тиетанила, пирролидинила, пиразолинила, тетрагидрофуранила, тилоланила, пиперидинила, пиперазинила, тетрагидро-2H-пиранила, 1,4-диоксанила, морфолинила и тианила. R_4 представляет собой азетидинил.

R_4 может быть выбран из группы, состоящей из галогена, циано, метила, этила, $(^2H_3)$ метила, $(^2H_3)$ этила, дифторметила, трифторметила, метокси, этокси, $(^2H_3)$ метокси, метиламино, этиламино, циклопропила и азетидинила.

Некоторые аспекты включают соединение Формулы (I), в котором X представляет собой CH. В других аспектах X представляет собой CF. В других аспектах X представляет собой N.

Один аспект включает соединение Формулы (I), в котором R_w выбран из группы, состоящей из галогена, гидроксила, циано, C_{1-4} алкила, дейтеро- C_{1-4} алкила, галоген- C_{1-4} алкила, amino, C_{1-4} алкил-amino, $(C_{1-4}$ алкил)₂-amino, C_{1-4} алкокси и галоген- C_{1-4} алкокси. R_w может быть выбран из группы, состоящей из галогена и C_{1-4} алкила. R_w может представлять собой галоген, выбранный из группы, состоящей из брома, хлора, фтора и йода. R_w может представлять собой фтор. R_w может представлять собой C_{1-4} алкил, выбранный из метила, этила, пропила, изопропила и трет-бутила. R_w может представлять собой метил. R_w может представлять собой фтор, хлор, бром, метил или этил.

Некоторые аспекты включают соединение Формулы (I), в котором n представляет собой 0. В других аспектах n представляет собой 1.

Один аспект включает соединение формулы (I), в котором n представляет собой 0, а R_1 представляет собой водород или C_{1-4} алкил. В одном аспекте n представляет собой 0, а X представляет собой C.

Один аспект включает соединение Формулы (I), в котором n представляет собой 0, R_2 представляет собой C_{1-4} алкил, галоген- C_{1-4} алкил, гидроксил- C_{1-4} алкил, циклопропил, циклобутил, фенил, или оксетанил, необязательно замещенный одним или двумя R_3 заместителями, и R_1 представляет собой водород или C_{1-4} алкил.

Один аспект включает соединение формулы (I), в котором A представляет собой A_1 , A_2 , A_3 , A_4 , A_5 или A_6 , n представляет собой 0, а R_1 представляет собой водород или C_{1-4} алкил. В другом аспекте A представляет собой A_1 , A_2 , A_3 , A_4 , A_5 или A_6 , n представляет собой 0, X представляет собой C , а R_1 представляет собой водород или C_{1-4} алкил.

Один аспект включает соединение Формулы (I), в котором:

n представляет собой 0;

X представляет собой C ;

R_2 представляет собой C_{1-4} алкил, галоген- C_{1-4} алкил, гидроксил- C_{1-4} алкил, циклопропил, циклобутил, фенил, или оксетанил, необязательно замещенный одним или двумя R_3 заместителями;

R_4 выбран из группы, состоящей из галогена, циано, C_{1-4} алкила, дейтеро- C_{1-4} алкила, галоген- C_{1-4} алкила, C_{1-4} алкокси, дейтеро- C_{1-4} алкокси, C_{1-4} алкил-амино, C_3 -6циклоалкила и гетероциклила;

R_1 представляет собой водород или C_{1-4} алкил; и

B выбран из группы, состоящей из:

фенила, незамещенного или замещенного одним R_4 заместителем;

гетероарила,

причем гетероарил представляет собой 5- или 6-членный моноциклический ароматический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 1, 2 или 3 атома N , и необязательно, когда кольцевая структура содержит 1 или 2 N , второй гетероатом, выбранный из O и S , необязательно замещенный одним R_4 заместителем, или

причем гетероарил представляет собой 9-членный бициклический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 2, 3 или 4 атома N , необязательно, когда кольцевая структура содержит 2 или 3 N , содержащий второй гетероатомный член в кольце, выбранный из O или S , и необязательно замещенный одним или двумя независимо выбранными R_4 заместителями; и

гетероциклила,

причем гетероциклил представляет собой 8- или 9-членный бициклический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 2, 3 или 4 атома N, и необязательно, когда кольцевая структура содержит 2 или 3 N, содержащий второй гетероатомный член в кольце, выбранный из O или S, необязательно замещенный одним или двумя независимо выбранными R₄ заместителями.

Один аспект включает соединение Формулы (I), в котором:

n представляет собой 0;

X представляет собой C;

R₂ представляет собой C₁₋₄алкил, галоген-C₁₋₄алкил, гидроксил-C₁₋₄алкил, циклопропил, циклобутил, фенил или оксетанил, необязательно замещенный одним или двумя R₃ заместителями;

R₄ выбран из группы, состоящей из галогена, циано, C₁₋₄алкила, дейтеро-C₁₋₄алкила, галоген-C₁₋₄алкила, C₁₋₄алкокси, дейтеро-C₁₋₄алкокси, C₁₋₄алкил-амино, C₃₋₆циклоалкила и гетероциклила;

R₁ представляет собой водород или C₁₋₄алкил;

A представляет собой A1-A24; и

B выбран из группы, состоящей из:

фенила, незамещенного или замещенного одним R₄ заместителем;

гетероарила,

причем гетероарил представляет собой 5- или 6-членный моноциклический ароматический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 1, 2 или 3 атома N, и необязательно, когда кольцевая структура содержит 1 или 2 N, второй гетероатом, выбранный из O и S, необязательно замещенный одним R₄ заместителем, или

причем гетероарил представляет собой 9-членный бициклический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 2, 3 или 4 атома N, необязательно, когда кольцевая структура содержит 2 или 3 N, содержащий второй гетероатомный член в кольце, выбранный из O или S, и необязательно замещенный одним или двумя независимо выбранными R₄ заместителями; и

гетероциклила,

причем гетероциклил представляет собой 8- или 9-членный бициклический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 2, 3 или 4 атома N, и необязательно, когда кольцевая структура содержит 2 или 3 N, содержащий второй гетероатомный член в кольце, выбранный из O или S, необязательно замещенный

одним или двумя независимо выбранными R₄ заместителями.

Один аспект включает соединение Формулы (I), в котором:

n представляет собой 0;

X представляет собой C;

R₂ представляет собой C₁₋₄алкил, галоген-C₁₋₄алкил, гидроксил-C₁₋₄алкил, циклопропил, циклобутил, фенил или оксетанил, необязательно замещенный одним или двумя R₃ заместителями;

R₄ выбран из группы, состоящей из галогена, циано, метила, этила, (²H₃)метила, (²H₃)этила, дифторметила, трифторметила, метокси, этокси, (²H₃)метокси, метиламино, этиламино, циклопропила и азетидинила;

R₁ представляет собой водород или C₁₋₄алкил;

A представляет собой A1-A6; и

B выбран из группы, состоящей из гетероарила и гетероцикла, причем гетероарил представляет собой 5- или 6-членный моноциклический ароматический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 1, 2 или 3 атома N, и необязательно, когда кольцевая структура содержит 1 или 2 N, второй гетероатом, выбранный из O и S, необязательно замещенный одним R₄ заместителем, или

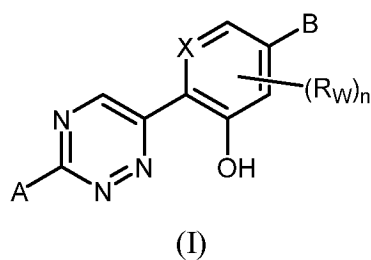
причем гетероарил представляет собой 9-членный бициклический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 2, 3 или 4 атома N, необязательно, когда кольцевая структура содержит 2 или 3 N, содержащий второй гетероатомный член в кольце, выбранный из O или S, и необязательно замещенный одним или двумя независимо выбранными R₄ заместителями; и

причем гетероцикл представляет собой 8- или 9-членный бициклический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 2, 3 или 4 атома N, и необязательно, когда кольцевая структура содержит 2 или 3 N, содержащий второй гетероатомный член в кольце, выбранный из O или S, необязательно замещенный одним или двумя независимо выбранными R₄ заместителями.

В одном варианте осуществления B является незамещенным. В другом варианте осуществления B представляет собой гетероарил, незамещенный или замещенный одним R₄ заместителем. В другом варианте осуществления B представляет собой 9-членный бициклический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода. В другом варианте осуществления B представляет собой 5- или 6-членный моноциклический ароматический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода. В одном варианте

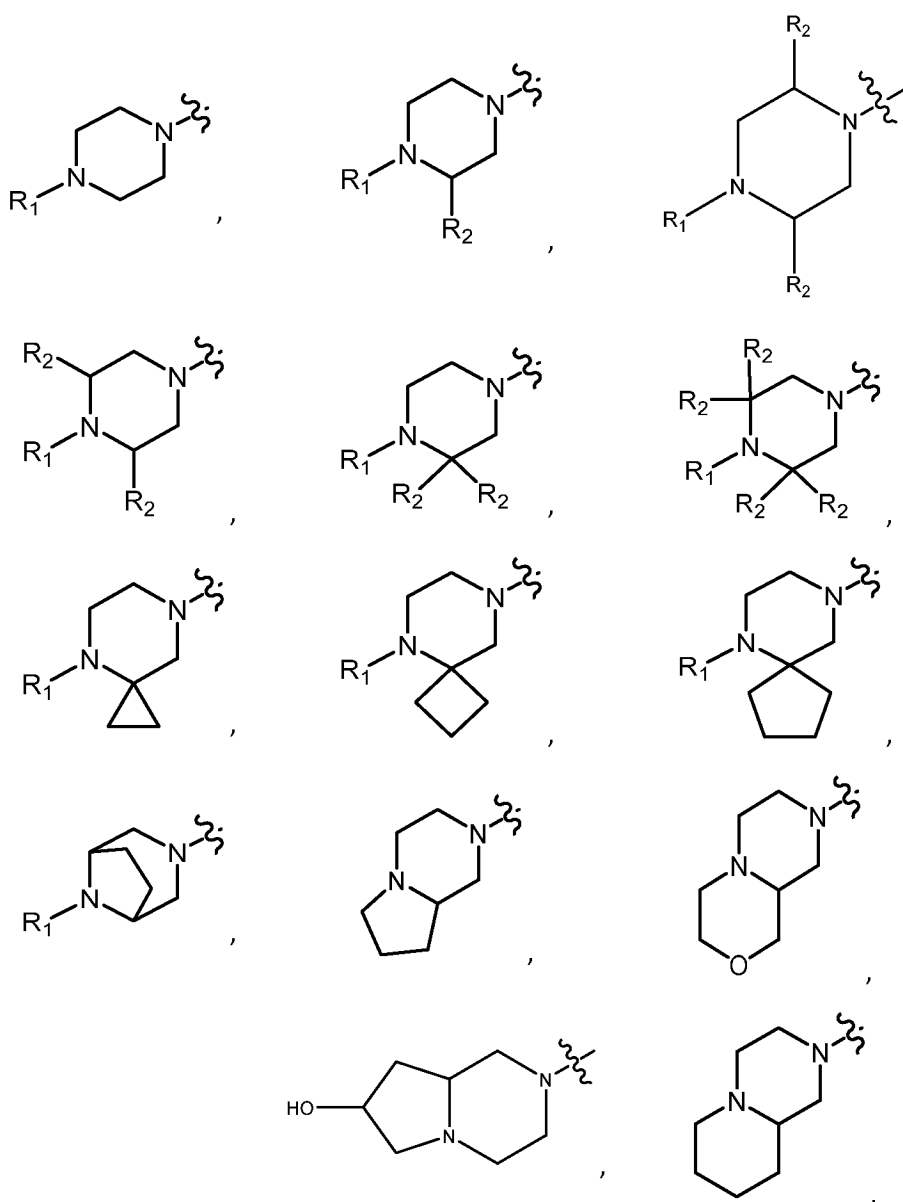
осуществления В представляет собой гетероцикл, незамещенный или замещенный одним R₄ заместителем.

Другой аспект включает соединение Формулы (I) или его форму:



где:

A выбран из группы, состоящей из:



и любого их стереоизомера;

R_1 выбран из группы, состоящей из водорода, C_{1-4} алкила, и C_{3-6} циклоалкила;

R_2 независимо выбран из группы, состоящей из галогена, C_{1-4} алкила, дейтеро-

C_{1-4} алкила, галоген- C_{1-4} алкила, гидроксил- C_{1-4} алкила, C_{1-4} алкокси- C_{1-4} алкила, C_{2-4} алкенила, C_{3-6} циклоалкила, фенила, пиридинила и гетероциклила, причем гетероциклил представляет собой 3-6-членный радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 1 или 2 гетероатомных члена в кольце, выбранных из N, O и S, и

причем в каждом случае C_{1-4} алкил, C_{3-6} циклоалкил, фенил, пиридинил и гетероциклил необязательно замещен одним или двумя заместителями R_3 ;

R_3 независимо выбран из группы, состоящей из галогена, гидроксила, C_{1-4} алкила, C_{1-4} алкокси и C_{3-6} циклоалкила;

B выбран из группы, состоящей из:

фенила, необязательно замещенного одним или двумя независимо выбранными заместителями R_4 ; и

гетероарила, причем гетероарил представляет собой 5- или 6-членный

моноциклический ароматический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 1, 2 или 3 гетероатома, выбранных из N, O и S, необязательно замещенный одним R_4 заместителем;

R_4 выбран из группы, состоящей из галогена, циано, C_{1-4} алкила, дейтеро- C_{1-4} алкила, галоген- C_{1-4} алкила, C_{1-4} алкокси, дейтеро- C_{1-4} алкокси, amino, C_{1-4} алкил-amino, $(C_{1-4}$ алкил)₂-amino, C_{3-6} циклоалкила и гетероциклила, причем гетероциклил представляет собой 3-6-членный моноциклический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 1 или 2 гетероатомных члена в кольце, независимо выбранных из N, O или S;

X выбран из группы, состоящей из CH, CF и N;

R_w выбран из группы, состоящей из галогена, гидроксила, циано, C_{1-4} алкила, дейтеро- C_{1-4} алкила, галоген- C_{1-4} алкила, amino, C_{1-4} алкил-amino, $(C_{1-4}$ алкил)₂-amino, C_{1-4} алкокси и галоген- C_{1-4} алкокси; и

n выбран из группы, состоящей из 0 или 1;

причем форма соединения выбрана из группы, состоящей из его соли, гидрата, сольвата и таутомерной формы.

За исключением случаев, когда это предусмотрено, каждый из терминов и определений для этого аспекта является таким, как определено выше.

В одном аспекте В может представлять собой 5- или 6-членный моноциклический ароматический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 1, 2 или 3 гетероатома, выбранных из N, O и S. В может быть выбран из группы, состоящей из: фенила, необязательно замещенного одним или двумя независимо выбранными R₄ заместителями; и гетероарила, причем гетероарил представляет собой 5- или 6-членный моноциклический ароматический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий по меньшей мере один атом N. В может быть выбран из группы, состоящей из: фенила, необязательно замещенного одним R₄ заместителем; и гетероарила, причем гетероарил представляет собой 5- или 6-членный моноциклический ароматический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 1, 2 или 3 атома N, и необязательно, когда кольцевая структура содержит 1 или 2 N, второй гетероатом, выбранный из O и S, необязательно замещенный одним R₄ заместителем. В может представлять собой гетероарил, причем гетероарил представляет собой 5- или 6-членный моноциклический ароматический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 1, 2 или 3 атома N, необязательно замещенный одним R₄ заместителем.

Один аспект включает соединение формулы (I), в котором В выбран из группы, состоящей из:

фенила, необязательно замещенного одним или двумя независимо выбранными заместителями R₄;

гетероарила, причем гетероарил представляет собой 5- или 6-членный моноциклический ароматический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 1, 2 или 3 гетероатома, выбранных из N, O и S, необязательно замещенный одним R₄ заместителем.

В может представлять собой фенил, необязательно замещенный одним или двумя независимо выбранными заместителями R₄. В может представлять собой незамещенный фенил или фенил, замещенный одним R₄ заместителем.

Один аспект включает соединение формулы (I), в котором В представляет собой гетероарил, причем гетероарил представляет собой 5- или 6-членный моноциклический ароматический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 1, 2 или 3 гетероатома, выбранных из N, O и S, необязательно замещенный одним R₄ заместителем. В может представлять собой гетероарил, причем гетероарил представляет собой 5- или 6-членный моноциклический ароматический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 1, 2 или 3 атома N, и

необязательно второй гетероатом, выбранный из O и S, необязательно замещенный одним R₄ заместителем. В может представлять собой гетероарил, причем гетероарил представляет собой 5- или 6-членный моноциклический ароматический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 2 или 3 гетероатома, выбранных из N, O и S, необязательно замещенный одним R₄ заместителем. В может представлять собой гетероарил, причем гетероарил представляет собой 5- или 6-членный моноциклический ароматический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 2 или 3 атома N, и необязательно второй гетероатом, выбранный из O и S, необязательно замещенный одним R₄ заместителем.

В может представлять собой гетероарил, выбранный из группы, состоящей из фуридила, тιοфенила, 1H-пиразолила, 1H-имидазолила, изоксазолила, 1,3-тиазолила, 1,3-оксазолила, тетразолила, 1H-1,2,3-триазолила, 2H-1,2,3-триазолила, 1,2,4-оксадиазолила, 1,3,4-оксадиазолила, 1,2,3-тиадиазолила, пиридинила, пиримидинила, пиазинила, пиридазинила, 1H-1,2,4-триазолила, 1,2,4-тиадиазолила, 1,3,4-оксадиазолила, изотиазолила, 1,2,5-тиадиазолила и 1,3,4-тиадиазолила, необязательно замещенного одним R₄ заместителем.

В может представлять собой гетероарил, выбранный из группы, состоящей из 1H-пиразолила, 1H-имидазолила, 1,3-тиазолила, 1,3-оксазолила, 1H-1,2,3-триазолила, 2H-1,2,3-триазолила, пиридинила, пиримидинила, пиазинила, 1H-1,2,4-триазолила, 1,2,4-тиадиазолила, 1,3,4-оксадиазолила, изотиазолила, 1,2,5-тиадиазолила и 1,3,4-тиадиазолила, необязательно замещенного одним R₄ заместителем.

В может представлять собой гетероарил, выбранный из группы, состоящей из 1H-пиразолила, 1H-имидазолила, 1,3-тиазолила, 1,3-оксазолила, 1H-1,2,3-триазолила, 2H-1,2,3-триазолила, пиридинила, пиримидинила, пиазинила, 1H-1,2,4-триазолила, 1,2,4-тиадиазолила, 1,3,4-оксадиазолила, изотиазолила, 1,2,5-тиадиазолила и 1,3,4-тиадиазолила, замещенного одним R₄ заместителем.

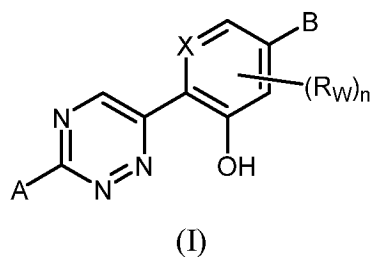
В может представлять собой гетероарил, выбранный из группы, состоящей из фуран-2-ила, фуран-3-ила, тιοфен-2-ила, тιοфен-3-ила, 1H-пиразол-1-ила, 1H-пиразол-3-ила, 1H-пиразол-4-ила, 1H-пиразол-5-ила, 1H-имидазол-1-ила, 1H-имидазол-4-ила, изоксазол-3-ила, изоксазол-4-ила, изоксазол-5-ила, 1,3-тиазол-2-ила, 1,3-тиазол-4-ила, 1,3-тиазол-5-ила, 1,3-оксазол-2-ила, 1,3-оксазол-4-ила, 1,3-оксазол-5-ила, тетразол-5-ила, 1H-1,2,3-триазол-1-ила, 1H-1,2,3-триазол-4-ила, 1H-1,2,3-триазол-5-ила, 2H-1,2,3-триазол-2-ила, 2H-1,2,3-триазол-4-ила, 2H-1,2,3-триазол-5-ила, 1,2,4-оксадиазол-3-ила, 1,3,4-оксадиазол-2-ила, 1,2,3-тиадиазол-4-ила,

1,2,3-тиадиазол-5-ила, пиридин-2-ила, пиридин-3-ила, пиридин-4-ила, пиримидин-4-ила, пиримидин-2-ила, пиразин-2-ила, пиридазин-3-ила, пиридазин-4-ила, 1Н-1,2,4-триазол-3-ила, 1Н-1,2,4-триазол-5-ила, 1,2,4-тиадиазол-3-ила, 1,2,4-тиадиазол-5-ила, 1,3,4-оксадиазол-2-ила, изотиазол-3-ила, изотиазол-4-ила, изотиазол-5-ила, 1,2,5-тиадиазол-3-ила, 1,3,4-тиадиазол-2-ила, необязательно замещенного одним R_4 заместителем.

В может представлять собой гетероарил, выбранный из группы, состоящей из 1Н-пиразол-4-ила, 1Н-имидазол-1-ила, 1,3-тиазол-2-ила, 1,3-тиазол-4-ила, 1,3-оксазол-2-ила, 1Н-1,2,3-триазол-4-ила, 1Н-1,2,3-триазол-5-ила, 2Н-1,2,3-триазол-2-ила, 2Н-1,2,3-триазол-4-ила, пиридин-3-ила, пиридин-4-ила, пиримидин-4-ила, пиримидин-2-ила, пиразин-2-ила, 1Н-1,2,4-триазол-3-ила, 1,2,4-тиадиазол-3-ила, 1,2,4-тиадиазол-5-ила, 1,3,4-оксадиазол-2-ила, изотиазол-3-ила, изотиазол-4-ила, изотиазол-5-ила, 1,2,5-тиадиазол-3-ила, 1,3,4-тиадиазол-2-ила, необязательно замещенного одним R_4 заместителем.

В может представлять собой гетероарил, выбранный из группы, состоящей из 1Н-пиразол-4-ила, 1Н-имидазол-1-ила, 1,3-тиазол-2-ила, 1,3-тиазол-4-ила, 1,3-оксазол-2-ила, 1Н-1,2,3-триазол-4-ила, 1Н-1,2,3-триазол-5-ила, 2Н-1,2,3-триазол-2-ила, 2Н-1,2,3-триазол-4-ила, пиридин-3-ила, пиридин-4-ила, пиримидин-4-ила, пиримидин-2-ила, пиразин-2-ила, 1Н-1,2,4-триазол-3-ила, 1,2,4-тиадиазол-3-ила, 1,2,4-тиадиазол-5-ила, 1,3,4-оксадиазол-2-ила, изотиазол-3-ила, изотиазол-4-ила, изотиазол-5-ила, 1,2,5-тиадиазол-3-ила, 1,3,4-тиадиазол-2-ила, замещенного одним R_4 заместителем.

В одном аспекте соединения Формулы (I) или его форма, представляет собой:



где:

R_3 независимо выбран из группы, состоящей из галогена, гидроксила, C_{1-4} алкила, C_{1-4} алкокси и C_{3-6} циклоалкила;

B выбран из группы, состоящей из:

гетероарила, причем гетероарил представляет собой 9- или 10-членный бициклический ароматический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 1, 2, 3 или 4 гетероатома в кольце, независимо выбранных из N, O или S, необязательно замещенный одним или двумя независимо выбранными R_4 заместителями; и

гетероциклила, причем гетероциклил представляет собой 8-10-членный бициклический ароматический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 1, 2, 3 или 4 гетероатомных члена в кольце, независимо выбранных из N, O или S, необязательно замещенный одним или двумя независимо выбранными R_4 заместителями;

R_4 выбран из группы, состоящей из галогена, циано, C_{1-4} алкила, дейтеро- C_{1-4} алкила, галоген- C_{1-4} алкила, C_{1-4} алкокси, дейтеро- C_{1-4} алкокси, amino, C_{1-4} алкил-amino, $(C_{1-4}$ алкил)₂-amino, C_{3-6} циклоалкила и гетероциклила, причем гетероциклил представляет собой 3-6-членный моноциклический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 1 или 2 гетероатомных члена в кольце, независимо выбранных из N, O или S;

X выбран из группы, состоящей из CH, CF и N;

R_w выбран из группы, состоящей из галогена, гидроксила, циано, C_{1-4} алкила, дейтеро- C_{1-4} алкила, галоген- C_{1-4} алкила, amino, C_{1-4} алкил-amino, $(C_{1-4}$ алкил)₂-amino, C_{1-4} алкокси, и галоген- C_{1-4} алкокси; и

n выбран из группы, состоящей из 0 или 1;

причем форма соединения выбрана из группы, состоящей из его соли, гидрата, сольвата и таутомерной формы.

За исключением случаев, когда это предусмотрено, каждый из терминов и определений для этого аспекта является таким, как определено выше.

B может представлять собой гетероарил, причем гетероарил представляет собой 9- или 10-членную бициклическую ароматическую кольцевую систему, содержащую 1, 2, 3 или 4 гетероатомных члена в кольце, независимо выбранных из N, O или S. B может представлять собой гетероарил, причем гетероарил представляет собой 9-членный бициклический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 2, 3 или 4 атома N, и необязательно замещенный одним или двумя

независимо выбранными R₄ заместителями.

В может представлять собой гетероциклил, причем гетероциклил представляет собой 8-10-членный бициклический ароматический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 1, 2, 3 или 4 гетероатомных члена в кольце, независимо выбранных из N, O или S.

В может быть выбран из группы, состоящей из:

гетероарила, причем гетероарил представляет собой 9-членный бициклический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий по меньшей мере 2 атома N; и

гетероциклила, причем гетероциклил представляет собой 8- или 9-членный бициклический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий по меньшей мере один атом N.

В может быть выбран из группы, состоящей из:

гетероарила, причем гетероарил представляет собой 9-членный бициклический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 2, 3 или 4 атома N, необязательно замещенный одним или двумя независимо выбранными R₄ заместителями; и

гетероциклила, причем гетероциклил представляет собой 8- или 9-членный бициклический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 2, 3 или 4 N, необязательно замещенный одним или двумя независимо выбранными R₄ заместителями.

Один аспект включает соединение формулы (I), в котором В представляет собой гетероарил, причем гетероарил представляет собой 9- или 10-членный ароматический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 1, 2, 3 или 4 гетероатомных члена в кольце, независимо выбранных из N, O или S, необязательно замещенный одним или двумя независимо выбранными R₄ заместителями. В может представлять собой гетероарил, причем гетероарил представляет собой 9- или 10-членный бициклический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий по меньшей мере один атом N в кольце, необязательно содержащий второй гетероатомный член в кольце, выбранный из O или S, и необязательно замещенный одним или двумя независимо выбранными R₄ заместителями. В может представлять собой гетероарил, причем гетероарил представляет собой 9- или 10-членный бициклический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 2, 3 или 4 атома N, необязательно содержащий второй гетероатомный член в кольце,

выбранный из O или S, и необязательно замещенный одним или двумя независимо выбранными R₄ заместителями. В может представлять собой гетероарил, причем гетероарил представляет собой 9-членный бициклический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 2, 3 или 4 атома N, необязательно замещенный одним или двумя независимо выбранными R₄ заместителями. В может представлять собой гетероарил, причем гетероарил представляет собой 9-членный бициклический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 2, 3 или 4 N, необязательно содержащий второй гетероатомный член в кольце, выбранный из O или S, и необязательно замещенный одним или двумя независимо выбранными R₄ заместителями. В может представлять собой гетероарил, причем гетероарил представляет собой незамещенный 9-членный бициклический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 2, 3 или 4 N, необязательно содержащий второй гетероатомный член в кольце, выбранный из O или S. В может представлять собой гетероарил, причем гетероарил представляет собой 9-членный бициклический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 2, 3 или 4 N, необязательно содержащий второй гетероатомный член в кольце, выбранный из O или S, и незамещенный или замещенный одним R₄ заместителем.

В может представлять собой гетероарил, выбранный из группы, состоящей из 1H-индазолила, 2H-индазолила, индолизинила, бензофуранила, бензотиофенила, 1H-бензимидазолила, 1,3-бензоксазолила, 1,3-бензотиазолила, 1,3-бензодиоксолила, 1,2,3-бензотриазолила, 7H-пуринила, фуро[3,2-b]пиридинила, фуро[3,2-c]пиридинила, 1,3-оксазоло[5,4-b]пиридинила, тиено[3,2-c]пиридинила, тиено[2,3-d]пиримидинила, пирроло[1,2-a]пиримидинила, пирроло[1,2-a]пиразинила, пирроло[1,2-b]пиридазинила, пиразоло[1,5-a]пиридинила, 1H-пирроло[2,3-b]пиридинила, 5H-пирроло[2,3-b]пиразинила, 1H-пирроло[2,3-c]пиридинила, 1H-пиразоло[3,4-b]пиридинила, 2H-пиразоло[3,4-b]пиридинила, 1H-пиразоло[3,4-b]пиразинила, 1H-пиразоло[3,4-c]пиридинила, 1H-пиразоло[4,3-b]пиридинила, 2H-пиразоло[4,3-b]пиридинила, 2H-пиразоло[4,3-c]пиридинила, 1H-пиразоло[4,3-d]пиримидинила, пиразоло[1,5-a]пиразинила, имидазо[1,2-a]пиридинила, имидазо[1,2-a]пиримидинила, имидазо[1,2-a]пиразинила, имидазо[1,2-b]пиридазинила, имидазо[1,2-c]пиримидин-2-ила, 1H-имидазо[4,5-b]пиридинила, 3H-имидазо[4,5-b]пиридинила, имидазо[2,1-b][1,3]тиазолила, имидазо[2,1-b][1,3,4]тиадиазолила, [1,3]оксазоло[4,5-b]пиридинила, [1,2,3]триазоло[1,5-a]пиридинила, 1H-[1,2,3]триазоло[4,5-b]пиридинила, 3H-[1,2,3]триазоло[4,5-b]пиридинила,

[1,2,4]триазоло[1,5-а]пиридинила, [1,2,4]триазоло[1,5-а]пиримидинила, [1,2,4]триазоло[1,5-а]пиразинила, [1,2,4]триазоло[1,5-б]пиридазинила, [1,2,4]триазоло[4,3-а]пиридинила, тетразоло[1,5-а]пиридинила, тетразоло[1,5-б]пиридазинила, тиазоло[4,5-б]пиразинила, тиазоло[5,4-с]пиридинила, хинолинила, изохинолинила, [1,2,5]тиадиазоло[3,4-б]пиридинила, 1Н-пиразоло[3,4-д]пиримидинила, 1Н-пирроло[3,2-б]пиридинила, 2Н-[1,2,3]триазоло[4,5-б]пиридинила, 2Н-[1,2,3]триазоло[4,5-с]пиридинила, 3Н-[1,2,3]триазоло[4,5-б]пиридинила, 3Н-[1,2,3]триазоло[4,5-с]пиридинила, бензо[с][1,2,5]тиадиазолила, имидазо[1,5-а]пиридинила, пиразоло[1,5-а]пиримидинила и тиазоло[5,4-б]пиридинила, необязательно замещенного одним или двумя независимо выбранными R₄ заместителями.

В может представлять собой гетероарил выбранный из группы, состоящей из 2Н-индазолила, 7Н-пуридила, фуоро[3,2-б]пиридинила, пиразоло[1,5-а]пиридинила, 2Н-пиразоло[3,4-б]пиридинила, 1Н-пиразоло[4,3-б]пиридинила, имидазо[1,2-а]пиридинила, имидазо[1,2-а]пиразинила, имидазо[1,2-б]пиридазинила, [1,2,3]триазоло[1,5-а]пиридинила, 1Н-[1,2,3]триазоло[4,5-б]пиридинила, [1,2,4]триазоло[1,5-а]пиридинила, [1,2,4]триазоло[1,5-а]пиримидинила, [1,2,4]триазоло[1,5-а]пиразинила, [1,2,4]триазоло[1,5-б]пиридазинила, [1,2,4]триазоло[4,3-а]пиридинила, тиазоло[4,5-б]пиразинила, тиазоло[5,4-с]пиридинила, [1,2,5]тиадиазоло[3,4-б]пиридинила, 1Н-пиразоло[3,4-д]пиримидинила, 1Н-пирроло[3,2-б]пиридинила, 2Н-[1,2,3]триазоло[4,5-б]пиридинила, 2Н-[1,2,3]триазоло[4,5-с]пиридинила, 3Н-[1,2,3]триазоло[4,5-б]пиридинила, 3Н-[1,2,3]триазоло[4,5-с]пиридинила, бензо[с][1,2,5]тиадиазолила, имидазо[1,5-а]пиридинила, пиразоло[1,5-а]пиримидинила и тиазоло[5,4-б]пиридинила, необязательно замещенного одним или двумя независимо выбранными R₄ заместителями.

В может представлять собой гетероарил выбранный из группы, состоящей из 2Н-индазолила, 7Н-пуридила, фуоро[3,2-б]пиридинила, пиразоло[1,5-а]пиридинила, 2Н-пиразоло[3,4-б]пиридинила, 1Н-пиразоло[4,3-б]пиридинила, имидазо[1,2-а]пиридинила, имидазо[1,2-а]пиразинила, имидазо[1,2-б]пиридазинила, [1,2,3]триазоло[1,5-а]пиридинила, 1Н-[1,2,3]триазоло[4,5-б]пиридинила, [1,2,4]триазоло[1,5-а]пиридинила, [1,2,4]триазоло[1,5-а]пиримидинила, [1,2,4]триазоло[1,5-а]пиразинила, [1,2,4]триазоло[1,5-б]пиридазинила, [1,2,4]триазоло[4,3-а]пиридинила, тиазоло[4,5-б]пиразинила, тиазоло[5,4-с]пиридинила, [1,2,5]тиадиазоло[3,4-б]пиридинила, 1Н-пиразоло[3,4-д]пиримидинила, 1Н-пирроло[3,2-б]пиридинила, 2Н-[1,2,3]триазоло[4,5-

b]пиридинила, 2H-[1,2,3]триазоло[4,5-с]пиридинила, 3H-[1,2,3]триазоло[4,5-b]пиридинила, 3H-[1,2,3]триазоло[4,5-с]пиридинила, бензо[с][1,2,5]тиадиазолила, имидазо[1,5-а]пиридинила, пиразоло[1,5-а]пиримидинила и тиазоло[5,4-b]пиридинила, замещенного одним R₄ заместителем.

В может представлять собой гетероарил выбранный из группы, состоящей из 2H-индазолила, 7H-пуридила, фуоро[3,2-b]пиридинила, пиразоло[1,5-а]пиридинила, 2H-пиразоло[3,4-b]пиридинила, 1H-пиразоло[4,3-b]пиридинила, имидазо[1,2-а]пиридинила, имидазо[1,2-а]пиразинила, имидазо[1,2-b]пиридазинила, [1,2,3]триазоло[1,5-а]пиридинила, 1H-[1,2,3]триазоло[4,5-b]пиридинила, [1,2,4]триазоло[1,5-а]пиридинила, [1,2,4]триазоло[1,5-а]пиримидинила, [1,2,4]триазоло[1,5-а]пиразинила, [1,2,4]триазоло[1,5-b]пиридазинила, [1,2,4]триазоло[4,3-а]пиридинила, тиазоло[4,5-b]пиразинила, тиазоло[5,4-с]пиридинила, [1,2,5]тиадиазоло[3,4-b]пиридинила, 1H-пиразоло[3,4-d]пиримидинила, 1H-пирроло[3,2-b]пиридинила, 2H-[1,2,3]триазоло[4,5-b]пиридинила, 2H-[1,2,3]триазоло[4,5-с]пиридинила, 3H-[1,2,3]триазоло[4,5-b]пиридинила, 3H-[1,2,3]триазоло[4,5-с]пиридинила, бензо[с][1,2,5]тиадиазолила, имидазо[1,5-а]пиридинила, пиразоло[1,5-а]пиримидинила и тиазоло[5,4-b]пиридинила, замещенного двумя независимо выбранными R₄ заместителями.

В может представлять собой гетероарил, выбранный из группы, состоящей из 1H-индазол-5-ила, 2H-индазол-5-ила, индолизин-2-ила, бензофуран-2-ила, бензофуран-5-ила, бензотиофен-2-ила, бензотиофен-3-ила, 1H-бензимидазол-2-ила, 1H-бензимидазол-5-ила, 1H-бензимидазол-6-ила, 1,3-бензоксазол-2-ила, 1,3-бензоксазол-5-ила, 1,3-бензоксазол-6-ила, 1,3-бензотиазол-2-ила, 1,3-бензотиазол-5-ила, 1,3-бензотиазол-6-ила, 1,3-бензодиоксол-5-ила, 1,2,3-бензотриазол-5-ила, 7H-пурин-2-ила, фуоро[3,2-b]пиридин-2-ила, фуоро[3,2-с]пиридин-2-ила, фуоро[2,3-с]пиридин-2-ила, 1,3-оксазоло[5,4-b]пиридин-5-ила, тиено[3,2-с]пиридин-2-ила, тиено[2,3-d]пиримидин-6-ила, пирроло[1,2-а]пиримидин-7-ила, пирроло[1,2-а]пиразин-7-ила, пирроло[1,2-b]пиридазин-2-ила, пиразоло[1,5-а]пиридин-2-ила, пиразоло[1,5-а]пиридин-3-ила, пиразоло[1,5-а]пиридин-5-ила, 1H-пирроло[2,3-b]пиридин-5-ила, 5H-пирроло[2,3-b]пиразин-2-ила, 1H-пирроло[2,3-с]пиридин-4-ила, 1H-пиразоло[3,4-b]пиридин-5-ила, 1H-пиразоло[3,4-b]пиридин-6-ила, 2H-пиразоло[3,4-b]пиридин-5-ила, 1H-пиразоло[3,4-b]пиразин-5-ила, 1H-пиразоло[3,4-с]пиридин-1-ила, 1H-пиразоло[3,4-с]пиридин-5-ила, 1H-пиразоло[4,3-b]пиридин-1-ила, 1H-пиразоло[4,3-b]пиридин-5-ила, 1H-пиразоло[4,3-b]пиридин-6-ила, 2H-

пиразоло[4,3-b]пиридин-5-ила, 2Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-5-ила, 1Н-пиразоло[4,3-d]пиримидин-5-ила, пиразоло[1,5-а]пиразин-2-ила, имидазо[1,2-а]пиридин-2-ила, имидазо[1,2-а]пиридин-6-ила, имидазо[1,2-а]пиримидин-2-ила, имидазо[1,2-а]пиримидин-6-ила, имидазо[1,2-а]пиразин-2-ила, имидазо[1,2-а]пиразин-6-ила, имидазо[1,2-b]пиридазин-2-ила, имидазо[1,2-b]пиридазин-6-ила, имидазо[1,2-с]пиримидин-2-ила, 1Н-имидазо[4,5-b]пиридин-5-ила, 3Н-имидазо[4,5-b]пиридин-5-ила, имидазо[2,1-b][1,3]тиазол-6-ила, имидазо[2,1-b][1,3,4]тиадиазол-6-ила, [1,3]оксазоло[4,5-b]пиридин-2-ила, [1,2,3]триазоло[1,5-а]пиридин-5-ила, [1,2,3]триазоло[1,5-а]пиридин-6-ила, 1Н-[1,2,3]триазоло[4,5-b]пиридин-5-ила, 1Н-[1,2,3]триазоло[4,5-b]пиридин-6-ила, 3Н-[1,2,3]триазоло[4,5-b]пиридин-5-ила, [1,2,4]триазоло[1,5-а]пиридин-6-ила, [1,2,4]триазоло[1,5-а]пиримидин-2-ила, [1,2,4]триазоло[1,5-а]пиримидин-6-ила, [1,2,4]триазоло[1,5-а]пиразин-6-ила, [1,2,4]триазоло[1,5-b]пиридазин-6-ила, [1,2,4]триазоло[4,3-а]пиридин-6-ила, тетразоло[1,5-а]пиридин-7-ила, тетразоло[1,5-b]пиридазин-7-ила, тиазоло[4,5-b]пиразин-2-ила, тиазоло[5,4-с]пиридин-2-ила, тетразоло[1,5-а]пиридин-7-ила, тетразоло[1,5-b]пиридазин-7-ила, хинолин-6-ила, изохинолин-6-ила, [1,2,5]тиадиазоло[3,4-b]пиридин-6-ила, 1Н-пиразоло[3,4-d]пиримидин-1-ила, 1Н-пирроло[3,2-b]пиридин-1-ила, 2Н-[1,2,3]триазоло[4,5-b]пиридин-5-ила, 2Н-[1,2,3]триазоло[4,5-b]пиридин-6-ила, 2Н-[1,2,3]триазоло[4,5-с]пиридин-6-ила, 2Н-[1,2,3]триазоло[4,5-b]пиридин-6-ила, 3Н-[1,2,3]триазоло[4,5-с]пиридин-6-ила, бензо[с][1,2,5]тиадиазол-5-ила, имидазо[1,5-а]пиридин-6-ила, имидазо[1,5-а]пиридин-7-ила, пиразоло[1,5-а]пиримидин-3-ила, тиазоло[5,4-b]пиридин-2-ила, необязательно замещенного одним или двумя независимо выбранными R₄ заместителями.

В может представлять собой гетероарил, выбранный из группы, состоящей из 1Н-индазол-5-ила, 7Н-пурин-2-ила, фуоро[3,2-b]пиридин-2-ила, пиразоло[1,5-а]пиридин-3-ила, 2Н-пиразоло[3,4-b]пиридин-5-ила, 1Н-пиразоло[4,3-b]пиридин-1-ила, имидазо[1,2-а]пиридин-6-ила, имидазо[1,2-а]пиразин-6-ила, имидазо[1,2-b]пиридазин-6-ила [1,2,3]триазоло[1,5-а]пиридин-6-ила, 1Н-[1,2,3]триазоло[4,5-b]пиридин-5-ила, 1Н-[1,2,3]триазоло[4,5-b]пиридин-6-ила, [1,2,4]триазоло[1,5-а]пиридин-6-ила, [1,2,4]триазоло[1,5-а]пиримидин-2-ила, [1,2,4]триазоло[1,5-а]пиримидин-6-ила, [1,2,4]триазоло[1,5-а]пиразин-6-ила, [1,2,4]триазоло[1,5-b]пиридазин-6-ила, [1,2,4]триазоло[4,3-а]пиридин-6-ила, тиазоло[4,5-b]пиразин-2-ила, тиазоло[5,4-с]пиридин-2-ила, [1,2,5]тиадиазоло[3,4-

b]пиридин-6-ила, 1Н-пиразоло[3,4-d]пиримидин-1-ила, 1Н-пирроло[3,2-b]пиридин-1-ила, 2Н-[1,2,3]триазоло[4,5-b]пиридин-5-ила, 2Н-[1,2,3]триазоло[4,5-b]пиридин-6-ила, 2Н-[1,2,3]триазоло[4,5-c]пиридин-6-ила, 2Н-[1,2,3]триазоло[4,5-b]пиридин-6-ила, 3Н-[1,2,3]триазоло[4,5-c]пиридин-6-ила, бензо[с][1,2,5]тиадиазол-5-ила, имидазо[1,5-a]пиридин-6-ила, имидазо[1,5-a]пиридин-7-ила, пиразоло[1,5-a]пиримидин-3-ила, тиазоло[5,4-b]пиридин-2-ила, необязательно замещенного одним или двумя независимо выбранными R₄ заместителями.

В может представлять собой гетероарил, выбранный из группы, состоящей из 1Н-индазол-5-ила, 7Н-пурин-2-ила, фуоро[3,2-b]пиридин-2-ила, пиразоло[1,5-a]пиридин-3-ила, 2Н-пиразоло[3,4-b]пиридин-5-ила, 1Н-пиразоло[4,3-b]пиридин-1-ила, имидазо[1,2-a]пиридин-6-ила, имидазо[1,2-a]пиразин-6-ила, имидазо[1,2-b]пиридазин-6-ила [1,2,3]триазоло[1,5-a]пиридин-6-ила, 1Н-[1,2,3]триазоло[4,5-b]пиридин-5-ила, 1Н-[1,2,3]триазоло[4,5-b]пиридин-6-ила, [1,2,4]триазоло[1,5-a]пиридин-6-ила, [1,2,4]триазоло[1,5-a]пиримидин-2-ила, [1,2,4]триазоло[1,5-a]пиримидин-6-ила, [1,2,4]триазоло[1,5-a]пиразин-6-ила, [1,2,4]триазоло[1,5-b]пиридазин-6-ила, [1,2,4]триазоло[4,3-a]пиридин-6-ила, тиазоло[4,5-b]пиразин-2-ила, тиазоло[5,4-c]пиридин-2-ила, [1,2,5]тиадиазоло[3,4-b]пиридин-6-ила, 1Н-пиразоло[3,4-d]пиримидин-1-ила, 1Н-пирроло[3,2-b]пиридин-1-ила, 2Н-[1,2,3]триазоло[4,5-b]пиридин-5-ила, 2Н-[1,2,3]триазоло[4,5-b]пиридин-6-ила, 2Н-[1,2,3]триазоло[4,5-c]пиридин-6-ила, 2Н-[1,2,3]триазоло[4,5-b]пиридин-6-ила, 3Н-[1,2,3]триазоло[4,5-c]пиридин-6-ила, бензо[с][1,2,5]тиадиазол-5-ила, имидазо[1,5-a]пиридин-6-ила, имидазо[1,5-a]пиридин-7-ила, пиразоло[1,5-a]пиримидин-3-ила, тиазоло[5,4-b]пиридин-2-ила, замещенного одним R₄ заместителем.

В может представлять собой гетероарил, выбранный из группы, состоящей из 1Н-индазол-5-ила, 7Н-пурин-2-ила, фуоро[3,2-b]пиридин-2-ила, пиразоло[1,5-a]пиридин-3-ила, 2Н-пиразоло[3,4-b]пиридин-5-ила, 1Н-пиразоло[4,3-b]пиридин-1-ила, имидазо[1,2-a]пиридин-6-ила, имидазо[1,2-a]пиразин-6-ила, имидазо[1,2-b]пиридазин-6-ила [1,2,3]триазоло[1,5-a]пиридин-6-ила, 1Н-[1,2,3]триазоло[4,5-b]пиридин-5-ила, 1Н-[1,2,3]триазоло[4,5-b]пиридин-6-ила, [1,2,4]триазоло[1,5-a]пиридин-6-ила, [1,2,4]триазоло[1,5-a]пиримидин-2-ила, [1,2,4]триазоло[1,5-a]пиримидин-6-ила, [1,2,4]триазоло[1,5-a]пиразин-6-ила, [1,2,4]триазоло[1,5-b]пиридазин-6-ила, [1,2,4]триазоло[4,3-a]пиридин-6-ила, тиазоло[4,5-b]пиразин-2-ила, тиазоло[5,4-c]пиридин-2-ила, [1,2,5]тиадиазоло[3,4-b]пиридин-6-ила, 1Н-пиразоло[3,4-d]пиримидин-1-ила, 1Н-пирроло[3,2-b]пиридин-1-

ила, 2Н-[1,2,3]триазоло[4,5-*b*]пиридин-5-ила, 2Н-[1,2,3]триазоло[4,5-*b*]пиридин-6-ила, 2Н-[1,2,3]триазоло[4,5-*c*]пиридин-6-ила, 2Н-[1,2,3]триазоло[4,5-*b*]пиридин-6-ила, 3Н-[1,2,3]триазоло[4,5-*c*]пиридин-6-ила, бензо[*c*][1,2,5]тиадиазол-5-ила, имидазо[1,5-*a*]пиридин-6-ила, имидазо[1,5-*a*]пиридин-7-ила, пиразоло[1,5-*a*]пиримидин-3-ила, тиазоло[5,4-*b*]пиридин-2-ила, замещенного двумя независимо выбранными R₄ заместителями.

Один аспект включает соединение формулы (I), в котором В представляет собой гетероциклил, причем гетероциклил представляет собой 8-10-членный бициклический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 1, 2, 3 или 4 гетероатомных члена в кольце, независимо выбранных из N, O или S, необязательно замещенный одним или двумя независимо выбранными R₄ заместителями. В может представлять собой гетероциклил, причем гетероциклил представляет собой 8- или 9-членный бициклический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий по меньшей мере один N, необязательно замещенный одним или двумя независимо выбранными R₄ заместителями. В может представлять собой гетероциклил, причем гетероциклил представляет собой 8- или 9-членный бициклический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 2, 3 или 4 N, необязательно замещенный одним или двумя независимо выбранными R₄ заместителями. В может представлять собой гетероциклил, причем гетероциклил представляет собой радикал с кольцевой структурой из 9-членный бициклический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 2, 3 или 4 N, необязательно замещенный одним или двумя независимо выбранными R₄ заместителями, или гетероциклил представляет собой 8-членный бициклический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 2 или 3 N, необязательно замещенный одним или двумя независимо выбранными R₄ заместителями. В может представлять собой гетероциклил, причем гетероциклил представляет собой 8- или 9-членный бициклический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 2, 3 или 4 N, и необязательно содержащий второй гетероатомный член в кольце, выбранный из O или S, необязательно замещенный одним или двумя независимо выбранными R₄ заместителями. В может представлять собой гетероциклил, причем гетероциклил представляет собой 9-членный бициклический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 2, 3 или 4 N, и необязательно содержащий второй гетероатомный член в кольце, выбранный из O или S, необязательно замещенный одним или двумя независимо выбранными R₄ заместителями. В может представлять

собой гетероцикл, причем гетероцикл представляет собой незамещенный 8- или 9-членный бициклический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 2, 3 или 4 N, необязательно содержащий второй гетероатомный член в кольце, выбранный из O или S. В может представлять собой гетероцикл, причем гетероцикл представляет собой 8- или 9-членный бициклический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 2, 3 или 4 N, необязательно содержащий второй гетероатомный член в кольце, выбранный из O или S, и незамещенный или замещенный одним R₄ заместителем.

В может представлять собой гетероцикл, выбранный из группы, состоящей из 5,6-дигидро-[1,2,4]триазоло[1,5-а]пирозин-7(8H)-ила, 2,3-дигидро-1H-имидазо[1,2-b]пирозола, 5,6-дигидро-4H-пирроло[1,2-b]пирозола, 4,5,6,7-тетрагидропирозоло[1,5-а]пиридинила, 5,6-дигидро-4H-пирроло[1,2-b]пирозола, 6,7-дигидро-5H-пирроло[1,2-а]имидазола, 5,6-дигидро-4H-пирроло[1,2-b]пирозола и 5,6-дигидро-4H-пирроло[1,2-b]пирозола, необязательно замещенного одним или двумя независимо выбранными R₄ заместителями.

В может представлять собой гетероцикл, выбранный из группы, состоящей из 5,6-дигидро-[1,2,4]триазоло[1,5-а]пирозин-7(8H)-ила, 2,3-дигидро-1H-имидазо[1,2-b]пирозола, 5,6-дигидро-4H-пирроло[1,2-b]пирозола, 4,5,6,7-тетрагидропирозоло[1,5-а]пиридинила, 5,6-дигидро-4H-пирроло[1,2-b]пирозола, 6,7-дигидро-5H-пирроло[1,2-а]имидазола, 5,6-дигидро-4H-пирроло[1,2-b]пирозола и 5,6-дигидро-4H-пирроло[1,2-b]пирозола, замещенного двумя независимо выбранными R₄ заместителями.

В может представлять собой гетероцикл, выбранный из группы, состоящей из 5,6-дигидро-[1,2,4]триазоло[1,5-а]пирозин-7(8H)-ила, 2,3-дигидро-1H-имидазо[1,2-b]пирозола, 5,6-дигидро-4H-пирроло[1,2-b]пирозола, 4,5,6,7-тетрагидропирозоло[1,5-а]пиридинила, 5,6-дигидро-4H-пирроло[1,2-b]пирозола, 6,7-дигидро-5H-пирроло[1,2-а]имидазола, 5,6-дигидро-4H-пирроло[1,2-b]пирозола и 5,6-дигидро-4H-пирроло[1,2-b]пирозола, замещенного одним R₄ заместителем.

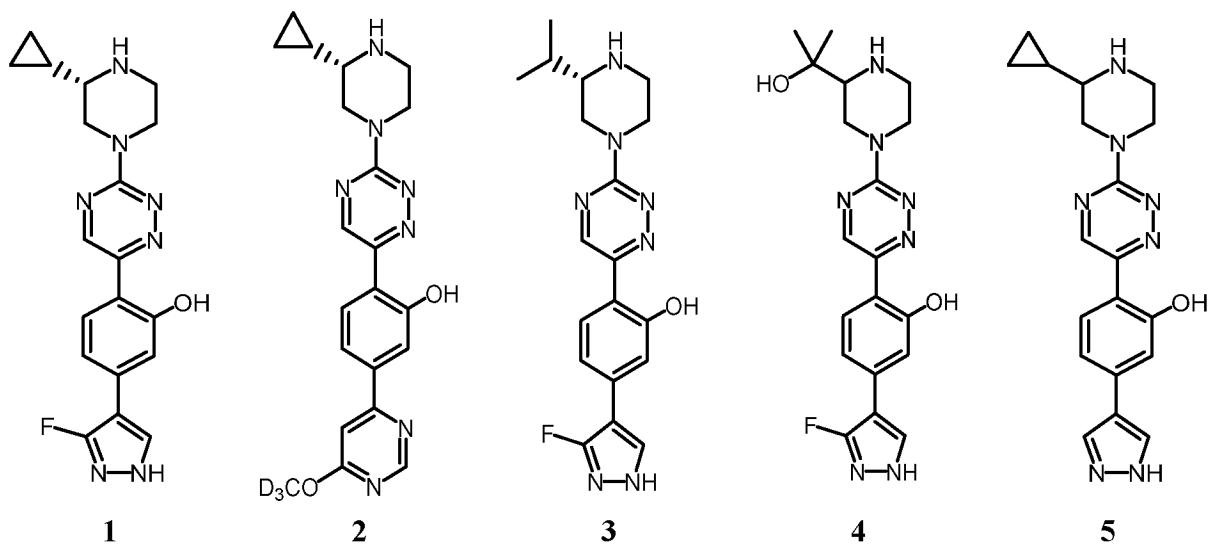
В может представлять собой гетероцикл, выбранный из группы, состоящей из 5,6-дигидро-[1,2,4]триазоло[1,5-а]пирозин-7(8H)-ила, 2,3-дигидро-1H-имидазо[1,2-b]пирозол-7-ила, 5,6-дигидро-4H-пирроло[1,2-b]пирозол-3-ила, 4,5,6,7-тетрагидропирозоло[1,5-а]пиридин-3-ила, 5,6-дигидро-4H-пирроло[1,2-b]пирозол-3-ила, 6,7-дигидро-5H-пирроло[1,2-а]имидазол-3-ила, 5,6-дигидро-4H-пирроло[1,2-b]пирозол-3-ила и 5,6-дигидро-4H-пирроло[1,2-b]пирозол-3-ила, необязательно замещенного

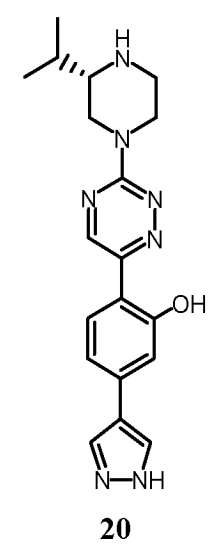
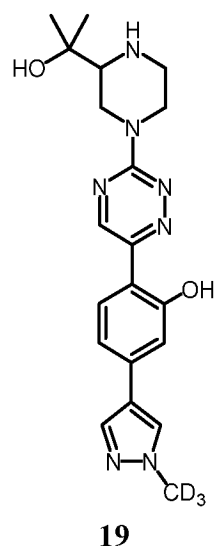
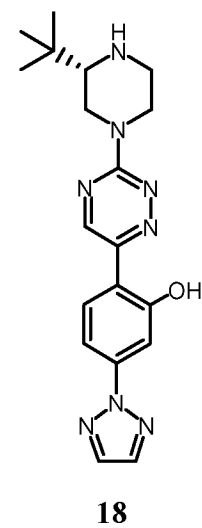
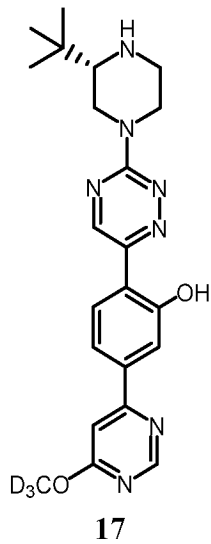
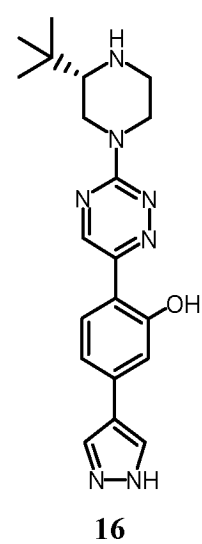
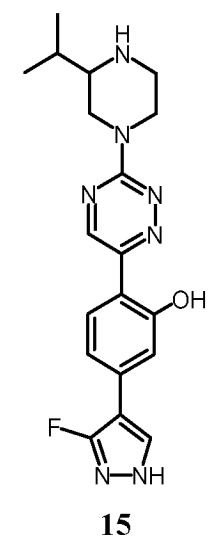
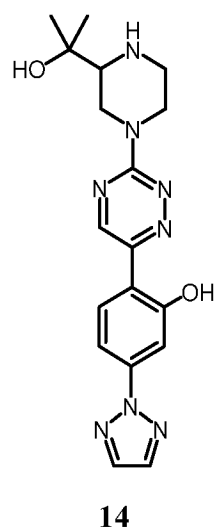
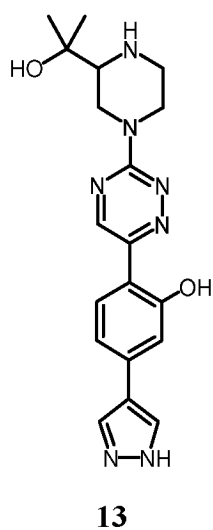
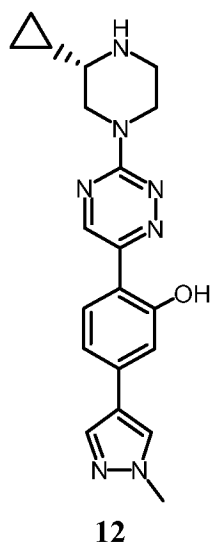
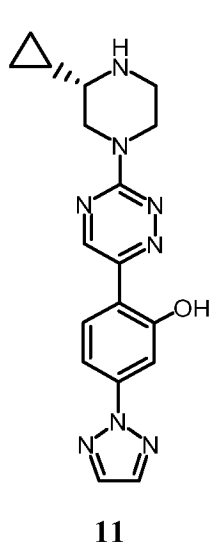
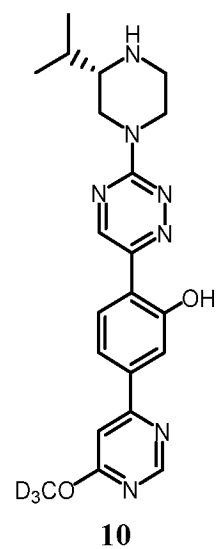
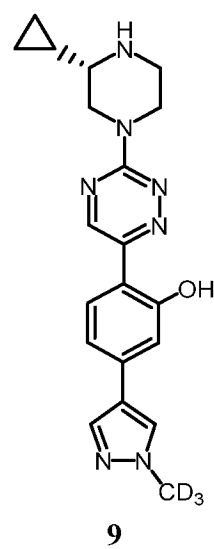
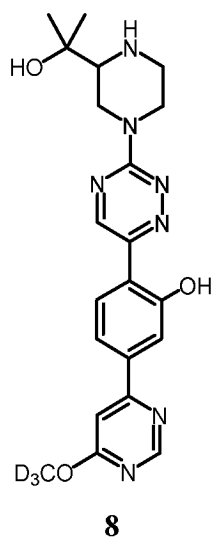
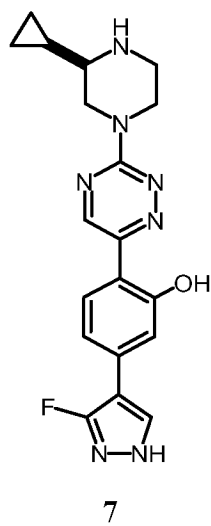
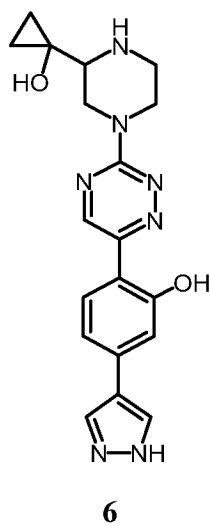
одним или двумя независимо выбранными R₄ заместителями.

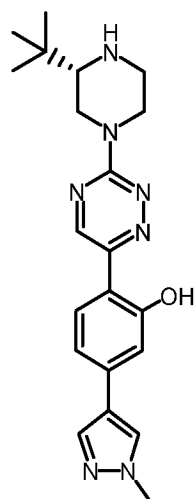
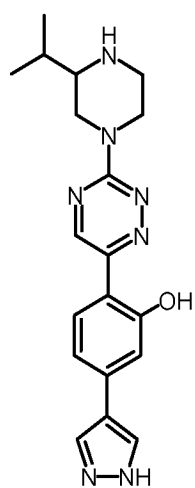
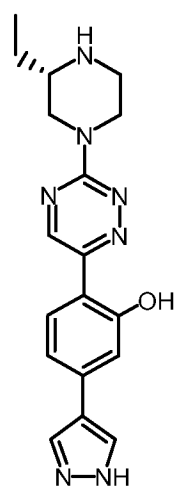
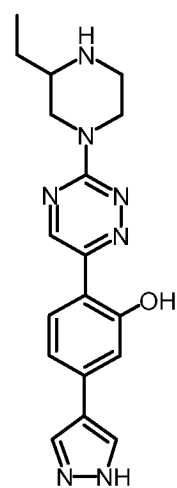
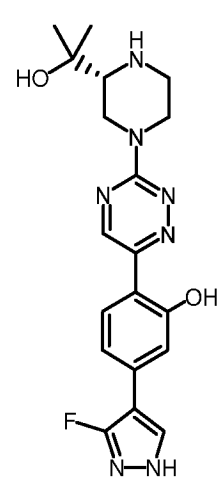
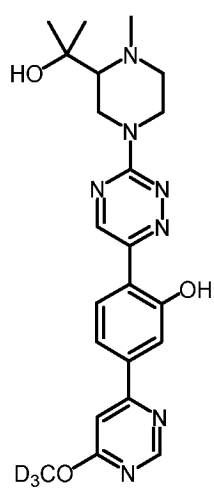
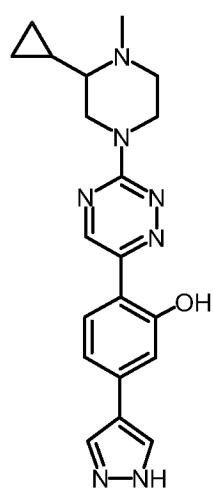
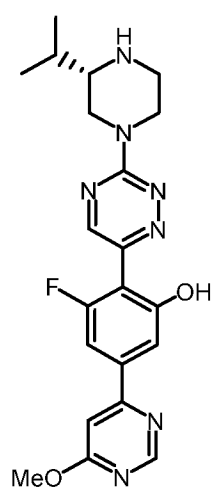
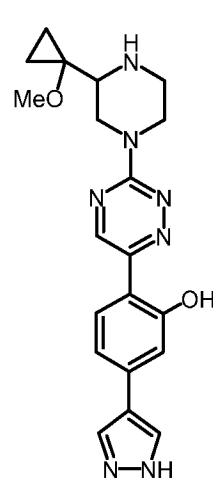
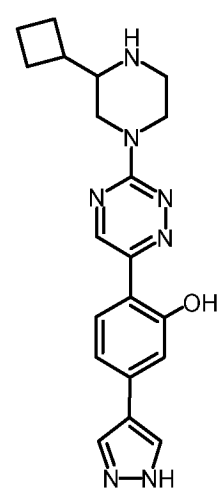
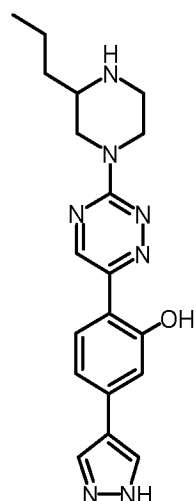
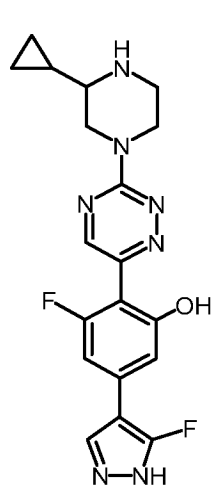
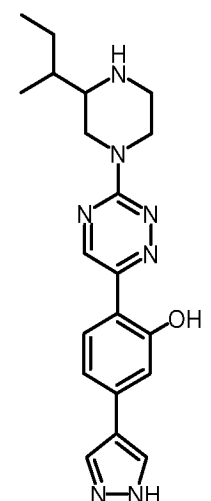
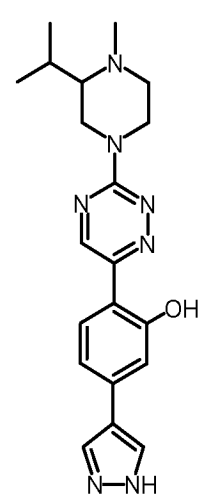
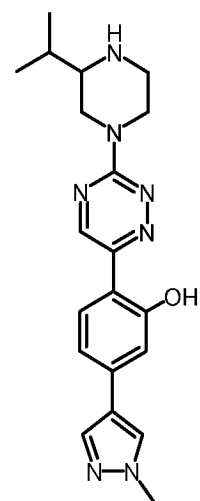
В может представлять собой гетероциклил, выбранный из группы, состоящей из 5,6-дигидро-[1,2,4]триазоло[1,5-а]пирозин-7(8Н)-ила, 2,3-дигидро-1Н-имидазо[1,2-в]пирозол-7-ила, 5,6-дигидро-4Н-пирроло[1,2-в]пиразол-3-ила, 4,5,6,7-тетрагидропиразоло[1,5-а]пиридин-3-ила, 5,6-дигидро-4Н-пирроло[1,2-в]пиразол-3-ила, 6,7-дигидро-5Н-пирроло[1,2-а]имидазол-3-ила, 5,6-дигидро-4Н-пирроло[1,2-в]пиразол-3-ила и 5,6-дигидро-4Н-пирроло[1,2-в]пиразол-3-ила, замещенного одним R₄ заместителем.

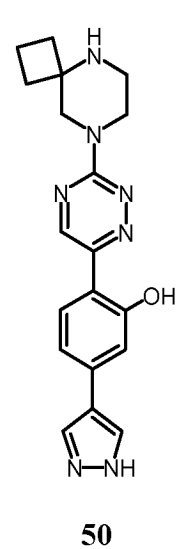
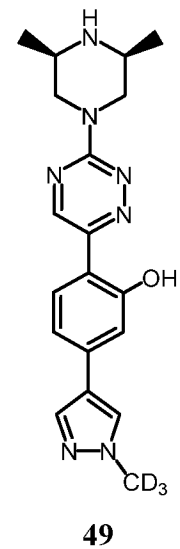
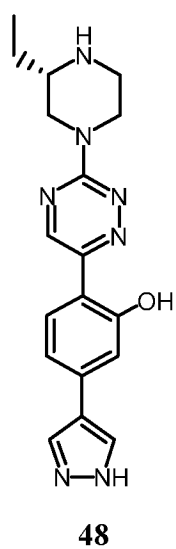
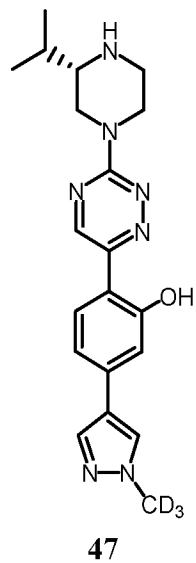
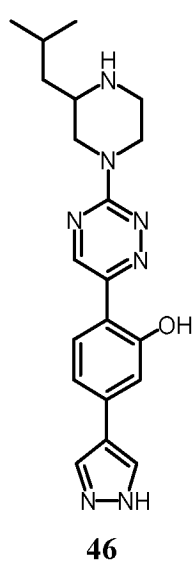
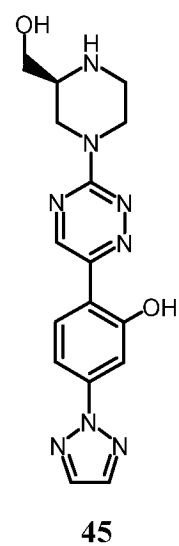
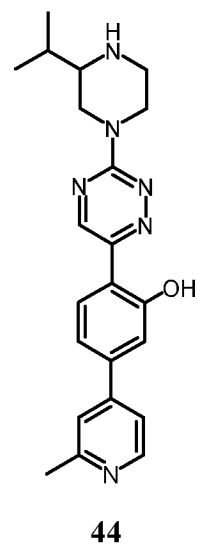
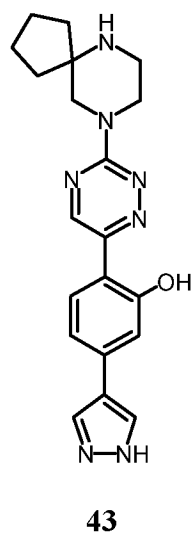
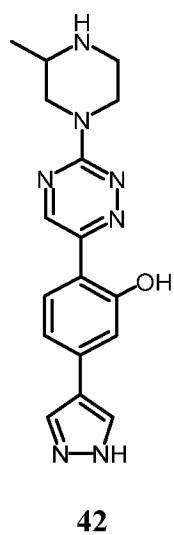
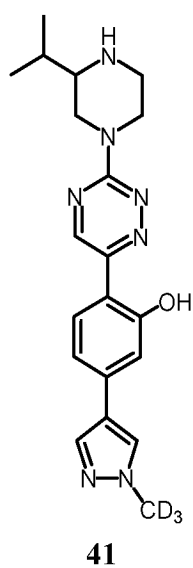
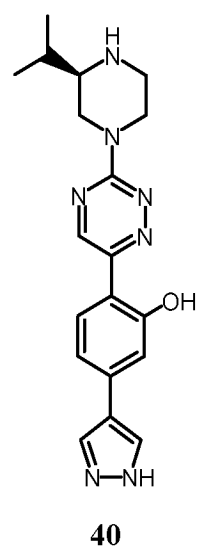
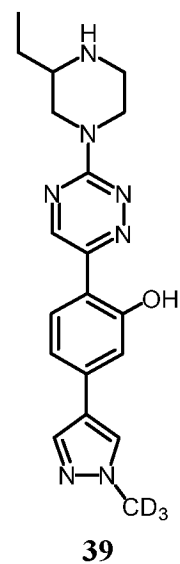
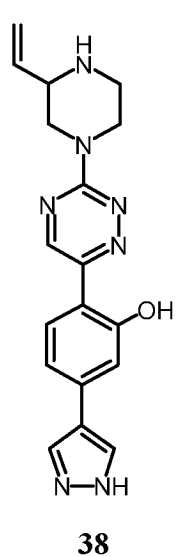
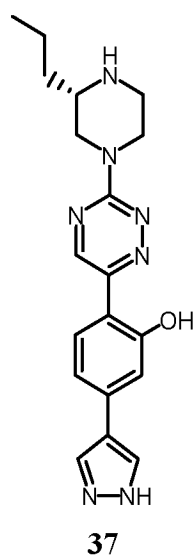
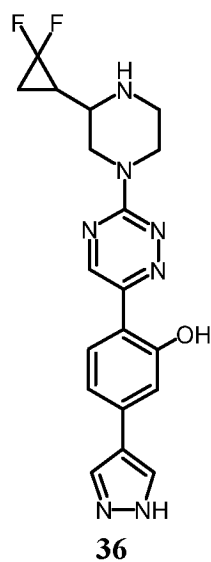
В может представлять собой гетероциклил, выбранный из группы, состоящей из 5,6-дигидро-[1,2,4]триазоло[1,5-а]пирозин-7(8Н)-ила, 2,3-дигидро-1Н-имидазо[1,2-в]пирозол-7-ила, 5,6-дигидро-4Н-пирроло[1,2-в]пиразол-3-ила, 4,5,6,7-тетрагидропиразоло[1,5-а]пиридин-3-ила, 5,6-дигидро-4Н-пирроло[1,2-в]пиразол-3-ила, 6,7-дигидро-5Н-пирроло[1,2-а]имидазол-3-ила, 5,6-дигидро-4Н-пирроло[1,2-в]пиразол-3-ила и 5,6-дигидро-4Н-пирроло[1,2-в]пиразол-3-ила, замещенного двумя независимо выбранными R₄ заместителями.

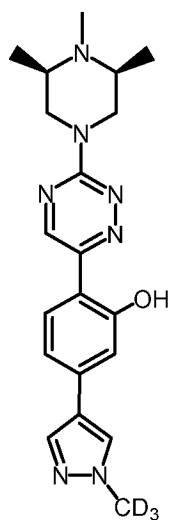
Аспект соединения Формулы (I) или его формы включает соединение, выбранное из группы, состоящей из, где “#” показывает, что соединение представляет собой рацемическую смесь энантиомеров, и где “&” показывает, что соединение может существовать как противоположный энантиомер:



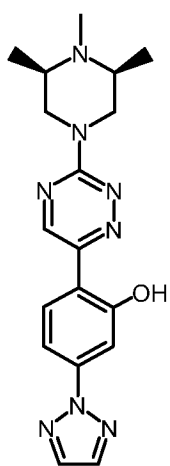


**21****22****23****24****25****26****27****28****29****30****31****32****33****34****35**

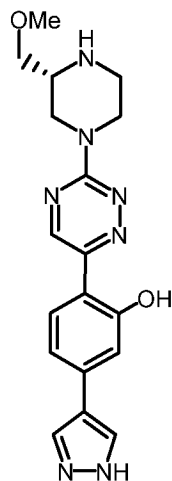




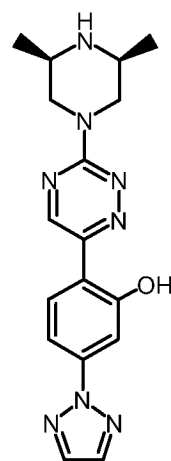
51



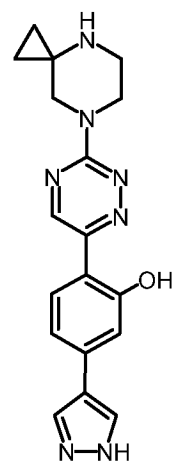
52



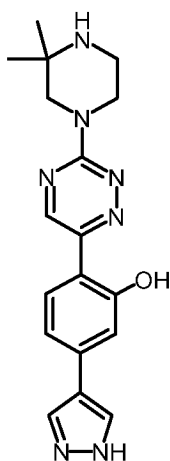
53



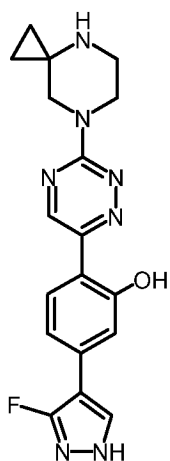
54



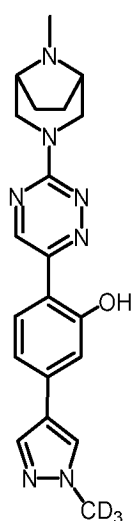
55



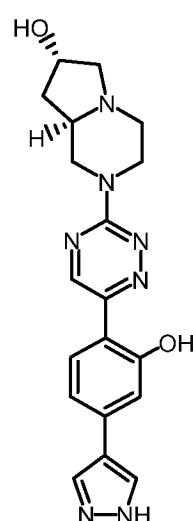
56



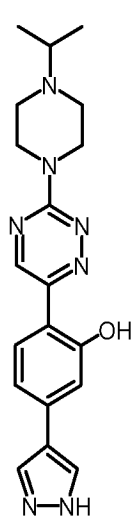
57



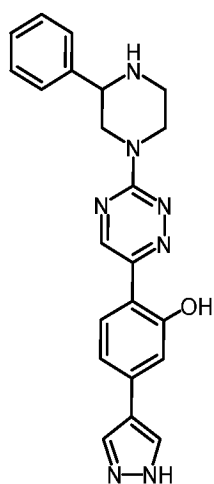
58



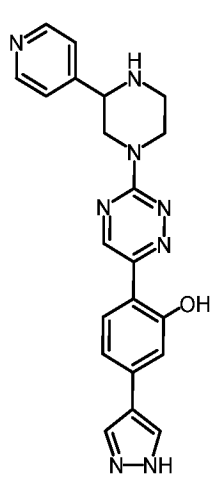
59



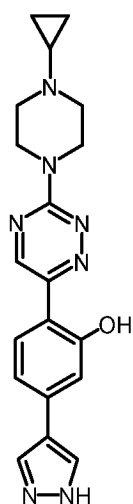
60



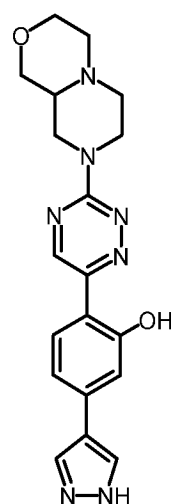
61



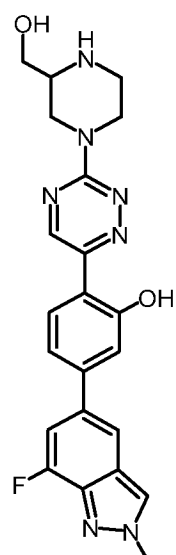
62



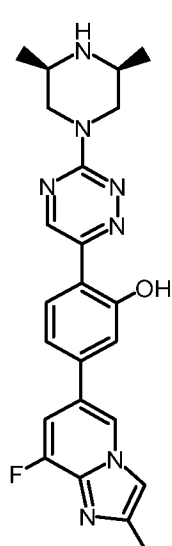
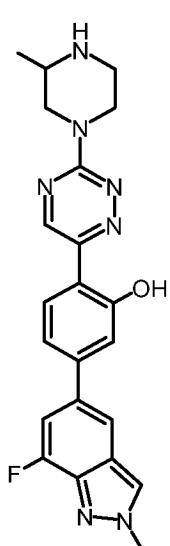
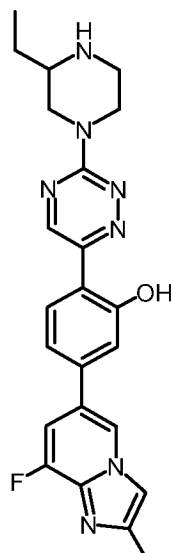
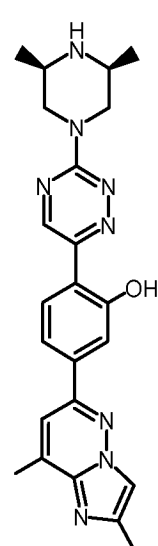
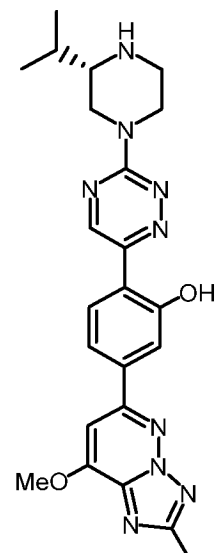
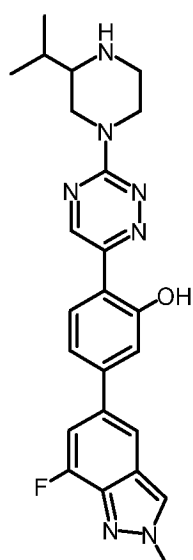
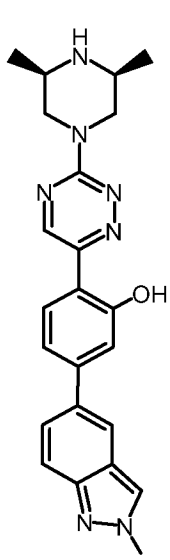
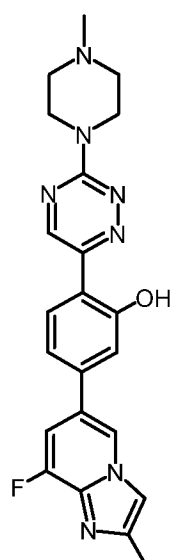
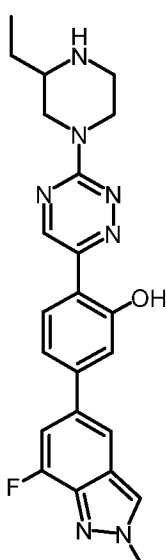
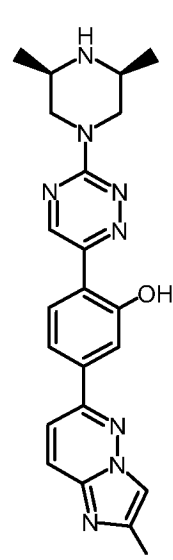
63

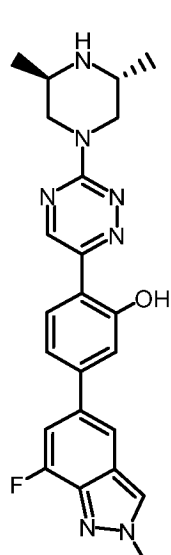


64

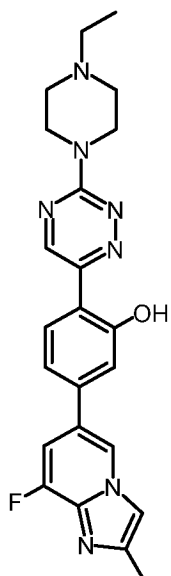


65

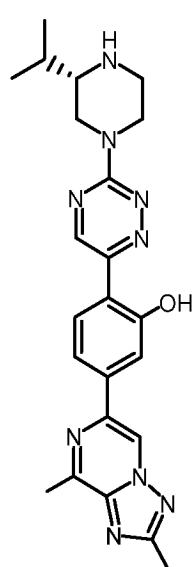
**66****67****68****69****70****71****72****73****74****75**



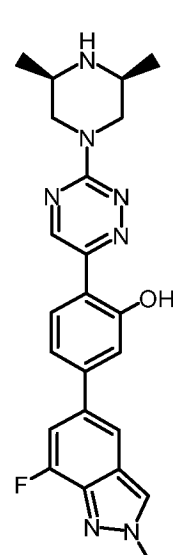
76



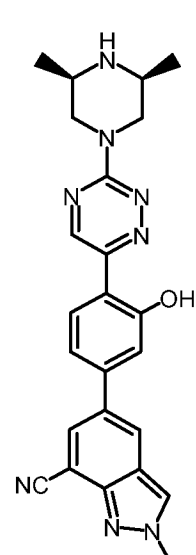
77



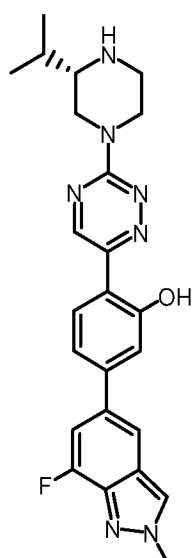
78



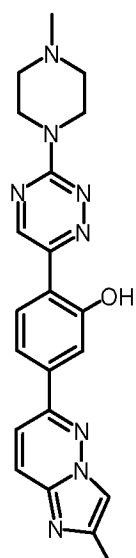
79



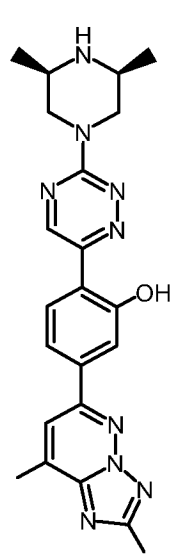
80



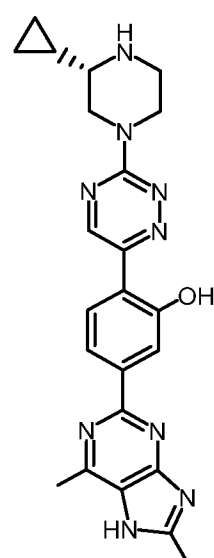
81



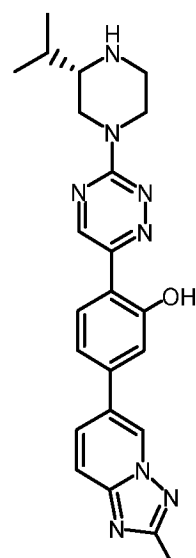
82



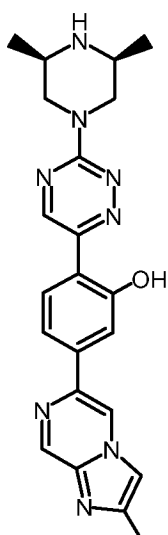
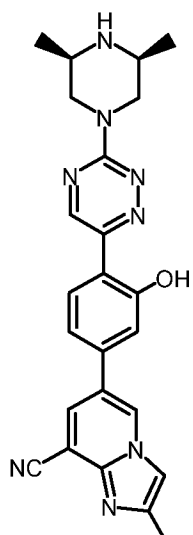
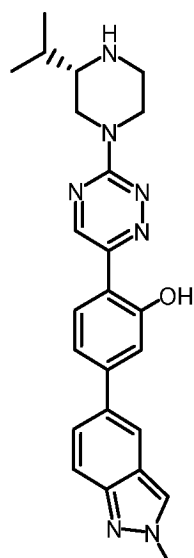
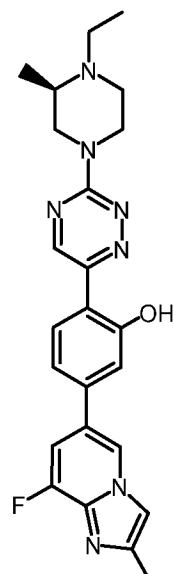
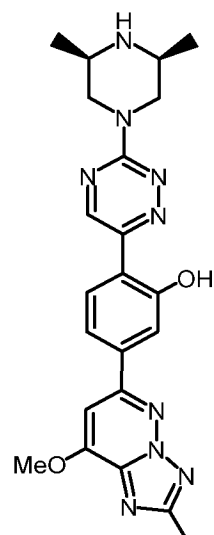
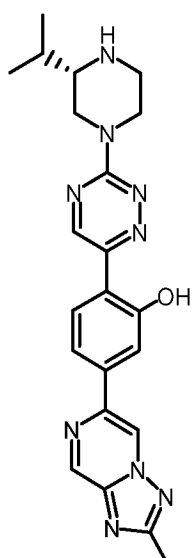
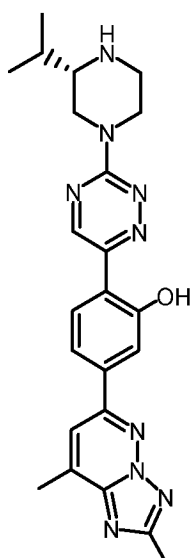
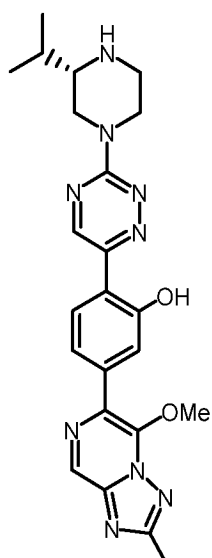
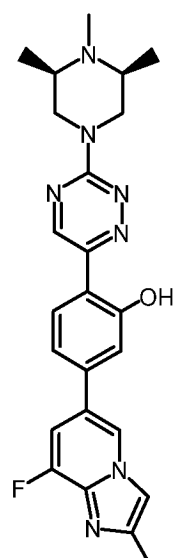
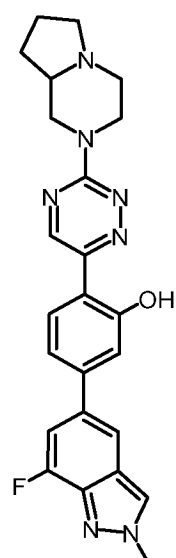
83

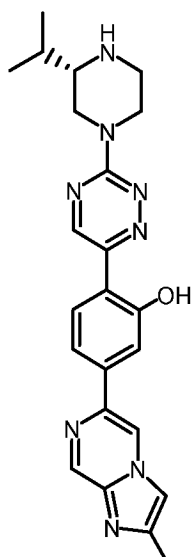


84

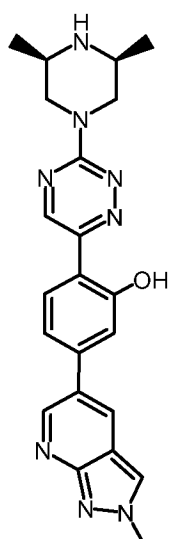


85

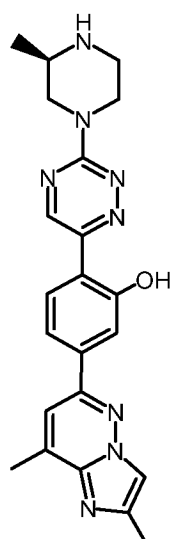
**86****87****88****89****90****91****92****93****94****95**



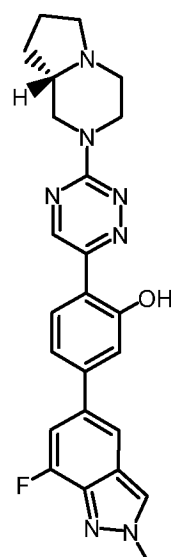
96



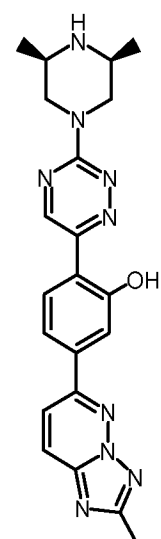
97



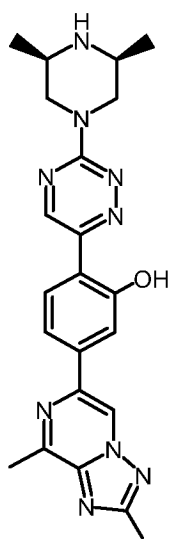
98



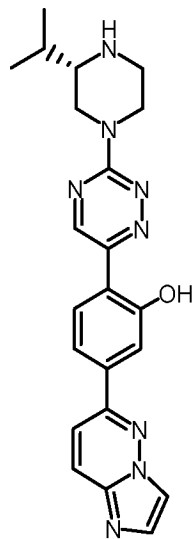
99



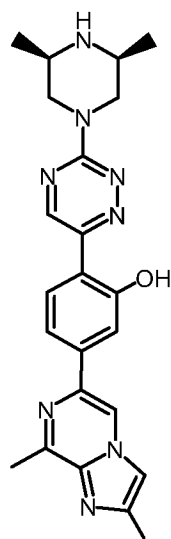
100



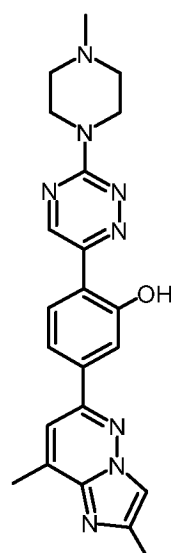
101



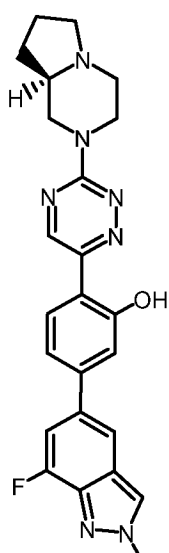
102



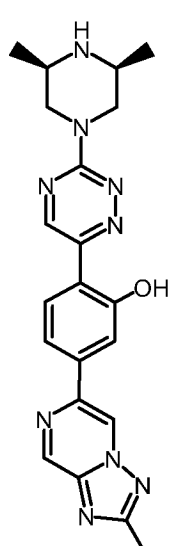
103



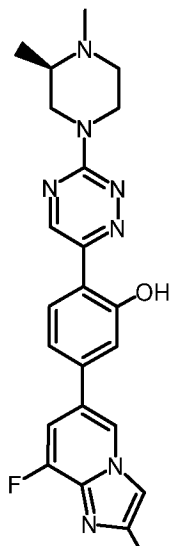
104



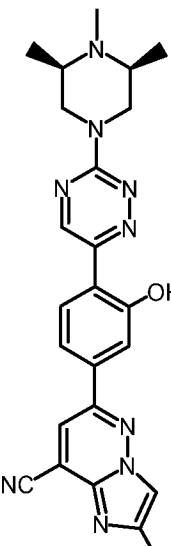
105



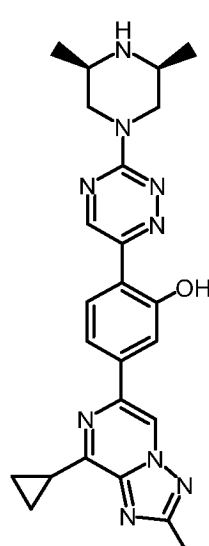
106



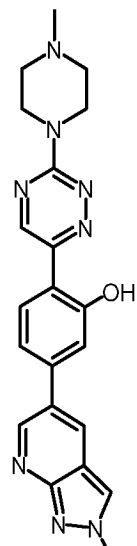
107



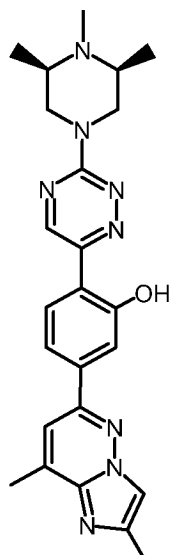
108



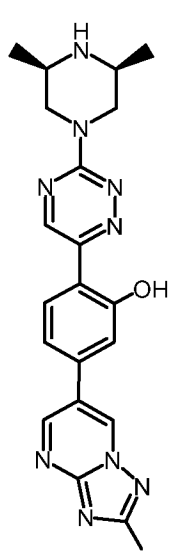
109



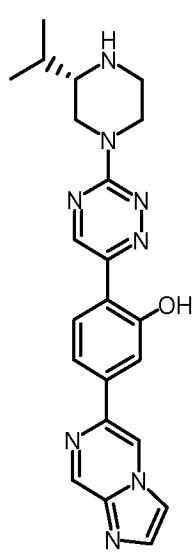
110



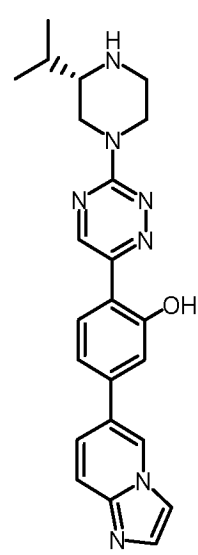
111



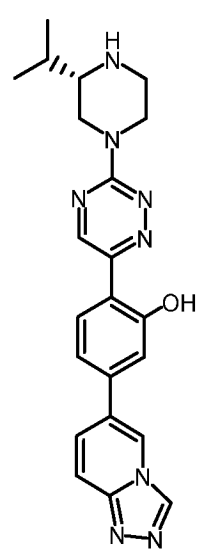
112



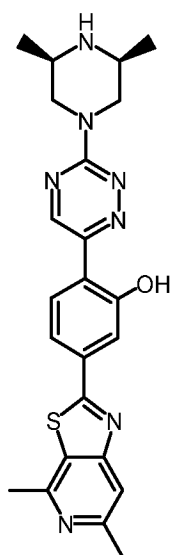
113



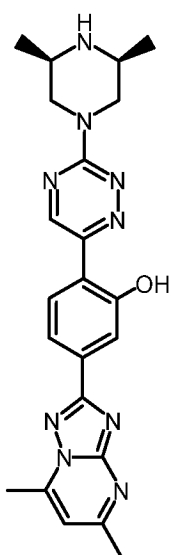
114



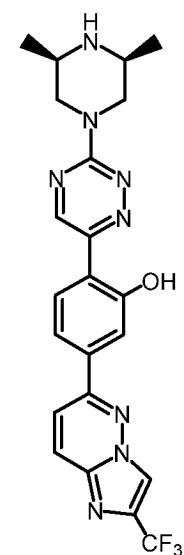
115



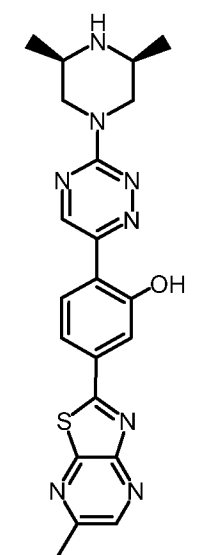
116



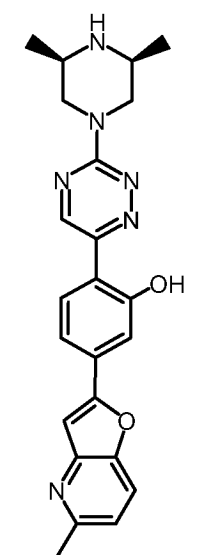
117



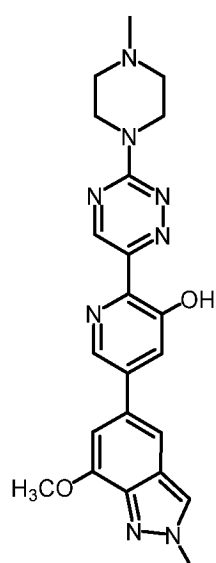
118



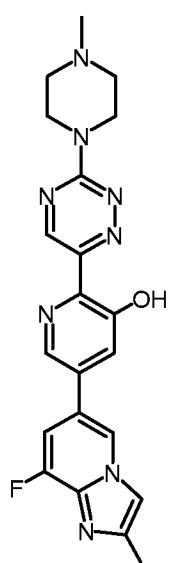
119



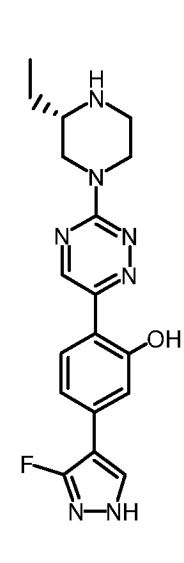
120



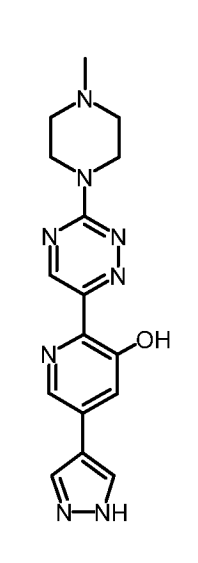
121



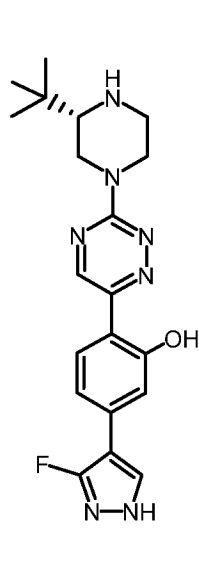
122



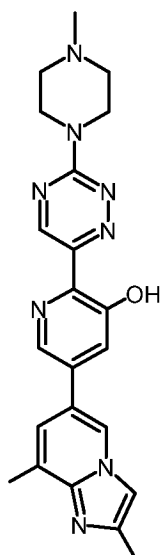
123



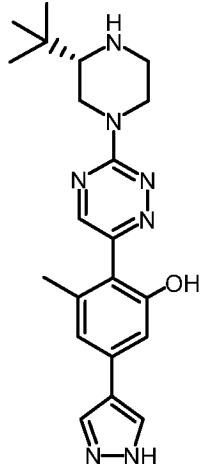
124



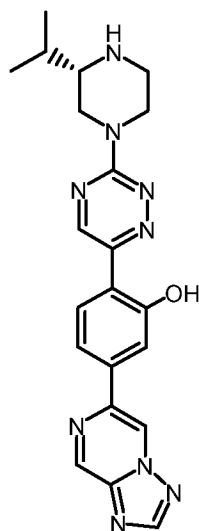
125



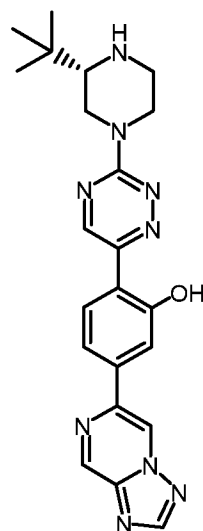
126



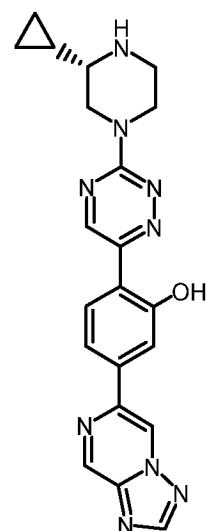
127



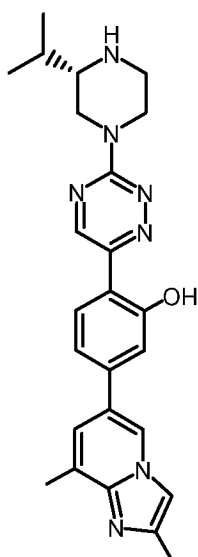
128



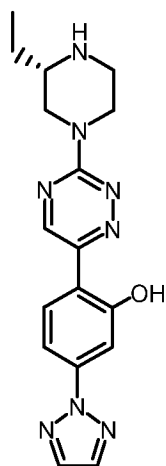
129



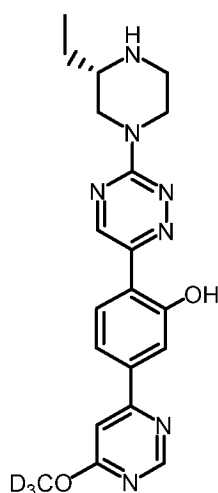
130



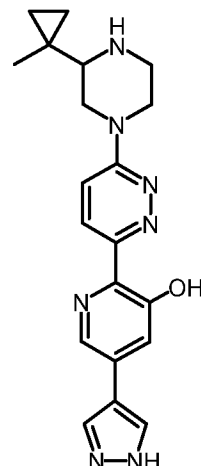
131



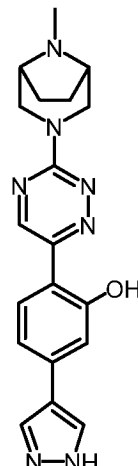
132



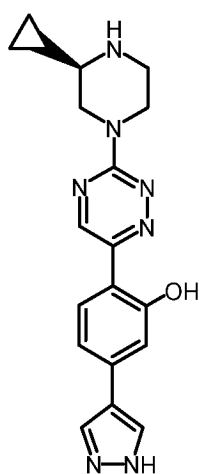
133



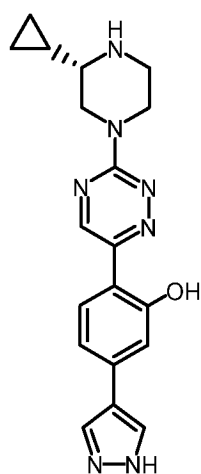
134



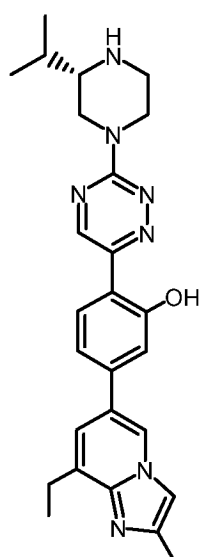
135



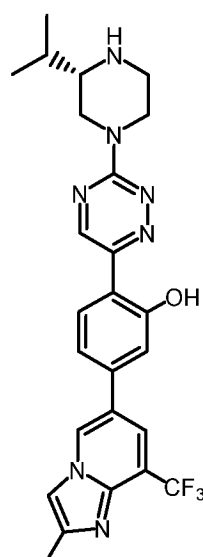
136



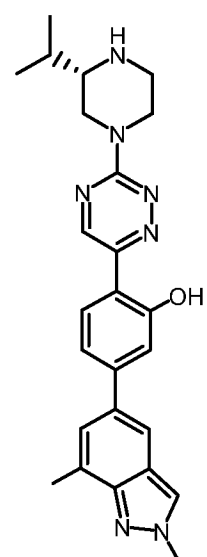
137



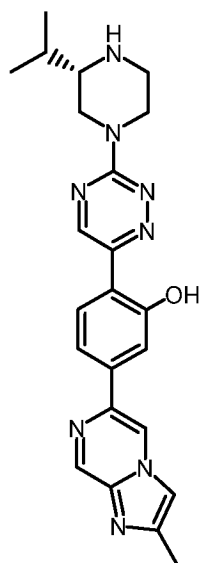
138



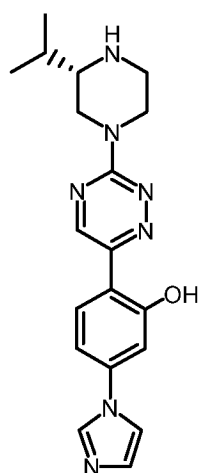
139



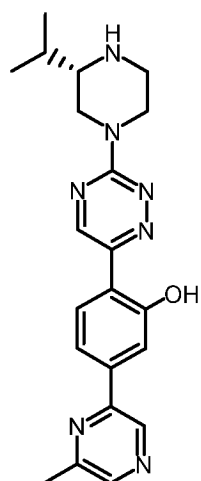
140



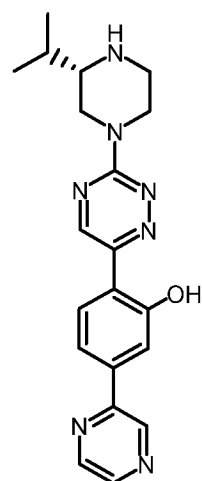
141



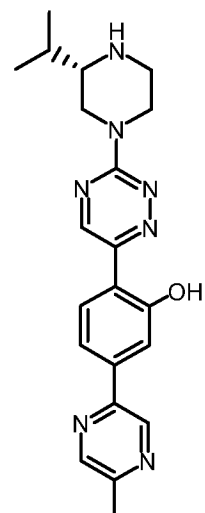
142



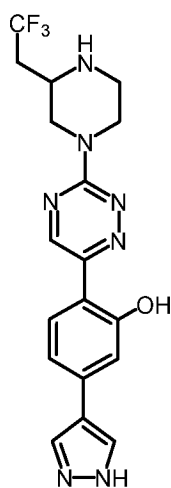
143



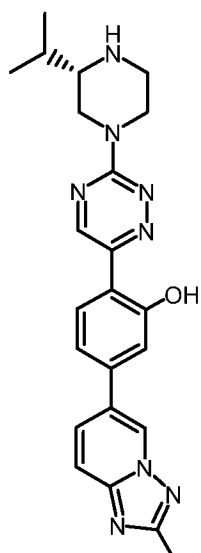
144



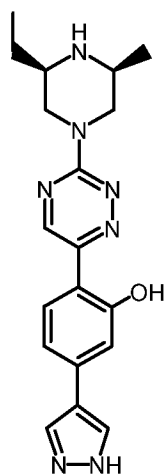
145



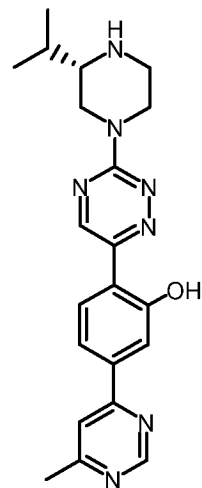
146



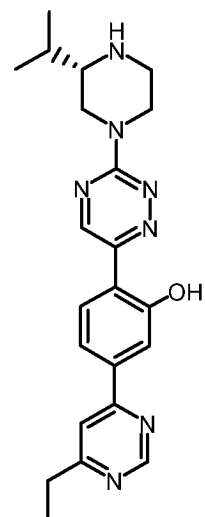
147



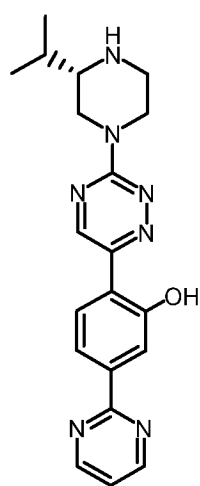
148#



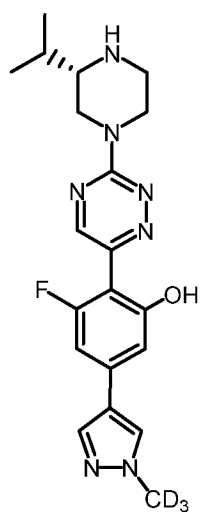
149



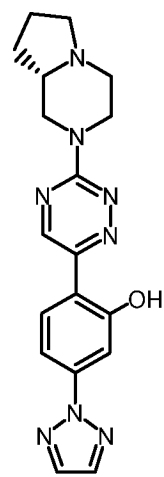
150



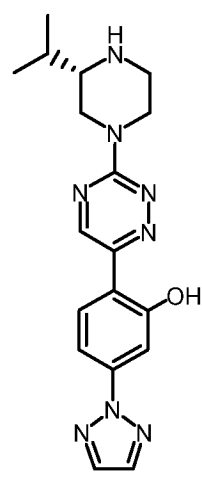
151



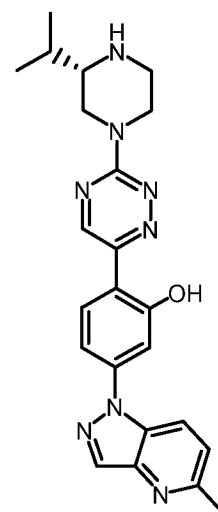
152



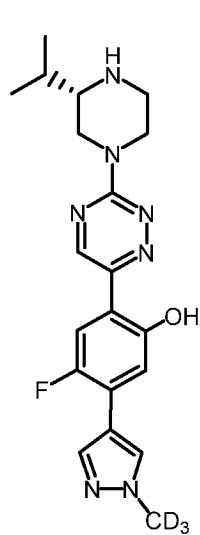
153



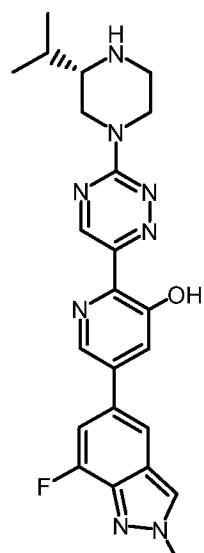
154



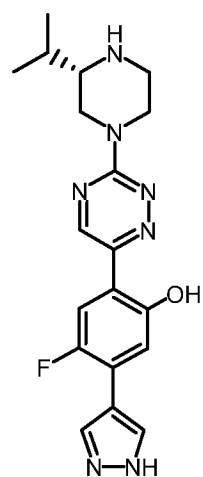
155



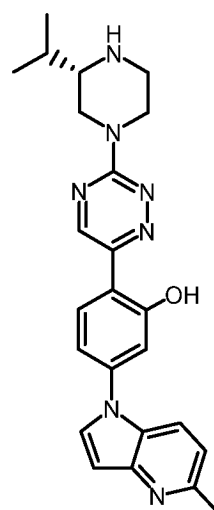
156



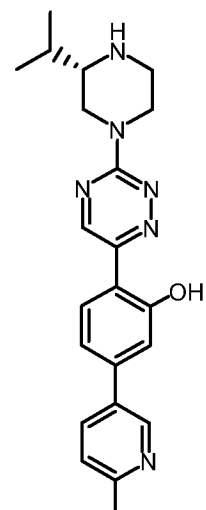
157



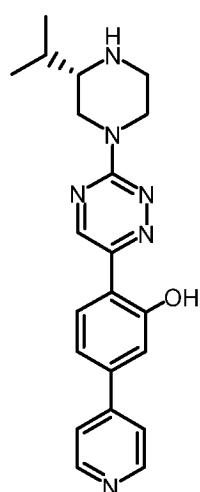
158



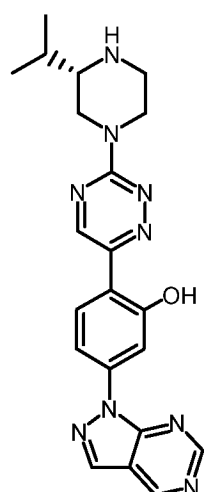
159



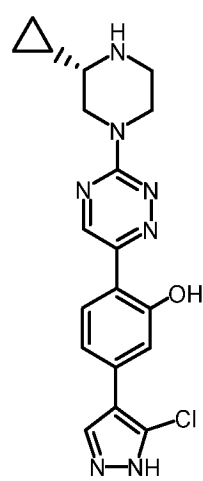
160



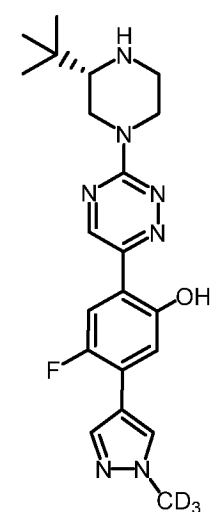
161



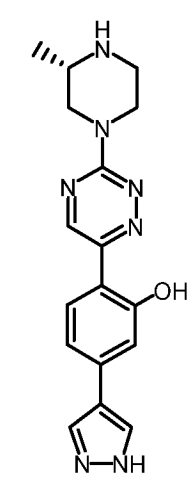
162



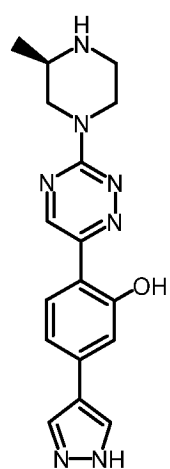
163



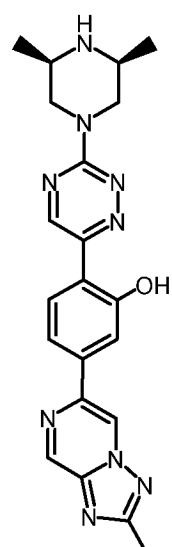
164



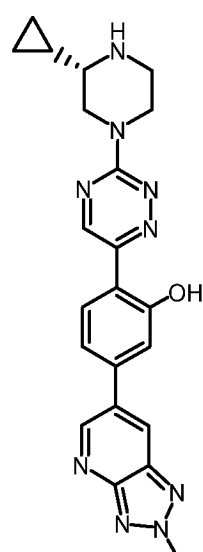
165



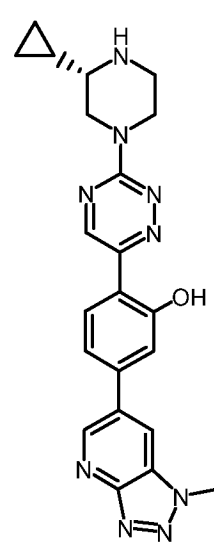
166



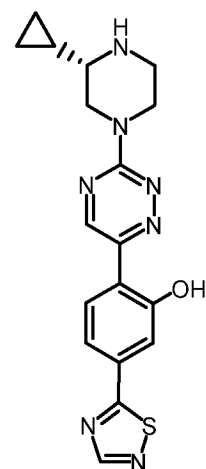
167



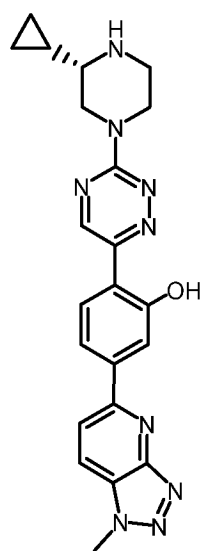
168



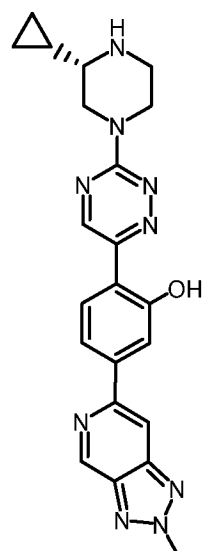
169



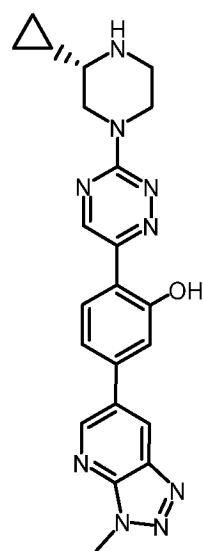
170



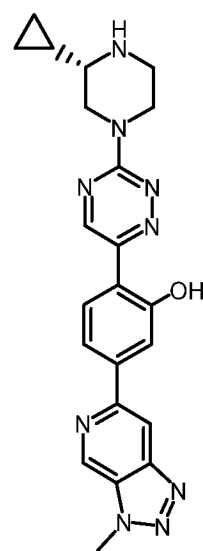
171



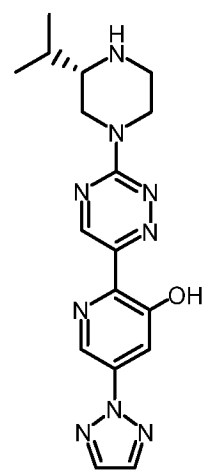
172



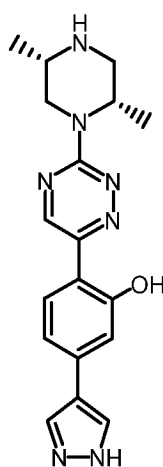
173



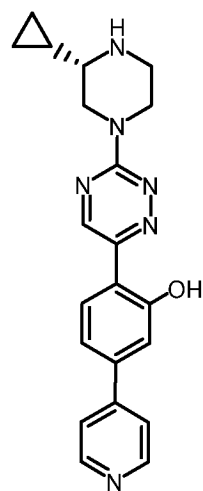
174



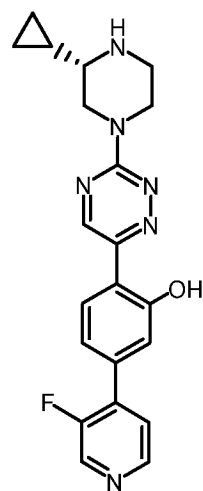
175



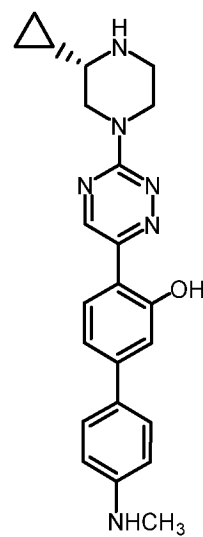
176



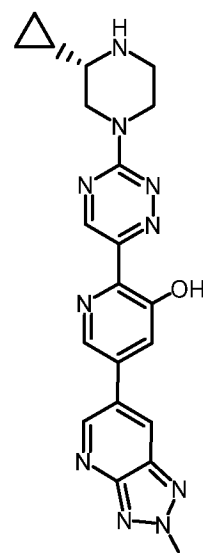
177



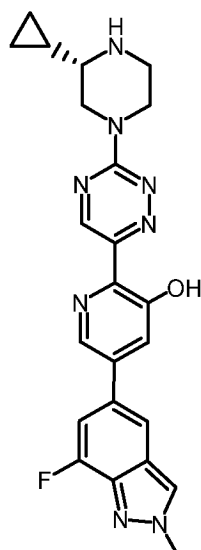
178



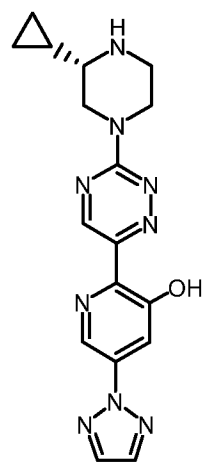
179



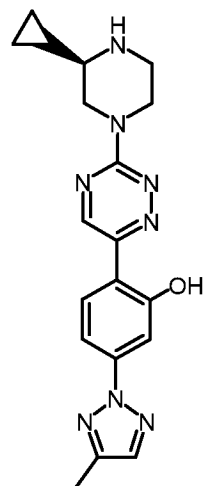
180



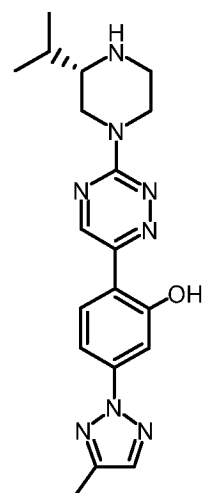
181



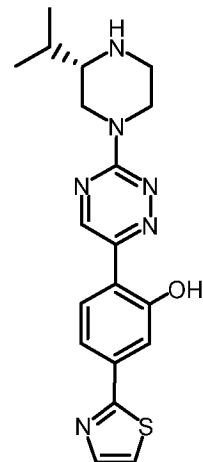
182



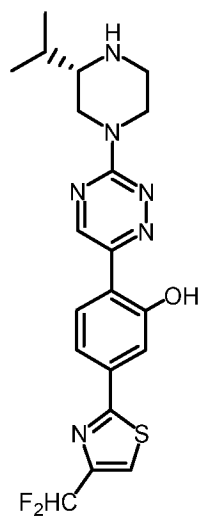
183



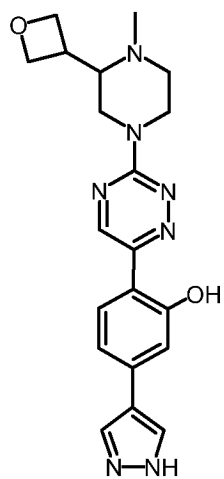
184



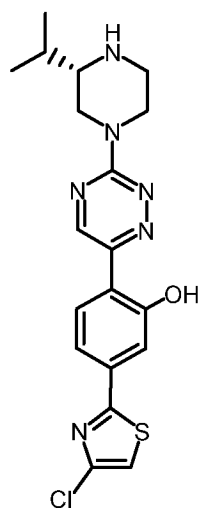
185



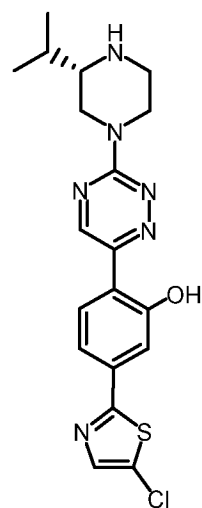
186



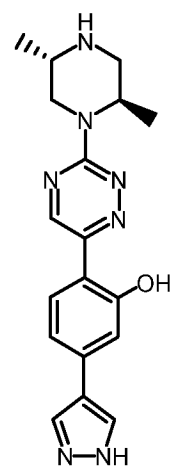
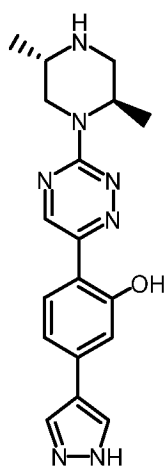
187



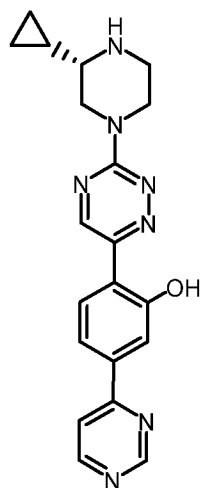
188



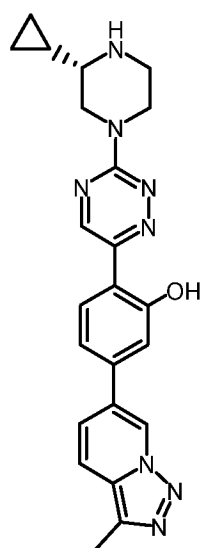
189

190[&]

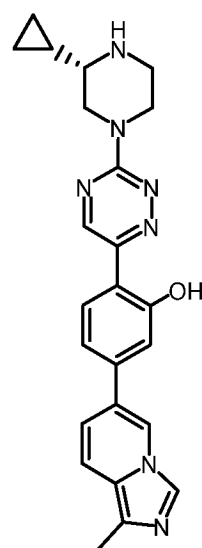
191



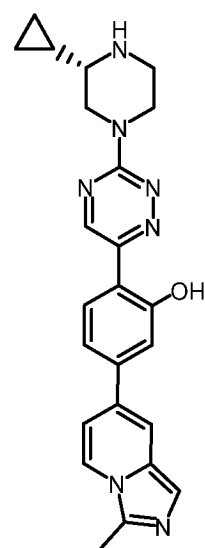
192



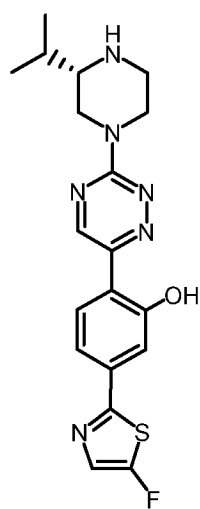
193



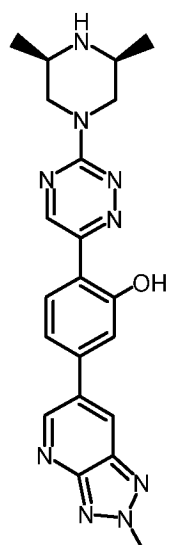
194



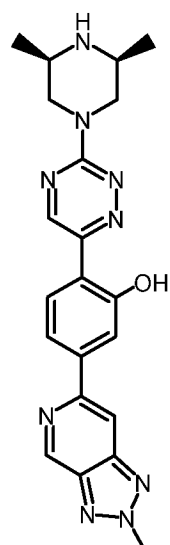
195



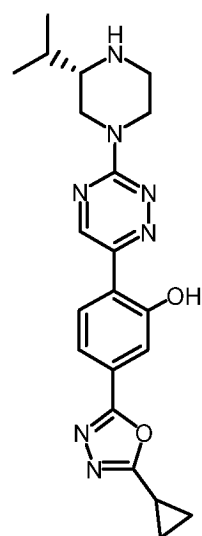
196



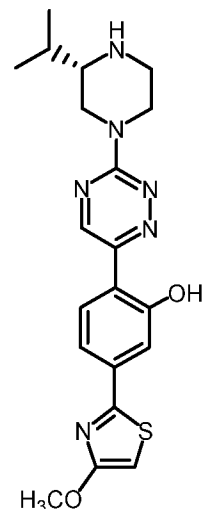
197



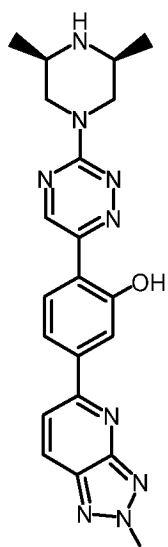
198



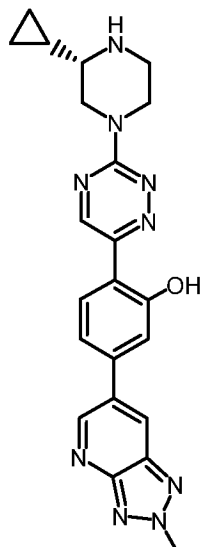
199



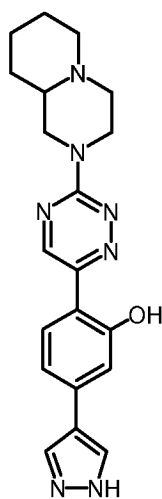
200



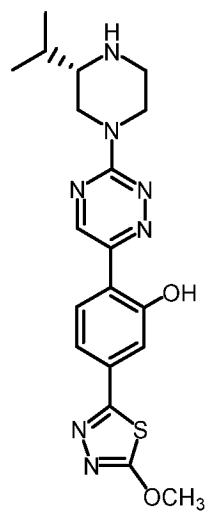
201#



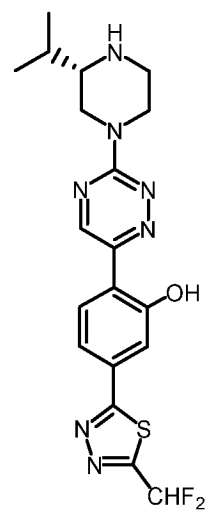
202



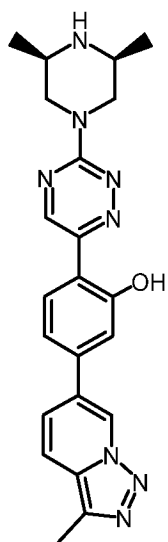
203



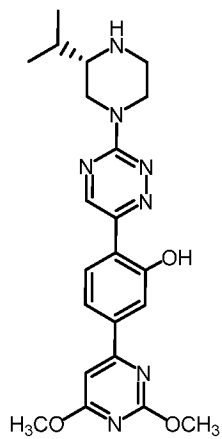
204



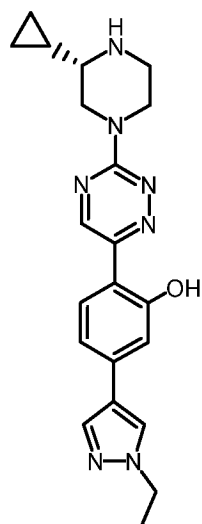
205



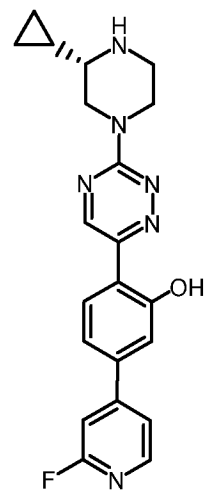
206#



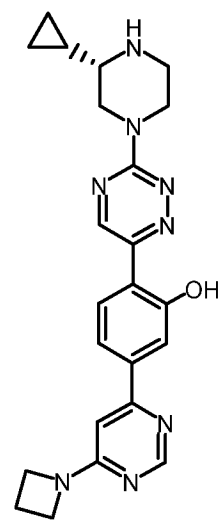
207



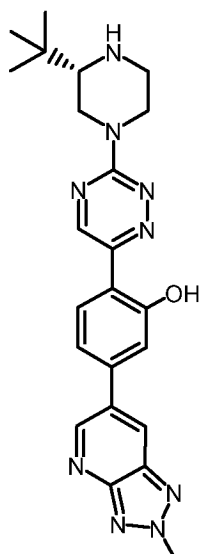
208



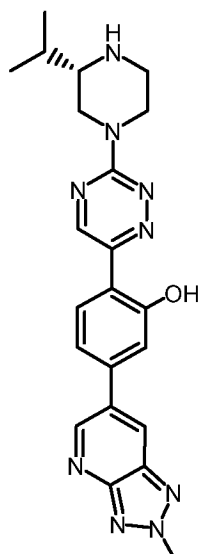
209#



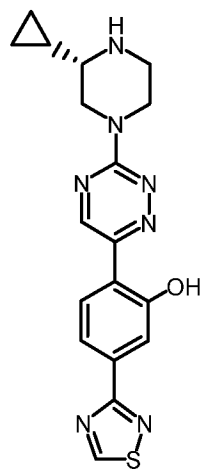
210[#]



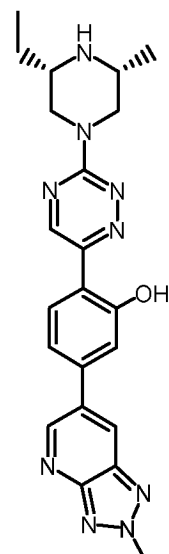
211



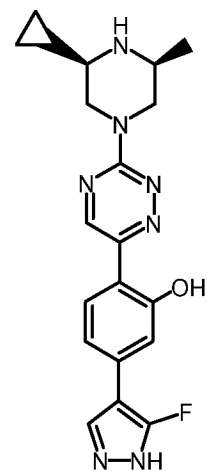
212



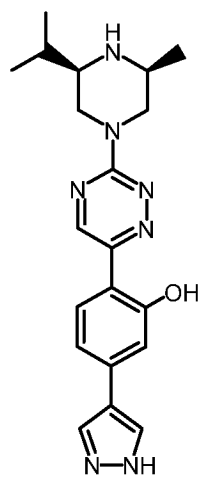
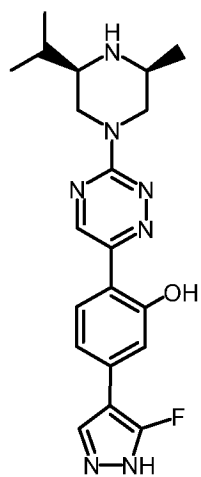
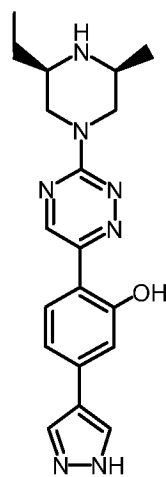
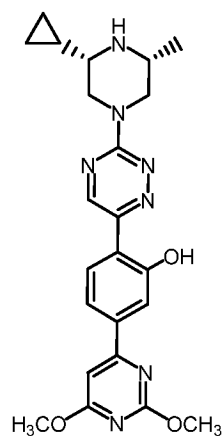
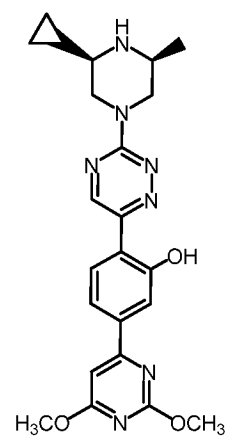
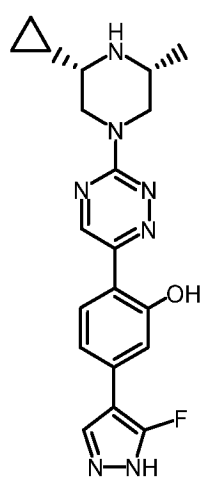
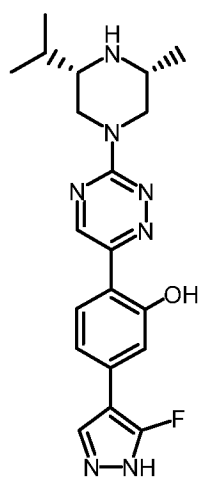
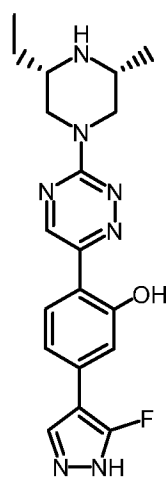
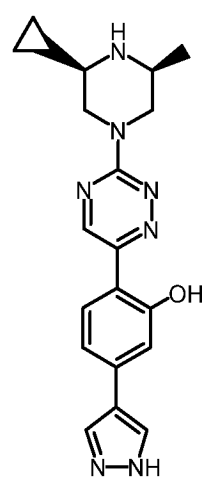
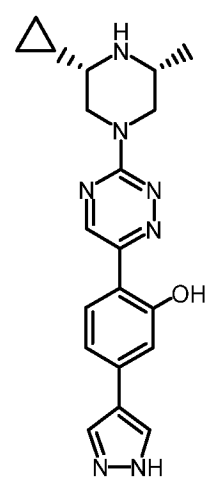
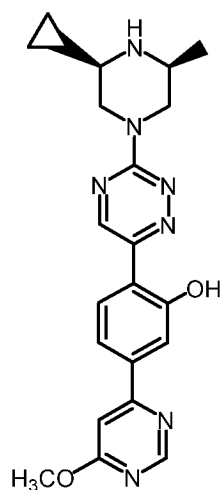
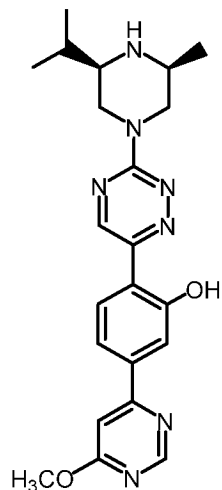
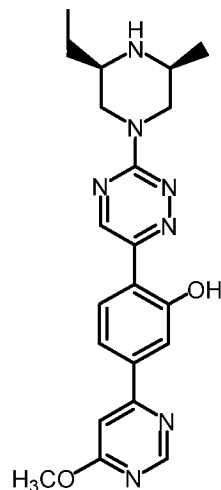
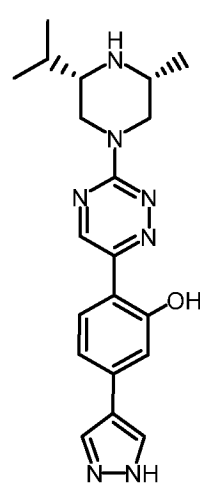
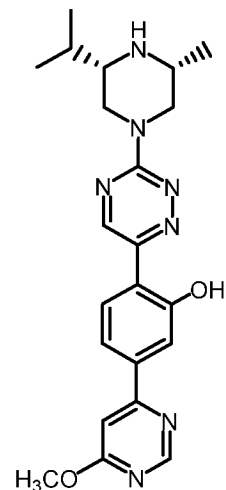
213

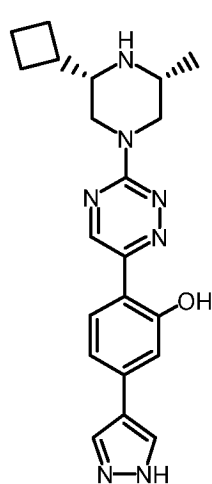
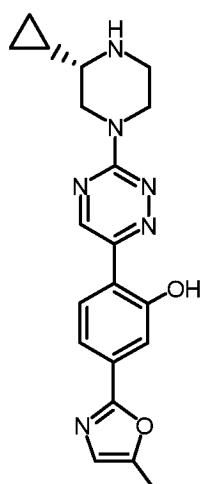
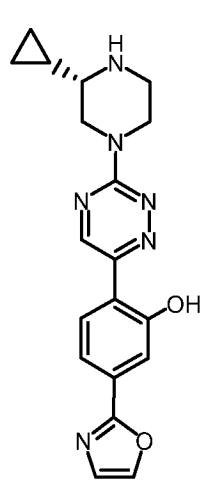
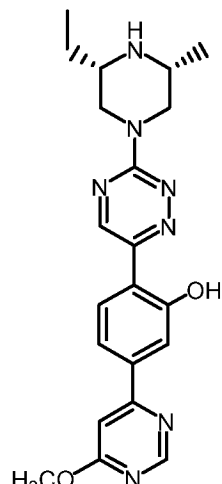
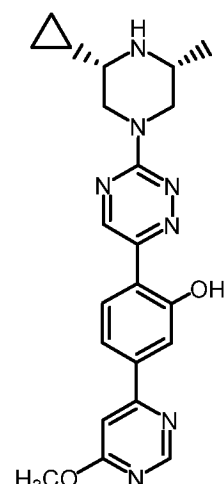
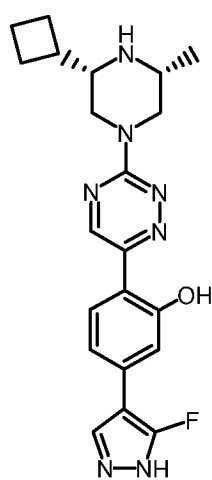
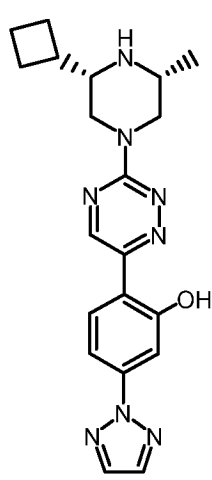
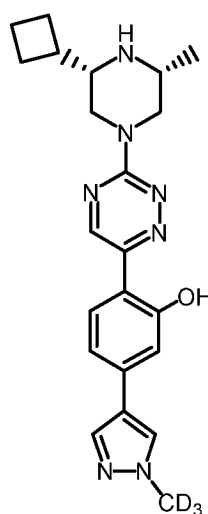
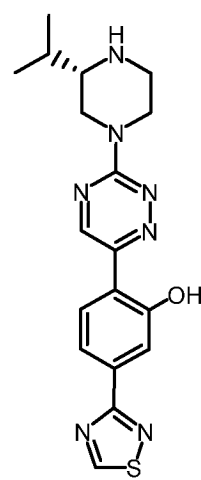
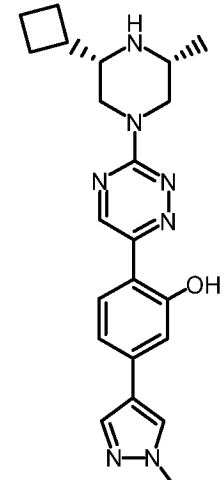
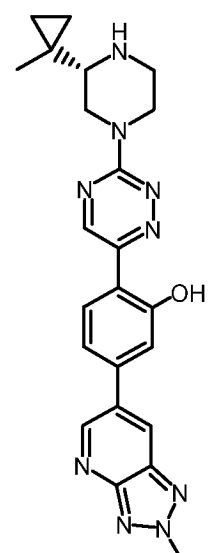
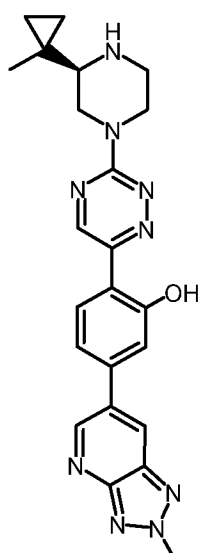
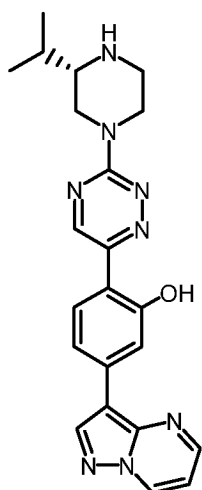
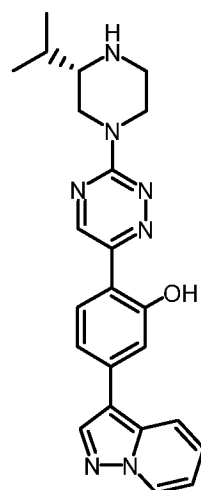
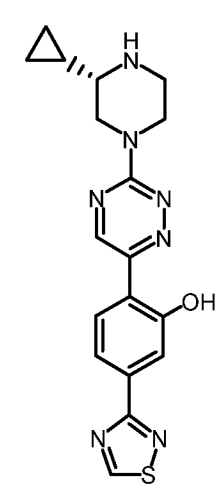


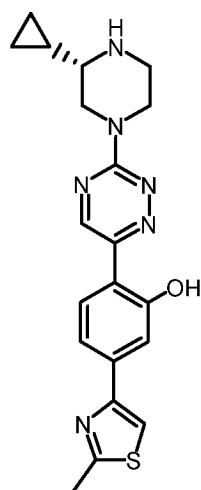
214



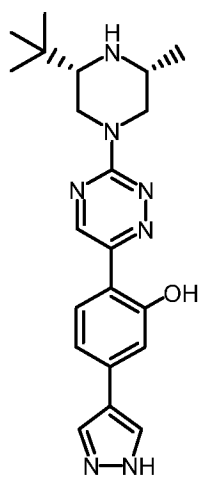
215

**216****217****218****219****220****221****222****223****224****225****226****227****228****229****230**

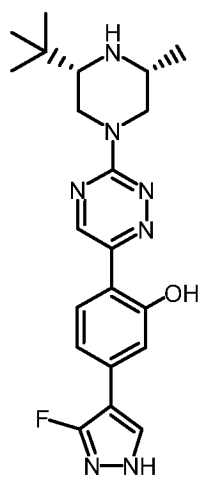
**231****232****233****234****235****236****237****238****239****240****241****242****243****244****245**



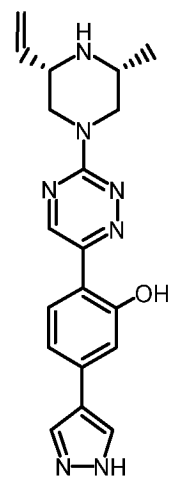
246



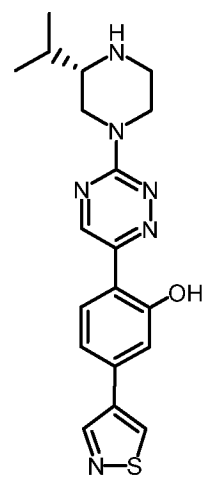
247



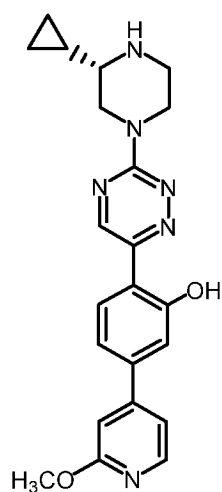
248



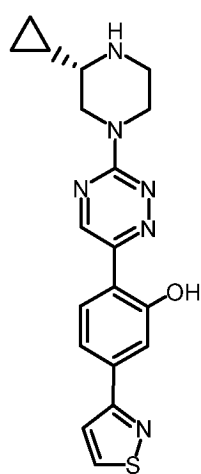
249



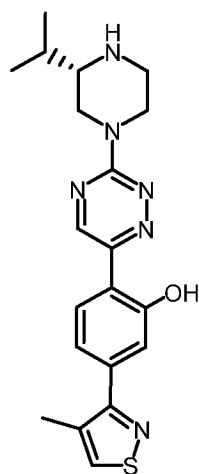
250



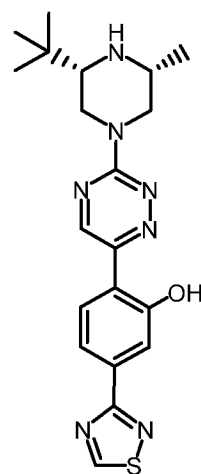
251



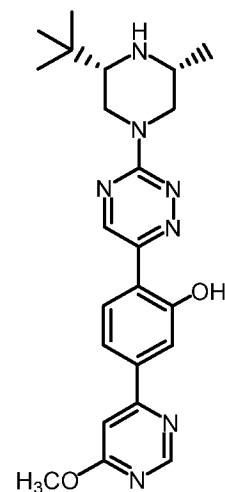
252



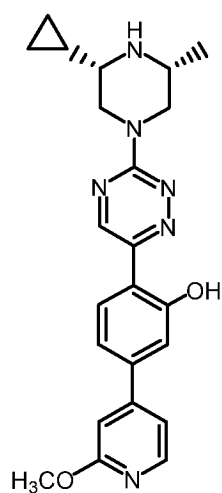
253



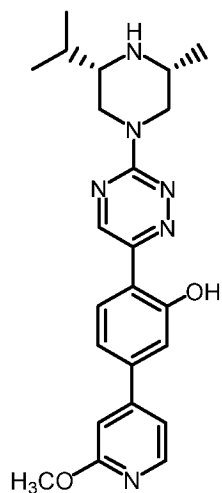
254



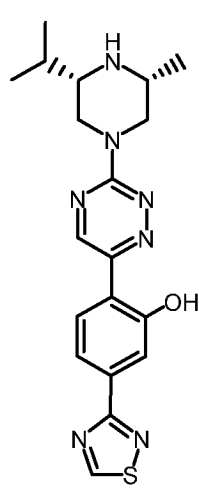
255



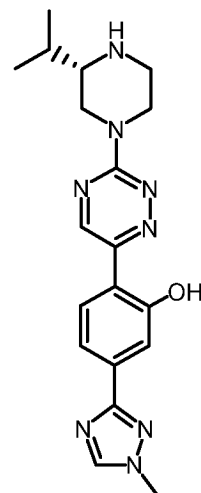
256



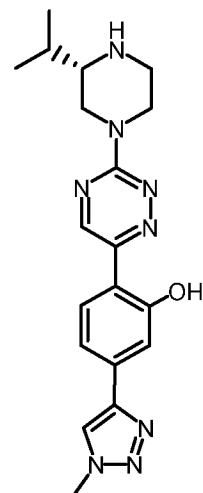
257



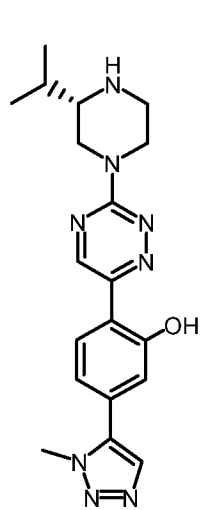
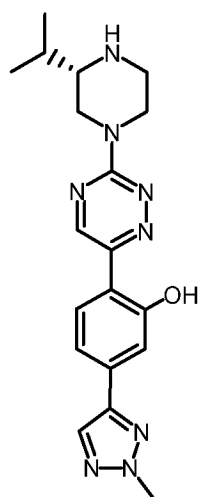
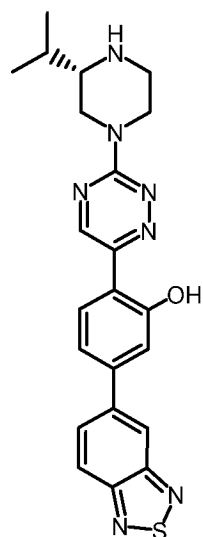
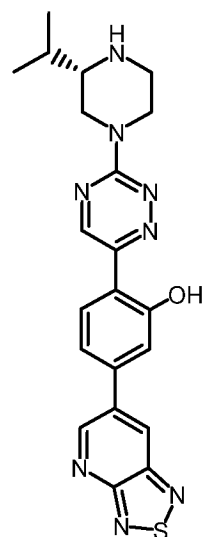
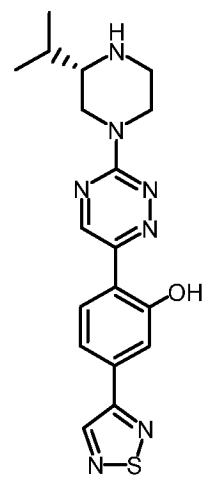
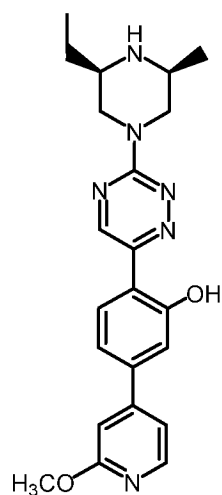
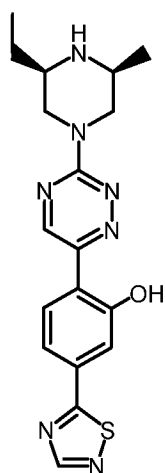
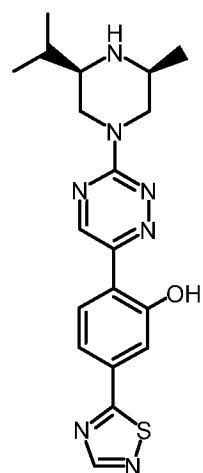
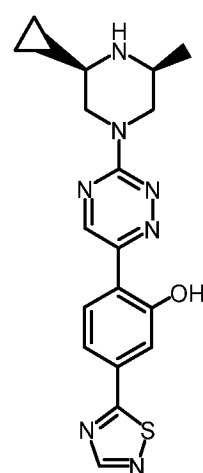
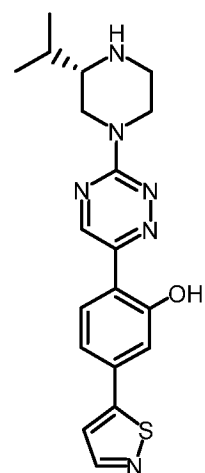
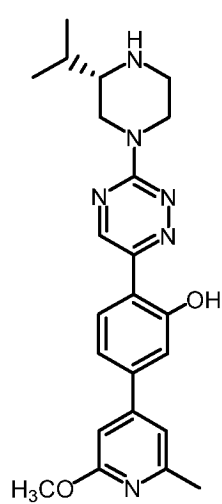
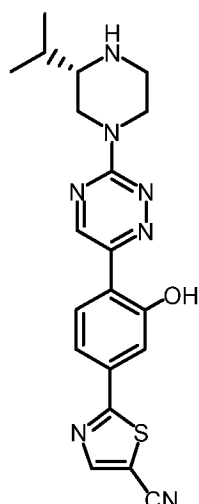
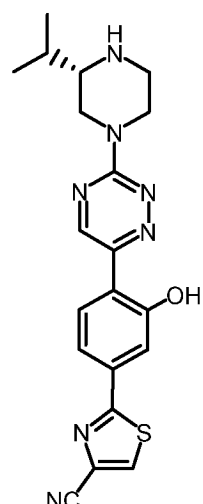
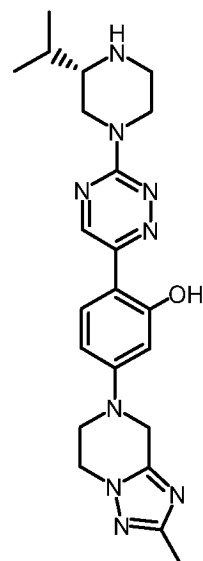
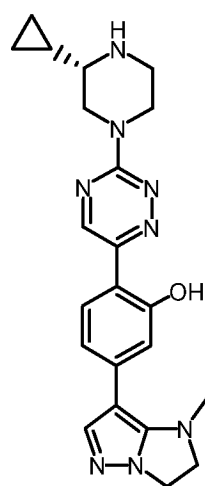
258

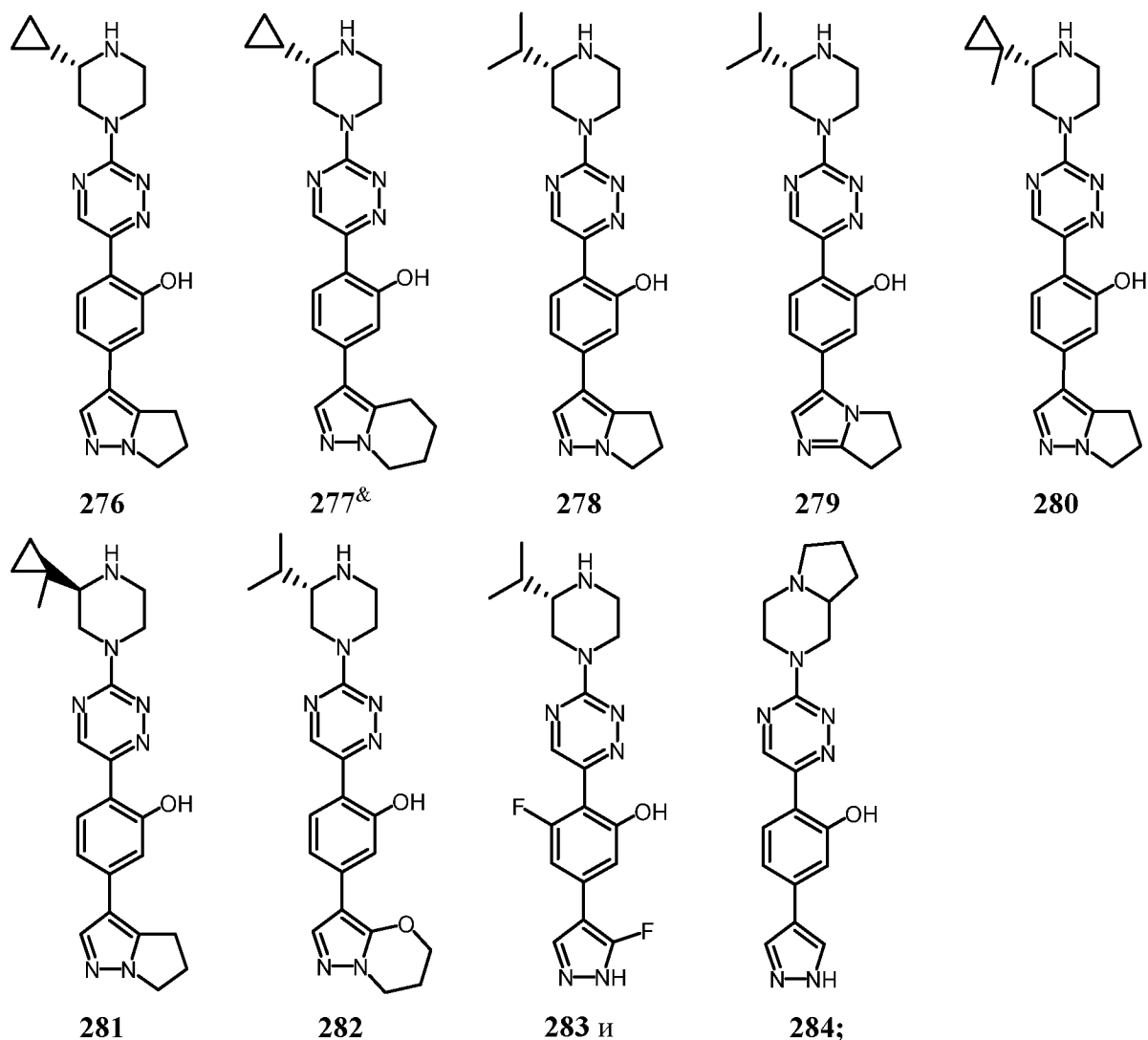


259



260

**261****262****263****264****265****266[&]****267[&]****268[&]****269[&]****270[#]****271****272****273****274****275**



причем форма соединения выбрана из группы, состоящей из его соли, гидрата, сложного эфира, сольвата и таутомерной формы.

Один аспект соединения формулы (I) или его формы (где номер соединения (#¹) показывает, что форма соли была выделена) включает соединение, выбранное из группы, состоящей из:

Сое д	Название
1 ¹	2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(3-фтор-1H-пиразол-4-ил)фенол
2 ¹	2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-{6-[(² H ₃)метилокси]пиримидин-4-ил}фенол
3 ¹	5-(3-фтор-1H-пиразол-4-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол
4 ¹	5-(3-фтор-1H-пиразол-4-ил)-2-{3-[3-(2-гидроксипропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол

Сое д	Название
5 ¹	2-[3-(3-циклопропилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенол
6 ¹	2-{3-[3-(1-гидроксициклопропил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенол
7 ¹	2-{3-[(3R)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(3-фтор-1Н-пиразол-4-ил)фенол
8 ¹	2-{3-[3-(2-гидроксипропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-{6-[(² H ₃)метилокси]пиримидин-4-ил}фенол
9 ¹	2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-[1-(² H ₃)метил-1Н-пиразол-4-ил]фенол
10 ¹	5-{6-[(² H ₃)метилокси]пиримидин-4-ил}-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол
11 ¹	2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2Н-1,2,3-триазол-2-ил)фенол
12 ¹	2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1-метил-1Н-пиразол-4-ил)фенол
13 ¹	2-{3-[3-(2-гидроксипропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенол
14 ¹	2-{3-[3-(2-гидроксипропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2Н-1,2,3-триазол-2-ил)фенол
15 ¹	5-(3-фтор-1Н-пиразол-4-ил)-2-{3-[3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол
16 ¹	2-{3-[(3S)-3-трет-бутилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенол
17 ¹	2-{3-[(3S)-3-трет-бутилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-{6-[(² H ₃)метилокси]пиримидин-4-ил}фенол
18 ¹	2-{3-[(3S)-3-трет-бутилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2Н-1,2,3-триазол-2-ил)фенол
19 ¹	2-{3-[3-(2-гидроксипропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-[1-(² H ₃)метил-1Н-пиразол-4-ил]фенол
20	2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенол
21 ¹	2-{3-[(3S)-3-трет-бутилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1-метил-1Н-пиразол-4-ил)фенол
22	2-{3-[3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенол
23	2-{3-[(3S)-3-этилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенол
24 ¹	2-[3-(3-этилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенол
25 ¹	5-(3-фтор-1Н-пиразол-4-ил)-2-{3-[(3R)-3-(2-гидроксипропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол

Сое д	Название
26 ¹	2-{3-[3-(2-гидроксипропан-2-ил)-4-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-{6-[(² H ₃)метилокси]пиримидин-4-ил} фенол
27 ¹	2-[3-(3-циклопропил-4-метилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенол
28 ¹	3-фтор-5-(6-метоксипиримидин-4-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенол
29 ¹	2-{3-[3-(1-метоксициклопропил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенол
30	2-[3-(3-циклобутилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенол
31 ¹	2-[3-(3-пропилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенол
32 ¹	2-[3-(3-циклопропилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-3-фтор-5-(5-фтор-1Н-пиразол-4-ил)фенол
33 ¹	2-{3-[3-(бутан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенол
34	2-{3-[4-метил-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенол
35 ¹	5-(1-метил-1Н-пиразол-4-ил)-2-{3-[3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенол
36 ¹	2-{3-[3-(2,2-дифторциклопропил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенол
37 ¹	2-{3-[(3S)-3-пропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенол
38 ¹	2-[3-(3-этилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенол
39 ¹	2-[3-(3-этилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-[1-(² H ₃)метил-1Н-пиразол-4-ил]фенол
40	2-{3-[(3R)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенол
41 ¹	5-[1-(² H ₃)метил-1Н-пиразол-4-ил]-2-{3-[3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенол
42	2-[3-(3-метилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенол
43 ¹	2-[3-(6,9-диазаспиро[4.5]декан-9-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенол
44 ¹	5-(2-метилпиримидин-4-ил)-2-{3-[3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенол
45 ¹	2-{3-[(3S)-3-(гидроксиметил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2Н-1,2,3-пиразол-2-ил)фенол
46	2-{3-[3-(2-метилпропил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенол
47 ¹	5-[1-(² H ₃)метил-1Н-пиразол-4-ил]-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенол

Сое д	Название
48	2-{3-[(3R)-3-этилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1H-пиразол-4-ил)фенол
49 ¹	2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-[1-(² H ₃)метил-1H-пиразол-4-ил]фенол
50 ¹	2-[3-(5,8-диазаспиро[3.5]нонан-8-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(1H-пиразол-4-ил)фенол
51 ¹	5-[1-(² H ₃)метил-1H-пиразол-4-ил]-2-{3-[(3R,5S)-3,4,5-триметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол
52 ¹	5-(2H-1,2,3-триазол-2-ил)-2-{3-[(3R,5S)-3,4,5-триметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол
53	2-{3-[(3R)-3-(метоксиметил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1H-пиразол-4-ил)фенол
54 ¹	2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2H-1,2,3-триазол-2-ил)фенол
55 ¹	2-[3-(4,7-диазаспиро[2.5]октан-7-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(1H-пиразол-4-ил)фенол
56 ¹	2-[3-(3,3-диметилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(1H-пиразол-4-ил)фенол
57 ¹	2-[3-(4,7-диазаспиро[2.5]октан-7-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(3-фтор-1H-пиразол-4-ил)фенол
58 ¹	2-[3-(8-метил-3,8-диазабицикло[3.2.1]октан-3-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-[1-(² H ₃)метил-1H-пиразол-4-ил]фенол
59 ¹	(7R,8aS)-2-{6-[2-гидрокси-4-(1H-пиразол-4-ил)фенил]-1,2,4-триазин-3-ил}октагидропирроло[1,2-a]пиперазин-7-ол
60	2-{3-[4-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1H-пиразол-4-ил)фенол
61 ¹	2-[3-(3-фенилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(1H-пиразол-4-ил)фенол
62 ¹	5-(1H-пиразол-4-ил)-2-{3-[3-(пиридин-4-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол
63	2-[3-(4-циклопропилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(1H-пиразол-4-ил)фенол
64	2-[3-(гексагидропиразино[2,1-с][1,4]оксазин-8(1H)-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(1H-пиразол-4-ил)фенол
65 ¹	5-(7-фтор-2-метил-2H-индазол-5-ил)-2-{3-[3-(гидроксиметил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол
66 ¹	2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(8-фтор-2-метилимидазо[1,2-a]пиридин-6-ил)фенол
67 ¹	5-(7-фтор-2-метил-2H-индазол-5-ил)-2-[3-(3-метилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]фенол
68 ¹	2-[3-(3-этилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(8-фтор-2-метилимидазо[1,2-a]пиридин-6-ил)фенол
69 ¹	5-(2,8-диметилимидазо[1,2-b]пиридазин-6-ил)-2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол

Сое д	Название
70 ¹	5-(8-метокси-2-метил[1,2,4]триазоло[1,5-b]пиридазин-6-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенол
71 ¹	5-(7-фтор-2-метил-2Н-индазол-5-ил)-2-{3-[3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенол
72	2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2-метил-2Н-индазол-5-ил) фенол
73 ¹	5-(8-фтор-2-метилимидазо[1,2-a]пиридин-6-ил)-2-[3-(4-метилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил] фенол
74 ¹	2-[3-(3-этилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(7-фтор-2-метил-2Н-индазол-5-ил) фенол
75	2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2-метилимидазо[1,2-b]пиридазин-6-ил) фенол
76	2-{3-[(3R,5R)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(7-фтор-2-метил-2Н-индазол-5-ил) фенол
77 ¹	2-[3-(4-этилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(8-фтор-2-метилимидазо[1,2-a]пиридин-6-ил) фенол
78 ¹	5-(2,8-диметил[1,2,4]триазоло[1,5-a]пиридин-6-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенол
79	2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(7-фтор-2-метил-2Н-индазол-5-ил) фенол
80 ¹	5-(4-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-3-гидроксифенил)-2-метил-2Н-индазол-7-карбонитрил
81 ¹	5-(7-фтор-2-метил-2Н-индазол-5-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенол
82	5-(2-метилимидазо[1,2-b]пиридазин-6-ил)-2-[3-(4-метилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил] фенол
83 ¹	2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2,8-диметил[1,2,4]триазоло[1,5-b]пиридазин-6-ил) фенол
84 ¹	2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(6,8-диметил-7Н-пурин-2-ил) фенол
85 ¹	5-(2-метил[1,2,4]триазоло[1,5-a]пиридин-6-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенол
86 ¹	2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2-метилимидазо[1,2-a]пиридин-6-ил) фенол
87	6-(4-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-3-гидроксифенил)-2-метилимидазо[1,2-a]пиридин-8-карбонитрил
88 ¹	5-(2-метил-2Н-индазол-5-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенол
89 ¹	2-{3-[(3R)-4-этил-3-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(8-фтор-2-метилимидазо[1,2-a]пиридин-6-ил) фенол

Сое д	Название
90 ¹	2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(8-метокси-2-метил[1,2,4]триазоло[1,5-b]пиридазин-6-ил)фенол
91 ¹	5-(2-метил[1,2,4]триазоло[1,5-a]пиразин-6-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол
92 ¹	5-(2,8-диметил[1,2,4]триазоло[1,5-b]пиридазин-6-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол
93 ¹	5-(8-метокси-2-метил[1,2,4]триазоло[1,5-a]пиразин-6-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол
94 ¹	5-(8-фтор-2-метилимидазо[1,2-a]пиридин-6-ил)-2-{3-[(3R,5S)-3,4,5-триметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол
95 ¹	5-(7-фтор-2-метил-2Н-индазол-5-ил)-2-[3-(гексагидропирроло[1,2-a]пиразин-2(1H)-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]фенол
96 ¹	5-(2,8-диметилимидазо[1,2-a]пиразин-6-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол
97	2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2-метил-2Н-пиразоло[3,4-b]пиридин-5-ил)фенол
98 ¹	5-(2,8-диметилимидазо[1,2-b]пиридазин-6-ил)-2-{3-[(3R)-3-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол
99	5-(7-фтор-2-метил-2Н-индазол-5-ил)-2-{3-[(8aS)-гексагидропирроло[1,2-a]пиразин-2(1H)-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол
100 ¹	2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2-метил[1,2,4]триазоло[1,5-b]пиридазин-6-ил)фенол
101 ¹	2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2,8-диметил[1,2,4]триазоло[1,5-a]пиразин-6-ил)фенол
102 ¹	5-(имидазо[1,2-b]пиридазин-6-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол
103 ¹	5-(2,8-диметилимидазо[1,2-a]пиразин-6-ил)-2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол
104 ¹	5-(2,8-диметилимидазо[1,2-b]пиридазин-6-ил)-2-[3-(4-метилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]фенол
105 ¹	5-(7-фтор-2-метил-2Н-индазол-5-ил)-2-{3-[(8aR)-гексагидропирроло[1,2-a]пиразин-2(1H)-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол
106 ¹	2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2-метил[1,2,4]триазоло[1,5-a]пиразин-6-ил)фенол
107 ¹	2-{3-[(3R)-3,4-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(8-фтор-2-метилимидазо[1,2-a]пиридин-6-ил)фенол
108 ¹	6-(3-гидрокси-4-{3-[(3R,5S)-3,4,5-триметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенил)-2-метилимидазо[1,2-b]пиридазин-8-карбонитрил
109 ¹	5-(8-циклопропил-2-метил[1,2,4]триазоло[1,5-a]пиразин-6-ил)-2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол

Сое д	Название
110	2-[3-(4-метилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(2-метил-2Н-пиразоло[3,4-b]пиридин-5-ил)фенол
111 ¹	5-(2,8-диметилимидазо[1,2-b]пиридазин-6-ил)-2-{3-[(3R,5S)-3,4,5-триметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол
112 ¹	2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2-метил[1,2,4]триазоло[1,5-а]пиримидин-6-ил)фенол
113 ¹	5-(имидазо[1,2-а]пиразин-6-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол
114 ¹	5-(имидазо[1,2-а]пиридин-6-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол
115 ¹	2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-([1,2,4]триазоло[4,3-а]пиридин-6-ил)фенол
116 ¹	2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(4,6-диметил[1,3]тиазоло[5,4-с]пиридин-2-ил)фенол
117 ¹	2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(5,7-диметил[1,2,4]триазоло[1,5-а]пиримидин-2-ил)фенол
118 ¹	2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-[2-(трифторметил)имидазо[1,2-b]пиридазин-6-ил]фенол
119 ¹	2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(6-метил[1,3]тиазоло[4,5-b]пиразин-2-ил)фенол
120 ¹	2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(5-метилфуро[3,2-b]пиридин-2-ил)фенол
121 ¹	5-(7-метокси-2-метил-2Н-индазол-5-ил)-2-[3-(4-метилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]пиридин-3-ол
122 ¹	5-(8-фтор-2-метилимидазо[1,2-а]пиридин-6-ил)-2-[3-(4-метилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]пиридин-3-ол
123 ¹	2-{3-[(3S)-3-этилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(3-фтор-1Н-пиразол-4-ил)фенол
124 ¹	2-[3-(4-метилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(1Н-пиразол-4-ил)пиридин-3-ол
125 ¹	2-{3-[(3S)-3-трет-бутилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(3-фтор-1Н-пиразол-4-ил)фенол
126 ¹	5-(2,8-диметилимидазо[1,2-а]пиридин-6-ил)-2-[3-(4-метилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]пиридин-3-ол
127 ¹	3-метил-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенол
128 ¹	2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-([1,2,4]триазоло[1,5-а]пиразин-6-ил)фенол
129 ¹	2-{3-[(3S)-3-трет-бутилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-([1,2,4]триазоло[1,5-а]пиразин-6-ил)фенол

Сое д	Название
130¹	2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-([1,2,4]триазоло[1,5-а]пиразин-6-ил)фенол
131¹	5-(2,8-диметилимидазо[1,2-а]пиридин-6-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол
132¹	2-{3-[(3S)-3-этилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2H-1,2,3-триазол-2-ил)фенол
133¹	2-{3-[(3S)-3-этилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-{6-[(² H ₃)метилокси]пиримидин-4-ил}фенол
134¹	2-{3-[3-(1-метилциклопропил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1H-пиразол-4-ил)фенол
135¹	2-[3-(3,8-диазабицикло[3.2.1]октан-3-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(1H-пиразол-4-ил)фенол
136¹	2-{3-[(3R)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1H-пиразол-4-ил)фенол
137¹	2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1H-пиразол-4-ил)фенол
138¹	5-(8-этил-2-метилимидазо[1,2-а]пиридин-6-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол
139¹	5-[2-метил-8-(трифторметил)имидазо[1,2-а]пиридин-6-ил]-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол
140¹	5-(2,7-диметил-2H-индазол-5-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол
141¹	5-(2-метилимидазо[1,2-а]пиразин-6-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол
142	5-(1H-имидазол-1-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол
143	5-(6-метилпиразин-2-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол
144	2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(пиразин-2-ил)фенол
145	5-(5-метилпиразин-2-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол
146¹	5-(1H-пиразол-4-ил)-2-{3-[3-(2,2,2-трифторэтил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол
147¹	5-(2-метил[1,2,4]триазоло[1,5-а]пиридин-7-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол
148¹	2-{3-[rac-(3S,5R)-3-этил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1H-пиразол-4-ил)фенол
149¹	5-(6-метилпиримидин-4-ил)-2-{3-[(3RS)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол

Сое д	Название
150	5-(6-этилпиримидин-4-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол
151	2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(пиримидин-2-ил)фенол
152¹	4-фтор-5-[1-(² H ₃)метил-1Н-пиразол-4-ил]-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол
153¹	2-{3-[(8aS)-гексагидропирроло[1,2-a]пиазин-2(1H)-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2H-1,2,3-триазол-2-ил)фенол
154¹	2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2H-1,2,3-триазол-2-ил)фенол
155¹	5-(5-метил-1Н-пиразоло[4,3-b]пиридин-1-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол
156¹	2-{3-[(3S)-3-трет-бутилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-4-фтор-5-[1-(² H ₃)метил-1Н-пиразол-4-ил]фенол
157¹	5-(7-фтор-2-метил-2Н-индазол-5-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}пиридин-3-ол
158¹	4-фтор-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенол
159¹	5-(5-метил-1Н-пирроло[3,2-b]пиридин-1-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол
160	5-(6-метилпиридин-3-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол
161	2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(пиридин-4-ил)фенол
162¹	2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1Н-пиразоло[3,4-d]пиримидин-1-ил)фенол
163¹	5-(3-хлор-1Н-пиразол-4-ил)-2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол
164¹	2-{3-[(3S)-3-трет-бутилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-4-фтор-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенол
165¹	2-{3-[(3S)-3-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенол
166¹	2-{3-[(3R)-3-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенол
167	2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2-метил[1,2,4]триазоло[1,5-a]пиазин-6-ил)фенол
168¹	2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2-метил-2Н-[1,2,3]триазоло[4,5-b]пиридин-6-ил)фенол
169¹	2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1-метил-1Н-[1,2,3]триазоло[4,5-b]пиридин-6-ил)фенол

Сое д	Название
170	2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1,2,4-тиадиазол-5-ил)фенол
171¹	2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1-метил-1Н-[1,2,3]триазоло[4,5- <i>b</i>]пиридин-5-ил)фенол
172¹	2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2-метил-2Н-[1,2,3]триазоло[4,5- <i>c</i>]пиридин-6-ил)фенол
173¹	2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(3-метил-3Н-[1,2,3]триазоло[4,5- <i>b</i>]пиридин-5-ил)фенол
174¹	2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1-метил-1Н-[1,2,3]триазоло[4,5- <i>c</i>]пиридин-6-ил)фенол
175¹	2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2Н-1,2,3-триазол-2-ил)пиридин-3-ол
176¹	2-{3-[(2S,5S)-2,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенол
177¹	2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(пиридин-4-ил)фенол
178¹	2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(3-фторпиридин-4-ил)фенол
179¹	4-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-4'-(метиламино)[1,1'-бифенил]-3-ол
180¹	2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2-метил-2Н-[1,2,3]триазоло[4,5- <i>b</i>]пиридин-6-ил)пиридин-3-ол
181¹	2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(7-фтор-2-метил-2Н-индазол-5-ил)пиридин-3-ол
182¹	2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2Н-1,2,3-триазол-2-ил)пиридин-3-ол
183¹	2-{3-[(3R)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(4-метил-2Н-1,2,3-триазол-2-ил)фенол
184¹	5-(4-метил-2Н-1,2,3-триазол-2-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол
185	2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1,3-тиазол-2-ил)фенол
186	5-[4-(диформетил)-1,3-тиазол-2-ил]-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол
187¹	2-{3-[4-метил-3-(оксетан-3-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенол
188	5-(4-хлор-1,3-тиазол-2-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол
189	5-(5-хлор-1,3-тиазол-2-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол

Сое д	Название
190¹	2-{3-[(2R,5S)-2,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1H-пиразол-4-ил)фенол или 2-{3-[(2S,5R)-2,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1H-пиразол-4-ил)фенол
191¹	2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-([1,3]тиазоло[5,4-b]пиридин-2-ил)фенол
192	2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(пиримидин-4-ил)фенол
193¹	2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(3-метил[1,2,3]триазоло[1,5-a]пиридин-6-ил)фенол
194¹	2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1-метилимидазо[1,5-a]пиридин-6-ил)фенол
195¹	2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(3-метилимидазо[1,5-a]пиридин-7-ил)фенол
196	5-(5-фтор-1,3-тиазол-2-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол
197	2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2-метил-2H-[1,2,3]триазоло[4,5-b]пиридин-6-ил)фенол
198	2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2-метил-2H-[1,2,3]триазоло[4,5-c]пиридин-6-ил)фенол
199	5-(5-циклопропил-1,3,4-оксадиазол-2-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол
200	5-(4-метокси-1,3-тиазол-2-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол
201	2-{3-[гас-(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2-метил-2H-[1,2,3]триазоло[4,5-b]пиридин-5-ил)фенол
202¹	2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2-метил-2H-[1,2,3]триазоло[4,5-b]пиридин-5-ил)фенол
203	2-[3-(октагидро-2H-пиридо[1,2-a]пиразин-2-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(1H-пиразол-4-ил)фенол
204	5-(5-метокси-1,3,4-тиадиазол-2-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол
205	5-[5-(дифторметил)-1,3,4-тиадиазол-2-ил]-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол
206	2-{3-[гас-(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(3-метил[1,2,3]триазоло[1,5-a]пиридин-6-ил)фенол
207	5-(2,6-диметоксипиримидин-4-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол
208¹	2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1-этил-1H-пиразол-4-ил)фенол

Сое д	Название
209	2-{3-[(3RS)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2-фторпиридин-4-ил)фенол
210	5-[6-(азетидин-1-ил)пиримидин-4-ил]-2-{3-[(3RS)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол
211¹	2-{3-[(3S)-3-трет-бутилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2-метил-2Н-[1,2,3]триазоло[4,5- <i>b</i>]пиридин-6-ил)фенол
212¹	5-(2-метил-2Н-[1,2,3]триазоло[4,5- <i>b</i>]пиридин-6-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол
213¹	2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1,2,4-тиадиазол-3-ил)фенол
214	2-{3-[(3S,5R)-3-этил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2-метил-2Н-[1,2,3]триазоло[4,5- <i>b</i>]пиридин-6-ил)фенол
215	2-{3-[(3R,5S)-3-циклопропил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(5-фтор-1Н-пиразол-4-ил)фенол
216	2-{3-[(3S,5R)-3-метил-5-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенол
217	5-(5-фтор-1Н-пиразол-4-ил)-2-{3-[(3S,5R)-3-метил-5-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол
218	2-{3-[(3R,5S)-3-этил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(5-фтор-1Н-пиразол-4-ил)фенол
219	2-{3-[(3S,5R)-3-циклопропил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2,6-диметокси-пиримидин-4-ил)фенол
220	2-{3-[(3R,5S)-3-циклопропил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2,6-диметокси-пиримидин-4-ил)фенол
221	2-{3-[(3S,5R)-3-циклопропил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(5-фтор-1Н-пиразол-4-ил)фенол
222	5-(5-фтор-1Н-пиразол-4-ил)-2-{3-[(3R,5S)-3-метил-5-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол
223	2-{3-[(3S,5R)-3-этил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(5-фтор-1Н-пиразол-4-ил)фенол
224	2-{3-[(3R,5S)-3-циклопропил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенол
225	2-{3-[(3S,5R)-3-циклопропил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенол
226	2-{3-[(3R,5S)-3-циклопропил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(6-метокси-пиримидин-4-ил)фенол
227	5-(6-метокси-пиримидин-4-ил)-2-{3-[(3S,5R)-3-метил-5-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол
228	2-{3-[(3R,5S)-3-этил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(6-метокси-пиримидин-4-ил)фенол

Сое д	Название
229	2-{3-[(3R,5S)-3-метил-5-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1H-пиразол-4-ил)фенол
230	5-(6-метоксипиримидин-4-ил)-2-{3-[(3R,5S)-3-метил-5-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол
231¹	2-{3-[(3S,5R)-3-циклобутил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1H-пиразол-4-ил)фенол
232¹	2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(5-метил-1,3-оксазол-2-ил)фенол
233¹	2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1,3-оксазол-2-ил)фенол
234	2-{3-[(3S,5R)-3-этил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(6-метоксипиримидин-4-ил)фенол
235	2-{3-[(3S,5R)-3-циклопропил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(6-метоксипиримидин-4-ил)фенол
236¹	2-{3-[(3S,5R)-3-циклобутил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(3-фтор-1H-пиразол-4-ил)фенол
237¹	2-{3-[(3S,5R)-3-циклобутил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2H-1,2,3-триазол-2-ил)фенол
238¹	2-{3-[(3S,5R)-3-циклобутил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-[1-(² H ₃)метил-1H-пиразол-4-ил]фенол
239¹	2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1,2,4-тиадиазол-3-ил)фенол
240¹	2-{3-[(3S,5R)-3-циклобутил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1-метил-1H-пиразол-3-ил)фенол
241¹	2-{3-[(3S)-3-(1-метилциклопропил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2-метил-2H-[1,2,3]триазоло[4,5-b]пиридин-6-ил)фенол
242¹	2-{3-[(3R)-3-(1-метилциклопропил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2-метил-2H-[1,2,3]триазоло[4,5-b]пиридин-6-ил)фенол
243¹	2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(пиразоло[1,5-a]пиримидин-3-ил)фенол
244	2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(пиразоло[1,5-a]пиридин-3-ил)фенол
245¹	2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(5-метил-1,2,4-тиадиазол-3-ил)фенол
246¹	2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2-метил-1,3-тиазол-4-ил)фенол
247¹	2-{3-[(3S,5R)-3-трет-бутил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1H-пиразол-4-ил)фенол
248¹	2-{3-[(3S,5R)-3-трет-бутил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(3-фтор-1H-пиразол-4-ил)фенол

Сое д	Название
249¹	2-{3-[(3S,5R)-3-этенил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1H-пиразол-4-ил)фенол
250¹	2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1,2-тиазол-4-ил)фенол
251¹	2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2-метоксипиридин-4-ил)фенол
252¹	2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1,2-тиазол-3-ил)фенол
253	5-(4-метил-1,2-тиазол-5-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол
254¹	2-{3-[(3S,5R)-3-трет-бутил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1,2,4-тиадиазол-3-ил)фенол
255¹	2-{3-[(3S,5R)-3-трет-бутил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(6-метоксипиримидин-4-ил)фенол
256	2-{3-[(3S,5R)-3-циклопропил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2-метоксипиридин-4-ил)фенол
257	5-(2-метоксипиридин-4-ил)-2-{3-[(3R,5S)-3-метил-5-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол
258	2-{3-[(3S)-3-трет-бутилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1,2,4-тиадиазол-3-ил)фенол
259	5-(1-метил-1H-1,2,4-триазол-3-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол
260¹	5-(1-метил-1H-1,2,3-триазол-4-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол
261¹	5-(1-метил-1H-1,2,3-триазол-5-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол
262¹	5-(2-метил-2H-1,2,3-триазол-4-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол
263¹	5-(2,1,3-бензотиадиазол-5-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол
264¹	2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-([1,2,5]тиадиазоло[3,4-b]пиридин-6-ил)фенол
265¹	2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1,2,5-тиадиазол-3-ил)фенол
266	2-{3-[(3S,5R)-3-этил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2-метоксипиридин-4-ил)фенол или 2-{3-[(3R,5S)-3-этил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2-метоксипиридин-4-ил)фенол
267	2-{3-[(3S,5R)-3-этил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1,2,4-тиадиазол-5-ил)фенол или

Сое д	Название
	2-{3-[(3R,5S)-3-этил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1,2,4-тиадиазол-5-ил)фенол
268	2-{3-[(3R,5S)-3-метил-5-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1,2,4-тиадиазол-5-ил)фенол или 2-{3-[(3S,5R)-3-метил-5-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1,2,4-тиадиазол-5-ил)фенол
269	2-{3-[(3S,5R)-3-циклопропил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1,2,4-тиадиазол-5-ил)фенол или 2-{3-[(3R,5S)-3-циклопропил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1,2,4-тиадиазол-5-ил)фенол
270 ¹	2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1,2-тиазол-5-ил)фенол
271 ¹	5-(2-метокси-6-метилпиридин-4-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол
272 ¹	2-(3-гидрокси-4-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенил)-1,3-тиазол-5-карбонитрил
273 ¹	2-(3-гидрокси-4-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенил)-1,3-тиазол-4-карбонитрил
274 ¹	5-(2-метил-5,6-дигидро[1,2,4]триазоло[1,5-а]пирозин-7(8H)-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол
275 ¹	2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1-метил-2,3-дигидро-1H-имидазо[1,2-b]пирозол-7-ил)фенол
276 ¹	2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(5,6-дигидро-4H-пирроло[1,2-b]пирозол-3-ил)фенол
277 ¹	2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(4,5,6,7-тетрагидропиразоло[1,5-а]пиридин-3-ил)фенол или 2-{3-[(3R)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(4,5,6,7-тетрагидропиразоло[1,5-а]пиридин-3-ил)фенол
278	5-(5,6-дигидро-4H-пирроло[1,2-b]пирозол-3-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол
279	5-(6,7-дигидро-5H-пирроло[1,2-а]имидазол-3-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол
280	5-(5,6-дигидро-4H-пирроло[1,2-b]пирозол-3-ил)-2-{3-[(3S)-3-(1-метилциклопропил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол
281	5-(5,6-дигидро-4H-пирроло[1,2-b]пирозол-3-ил)-2-{3-[(3R)-3-(1-метилциклопропил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол
282	5-(6,7-дигидро-5H-пиразоло[5,1-b][1,3]оксазин-3-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол, и
283 ¹	3-фтор-5-(5-фтор-1H-пиразол-4-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол;

причем форма соединения выбрана из группы, состоящей из его соли, гидрата, сольвата и таутомерной формы.

Другой аспект соединения формулы (I) или его формы представляет собой соль соединения, выбранную из группы, состоящей из следующих:

Сое д	Название
1	2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(3-фтор-1Н-пиразол-4-ил)фенола дигидрохлорид
2	2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-{6-[(² H ₃)метилокси]пиримидин-4-ил} фенола дигидрохлорид
3	5-(3-фтор-1Н-пиразол-4-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенола дигидрохлорид
4	5-(3-фтор-1Н-пиразол-4-ил)-2-{3-[3-(2-гидроксипропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенола дигидрохлорид
5	2-[3-(3-циклопропилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенола дигидрохлорид
6	2-{3-[3-(1-гидроксициклопропил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенола диформиат
7	2-{3-[(3R)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(3-фтор-1Н-пиразол-4-ил)фенола дигидрохлорид
8	2-{3-[3-(2-гидроксипропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-{6-[(² H ₃)метилокси]пиримидин-4-ил} фенола дигидрохлорид
9	2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-[1-(² H ₃)метил-1Н-пиразол-4-ил]фенола дигидрохлорид
10	5-{6-[(² H ₃)метилокси]пиримидин-4-ил}-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенола дигидрохлорид
11	2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2Н-1,2,3-триазол-2-ил)фенола дигидрохлорид
12	2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1-метил-1Н-пиразол-4-ил)фенола дигидрохлорид
13	2-{3-[3-(2-гидроксипропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенола дигидрохлорид
14	2-{3-[3-(2-гидроксипропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2Н-1,2,3-триазол-2-ил)фенола дигидрохлорид
15	5-(3-фтор-1Н-пиразол-4-ил)-2-{3-[3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенола дигидрохлорид
16	2-{3-[(3S)-3-трет-бутилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенола дигидрохлорид
17	2-{3-[(3S)-3-трет-бутилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-{6-[(² H ₃)метилокси]пиримидин-4-ил} фенола дигидрохлорид
18	2-{3-[(3S)-3-трет-бутилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2Н-1,2,3-триазол-2-ил)фенола дигидрохлорид

Сое д	Название
19	2-{3-[3-(2-гидроксипропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-[1-(² H ₃)метил-1Н-пиразол-4-ил]фенола дигидрохлорид
21	2-{3-[(3S)-3-трет-бутилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1-метил-1Н-пиразол-4-ил)фенола дигидрохлорид
24	2-[3-(3-этилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенола дигидрохлорид
25	5-(3-фтор-1Н-пиразол-4-ил)-2-{3-[(3R)-3-(2-гидроксипропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенола дигидрохлорид
26	2-{3-[3-(2-гидроксипропан-2-ил)-4-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-{6-[(² H ₃)метилокси]пиримидин-4-ил}фенола дигидрохлорид
27	2-[3-(3-циклопропил-4-метилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенола дигидрохлорид
28	3-фтор-5-(6-метоксипиримидин-4-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенола формиат
29	2-{3-[3-(1-метоксициклопропил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенола диформиат
31	2-[3-(3-пропилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенола дигидрохлорид
32	2-[3-(3-циклопропилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-3-фтор-5-(5-фтор-1Н-пиразол-4-ил)фенола формиат
33	2-{3-[3-(бутан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенола дигидрохлорид
35	5-(1-метил-1Н-пиразол-4-ил)-2-{3-[3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенола дигидрохлорид
36	2-{3-[3-(2,2-дифторциклопропил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенола дигидрохлорид
38	2-[3-(3-этенилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенола дигидрохлорид
39	2-[3-(3-этилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-[1-(² H ₃)метил-1Н-пиразол-4-ил]фенола дигидрохлорид
41	5-[1-(² H ₃)метил-1Н-пиразол-4-ил]-2-{3-[3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенола дигидрохлорид
43	2-[3-(6,9-диазаспиро[4.5]декан-9-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенола дигидрохлорид
44	5-(2-метилпиридин-4-ил)-2-{3-[3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенола дигидрохлорид
45	2-{3-[(3S)-3-(гидроксиметил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2Н-1,2,3-триазол-2-ил)фенола дигидрохлорид
47	5-[1-(² H ₃)метил-1Н-пиразол-4-ил]-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенола дигидрохлорид

Сое д	Название
49	2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-[1-(² H ₃)метил-1H-пиразол-4-ил]фенола дигидрохлорид
50	2-[3-(5,8-диазаспиро[3.5]нонан-8-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(1H-пиразол-4-ил)фенола дигидрохлорид
51	5-[1-(² H ₃)метил-1H-пиразол-4-ил]-2-{3-[(3R,5S)-3,4,5-триметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенола дигидрохлорид
52	5-(2H-1,2,3-триазол-2-ил)-2-{3-[(3R,5S)-3,4,5-триметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенола дигидрохлорид
54	2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2H-1,2,3-триазол-2-ил)фенола дигидрохлорид
55	2-[3-(4,7-диазаспиро[2.5]октан-7-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(1H-пиразол-4-ил)фенола дигидрохлорид
56	2-[3-(3,3-диметилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(1H-пиразол-4-ил)фенола дигидрохлорид
57	2-[3-(4,7-диазаспиро[2.5]октан-7-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(3-фтор-1H-пиразол-4-ил)фенола дигидрохлорид
58	2-[3-(8-метил-3,8-диазабицикло[3.2.1]октан-3-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-[1-(² H ₃)метил-1H-пиразол-4-ил]фенола дигидрохлорид
59	(7R,8aS)-2-{6-[2-гидрокси-4-(1H-пиразол-4-ил)фенил]-1,2,4-триазин-3-ил}октагидропирроло[1,2-a]пиперазин-7-ола дигидрохлорид
61	2-[3-(3-фенилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(1H-пиразол-4-ил)фенола дигидрохлорид
62	5-(1H-пиразол-4-ил)-2-{3-[3-(пиридин-4-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенола дигидрохлорид
65	5-(7-фтор-2-метил-2H-индазол-5-ил)-2-{3-[3-(гидроксиметил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенола дигидрохлорид
66	2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(8-фтор-2-метилимидазо[1,2-a]пиридин-6-ил)фенола дигидрохлорид
67	5-(7-фтор-2-метил-2H-индазол-5-ил)-2-[3-(3-метилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]фенола дигидрохлорид
68	2-[3-(3-этилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(8-фтор-2-метилимидазо[1,2-a]пиридин-6-ил)фенола дигидрохлорид
69	5-(2,8-диметилимидазо[1,2-b]пиридазин-6-ил)-2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенола дигидрохлорид
70	5-(8-метокси-2-метил[1,2,4]триазоло[1,5-b]пиридазин-6-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенола дигидрохлорид
71	5-(7-фтор-2-метил-2H-индазол-5-ил)-2-{3-[3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенола дигидрохлорид
73	5-(8-фтор-2-метилимидазо[1,2-a]пиридин-6-ил)-2-[3-(4-метилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]фенола дигидрохлорид

Сое д	Название
74	2-[3-(3-этилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(7-фтор-2-метил-2Н-индазол-5-ил)фенола дигидрохлорид
77	2-[3-(4-этилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(8-фтор-2-метилимидазо[1,2-а]пиридин-6-ил)фенола дигидрохлорид
78	5-(2,8-диметил[1,2,4]триазоло[1,5-а]пиразин-6-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенола дигидрохлорид
80	5-(4-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-3-гидроксифенил)-2-метил-2Н-индазол-7-карбонитрила дигидрохлорид
81	5-(7-фтор-2-метил-2Н-индазол-5-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенола дигидрохлорид
83	2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2,8-диметил[1,2,4]триазоло[1,5-б]пиридазин-6-ил)фенола дигидрохлорид
84	2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(6,8-диметил-7Н-пурин-2-ил)фенола диформиат
85	5-(2-метил[1,2,4]триазоло[1,5-а]пиридин-6-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенола дигидрохлорид
86	2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2-метилимидазо[1,2-а]пиразин-6-ил)фенола дигидрохлорид
88	5-(2-метил-2Н-индазол-5-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенола дигидрохлорид
89	2-{3-[(3R)-4-этил-3-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(8-фтор-2-метилимидазо[1,2-а]пиридин-6-ил)фенола дигидрохлорид
90	2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(8-метокси-2-метил[1,2,4]триазоло[1,5-б]пиридазин-6-ил)фенола дигидрохлорид
91	5-(2-метил[1,2,4]триазоло[1,5-а]пиразин-6-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенола дигидрохлорид
92	5-(2,8-диметил[1,2,4]триазоло[1,5-б]пиридазин-6-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенола дигидрохлорид
93	5-(8-метокси-2-метил[1,2,4]триазоло[1,5-а]пиразин-6-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенола дигидрохлорид
94	5-(8-фтор-2-метилимидазо[1,2-а]пиридин-6-ил)-2-{3-[(3R,5S)-3,4,5-триметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенола дигидрохлорид
95	5-(7-фтор-2-метил-2Н-индазол-5-ил)-2-[3-(гексагидропирроло[1,2-а]пиразин-2(1H)-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]фенола дигидрохлорид
96	5-(2,8-диметилимидазо[1,2-а]пиразин-6-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенола дигидрохлорид
98	5-(2,8-диметилимидазо[1,2-б]пиридазин-6-ил)-2-{3-[(3R)-3-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенола дигидрохлорид
100	2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2-метил[1,2,4]триазоло[1,5-б]пиридазин-6-ил)фенола дигидрохлорид

Сое д	Название
101	2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2,8-диметил[1,2,4]триазоло[1,5-а]пиразин-6-ил)фенола дигидрохлорид
102	5-(имидазо[1,2-б]пиридазин-6-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенола дигидрохлорид
103	5-(2,8-диметилимидазо[1,2-а]пиразин-6-ил)-2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенола дигидрохлорид
104	5-(2,8-диметилимидазо[1,2-б]пиридазин-6-ил)-2-[3-(4-метилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]фенола дигидрохлорид
105	5-(7-фтор-2-метил-2Н-индазол-5-ил)-2-{3-[(8aR)-гексагидропирроло[1,2-а]пиразин-2(1H)-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенола дигидрохлорид
106	2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2-метил[1,2,4]триазоло[1,5-а]пиразин-6-ил)фенола дигидрохлорид
107	2-{3-[(3R)-3,4-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(8-фтор-2-метилимидазо[1,2-а]пиридин-6-ил)фенола дигидрохлорид
108	6-(3-гидрокси-4-{3-[(3R,5S)-3,4,5-триметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенил)-2-метилимидазо[1,2-б]пиридазин-8-карбонитрила дигидрохлорид
109	5-(8-циклопропил-2-метил[1,2,4]триазоло[1,5-а]пиразин-6-ил)-2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенола дигидрохлорид
111	5-(2,8-диметилимидазо[1,2-б]пиридазин-6-ил)-2-{3-[(3R,5S)-3,4,5-триметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенола дигидрохлорид
112	2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2-метил[1,2,4]триазоло[1,5-а]пиримидин-6-ил)фенола дигидрохлорид
113	5-(имидазо[1,2-а]пиразин-6-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенола дигидрохлорид
114	5-(имидазо[1,2-а]пиридин-6-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенола дигидрохлорид
115	2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-([1,2,4]триазоло[4,3-а]пиридин-6-ил)фенола дигидрохлорид
116	2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(4,6-диметил[1,3]тиазоло[5,4-с]пиридин-2-ил)фенола дигидрохлорид
117	2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(5,7-диметил[1,2,4]триазоло[1,5-а]пиримидин-2-ил)фенола дигидрохлорид
118	2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-[2-(трифтометил)имидазо[1,2-б]пиридазин-6-ил]фенола дигидрохлорид
119	2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(6-метил[1,3]тиазоло[4,5-б]пиразин-2-ил)фенола дигидрохлорид
120	2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(5-метилфуоро[3,2-б]пиридин-2-ил)фенола дигидрохлорид
121	5-(7-метокси-2-метил-2Н-индазол-5-ил)-2-[3-(4-метилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]пиридин-3-ола гидрохлорид

Сое д	Название
122	5-(8-фтор-2-метилимидазо[1,2-а]пиридин-6-ил)-2-[3-(4-метилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]пиридин-3-ола гидрохлорид
123	2-{3-[(3S)-3-этилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(3-фтор-1Н-пиразол-4-ил)фенола дигидрохлорид
124	2-[3-(4-метилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(1Н-пиразол-4-ил)пиридин-3-ола гидрохлорид
125	2-{3-[(3S)-3-трет-бутилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(3-фтор-1Н-пиразол-4-ил)фенола дигидрохлорид
126	5-(2,8-диметилимидазо[1,2-а]пиридин-6-ил)-2-[3-(4-метилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]пиридин-3-ола гидрохлорид
127	3-метил-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенола формиат
128	2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-([1,2,4]триазоло[1,5-а]пиразин-6-ил)фенола дигидрохлорид
129	2-{3-[(3S)-3-трет-бутилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-([1,2,4]триазоло[1,5-а]пиразин-6-ил)фенола дигидрохлорид
130	2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-([1,2,4]триазоло[1,5-а]пиразин-6-ил)фенола дигидрохлорид
131	5-(2,8-диметилимидазо[1,2-а]пиридин-6-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенола дигидрохлорид
132	2-{3-[(3S)-3-этилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2Н-1,2,3-триазол-2-ил)фенола дигидрохлорид
133	2-{3-[(3S)-3-этилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-{6-[(² H ₃)метилокси]пиримидин-4-ил}фенола дигидрохлорид
134	2-{3-[3-(1-метилциклопропил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенола формиат
135	2-[3-(3,8-диазабицикло[3.2.1]октан-3-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенола диформиат
136	2-{3-[(3R)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенола дигидрохлорид
137	2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенола дигидрохлорид
138	5-(8-этил-2-метилимидазо[1,2-а]пиридин-6-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенола дигидрохлорид
139	5-[2-метил-8-(трифторметил)имидазо[1,2-а]пиридин-6-ил]-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенола дигидрохлорид
140	5-(2,7-диметил-2Н-индазол-5-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенола дигидрохлорид
141	5-(2-метилимидазо[1,2-а]пиразин-6-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенола дигидрохлорид

Сое д	Название
146	5-(1H-пиразол-4-ил)-2-{3-[3-(2,2,2-трифторэтил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенола диформиат
147	5-(2-метил[1,2,4]триазоло[1,5-а]пиридин-7-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенола дигидрохлорид
148	2-{3-[гас-(3S,5R)-3-этил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1H-пиразол-4-ил) фенола дигидрохлорид
149	5-(6-метилпиримидин-4-ил)-2-{3-[(3R)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенола дигидрохлорид
152	4-фтор-5-[1-(² H ₃)метил-1H-пиразол-4-ил]-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенола формиат
153	2-{3-[(8aS)-гексагидропирроло[1,2-а]пиразин-2(1H)-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2H-1,2,3-триазол-2-ил) фенола дигидрохлорид
154	2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2H-1,2,3-триазол-2-ил) фенола дигидрохлорид
155	5-(5-метил-1H-пиразоло[4,3-b]пиридин-1-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенола дигидрохлорид
156	2-{3-[(3S)-3-трет-бутилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-4-фтор-5-[1-(² H ₃)метил-1H-пиразол-4-ил] фенола формиат
157	5-(7-фтор-2-метил-2H-индазол-5-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} пиридин-3-ола гидрохлорид
158	4-фтор-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1H-пиразол-4-ил) фенола формиат
159	5-(5-метил-1H-пирроло[3,2-b]пиридин-1-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенола формиат
162	2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1H-пиразоло[3,4-d]пиримидин-1-ил) фенола дигидрохлорид
163	5-(3-хлор-1H-пиразол-4-ил)-2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенола дигидрохлорид
164	2-{3-[(3S)-3-трет-бутилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-4-фтор-5-(1H-пиразол-4-ил) фенола формиат
165	2-{3-[(3S)-3-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1H-пиразол-4-ил) фенола дигидрохлорид
166	2-{3-[(3R)-3-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1H-пиразол-4-ил) фенола дигидрохлорид
168	2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2-метил-2H-[1,2,3]триазоло[4,5-b]пиридин-6-ил) фенола дигидрохлорид
169	2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1-метил-1H-[1,2,3]триазоло[4,5-b]пиридин-6-ил) фенола дигидрохлорид
171	2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1-метил-1H-[1,2,3]триазоло[4,5-b]пиридин-5-ил) фенола дигидрохлорид

Сое д	Название
172	2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2-метил-2Н-[1,2,3]триазоло[4,5-с]пиридин-6-ил)фенола дигидрохлорид
173	2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(3-метил-3Н-[1,2,3]триазоло[4,5-б]пиридин-5-ил)фенола дигидрохлорид
174	2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1-метил-1Н-[1,2,3]триазоло[4,5-с]пиридин-6-ил)фенола дигидрохлорид
175	2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2Н-1,2,3-триазол-2-ил)пиридин-3-ола дигидрохлорид
176	2-{3-[(2S,5S)-2,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенола дигидрохлорид
177	2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(пиридин-4-ил)фенола дигидрохлорид
178	2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(3-фторпиридин-4-ил)фенола дигидрохлорид
179	4-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-4'-(метиламино)[1,1'-бифенил]-3-ола дигидрохлорид
180	2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2-метил-2Н-[1,2,3]триазоло[4,5-б]пиридин-6-ил)пиридин-3-ола трифторацетат
181	2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(7-фтор-2-метил-2Н-индазол-5-ил)пиридин-3-ола гидрохлорид
182	2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2Н-1,2,3-триазол-2-ил)пиридин-3-ола трифторацетат
183	2-{3-[(3R)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(4-метил-2Н-1,2,3-триазол-2-ил)фенола дигидрохлорид
184	5-(4-метил-2Н-1,2,3-триазол-2-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенола дигидрохлорид
187	2-{3-[4-метил-3-(оксетан-3-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенола формаат
190	2-{3-[(2R,5S)-2,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенол или энантиомер трифторацетат
191	2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-([1,3]тиазоло[5,4-б]пиридин-2-ил)фенола трифторацетат
193	2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(3-метил[1,2,3]триазоло[1,5-а]пиридин-6-ил)фенола формаат
194	2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1-метилимидазо[1,5-а]пиридин-6-ил)фенола формаат
195	2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(3-метилимидазо[1,5-а]пиридин-7-ил)фенола формаат
202	2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2-метил-2Н-[1,2,3]триазоло[4,5-б]пиридин-5-ил)фенола дигидрохлорид

Сое д	Название
208	2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1-этил-1Н-пиразол-4-ил)фенола дигидрохлорид
211	2-{3-[(3S)-3-трет-бутилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2-метил-2Н-[1,2,3]триазоло[4,5-b]пиридин-6-ил)фенола дигидрохлорид
212	5-(2-метил-2Н-[1,2,3]триазоло[4,5-b]пиридин-6-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенола дигидрохлорид
213	2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1,2,4-тиадиазол-3-ил)фенола трифторацетат
231	2-{3-[(3S,5R)-3-циклобутил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенола дигидрохлорид
232	2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(5-метил-1,3-оксазол-2-ил)фенола трифторацетат
233	2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1,3-оксазол-2-ил)фенола трифторацетат
236	2-{3-[(3S,5R)-3-циклобутил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(3-фтор-1Н-пиразол-4-ил)фенола дигидрохлорид
237	2-{3-[(3S,5R)-3-циклобутил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2Н-1,2,3-триазол-2-ил)фенола дигидрохлорид
238	2-{3-[(3S,5R)-3-циклобутил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-[1-(² H ₃)метил-1Н-пиразол-4-ил]фенола гидрохлорид
239	2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1,2,4-тиадиазол-3-ил)фенола трифторацетат
240	2-{3-[(3S,5R)-3-циклобутил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1-метил-1Н-пиразол-3-ил)фенола гидрохлорид
241	2-{3-[(3S)-3-(1-метилциклопропил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2-метил-2Н-[1,2,3]триазоло[4,5-b]пиридин-6-ил)фенола гидрохлорид
242	2-{3-[(3R)-3-(1-метилциклопропил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2-метил-2Н-[1,2,3]триазоло[4,5-b]пиридин-6-ил)фенола гидрохлорид
243	2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(пиразоло[1,5-a]пиримидин-3-ил)фенола трифторацетат
245	2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(5-метил-1,2,4-тиадиазол-3-ил)фенола трифторацетат
246	2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2-метил-1,3-тиазол-4-ил)фенола трифторацетат
247	2-{3-[(3S,5R)-3-трет-бутил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенола дигидрохлорид
248	2-{3-[(3S,5R)-3-трет-бутил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(3-фтор-1Н-пиразол-4-ил)фенола дигидрохлорид
249	2-{3-[(3S,5R)-3-этинил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенола дигидрохлорид

Сое д	Название
250	2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1,2-тиазол-4-ил)фенола гидрохлорид
251	2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2-метоксипиридин-4-ил)фенола трифторацетат
252	2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1,2-тиазол-3-ил)фенола трифторацетат
254	2-{3-[(3S,5R)-3-трет-бутил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1,2,4-тиадиазол-3-ил)фенола гидрохлорид
255	2-{3-[(3S,5R)-3-трет-бутил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(6-метоксипиримидин-4-ил)фенола гидрохлорид
260	5-(1-метил-1Н-1,2,3-триазол-4-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенола дигидрохлорид
261	5-(1-метил-1Н-1,2,3-триазол-5-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенола дигидрохлорид
262	5-(2-метил-2Н-1,2,3-триазол-4-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенола дигидрохлорид
263	5-(2,1,3-бензотиадиазол-5-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенола гидрохлорид
264	2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-([1,2,5]тиадиазоло[3,4- <i>b</i>]пиридин-6-ил)фенола дигидрохлорид
265	2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1,2,5-тиадиазол-3-ил)фенола трифторацетат
270	2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1,2-тиазол-5-ил)фенола дигидрохлорид
271	5-(2-метокси-6-метилпиридин-4-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенола дигидрохлорид
272	2-(3-гидрокси-4-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенил)-1,3-тиазол-5-карбонитрила гидрохлорид
273	2-(3-гидрокси-4-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенил)-1,3-тиазол-4-карбонитрила гидрохлорид
274	5-(2-метил-5,6-дигидро[1,2,4]триазоло[1,5- <i>a</i>]пиазин-7(8Н)-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенола формаат
275	2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1-метил-2,3-дигидро-1Н-имидазо[1,2- <i>b</i>]пиазол-7-ил)фенола дигидрохлорид
276	2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(5,6-дигидро-4Н-пирроло[1,2- <i>b</i>]пиазол-3-ил)фенола дигидрохлорид
277	2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(4,5,6,7-тетрагидропиазоло[1,5- <i>a</i>]пиридин-3-ил)фенола дигидрохлорид или 2-{3-[(3R)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(4,5,6,7-тетрагидропиазоло[1,5- <i>a</i>]пиридин-3-ил)фенол или энантиомер дигидрохлорид

Сое д	Название
283	3-фтор-5-(5-фтор-1Н-пиразол-4-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенола формиат, и
284	2-[3-(гексагидропирроло[1,2-а]пиразин-2(1Н)-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенол;

причем форма соединения выбрана из группы, состоящей из его гидрата, сольвата и таутомерной формы.

ХИМИЧЕСКИЕ ОПРЕДЕЛЕНИЯ

Химические термины, использованные выше и во всем описании в настоящем документе, если специально не определено иное, должны быть поняты обычным специалистом в данной области как имеющие следующие указанные значения.

Используемый в настоящей заявке термин «C₁₋₄₄алкил» обычно относится к насыщенным углеводородным радикалам, содержащим от одного до четырех атомов углерода в конфигурации с прямой или разветвленной цепью, включая, но не ограничиваясь ими, метил, этил, н-пропил (также называемый пропилом или пропанилом), изопропил, н-бутил (также называемый бутилом или бутанилом), изобутил, втор-бутил, трет-бутил и тому подобное. C₁₋₄₄алкильный радикал необязательно замещен заместителями, как описано в настоящей заявке, если это допускается доступными валентностями.

Используемый в настоящей заявке термин «C₂₋₄алкенил» обычно относится к частично ненасыщенным углеводородным радикалам, содержащим от двух до четырех атомов углерода в конфигурации с прямой или разветвленной цепью и одной или более двойными связями углерод-углерод в них, включая, но не ограничиваясь ими, этенил (также называемый винилом), аллил, пропенил и тому подобные. C₂₋₄алкенильный радикал необязательно замещен заместителями, как описано в настоящей заявке, если это допускается доступными валентностями.

Используемый в настоящей заявке термин «C₂₋₈алкинил» обычно относится к частично ненасыщенным углеводородным радикалам, содержащим от двух до восьми атомов углерода в конфигурации с прямой или разветвленной цепью и одной или более тройными связями углерод-углерод в них, включая, но не ограничиваясь ими, этинил, пропинил, бутинил и тому подобные. В некоторых аспектах C₂₋₈алкинил включает, но не ограничивается ими, C₂₋₆алкинил, C₂₋₄алкинил и тому подобные. C₂₋₈алкинильный радикал необязательно замещен заместителями, как описано в настоящей заявке, если

это допускается доступными валентностями.

Используемый в настоящей заявке термин «С₁₋₄алкокси» обычно относится к насыщенным углеводородным радикалам, содержащим от одного до четырех атомов углерода в конфигурации с прямой или разветвленной цепью формулы: -О-С₁₋₄алкил, включая, но не ограничиваясь ими, метокси, этокси, н-пропокси, изопропокси, н-бутокси, изобутокси, втор-бутокси, трет-бутокси и тому подобные. С₁₋₄алкокси радикал необязательно замещен заместителями, как описано в настоящей заявке, если это допускается доступными валентностями.

Используемый в настоящей заявке термин «С₃₋₆циклоалкил» обычно относится к насыщенному или частично ненасыщенному моноциклическому, бициклическому или полициклическому углеводородному радикалу, включая, но не ограничиваясь ими, циклопропил, циклобутил, цикlopентил и циклогексил. С₃₋₆циклоалкильный радикал необязательно замещен заместителями, как описано в настоящей заявке, если это допускается доступными валентностями.

Используемый в настоящей заявке термин «арил» обычно относится к моноциклическому, бициклическому или полициклическому ароматическому радикалу с кольцевой структурой из атомов углерода, включая, но не ограничиваясь ими, фенил, нафтил, антраценил, флуоренил, азуленил, фенантренил и тому подобные. Арильный радикал необязательно замещен заместителями, как описано в настоящей заявке, если это допускается доступными валентностями.

Используемый в настоящей заявке термин «гетероарил» обычно относится к моноциклическому, бициклическому или полициклическому ароматическому радикалу с кольцевой структурой из атомов углерода, в котором один или более членов кольца с углеродным атомом были заменены, если это допускается структурной стабильностью, одним или более гетероатомами, такими как атом О, S или N, включая, но не ограничиваясь ими, фуранил, тиенил, пирролил, пиразолил, имидазолил, изоксазолил, изотиазолил, оксазолил, 1,3-тиазолил, триазолил, оксадиазолил, тиадиазолил, тетразолил, пиридилил, пиримидинил, пиразинил, пиридазинил, триазинил, индолил, индазолил, индолизинил, изоиндолил, бензофуранил, бензотиенил, бензоимидазолил, 1,3 - бензотиазолил, 1,3 - бензоксазолил, пуринил, хинолинил, изохинолинил, хиназолинил, хиноксалинил, 1,3-дiazинил, 1,2-дiazинил, 1,2-дiazолил, 1,4-дiazанафталил, акридинил, фуро[3,2-*b*]пиридилил, фуро[3,2-*c*]пиридилил, фуро[2,3-*c*]пиридилил, 6*H*-тиено[2,3-*b*]пирролил, тиено[3,2-*c*]пиридилил, тиено[2,3-*d*]пиримидинил, 1*H*-пирроло[2,3-*b*]пиридилил, 1*H*-пирроло[2,3-*c*]пиридилил,

1*H*-пирроло[3,2-*b*]пиридинил, пирроло[1,2-*a*]пиразинил, пирроло[1,2-*b*]пиридазинил, пиразоло[1,5-*a*]пиридинил, пиразоло[1,5-*a*]пиразинил, имидазо[1,2-*a*]пиридинил, 3*H*-имидазо[4,5-*b*]пиридинил, имидазо[1,2-*a*]пиримидинил, имидазо[1,2-*c*]пиримидинил, имидазо[1,2-*b*]пиридазинил, имидазо[1,2-*a*]пиразинил, имидазо[2,1-*b*][1,3]тиазолил, имидазо[2,1-*b*][1,3,4]тиадиазолил, [1,2,4]триазоло[1,5-*a*]пиридинил, [1,2,4]триазоло[4,3-*a*]пиридинил и подобные. Гетероарильный радикал необязательно замещен у атома углерода или атома азота в кольце заместителями, как описано в настоящей заявке, если это допускается доступными валентностями.

В некоторых аспектах номенклатура гетероарильного радикала может отличаться, например, в неограничивающих примерах, где фуранил может также называться фурилом, тиофенил также может называться тиенилом, пиридинил может также называться пиридилем, бензотиофенил также может называться бензотиенилом, и 1,3-бензоксазолил также может называться 1,3-бензооксазолилом.

В некоторых других аспектах термин гетероарильного радикала может также включать другие региоизомеры, например, в неограничивающих примерах, где термин пирролил может также включать 2*H*-пирролил, 3*H*-пирролил и тому подобные, термин пиразолил может также включать 1*H*-пиразолил и тому подобные, термин имидазолил может также включать 1*H*-имидазолил и тому подобные, термин триазолил может также включать 1*H*-1,2,3-триазолил и тому подобные, термин оксадиазолил может также включать 1,2,4-оксадиазолил, 1,3,4-оксадиазолил и тому подобные, термин тетразолил может также включать 1*H*-тетразолил, 2*H*-тетразолил и тому подобные, термин индолил может также включать 1*H*-индолил и тому подобные, термин индазолил может также включать 1*H*-индазолил, 2*H*-индазолил и тому подобные, термин бензоимидазолил также может включать 1*H*-бензоимидазолил, и термин пуринил может также включать 9*H*-пуринил и тому подобные.

Используемый в настоящей заявке термин «гетероциклил» обычно относится к насыщенному или частично ненасыщенному моноциклическому, бициклическому или полициклическому радикалу с кольцевой структурой из атомов углерода, в котором один или несколько членов кольца из атомов углерода заменены, если это допускается структурной стабильностью, на гетероатом, такой как атом O, S или N, включая, но не ограничиваясь ими, оксиранил, оксетанил, азетидинил, тетрагидрофуранил, пирролинил, пирролидинил, пиразолинил, пиразолидинил, имидазолинил, имидазолидинил, изоксазолинил, изоксазолидинил, изотиазолинил, изотиазолидинил,

оксазолинил, оксазолидинил, тиазолинил, тиазолидинил, триазолинил, триазолидинил, оксадиазолинил, оксадиазолидинил, тиадиазолинил, тиадиазолидинил, тетразолинил, тетразолидинил, пиранил, дигидро-2*H*-пиранил, тиопиранил, 1,3-диоксанил, 1,2,5,6-тетрагидропиридинил, 1,2,3,6-тетрагидропиридинил, пиперидинил, пиперазинил, морфолинил, тиоморфолинил, 1,4-дiazепанил, 1,3-бензодиоксолил, 1,4-бензодиоксанил, 2,3-дигидро-1,4-бензодиоксинил, гексагидропирроло[3,4-*b*]пиррол-(1*H*)-ил, (3*aS*,6*aS*)-гексагидропирроло[3,4-*b*]пиррол-(1*H*)-ил, (3*aR*,6*aR*)-гексагидропирроло[3,4-*b*]пиррол-(1*H*)-ил, гексагидропирроло[3,4-*b*]пиррол-(2*H*)-ил, (3*aS*,6*aS*)-гексагидропирроло[3,4-*b*]пиррол-(2*H*)-ил, (3*aR*,6*aR*)-гексагидропирроло[3,4-*b*]пиррол-(2*H*)-ил, гексагидропирроло[3,4-*c*]пиррол-(1*H*)-ил, (3*aR*,6*aS*)-гексагидропирроло[3,4-*c*]пиррол-(1*H*)-ил, (3*aR*,6*aR*)-гексагидропирроло[3,4-*c*]пиррол-(1*H*)-ил, октагидро-5*H*-пирроло[3,2-*c*]пиридинил, октагидро-6*H*-пирроло[3,4-*b*]пиридинил, (4*aR*,7*aR*)-октагидро-6*H*-пирроло[3,4-*b*]пиридинил, (4*aS*,7*aS*)-октагидро-6*H*-пирроло[3,4-*b*]пиридинил, гексагидропирроло[1,2-*a*]пиразин-(1*H*)-ил, (7*R*,8*aS*)-гексагидропирроло[1,2-*a*]пиразин-(1*H*)-ил, (8*aS*)-гексагидропирроло[1,2-*a*]пиразин-(1*H*)-ил, (8*aR*)-гексагидропирроло[1,2-*a*]пиразин-(1*H*)-ил, (8*aS*)-октагидропирроло[1,2-*a*]пиразин-(1*H*)-ил, (8*aR*)-октагидропирроло[1,2-*a*]пиразин-(1*H*)-ил, гексагидропирроло[1,2-*a*]пиразин-(2*H*)-он, октагидро-2*H*-пиридо[1,2-*a*]пиразинил, 3-азабицикло[3.1.0]гексил, (1*R*,5*S*)-3-азабицикло[3.1.0]гексил, 8-азабицикло[3.2.1]октил, (1*R*,5*S*)-8-азабицикло[3.2.1]октил, 8-азабицикло[3.2.1]окт-2-енил, (1*R*,5*S*)-8-азабицикло[3.2.1]окт-2-енил, 9-азабицикло[3.3.1]нонил, (1*R*,5*S*)-9-азабицикло[3.3.1]нонил, 2,5-диазабицикло[2.2.1]гептил, (1*S*,4*S*)-2,5-диазабицикло[2.2.1]гептил, 2,5-диазабицикло[2.2.2]октил, 3,8-диазабицикло[3.2.1]октил, (1*R*,5*S*)-3,8-диазабицикло[3.2.1]октил, 1,4-диазабицикло[3.2.2]нонил, азаспиро[3.3]гептил, 2,6-дiazаспиро[3.3]гептил, 2,6-дiazаспиро[3.4]октил, 2,7-дiazаспиро[3.5]нонил, 5,8-дiazаспиро[3.5]нонил, 2,7-дiazаспиро[4.4]нонил, 6,9-дiazаспиро[4.5]децил, 7-азадиспиро[5.1.5⁸.3⁶]гексадеканил и подобные. Гетероциклический радикал

необязательно замещен на члене кольца, который является атомом углерода или азота, заместителями, как описано в настоящей заявке, если это допускается доступными валентностями.

В некоторых аспектах номенклатура гетероциклического радикала может отличаться, например, в неограничивающих примерах, где 1,3-бензодиоксилил также может называться бензо[*d*][1,3]диоксилил, а 2,3-дигидро-1,4-бензодиоксинил также может называться 2,3-дигидробензо[*b*][1,4]диоксинил.

В настоящем документе термин “С₁₋₄алкокси-С₁₋₄алкил” относится к радикалу формулы: -С₁₋₄алкил-О-С₁₋₄алкил.

В настоящем документе термин “С₁₋₄алкил-амино” относится к радикалу формулы: -NH-С₁₋₄алкил.

В настоящем документе термин “(С₁₋₄алкил)₂-амино” относится к радикалу формулы: -N(С₁₋₄алкил)₂.

В настоящем документе термин “С₁₋₄алкил-карбонил” относится к радикалу формулы: -C(O)-С₁₋₄алкил.

В настоящем документе термин “С₁₋₄алкил-карбонил-амино” относится к радикалу формулы: -NH-C(O)-С₁₋₄алкил.

В настоящем документе термин “С₁₋₄алкил-тио” относится к радикалу формулы: -S-С₁₋₄алкил.

В настоящем документе термин “амино-С₁₋₄алкил” относится к радикалу формулы: -С₁₋₄алкил-NH₂.

В настоящем документе термин “дейтеро-С₁₋₄алкил,” относится к радикалу формулы: -С₁₋₄алкил-дейтеро, где С₁₋₄алкил частично или полностью замещен одним или более атомами дейтерия, если это допускается доступными валентностями.

Используемый в настоящей заявке термин «галоген» обычно относится к радикалу атома галогена, включая фтор, хлор, бром и йод.

В настоящем документе термин “галоген-С₁₋₄алкокси” относится к радикалу формулы: -О-С₁₋₄алкил-галоген, где С₁₋₄алкил частично или полностью замещен одним или более атомами галогена, если это допускается доступными валентностями.

В настоящем документе термин “галоген-С₁₋₄алкил” относится к радикалу формулы: -С₁₋₄алкил-галоген, где С₁₋₄алкил частично или полностью замещен одним или более атомами галогена, если это допускается доступными валентностями.

В настоящем документе термин “галоген-С₁₋₄алкил-амино” относится к радикалу формулы: -NH-С₁₋₄алкил-галоген.

Используемый в настоящей заявке термин «гидроксид» относится к радикалу формулы -ОН.

В настоящем документе термин “гидроксид-С₁₋₄алкил” относится к радикалу формулы: -С₁₋₄алкил-ОН, где С₁₋₄алкил частично или полностью замещен одним или более гидроксильными радикалами, если это допускается доступными валентностями.

Используемый в настоящей заявке термин «заместитель» означает переменные положения на атомах основной молекулы, которые замещены в указанном положении атома, заменяя один или несколько атомов водорода на указанном атоме, при условии, что нормальная валентность указанного атома не превышает, и что замещение приводит к стабильному соединению. Комбинации заместителей и/или переменных допустимы, только если такие комбинации приводят к стабильным соединениям. Специалисту в данной области техники следует отметить, что любой углерод, а также гетероатом с валентностями, которые кажутся неудовлетворительными, как описано или показано в настоящей заявке, как предполагается, имеют достаточное количество атома(ов) водорода, чтобы удовлетворять описанным или показанным валентностям. В некоторых случаях один или более заместителей, имеющих двойную связь (например, «оксо» или «=О») в качестве точки присоединения, могут быть описаны, показаны или перечислены в настоящей заявке в рамках группы заместителей, где структура может иметь только одинарную связь как точку присоединения к основной структуре формулы (I). Специалист в данной области техники будет понятно, что, хотя показана только одинарная связь, для таких заместителей предназначена двойная связь.

Используемый в настоящей заявке термин «и тому подобные» со ссылкой на определения химических терминов, предложенных в настоящей заявке, означает, что вариации химических структур, которые может ожидать специалист в данной области техники, включают, без ограничения, изомеры (включая цепи, разветвление или позиционные структурные изомеры), гидратацию кольцевых систем (включая насыщенность или частичную ненасыщенность моноциклических, бициклических или полициклических кольцевых структур) и все другие вариации, если это допускается доступными валентностями, которые приводят к стабильному соединению.

Для целей настоящего описания, когда один или более переменных заместителей для соединения формулы (I) или его формы охватывают функциональные группы, включенные в соединение формулы (I), причем каждая функциональность, появляющаяся в любом месте в раскрытом соединении, может быть независимо выбрана и, при необходимости, независимо и/или необязательно замещена.

Используемые в настоящей заявке термины «независимо выбранный» или «каждый выбранный» относятся к функциональным переменным в списке заместителей, которые могут встречаться более одного раза в структуре формулы (I), причем вариант замещения в каждом случае не зависит от варианта в любом другом случае. Кроме того, подразумевается, что использование общего заместителя в любой формуле или структуре для соединения, описанного в настоящей заявке, включает замену общего заместителя на видовые заместители, которые включены в конкретный род, *например*, арил может быть заменен на фенил или нафталинил и тому подобное, и что полученное соединение должно быть включено в объем соединений, описанных в настоящей заявке.

Используемые в настоящей заявке термины «в каждом случае» или «в каждом случае, если присутствует», если они используются перед фразой, такой как «...C₃₋₁₄циклоалкил, C₃₋₁₄циклоалкил-C₁₋₄алкил, арил, арил-C₁₋₄алкил, гетероарил, гетероарил-C₁₋₄алкил, гетероциклил и гетероциклил-C₁₋₄алкил» предназначены для обозначения C₃₋₁₄циклоалкильных, арильных, гетероарильных и гетероциклильных кольцевых систем, когда каждая присутствует либо отдельно, либо в качестве заместителя.

Используемый в настоящей заявке термин «необязательно замещенный» означает необязательное замещение указанными переменными заместителями, группами, радикалами или фрагментами.

ФОРМЫ СОЕДИНЕНИЯ

Используемый в настоящей заявке термин «форма» означает соединение Формулы (I), имеющее форму, выбранную из группы, состоящей из свободной кислоты, свободного основания, гидрата, сольвата, сложного эфира, стереоизомера и их таутомерной формы.

В определенных аспектах, описанных в настоящей заявке, форма соединения Формулы (I) представляет собой свободную кислоту, свободное основание или его соль.

В определенных аспектах, описанных в настоящей заявке, форма соединения Формулы (I) представляет собой его соль.

В определенных аспектах, описанных в настоящей заявке, форма соединения Формулы (I) представляет собой его таутомер.

В определенных аспектах, описанных в настоящей заявке, форма соединения Формулы (I) представляет собой фармацевтически приемлемую форму.

В определенных аспектах, описанных в настоящей заявке, соединение Формулы (I) или его форму выделяют для применения.

Используемый в настоящей заявке термин «выделенный» означает физическое состояние соединения формулы (I) или его формы после выделения и/или очистки в процессе синтеза (*например*, из реакционной смеси) или из природного источника или их комбинации в соответствии со способом или способами выделения или очистки, описанными в настоящей заявке или хорошо известными специалистами в данной области техники (например, хроматография, перекристаллизация и т.п.), с достаточной чистотой, чтобы их можно было охарактеризовать стандартными аналитическими методами, описанными в настоящей заявке или хорошо известными специалистами в данной области техники.

Используемый в настоящей заявке термин «защищенный» означает, что функциональная группа в соединении формулы (I) или его форме находится в форме, модифицированной для предотвращения нежелательных побочных реакций на защищенном участке, когда соединение подвергается реакции. Подходящие защитные группы будут признаны специалистами в данной области техники, а также ссылаясь на стандартные учебники, такие как, например, T.W. Greene *et al*, *Protective Groups in organic Synthesis* (1991), Wiley, New York. Такие функциональные группы включают гидроксильную, фенольную, амино и карбоновую кислоту. Подходящие защитные группы для гидроксильной или фенольной включают триалкилсилил или диарилалкилсилил (например, трет-бутилдиметилсилил, трет-бутилдифенилсилил или триметилсилил), тетрагидропиранил, бензил, замещенный бензил, метил, метоксиметанол и тому подобные. Подходящие защитные группы для амино, амидной и гуанидинной включают трет-бутоксикарбонил, бензилоксикарбонил и тому подобные. Подходящие защитные группы для карбоновой кислоты включают алкиловые, ариловые или арилалкиловые сложные эфиры. В некоторых случаях защитная группа также может быть полимерной смолой, такой как смола Ванга или 2-хлортритилхлоридная смола. Защитные группы могут быть добавлены или удалены в соответствии со стандартными методами, которые хорошо известны специалистам в данной области техники и как описано в настоящей заявке.

Одно или более описанных в настоящей заявке соединений могут существовать в несольватированных, а также в сольватированных формах с фармацевтически приемлемыми растворителями, такими как вода, этанол и тому подобные, и описание в настоящей заявке предназначено охватывать как сольватированные, так и несольватированные формы.

Используемый в настоящей заявке термин «сольват» означает физическую ассоциацию соединения, описанного в настоящей заявке, с одной или более молекулами растворителя. Такая физическая ассоциация включает различную степень ионной и ковалентной связи, включая водородную связь. В некоторых случаях сольват можно будет выделить, например, когда одна или более молекул растворителя включены в кристаллическую решетку кристаллического твердого вещества. Используемый в настоящей заявке термин «сольват» включает сольваты в фазе раствора и выделяемые сольваты. Неограничивающие примеры подходящих сольватов включают этанолаты, метанолаты и тому подобное.

Используемый в настоящей заявке термин «гидрат» означает сольват, в котором молекула растворителя представляет собой воду.

Соединения формулы (I) могут образовывать соли, которые, как предполагается, включены в объем настоящего описания. Подразумевается, что ссылка на форму соединения формулы (I) в настоящей заявке включает ссылку на его солевые формы, если не указано иное. Термин «соль(и)», как он используется в настоящей заявке, обозначает кислотные соли, образованные с неорганическими и/или органическими кислотами, а также основные соли, образованные с неорганическими и/или органическими основаниями. Кроме того, когда соединение формулы (I) или его форма содержит как основной фрагмент, такой как, без ограничения, аминовый фрагмент, так и кислотный фрагмент, такой как, без ограничения, карбоновая кислота, цвиттерионы («внутренние соли») могут быть образованы и включены в термин «соль(и)», который используется в настоящей заявке.

Термин «фармацевтически приемлемая соль(и)», как используется в настоящей заявке, означает те соли описанных в настоящей заявке соединений, которые являются безопасными и эффективными (т.е. нетоксичными, физиологически приемлемыми) для использования у млекопитающих и которые обладают биологической активностью, хотя другие соли тоже являются подходящими. Соли соединений формулы (I) могут быть образованы, например, путем реакции соединения формулы (I) или его формы с некоторым количеством кислоты или основания, таким как эквивалентное количество, в среде, такой как среда, в которой соль осаждается, или в водной среде с последующей лиофилизацией.

Фармацевтически приемлемые соли включают одну или более солей кислотных или основных групп, присутствующих в соединениях, описанных в настоящей заявке. Конкретные варианты кислотно-аддитивных солей включают, но не ограничиваются

ими, ацетат, аскорбат, бензоат, бензолсульфонат, бисульфат, битартрат, борат, бромид, бутират, хлорид, цитрат, камфорат, камфорсульфонат, этансульфонат, формиат, fumarat, гентизинат, глюконат, глюкаронат, глутамат, йодид, изоникотинат, лактат, малеат, метансульфонат, нафталинсульфонат, нитрат, оксалат, памоат, пантотенат, фосфат, пропионат, сахарат, салицилат, сукцинат, сульфат, тартрат, тиоцианат, толуолсульфонат (также известный как тозилат), трифторацетат и подобные. Некоторые конкретные варианты кислотно-аддитивных солей включают хлорид или дихлорид.

Кроме того, кислоты, которые обычно считаются подходящими для образования фармацевтически приемлемых солей из основных фармацевтических соединений, обсуждаются, например, в P. Stahl *et al*, Camille G. (eds.) *Handbook of Pharmaceutical Salts. Properties, Selection and Use*. (2002) Zurich: Wiley-VCH; S. Berge *et al*, *Journal of Pharmaceutical Sciences* (1977) 66(1) 1-19; P. Gould, *International J. of Pharmaceutics* (1986) 33, 201-217; Anderson *et al*, *The Practice of Medicinal Chemistry* (1996), Academic Press, New York; and in *The Orange Book* (Food & Drug Administration, Washington, D.C. на их вебсайте). Данные раскрытия включены в настоящую заявку путем ссылки.

Подходящие основные соли включают, но не ограничиваются ими, соли алюминия, аммония, кальция, лития, магния, калия, натрия и цинка.

Предполагается, что все такие кислотные соли и основные соли включены в объем фармацевтически приемлемых солей, как описано в настоящей заявке. Кроме того, все такие кислотные и основные соли считаются эквивалентными свободным формам соответствующих соединений для целей настоящего описания.

Соединения формулы (I) и их формы могут, кроме того, существовать в таутомерной форме. Предполагается, что все такие таутомерные формы входят в объем соединений формулы (I) или их форм, как описано в настоящей заявке.

Соединения формулы (I) или их формы могут содержать асимметричные или хиральные центры и, следовательно, существовать в различных стереоизомерных формах. Настоящее описание предназначено для включения всех стереоизомерных форм соединений формулы (I), а также их смесей, включая рацемические смеси.

Описанные в настоящей заявке соединения могут включать один или более хиральных центров и как таковые могут существовать в виде рацемических смесей (*R/S*) или в виде по существу чистых энантиомеров и диастереомеров. Соединения также могут существовать в виде по существу чистых (*R*) или (*S*) энантиомеров (когда присутствует один хиральный центр). В одном конкретном аспекте, соединения,

описанные в настоящей заявке, являются (*S*) изомерами и могут существовать в виде энантиомерно чистых композиций, по существу содержащих только (*S*) изомер. В другом конкретном аспекте, соединения, описанные в настоящей заявке, являются (*R*) изомерами и могут существовать в виде энантиомерно чистых композиций, по существу содержащих только (*R*) изомер. Специалисту в данной области техники будет понятно, что когда присутствует более одного хирального центра, соединения, описанные в настоящей заявке, могут также существовать как (*R,R*), (*R,S*), (*S,R*) или (*S,S*) изомер, как определено Рекомендациями по номенклатуре ИЮПАК.

Используемый в настоящей заявке термин «хиральный» относится к атому углерода, связанному с четырьмя неидентичными заместителями. Используемые в настоящей заявке стереохимические определения и условные обозначения обычно следуют S. P. Parker, Ed., McGraw-Hill Dictionary of Chemical Terms (1984) McGraw-Hill Book Company, New York; and Eliel, E. and Wilen, S., "Stereochemistry of Organic Compounds", John Wiley & Sons, Inc., New York, 1994. При описании оптически активного соединения префиксы D и L или *R* и *S* используются для обозначения абсолютной конфигурации молекулы относительно ее хирального центра(ов). Заместители, присоединенные к рассматриваемому хиральному центру, ранжируются в соответствии с правилом последовательности Кана, Ингольда и Прелога. (Cahn et al. Angew. Chem. Inter. Edit. 1966, 5, 385; errata 511).

Используемый в настоящей заявке термин «по существу чистый» относится к соединениям, состоящим по существу из одного изомера в количестве, превышающем или равном 90%, в количестве, превышающем или равном 92%, в количестве, превышающем или равном 95%, в количестве, превышающем или равном 98%, в количестве, превышающем или равном 99%, или в количестве, равном 100% одного изомера.

В одном аспекте настоящего описания соединение формулы (I) или его форма представляет собой по существу чистую (*S*) энантиомерную форму, присутствующую в количестве, превышающем или равном 90%, в количестве, превышающем или равном 92%, в количестве, превышающем или равном 95%, в количестве, превышающем или равном 98%, в количестве, превышающем или равном 99%, или в количестве, равном 100%.

В одном аспекте настоящего описания соединение формулы (I) или его форма представляет собой по существу чистую (*R*) энантиомерную форму, присутствующую в количестве, превышающем или равном 90%, в количестве, превышающем или равном

92%, в количестве, превышающем или равном 95%, в количестве, превышающем или равном 98%, в количестве, превышающем или равном 99%, или в количестве, равном 100%.

В данном контексте «рацемат» означает любую смесь изометрических форм, которые не являются «энантиомерно чистыми», включая смеси, такие как, без ограничения, в соотношении около 50/50, около 60/40, около 70/30 или около 80/20.

Кроме того, настоящее описание охватывает все геометрические и позиционные изомеры. Например, если соединение формулы (I) или его форма включает двойную связь или конденсированное кольцо, объемом описания охватываются как цис-, так и транс-формы, а также смеси. Смеси диастереомеров можно разделить на отдельные диастереомеры на основе их физико-химических различий способами, хорошо известными специалистами в данной области техники, такими как, например, хроматография и/или фракционная кристаллизация. Энантиомеры можно разделить с применением хиральной колонки ВЭЖХ или других хроматографических способов, известных специалистам в данной области техники. Энантиомеры также можно разделить путем превращения энантиомерной смеси в диастереомерную смесь реакцией с подходящим оптически активным соединением (*например*, хиральным вспомогательным веществом, таким как хиральный спирт или хлорид кислоты Мошера), разделением диастереомеров и превращением (*например*, гидролизом) отдельных диастереомеров в соответствующие чистые энантиомеры. Кроме того, некоторые из соединений формулы (I) могут быть атропоизомерами (*например*, замещенными биарилами) и рассматриваются как часть настоящего описания.

Все стереоизомеры (*например*, геометрические изомеры, оптические изомеры и тому подобные) соединений согласно настоящему изобретению (включая соли, сольваты, сложные эфиры и пролекарства соединений, а также их соли, сольваты и сложные эфиры пролекарств), такие как те, которые могут существовать вследствие асимметричных атомов углерода на различных заместителях, включая энантиомерные формы (которые могут существовать даже в отсутствие асимметричных атомов углерода), ротамерные формы, атропоизомеры и диастереомерные формы, рассматриваются в рамках настоящего описания, как и позиционные изомеры (такие как, *например*, 4-пиридирил и 3-пиридирил). Отдельные стереоизомеры описанных в настоящей заявке соединений могут, *например*, по существу не содержать других изомеров или могут присутствовать в рацемической смеси, как описано выше.

Использование терминов «соль», «сольват» и тому подобных предназначено для

равнозначного применения к соли и сольвату энантиомеров, стереоизомеров, ротамеров, таутомеров, позиционных изомеров или рацематов соединений согласно настоящему изобретению.

ПРИМЕНЕНИЯ СОЕДИНЕНИЙ

В соответствии с предполагаемым объемом настоящего описания аспекты настоящего описания включают соединения, которые были идентифицированы и продемонстрировали свою пригодность для избирательного предотвращения, лечения или облегчения БХ и были предложены для применения для предотвращения, лечения или облегчения БХ.

Аспект настоящего описания включает способ предотвращения, лечения или облегчения БХ у субъекта, нуждающегося в этом, включающий введение субъекту эффективного количества соединения Формулы (I) или его формы.

Аспект настоящего описания включает способ лечения или облегчения БХ у субъекта, нуждающегося в этом, включающий введение субъекту эффективного количества соединения Формулы (I) или его формы.

Аспект настоящего описания включает способ предотвращения БХ у субъекта, нуждающегося в этом, включающий введение субъекту эффективного количества соединения Формулы (I) или его формы.

Аспект настоящего описания включает способ лечения БХ у субъекта, нуждающегося в этом, включающий введение субъекту эффективного количества соединения Формулы (I) или его формы.

Аспект настоящего описания включает способ облегчения БХ у субъекта, нуждающегося в этом, включающий введение субъекту эффективного количества соединения Формулы (I) или его формы.

Другой аспект настоящего описания включает способ лечения или облегчения БХ у субъекта, нуждающегося в этом, включающий введение субъекту эффективного количества соли соединения Формулы (I) или его формы.

Другой аспект настоящего описания включает способ лечения или облегчения БХ у субъекта, нуждающегося в этом, включающий введение субъекту эффективного количества соединения или соли соединения Формулы (I) или его формы в комбинированном продукте или в виде комбинированной терапии с одним или более терапевтическими агентами.

Один аспект настоящего описания включает способ применения соединения

формулы (I) или его формы или композиции для лечения или облегчения БХ у субъекта, нуждающегося в этом, включающий введение субъекту эффективного количества соединения формулы (I) или его формы или композиции.

Другой аспект настоящего описания включает способ применения соли соединения формулы (I) или его формы или композиции для лечения или облегчения БХ у субъекта, нуждающегося в этом, включающее введение субъекту эффективного количества соли соединения формулы (I) или его формы.

Один аспект настоящего описания включает применение соединения формулы (I) или его формы для лечения или облегчения БХ у субъекта, нуждающегося в этом, включающее введение субъекту эффективного количества соединения формулы (I) или его формы.

Другой аспект настоящего описания включает применение соли соединения формулы (I) или его формы для лечения или облегчения БХ у субъекта, нуждающегося в этом, включающее введение субъекту эффективного количества соли соединения формулы (I) или его формы.

Один аспект настоящего описания включает применение соединения формулы (I) или его формы для получения лекарственного средства для лечения или облегчения БХ у субъекта, нуждающегося в этом, включающее введение субъекту эффективного количества лекарственного средства.

Другой аспект настоящего описания включает применение соли соединения формулы (I) или его формы для производства лекарственного средства для лечения или облегчения БХ у субъекта, нуждающегося в этом, включающее введение субъекту эффективного количества лекарственного средства.

Один из аспектов настоящего описания включает применение *in vitro* или *in vivo* соединения формулы (I) или его формы, обладающей активностью в отношении БХ.

Аспект настоящего описания включает применение соединения формулы (I) или его формы в комбинированной терапии для обеспечения аддитивной или синергической активности, что позволяет разработать комбинированный продукт для лечения или облегчения БХ.

Другой аспект настоящего описания включает комбинированную терапию, включающую соединения, описанные в настоящем документе, в комбинации с одним или более известными лекарственными средствами или одним или более известными терапевтическими средствами, которые можно применять для лечения БХ независимо от того, реагирует ли БХ на известное лекарственное средство.

Один аспект настоящего описания включает применение соединения формулы (I) или его формы в комбинированном продукте с одним или более терапевтическими агентами для лечения или облегчения БХ у субъекта, нуждающегося в этом, включающее введение субъекту эффективного количество соединения формулы (I) или его формы в комбинации с эффективным количеством одного или более агентов.

Другой аспект настоящего описания включает применение соли соединения формулы (I) или его формы в комбинированном продукте с одним или более терапевтическими агентами для лечения или облегчения БХ у субъекта, нуждающегося в этом, включающее введение субъекту эффективного количество соли соединения формулы (I) или его формы в комбинации с эффективным количеством одного или более агентов.

В одном из аспектов применения или способа, представленных в настоящем документе, соединения формулы (I) или их формы, применяемые в комбинации с одним или более дополнительными агентами, можно вводить субъекту или приводить в контакт с субъектом или клеткой (клетками) пациента до, одновременно с или после введения субъекту или пациенту или приведения клетки в контакт с дополнительным(и) агентом(ами). Соединение(я) формулы (I) или его форму и дополнительный(ые) агент(ы) можно вводить субъекту или приводить в контакт с клеткой в одной композиции или разных композициях. В конкретном аспекте соединение(я) формулы (I) или его форму используют в комбинации с генной терапией для ингибирования экспрессии НТТ (с применением, *например*, вирусных векторов доставки) или введением другого низкомолекулярного ингибитора НТТ. В другом конкретном аспекте соединение(я) формулы (I) или его форму применяют в комбинации с заменой клеток с применением дифференцированных немутантных стволовых клеток НТТ. В другом конкретном аспекте соединение(я) формулы (I) или его форму применяют в комбинации с заменой клеток с применением дифференцированных стволовых клеток НТТ.

В одном аспекте в настоящем документе предусмотрено применение соединений формулы (I) или их формы в комбинации с поддерживающей стандартной терапией, включая паллиативную помощь.

С одной стороны, для каждого из таких аспектов субъект не подвергался лечению. С другой стороны, для каждого из таких аспектов субъект ранее подвергался лечению.

Используемый в настоящем документе термин «предотвращение» относится к

недопущению возникновения заболевания, нарушения или состояния у субъекта, который может быть предрасположен к заболеванию, нарушению и/или состоянию, но у которого еще не было диагностировано заболевание, нарушение и/или состояние.

Используемый в настоящем документе термин «лечение» относится к торможению прогрессирования заболевания, нарушения или состояния у субъекта, уже проявляющего симптомы заболевания, нарушения и/или состояния, т. е. к остановке развития заболевания, нарушения и/или состояния, которое уже поражает субъекта.

Используемый в настоящем документе термин «облегчение» относится к облегчению симптомов заболевания, нарушения или состояния у субъекта, уже проявляющего симптомы заболевания, нарушения и/или состояния, т. е. к регрессии заболевания, нарушения и/или состояния, которое уже поражает субъекта.

Используемый в настоящем документе термин «субъект» относится к животному или любому живому организму, обладающему чувствительностью и способностью к произвольному движению и нуждающемуся в кислороде и органической пище. Неограничивающие примеры включают представителей видов человека, примата, лошади, свиньи, крупного рогатого скота, мыши, крысы, собаки и кошки. В некоторых аспектах субъект представляет собой млекопитающее или теплокровное позвоночное животное. В других аспектах субъектом является человек. Используемый в настоящем документе термин «пациент» может использоваться взаимозаменяемо с терминами «субъект» и «человек».

Используемые в настоящем документе термины «эффективное количество» или «терапевтически эффективное количество» означают количество соединения формулы (I) или его формы, композиции или лекарственного средства, при котором достигается целевая концентрация в плазме, которая эффективна для лечения или облегчения БХ, как описано в настоящем документе и, таким образом, вызывая желаемый терапевтический, облегчающий, ингибирующий или профилактический эффект у субъекта, нуждающегося в этом. В одном аспекте эффективное количество может представлять собой количество, необходимое для лечения БХ у субъекта или пациента, более конкретно, у человека.

В другом аспекте взаимосвязь между концентрацией и биологическим эффектом, наблюдаемая в отношении соединения формулы (I) или его формы, указывает на целевую концентрацию в плазме в диапазоне от приблизительно 0,001 мг/мл до приблизительно 50 мг/мл, от приблизительно 0,01 мг/мл до приблизительно 20 мг/мл, от приблизительно 0,05 мг/мл до приблизительно 10 мг/мл или от приблизительно 0,1

мг/мл до приблизительно 5 мг/мл. Для достижения таких концентраций в плазме описанные в настоящей заявке соединения можно вводить в дозах, которые варьируются, например, без ограничения, от 1,0 нг до 10000 мг.

В одном аспекте дозу, вводимую для достижения эффективной целевой концентрации в плазме, можно вводить на основе факторов, специфичных для субъекта или пациента, при этом дозы, вводимые на основе массы тела, могут находиться в диапазоне от около 0,001 мг/кг/день до около 3500 мг/кг/день, или от около 0,001 мг/кг/день до около 3000 мг/кг/день, или от около 0,001 мг/кг/день до около 2500 мг/кг/день, или от около 0,001 мг/кг/день до около 2000 мг/кг/день, или от около 0,001 мг/кг/день до около 1500 мг/кг/день, или от около 0,001 мг/кг/день до около 1000 мг/кг/день, или от около 0,001 мг/кг/день до около 500 мг/кг/день, или от около 0,001 мг/кг/день до около 250 мг/кг/день, или от около 0,001 мг/кг/день до около 200 мг/кг/день, или от около 0,001 мг/кг/день до около 150 мг/кг/день, или от около 0,001 мг/кг/день до около 100 мг/кг/день, или от около 0,001 мг/кг/день до около 75 мг/кг/день, или от около 0,001 мг/кг/день до около 50 мг/кг/день, или от около 0,001 мг/кг/день до около 25 мг/кг/день, или от около 0,001 мг/кг/день до около 10 мг/кг/день, или от около 0,001 мг/кг/день до около 5 мг/кг/день, или от около 0,001 мг/кг/день до около 1 мг/кг/день, или от около 0,001 мг/кг/день до около 0,5 мг/кг/день, или от около 0,001 мг/кг/день до около 0,1 мг/кг/день, или от около 0,01 мг/кг/день до около 3500 мг/кг/день, или от около 0,01 мг/кг/день до около 3000 мг/кг/день, или от около 0,01 мг/кг/день до около 2500 мг/кг/день, или от около 0,01 мг/кг/день до около 2000 мг/кг/день, или от около 0,01 мг/кг/день до около 1500 мг/кг/день, или от около 0,01 мг/кг/день до около 1000 мг/кг/день, или от около 0,01 мг/кг/день до около 500 мг/кг/день, или от около 0,01 мг/кг/день до около 250 мг/кг/день, или от около 0,01 мг/кг/день до около 200 мг/кг/день, или от около 0,01 мг/кг/день до около 150 мг/кг/день, или от около 0,01 мг/кг/день до около 100 мг/кг/день, или от около 0,01 мг/кг/день до около 75 мг/кг/день, или от около 0,01 мг/кг/день до около 50 мг/кг/день, или от около 0,01 мг/кг/день до около 25 мг/кг/день, или от около 0,01 мг/кг/день до около 10 мг/кг/день, или от около 0,01 мг/кг/день до около 5 мг/кг/день, или от около 0,01 мг/кг/день до около 1 мг/кг/день, или от около 0,01 мг/кг/день до около 0,5 мг/кг/день, или от около 0,01 мг/кг/день до около 0,1 мг/кг/день, или от около 0,1 мг/кг/день до около 3500 мг/кг/день, или от около 0,1 мг/кг/день до около 3000 мг/кг/день, или от около 0,1 мг/кг/день до около 2500 мг/кг/день, или от около 0,1 мг/кг/день до около 2000 мг/кг/день, или от около 0,1 мг/кг/день до около 1500

мг/кг/день, или от около 0,1 мг/кг/день до около 1000 мг/кг/день, или от около 0,1 мг/кг/день до около 500 мг/кг/день, или от около 0,1 мг/кг/день до около 250 мг/кг/день, или от около 0,1 мг/кг/день до около 200 мг/кг/день, или от около 0,1 мг/кг/день до около 150 мг/кг/день, или от около 0,1 мг/кг/день до около 100 мг/кг/день, или от около 0,1 мг/кг/день до около 75 мг/кг/день, или от около 0,1 мг/кг/день до около 50 мг/кг/день, или от около 0,1 мг/кг/день до около 25 мг/кг/день, или от около 0,1 мг/кг/день до около 10 мг/кг/день, или от около 0,1 мг/кг/день до около 5 мг/кг/день, или от около 0,1 мг/кг/день до около 1 мг/кг/день, или от около 0,1 мг/кг/день до около 0.5 мг/кг/день.

Эффективные количества для заданного субъекта могут быть определены с помощью обычных экспериментов, которые находятся в пределах компетенции и суждения клинициста или практикующего специалиста в данной области техники в свете факторов, связанных с субъектом. Дозировка и введение могут быть скорректированы для обеспечения достаточных уровней активного(ых) агента(ов) или для поддержания желаемого эффекта. Факторы, которые могут быть приняты во внимание, включают генетический скрининг, тяжесть болезненного состояния, статус прогрессирования заболевания, общее состояние здоровья субъекта, этническую принадлежность, возраст, массу тела, пол, диету, время дня и частоту введения, комбинацию(и) лекарственных средств, чувствительность реакции, опыт применения других способов лечения и переносимость/ответ на терапию.

Дозу, вводимую для достижения эффективной целевой концентрации в плазме, можно вводить перорально один раз (один раз в период приблизительно 24 часов; то есть «q.d.»), дважды (один раз в период приблизительно 12 часов; то есть «b.i.d.» или «q.12h»), трижды (один раз в период приблизительно 8 часов; т. е. «t.i.d.» или «q.8h») или четыре раза (один раз в период приблизительно 6 часов; т. е. «q.d.s.», «q.i.d.» или «q.6h») ежедневно.

В некоторых аспектах дозу, вводимую для достижения эффективной целевой концентрации в плазме, также может вводить в виде разовой, разделенной или непрерывной дозы для пациента или субъекта, имеющего массу тела в диапазоне от около 40 до около 200 кг (причем доза может быть скорректирована для пациентов или субъектов выше или ниже данного диапазона, особенно для детей до 40 кг). Ожидается, что типичный взрослый субъект имеет среднюю массу тела в диапазоне около 70 кг. Фармацевтические композиции пролонгированного действия можно вводить каждые 2, 3 или 4 дня, один раз в неделю или один раз каждые две недели в зависимости от

периода полувыведения и скорости клиренса конкретного состава.

Описанные в настоящей заявке соединения и композиции можно вводить субъекту любым путем доставки лекарственных средств, известным в данной области техники. Неограничивающие примеры включают пероральный, окулярный, ректальный, буккальный, местный, назальный, сублингвальный, трансдермальный, подкожный, внутримышечный, внутривенный (болус и инфузия), интрацеребральный и легочный пути введения.

В другом аспекте вводимая доза может быть скорректирована на основе описанной в настоящей заявке лекарственной формы, приготовленной для доставки в количестве около 0,02, 0,025, 0,03, 0,05, 0,06, 0,075, 0,08, 0,09, 0,10, 0,20, 0,25, 0,30, 0,50, 0,60, 0,75, 0,80, 0,90, 1,0, 1,10, 1,20, 1,25, 1,50, 1,75, 2,0, 3,0, 5,0, 10, 20, 30, 40, 50, 100, 150, 200, 250, 300, 400, 500, 1000, 1500, 2000, 2500, 3000 или 4000 мг/день.

Для любого соединения эффективное количество может быть первоначально оценено либо в анализах на культуре клеток, либо на соответствующих животных моделях, таких как животная модель мыши, морской свинки, шимпанзе, мартышки или тамарина. Соответствующие животные модели также можно использовать для определения подходящего диапазона концентраций и пути введения. Такую информацию затем можно использовать для определения подходящих доз и путей введения людям. Терапевтическая эффективность и токсичность могут быть определены стандартными фармацевтическими процедурами на культурах клеток или экспериментальных животных, *например*, ED_{50} (терапевтически эффективная доза для 50% популяции) и LD_{50} (летальная доза для 50% популяции). Соотношение доз между терапевтическими и токсическими эффектами является терапевтическим индексом и может быть выражено как отношение LD_{50}/ED_{50} . В некоторых аспектах эффективное количество является таким, что достигается большой терапевтический индекс. В дополнительных конкретных аспектах дозировка находится в диапазоне циркулирующих концентраций, который включает ED_{50} с небольшой токсичностью или без нее. Дозировка может варьироваться в данном диапазоне в зависимости от применяемой лекарственной формы, чувствительности пациента и пути введения.

В одном аспекте в настоящем документе предложены способы модулирования количества НТТ (белка хантингтина), включающие приведение клетки человека в контакт с соединением формулы (I) или его формой. В конкретном «аспекте» в настоящем документе предусмотрены способы модулирования количества НТТ, включающие приведение клетки человека в контакт с соединением формулы (I) или

его формой, что модулирует экспрессию НТТ. Клетка человека может быть приведена в контакт с соединением формулы (I) или его формой *in vitro* или *in vivo*, например, у животного, отличного от человека, или у человека. В конкретном аспекте клетка человека получена от или находится в человеке. В другом конкретном аспекте клетка человека получена от или находится в человеке с БХ. В другом конкретном аспекте клетка человека получена от или находится в человеке с БХ, вызванной повтором САГ в гене Htt, что приводит к потере экспрессии и/или функции НТТ. В другом аспекте клетка человека получена от человека с БХ. В другом аспекте клетка человека находится в человеке с БХ. В одном аспекте соединение представляет собой форму соединения формулы (I).

В конкретном аспекте в настоящем документе предложен способ усиления ингибирования мутантного НТТ, транскрибированного из гена Htt, включающий приведение клетки человека в контакт с соединением формулы (I) или его формой. Клетка человека может быть приведена в контакт с соединением формулы (I) или его формой *in vitro* или *in vivo*, например, у животного, отличного от человека, или у человека. В конкретном аспекте клетка человека получена от или находится в человеке. В другом конкретном аспекте клетка человека получена от или находится в человеке с БХ. В другом конкретном аспекте клетка человека получена от или находится в человеке с БХ, вызванной повтором САГ в гене Htt, что приводит к потере экспрессии и/или функции «нормального» НТТ дикого типа. В другом аспекте клетка человека получена от человека с БХ. В другом аспекте клетка человека находится в человеке с БХ. В одном аспекте соединение представляет собой форму соединения формулы (I).

В другом аспекте в настоящем документе предложен способ модулирования ингибирования мутантного НТТ, транскрибированного из гена Htt, включающий введение животной модели БХ, отличной от человека, соединения формулы (I) или его формы. В конкретном аспекте в настоящем документе предложен способ модулирования ингибирования мутантного НТТ, транскрибированного из гена Htt, включающий введение животной модели БХ, отличной от человека, соединения формулы (I) или его формы. В конкретном аспекте соединение представляет собой форму соединения формулы (I).

В другом аспекте в настоящем документе предложен способ уменьшения количества мутантного НТТ, включающий приведение клетки человека в контакт с соединением формулы (I) или его формой. В конкретном аспекте в настоящем документе предложен способ уменьшения количества мутантного НТТ, включающий

приведение клетки человека в контакт с соединением формулы (I), что ингибирует транскрипцию мутантного *HTT* (мРНК хантингтина) из гена *Htt*. В другом конкретном аспекте в настоящем документе предложен способ уменьшения количества НТТ, включающий приведение клетки человека в контакт с соединением формулы (I), что ингибирует экспрессию мутантного НТТ, транскрибированного из гена *Htt*. Клетка человека может быть приведена в контакт с соединением формулы (I) или его формой *in vitro* или *in vivo*, например, у животного, отличного от человека, или у человека. В конкретном аспекте клетка человека получена от или находится в человеке. В другом конкретном аспекте клетка человека получена от или находится в человеке с БХ. В другом конкретном аспекте клетка человека получена от или находится в человеке с БХ, вызванной повтором CAG в гене *Htt*, что приводит к потере экспрессии и/или функции НТТ. В другом аспекте клетка человека получена от человека с БХ. В другом аспекте клетка человека находится в человеке с БХ. В одном аспекте соединение представляет собой форму соединения формулы (I).

В некоторых аспектах лечение или облегчение БХ соединением формулы (I) или его формой (отдельно или в комбинации с дополнительным агентом) имеет терапевтический эффект и/или положительный эффект. В конкретном аспекте лечение БХ соединением формулы (I) или его формой (отдельно или в комбинации с дополнительным агентом) приводит к одному, двум или более из следующих эффектов: (i) уменьшает или облегчает тяжесть БХ; (ii) задерживает начало БХ; (iii) ингибирует прогрессирование БХ; (iv) уменьшает количество госпитализаций субъекта; (v) сокращает продолжительность госпитализации субъекта; (vi) увеличивает выживаемость субъекта; (vii) улучшает качество жизни субъекта; (viii) уменьшает количество симптомов, связанных с БХ; (ix) уменьшает или улучшает тяжесть симптома(ов), связанных с БХ; (x) уменьшает продолжительность симптома, связанного с БХ; (xi) предотвращает рецидив симптома, связанного с БХ; (xii) ингибирует развитие или появление симптома БХ; и/или (xiii) ингибирует прогрессирование симптома, связанного с БХ.

МЕТАБОЛИТЫ

Другим аспектом, включенным в объем настоящего описания, является применение продуктов метаболизма соединений, описанных в настоящей заявке, *in vivo*. Такие продукты могут возникать, например, в результате окисления, восстановления, гидролиза, амидирования, этерификации и тому подобного, вводимого соединения, в

первую очередь вследствие ферментативных процессов. Соответственно, настоящее описание включает применение соединений, полученных способом, содержащим приведение соединения, описанного в настоящей заявке, в контакт с тканью млекопитающего или млекопитающим в течение периода времени, достаточного для получения их метаболического продукта.

Такие продукты обычно идентифицируют путем получения радиоактивно меченного изотополога (*например*, ^{14}C или ^3H) соединения, описанного в настоящей заявке, введением радиоактивно меченного соединения в детектируемой дозе (*например*, более чем около 0,5 мг/кг) млекопитающему, такому как крыса, мышь, морская свинка, собака, обезьяна или человек, обеспечивая достаточное время для метаболизма (обычно от около 30 секунд до около 30 часов) и идентифицируя продукты метаболического превращения в моче, желчи, крови или других биологических образцах. Продукты превращения легко выделяются, поскольку они являются «радиоактивно мечеными» в силу того, что они обогащены изотопами (другие выделяют с использованием антител, способных связывать эпитопы, уцелевшие в метаболите). Структуры метаболитов определяют стандартным образом, например, с помощью масс-спектрометрии или ЯМР-анализа. В общем, анализ метаболитов может быть выполнен таким же образом, как и стандартные исследования метаболизма лекарственных средств, хорошо известные специалистам в данной области техники. Продукты превращения, если они иным образом не обнаруживаются *in vivo*, являются подходящими в диагностических анализах терапевтического дозирования описанных в настоящей заявке соединений, даже если они не обладают собственной биологической активностью.

ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ КОМПОЗИЦИИ

В соответствии с предполагаемым объемом настоящего описания аспекты настоящего описания включают соединения, которые были идентифицированы и продемонстрировали свою пригодность для избирательного предотвращения, лечения или облегчения БХ и были предложены для применения в виде одной или более фармацевтических композиций для предотвращения, лечения или облегчения БХ.

Один аспект настоящего описания включает применение соединения формулы (I) или его формы для приготовления фармацевтической композиции для лечения или облегчения БХ у субъекта, нуждающегося в этом, включающее введение субъекту эффективного количества соединения формулы (I) или его формы в смеси с одним или более фармацевтически приемлемыми вспомогательными веществами.

Один аспект настоящего описания включает применение фармацевтической композиции соединения формулы (I) или его формы для приготовления набора для лечения или облегчения БХ у субъекта, нуждающегося в этом, содержащего фармацевтическую композицию соединения формулы (I) или его форму и инструкции по введению фармацевтической композиции.

Используемый в настоящем документе термин «композиция» означает продукт, содержащий указанные ингредиенты в указанных количествах, а также любой продукт, который прямо или косвенно является результатом комбинации указанных ингредиентов в указанных количествах.

Фармацевтическая композиция может быть приготовлена для достижения физиологически совместимого значения pH в диапазоне от около pH 3 до около pH 11. В некоторых аспектах фармацевтическая композиция приготовлена для достижения pH от около pH 3 до около pH 7. В других аспектах фармацевтическая композиция приготовлена для достижения pH от около pH 5 до около pH 8.

Термин «фармацевтически приемлемое вспомогательное вещество» относится к вспомогательному веществу для введения фармацевтического агента, такого как соединения, описанные в настоящем документе. Термин относится к любому фармацевтическому вспомогательному веществу, которое можно вводить без чрезмерной токсичности. Фармацевтически приемлемые вспомогательные вещества могут частично определяться конкретной вводимой композицией, а также конкретным способом введения и/или лекарственной формой. Неограничивающие примеры фармацевтически приемлемых вспомогательных веществ включают носители, растворители, стабилизаторы, адъюванты, разбавители *и т. д.* Соответственно, существует широкий спектр подходящих составов фармацевтических композиций для настоящих соединений, описанных в настоящем документе (*см., например, Remington's Pharmaceutical Sciences*).

Подходящими вспомогательными веществами могут быть молекулы-носители, которые включают большие, медленно метаболизируемые макромолекулы, такие как белки, полисахариды, полимолочные кислоты, полигликолевые кислоты, полимерные аминокислоты, сополимеры аминокислот и неактивные антитела. Другие примеры вспомогательных веществ включают антиоксиданты, такие как аскорбиновая кислота; хелатирующие агенты, такие как ЭДТА; углеводы, такие как декстрин, гидроксиалкилцеллюлоза, гидроксиалкилметилцеллюлоза (*например, гидроксипропилметилцеллюлоза, также известная как ГПМЦ*), стеариновая кислота;

жидкости, такие как масла, вода, физиологический раствор, глицерин и этанол; смачивающие или эмульгирующие агенты; буферизующие pH вещества; и тому подобное. Липосомы также включены в определение фармацевтически приемлемых вспомогательных веществ.

Фармацевтические композиции, описанные в настоящем документе, могут быть приготовлены в любой форме, подходящей для предполагаемого применения, описанного в настоящем документе. Подходящие составы для перорального введения включают твердые вещества, жидкие растворы, эмульсии и суспензии, в то время как подходящие составы для ингаляции для введения в легкие включают жидкости и порошки. Альтернативные составы включают сиропы, кремы, мази, таблетки и лиофилизированные твердые вещества, которые перед введением могут быть восстановлены с помощью физиологически совместимого растворителя.

Если они предназначены для перорального применения, например, могут быть приготовлены таблетки, троше, пастилки, водные или масляные суспензии, неводные растворы, диспергируемые порошки или гранулы (включая микронизированные частицы или наночастицы), эмульсии, твердые или мягкие капсулы, сиропы или эликсиры. Композиции, предназначенные для перорального применения, могут быть приготовлены любым способом, известным в данной области техники для производства фармацевтических композиций, и такие композиции могут содержать один или более агентов, включая подсластители, ароматизаторы, красители и консерванты, чтобы обеспечить препарат с привлекательным вкусом.

Фармацевтически приемлемые вспомогательные вещества, пригодные для применения в сочетании с таблетками, включают, например, инертные разбавители, такие как целлюлозы, карбонат кальция или натрия, лактозу, фосфат кальция или натрия; разрыхлители, такие как кроскармеллоза натрия, поперечно сшитый повидон, кукурузный крахмал или альгиновая кислота; связующие агенты, такие как повидон, крахмал, желатин или аравийская камедь; и смазывающие агенты, такие как стеарат магния, стеариновая кислота или тальк. Таблетки могут быть непокрытыми или могут быть покрыты известными способами, включая микроинкапсуляцию, для замедления разрушения и адсорбции в желудочно-кишечном тракте и, таким образом, обеспечения устойчивого действия в течение более длительного периода времени. Например, можно применять материал с временной задержкой, такой как моностеарат глицерина или дистеарат глицерина, отдельно или с воском.

Составы для перорального применения также могут быть предложены в виде

твердых желатиновых капсул, в которых активный ингредиент смешан с инертным твердым разбавителем, например, целлюлозой, лактозой, фосфатом кальция или каолином, или в виде мягких желатиновых капсул, в которых активный ингредиент смешан с неводной или масляной средой, такой как глицерин, пропиленгликоль, полиэтиленгликоль, арахисовое масло, жидкий парафин или оливковое масло.

В других аспектах фармацевтические композиции, описанные в настоящем документе, могут быть приготовлены в виде суспензий, содержащих соединение формулы (I) или его форму в смеси с одним или более фармацевтически приемлемыми вспомогательными веществами, подходящими для приготовления суспензии. В других аспектах фармацевтические композиции, описанные в настоящем документе, могут быть приготовлены в виде диспергируемых порошков и гранул, подходящих для приготовления суспензии путем добавления одного или более вспомогательных веществ.

Вспомогательные вещества, подходящие для применения в суспензиях, включают суспендирующие агенты, такие как карбоксиметилцеллюлоза натрия, метилцеллюлоза, гидроксипропилметилцеллюлоза, альгинат натрия, поливинилпирролидон, трагакантовая камедь, аравийская камедь, диспергирующие или смачивающие агенты, такие как встречающийся в природе фосфатид (*например*, лецитин), продукт конденсации алкиленоксида с жирной кислотой (*например*, полиоксиэтиленстеарат), продукт конденсации этиленоксида с длинноцепочечным алифатическим спиртом (*например*, гептадекаэтиленоксицетанол), продукт конденсации этиленоксида с неполным сложным эфиром жирной кислоты и ангидрида гекситола (*например*, моноолеат полиоксиэтиленсорбитана); и загустители, такие как карбомер, пчелиный воск, твердый парафин или цетиловый спирт. Суспензии также могут содержать один или более консервантов, таких как уксусная кислота, метил- и/или н-пропил-п-гидроксibenзоат; один или более красителей; один или более ароматизаторов; и один или более подсластителей, таких как сахароза или сахарин.

Описанные в настоящем документе фармацевтические композиции также могут быть в форме эмульсий масло-в-воде. Масляная фаза может представлять собой растительное масло, такое как оливковое масло или арахисовое масло, минеральное масло, такое как жидкий парафин, или их смесь. Подходящие эмульгаторы включают встречающиеся в природе камеди, такие как аравийская камедь и трагакантовая камедь; встречающиеся в природе фосфатиды, такие как соевый лецитин, сложные эфиры или неполные сложные эфиры, полученные из жирных кислот; ангидридов гекситола, такие

как сорбитанмоноолеат; и продукты конденсации этих неполных сложных эфиров с этиленоксидом, такие как моноолеат полиоксиэтиленсорбитана. Эмульсия может также содержать подсластители и ароматизаторы. Сиропы и эликсиры могут быть приготовлены с подсластителями, такими как глицерин, сорбит или сахароза. Такие составы могут также содержать смягчающее средство, консервант, ароматизатор или краситель.

Кроме того, описанные в настоящем документе фармацевтические композиции могут быть в форме стерильного препарата для инъекций, такого как стерильная водная эмульсия для инъекций или маслянистая суспензия. Такую эмульсию или суспензию можно приготовить в соответствии с известным уровнем техники с применением тех подходящих диспергирующих или смачивающих агентов и суспендирующих агентов, которые были упомянуты выше. Стерильный препарат для инъекций может также представлять собой стерильный раствор или суспензию для инъекций в нетоксичном парентерально приемлемом разбавителе или растворителе, таком как раствор в 1,2-пропандиоле. Стерильный препарат для инъекций также может быть приготовлен в виде лиофилизированного порошка. В число приемлемых носителей и растворителей, которые можно использовать, входят вода, раствор Рингера и изотонический раствор хлорида натрия. Кроме того, в качестве растворителя или суспендирующей среды можно использовать стерильные нелетучие масла. Для этой цели можно использовать любое мягкое нелетучее масло, включая синтетические моно- или диглицериды. Кроме того, жирные кислоты, такие как олеиновая кислота, также могут быть использованы при приготовлении препаратов для инъекций.

Описанные в настоящем документе соединения могут быть практически нерастворимы в воде и умеренно растворимы в большинстве фармацевтически приемлемых протонных растворителей и растительных маслах, но обычно растворимы в жирных кислотах со средней длиной цепи (*например*, каприловой и каприновой кислотах) или триглицеридах и в сложных эфирах пропиленгликоля и жирных кислот со средней длиной цепи. Таким образом, в настоящем описании рассматриваются соединения, которые были модифицированы заменой или добавлением химических или биохимических фрагментов, что делает их более подходящими для доставки (*например*, повышает растворимость, биологическую активность, вкусовые качества, уменьшает побочные реакции и т. д.), например, путем эстерификации, гликозилирования, пегилирования и др.

В некоторых аспектах соединение, описанное в настоящем документе,

приготовлено для перорального введения в виде композиции на основе липидов, подходящей для соединений с низкой растворимостью. Препараты на основе липидов обычно могут повышать пероральную биодоступность таких соединений. Как таковые, фармацевтические композиции, описанные в настоящем документе, могут содержать эффективное количество соединения формулы (I) или его формы вместе с по меньшей мере одним фармацевтически приемлемым вспомогательным веществом, выбранным из жирных кислот со средней длиной цепи или их сложных эфиров пропиленгликоля (*например*, сложных эфиров пропиленгликоля и пищевых жирных кислот, таких как каприловая и каприновая жирные кислоты), и фармацевтически приемлемые поверхностно-активные вещества, такие как полисорбат 20 или 80 (также называемый Tween® 20 или Tween® 80 соответственно) или гидрогенизированное касторовое масло полиоксил 40.

В других аспектах биодоступность соединений с низкой растворимостью можно повысить с помощью способов оптимизации размера частиц, включая получение наночастиц или наносuspensions с использованием способов, известных специалистам в данной области техники. Формы соединений, присутствующие в таких препаратах, включают аморфные, частично аморфные, частично кристаллические или кристаллические формы.

В альтернативных аспектах фармацевтическая композиция может включать один или более усилителей растворимости в воде, таких как циклодекстрин. Неограничивающие примеры циклодекстрина включают гидроксипропил, гидроксизтил, глюкозил, мальтозил и мальтотриозил, производные α -, β - и γ -циклодекстрина и гидроксипропил- β -циклодекстрина (HPBC). В некоторых аспектах фармацевтическая композиция содержит HPBC в диапазоне от около 0,1% до около 20%, от около 1% до около 15% или от около 2,5% до около 10%. Количество используемого усилителя растворимости может зависеть от количества соединений в композиции.

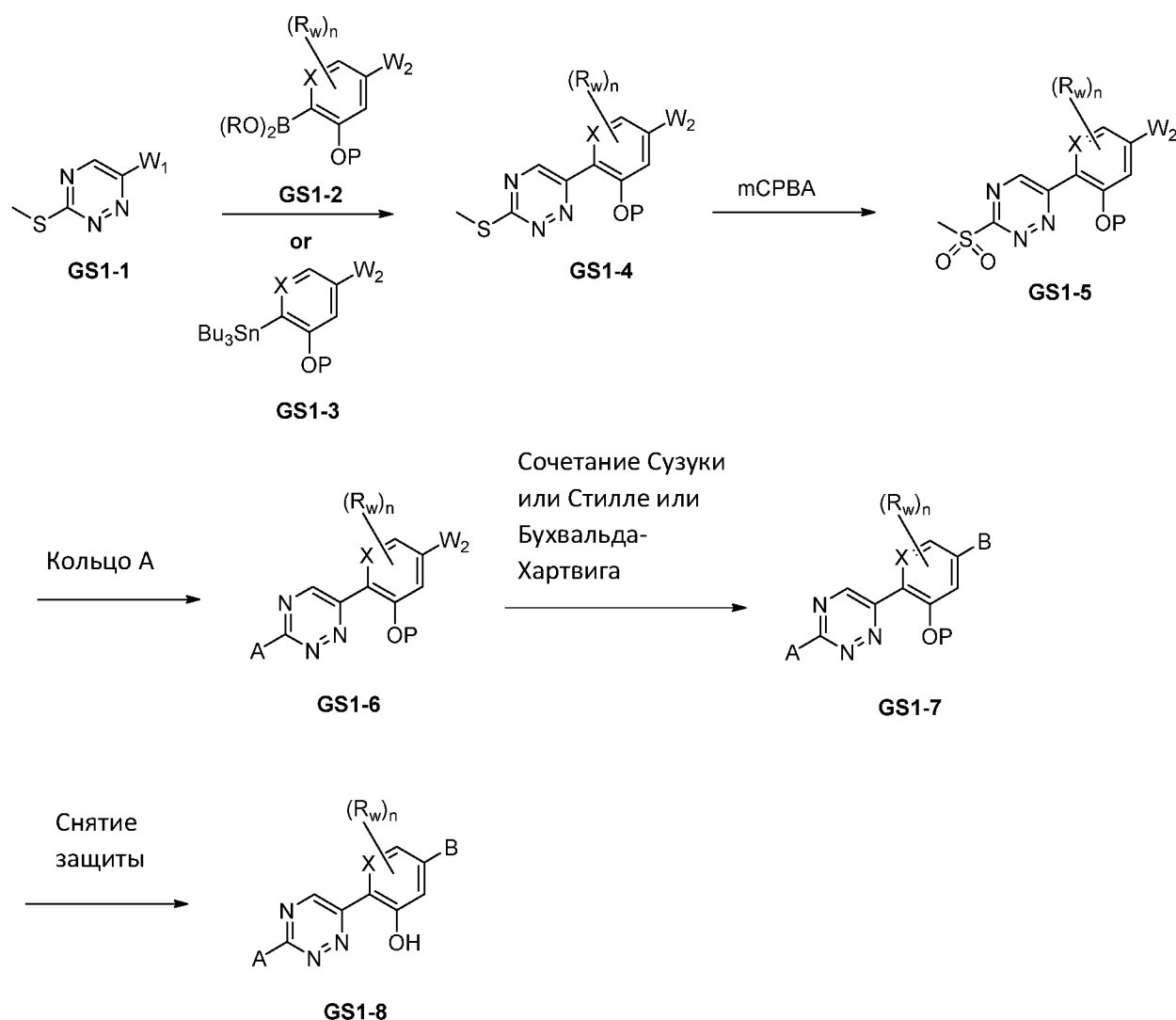
ПОЛУЧЕНИЕ СОЕДИНЕНИЙ ОБЩИЕ СПОСОБЫ СИНТЕЗА

Как раскрыто в настоящем документе, общие способы получения соединений формулы (I) или их форм, как описано в настоящем документе, доступны с помощью стандартной, хорошо известной методики синтеза. Многие из исходных материалов имеются в продаже или, если они недоступны, могут быть получены способами,

описанными ниже, с использованием способов, известных специалистам в данной области техники. Схемы синтеза, представленные в настоящем документе, включают несколько стадий реакции, каждая из которых подразумевается как самостоятельная и может осуществляться с какой-либо предшествующей или последующей стадией (стадиями) или без нее. Другими словами, рассматривается каждая из отдельных стадий реакции представленных в настоящем документе схем синтеза по отдельности.

Соединения формулы **GS1-8**, где A, B, X, R_w и n имеют значения, определенные для формулы (I), могут быть получены, как описано на Общей схеме 1 ниже.

Общая схема 1



Соединение **GS1-1** (где W₁ представляет собой бром, хлор и т.п.) превращают в соединение **GS1-4** путем реакции сочетания Сузуки с арилбороновой кислотой (или эфиром пинаколборной кислоты) **GS1-2** (где W₂ представляет собой бром, хлор и подобные; R₁ представляет собой водород, фтор, хлор, гидроксид, метокси, арил или гетероарил; и Р представляет собой защитную группу, такую как MOM и т.п.) в

присутствии катализатора (такого как Pd(dppf)Cl_2 и т.п.) и основания (такого как водный раствор K_2CO_3 и т.п.) в подходящем растворителе (таком как 1,4-диоксан и т.п.). В качестве альтернативы, соединение **GS1-1** превращают в соединение **GS1-4** путем реакции сочетания Стилле с арилстаннаном **GS1-3** (где W_2 представляет собой бром, хлор и т.п., а R представляет собой защитную группу, такую как MOM и т.п.) в присутствии катализатора (такого как $\text{Pd(PPh}_3)_2\text{Cl}_2$ и т.п.) и добавки (такой как CuI и т.п.) в подходящем растворителе (таком как 1,4-диоксан и т.п.). Соединение **GS1-4** превращают в соединение **GS1-5** обработкой окислителем (таким как mCPBA или оксон и т.п.) в подходящем растворителе (таком как дихлорметан и т.п.). Соединение **GS1-5** превращают в соединение **GS1-6** путем нуклеофильного замещения пиперазиновым кольцом **A** в присутствии подходящего основания (такого как Et_3N и т.п.) в подходящем растворителе (таком как ДМФА и т.п.). Соединение **GS1-6** превращают в соединение **GS1-7** путем реакции сочетания Сузуки с арил- или гетероарилбороновой кислотой (или пинаколбороновым эфиром) в присутствии катализатора (такого как Pd(dppf)Cl_2 и т.п.) и основания (такого как водный раствор K_2CO_3 и т.п.) в подходящем растворителе (таком как 1,4-диоксан и т.п.). В качестве альтернативы, соединение **A7** превращают в соединение **GS1-7** путем реакции сочетания Стилле с арил- или гетероарилстаннаном в присутствии катализатора (такого как $\text{Pd}_2(\text{dba})_3$ и т.п.), лиганда (такого как X-Phos и т.п.) и основания (такого как CsF и т.п.) в подходящем растворителе (таком как 1,4-диоксан и т.п.). В качестве альтернативы, соединение **GS1-6** превращают в соединение **GS1-7** обработкой пинаколатдибором и основанием (таким как KOAc и т.п.) в присутствии катализатора (такого как Pd(dppf)Cl_2 и т.п.) в подходящем растворителе (таком как 1,4-диоксан и т.п.) с последующим добавлением арил- или гетероарилгалогенида. В качестве альтернативы, соединение **GS1-6** превращают в соединение **GS1-7** путем реакции сочетания Бухвальда-Хартвига с гетероарилом или амином в присутствии катализатора (такого как $\text{Pd}_2(\text{dba})_3$ и т.п.), лиганда (такого как tBuX-Phos и т.п.) и основания (такого как K_3PO_4 и т.п.) в подходящем растворителе (таком как 1,4-диоксан и т.п.). Соединение **GS1-7** превращают в соединение **GS1-8** при обработке в условиях, подходящих для удаления защитных групп (таких как HCl в диоксане для защитной группы MOM) в подходящем растворителе (таком как диоксан и т.п.).

КОНКРЕТНЫЕ ПРИМЕРЫ СИНТЕЗА

Чтобы описать более подробно и помочь в понимании, предложены следующие неограничивающие примеры для более полной иллюстрации объема описанных в настоящем документе соединений, и их не следует толковать как конкретным образом ограничивающие их объем. Такие вариации описанных в настоящей заявке соединений, которые могут быть теперь известны или разработаны позже, которые будут находиться в пределах компетенции специалиста в данной области техники, считаются подпадающими под объем соединений, как описано и далее заявлено в настоящей заявке. Данные примеры иллюстрируют получение определенных соединений. Специалисты в данной области техники поймут, что методики, описанные в данных примерах, представляют собой методики, описанные специалистами в данной области техники, которые хорошо работают в практике синтеза и, как таковые, составляют предпочтительные способы их практического применения. Однако следует принимать во внимание, что специалисты в данной области техники должны, в свете настоящего раскрытия, принимать во внимание, что многие изменения могут быть внесены в конкретные раскрытые способы и все же получить подобный или аналогичный результат, не отступая от сущности и объема настоящего описания.

За исключением следующих примеров воплощенных соединений, если не указано иное, все числа, выражающие количества ингредиентов, условия реакции, экспериментальные данные и тому подобное, используемые в описании и формуле изобретения, следует понимать как измененные термином «около». Соответственно, все такие числа представляют собой приближения, которые могут варьироваться в зависимости от желаемых свойств, которые стремятся получить с помощью реакции или в результате переменных экспериментальных условий. Следовательно, в пределах ожидаемого диапазона экспериментальной воспроизводимости термин «около» в контексте полученных данных относится к диапазону предоставленных данных, который может варьироваться в зависимости от стандартного отклонения от среднего значения. Кроме того, для предоставленных экспериментальных результатов полученные данные могут быть округлены в большую или меньшую сторону, чтобы представить данные единообразным образом, без потери значимых цифр. По меньшей мере, и в качестве попытки ограничить применение доктрины эквивалентов объемом формулы изобретения, каждый числовой параметр следует толковать в свете количества значащих цифр и методов округления, используемых специалистами в данной области техники.

Хотя числовые диапазоны и параметры, определяющие широкий объем настоящего описания, являются приблизительными, числовые значения, изложенные в примерах, приведенных ниже, указаны с максимально возможной точностью. Однако любое числовое значение по своей сути содержит определенные ошибки, обязательно являющиеся результатом стандартного отклонения, обнаруженного в соответствующих испытательных измерениях.

Исходные материалы, используемые в представленных примерах, являются коммерчески доступными или могут быть получены в соответствии со способами, известными специалисту в данной области техники, или могут быть получены с помощью описанных в настоящем документе процедур. Структурное подтверждение было получено с использованием аналитических способов, известных специалистам в данной области техники, таких как спектроскопия ядерного магнитного резонанса ^1H или ^{13}C или масс-спектрометрия.

Соединения формулы (I) были синтезированы с использованием процедур, аналогичных описанным в публикации международной заявки № WO/2019/191229 A1, поданной 27 марта 2019 г. и в которой испрашивается приоритет предварительной заявки США 62/648699, поданной 27 марта 2018 г., путем замены соответствующих исходных материалов, реагентов и условий реакции.

ПРИМЕРЫ СОЕДИНЕНИЙ

При использовании выше и во всем настоящем описании следующие сокращения, если не указано иное, следует понимать как имеющие следующие значения:

Аббревиатура	Значение
Δ	нагревание (химия) или делеция (биология)
AcOH или HOAc	уксусная кислота
Ar	аргон
ACN или CH_3CN	ацетонитрил
водн.	водный
атм	атмосфера(ы)
BBr ₃	трибромид бора
B ₂ pin ₂	бис(пинаколато)дибор
Boc	трет-бутокси-карбонил
Boc ₂ O	ди-трет-бутил дикарбонат
t-Bu	трет-бутил

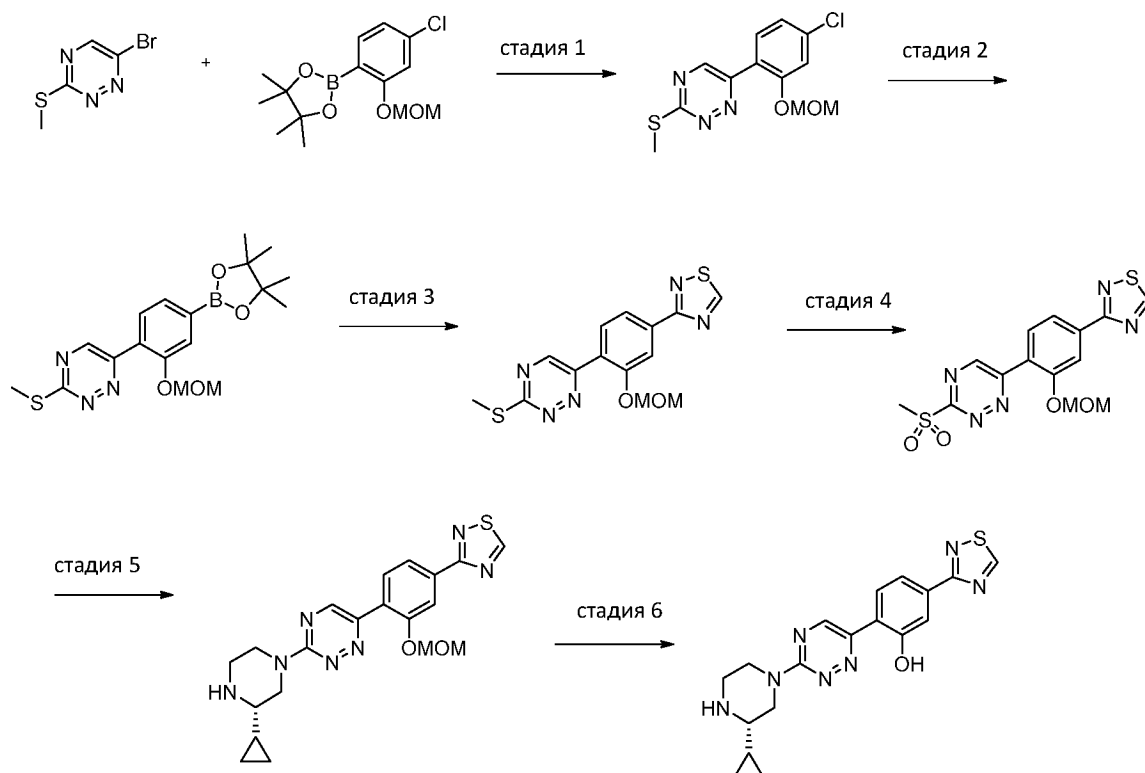
Аббревиатура	Значение
<i>t</i> -BuOK или KO <i>t</i> Bu	трет-бутоксид калия
BuOH или <i>n</i> -BuOH	<i>n</i> -бутанол
<i>t</i> -BuXPhos	2-ди-трет-бутилфосфино-2',4',6'-триизопропилбифенил
°C	градусы Цельсия
Celite [®] или целит	диатомитовая земля
mCPBA	мета-хлорпероксибензойная кислота
CuI	иодид меди (I)
д/ч/ч/часы/мин/с	день(д)/час(ч, ч или часы)/минута(мин)/секунда(с)
ДХМ или CH ₂ Cl ₂	дихлорметан
DIPEA	N, N-диизопропилэтиламин
DMAP	4-диметиламинопиридин
ДМФА	диметилформамид
ДМСО	диметилсульфоксид
EtOAc	этилацетат
EtOH	этанол
Et ₂ O	диэтиловый эфир
экв.	эквиваленты
H ₂	водород
HBr	бромистоводородная кислота
HCl	хлористоводородная кислота
H ₂ SO ₄	серная кислота
K ₂ CO ₃	карбонат калия
K ₃ PO ₄	фосфат трикалия
KOAc	ацетат калия
KOH	гидроксид калия
ЖХ/МС, ЖХМС или ЖХ-МС	жидкостная хроматография с масс-спектрометрией
LiO <i>t</i> -Bu	трет-бутоксид лития
LiOH	гидроксид лития
MeOH	метанол
MeSO ₃ H	метансульфоная кислота
MgSO ₄	сульфат магния
мл	миллилитр
MOM	метоксиметил
MS	масс-спектрометрия

Аббревиатура	Значение
NBS	N-бромсукцинимид
NEt ₃	триэтиламин
NH ₄ Cl	хлорид аммония
NH ₄ OAc	ацетат аммония
Na ₂ CO ₃	карбонат натрия
NaH	гидрид натрия
NaHCO ₃	бикарбонат натрия
NaOH	гидроксид натрия
Na ₂ SO ₄	сульфат натрия
N ₂	азот
NH ₄ Cl	хлорид аммония
NMP	N-метилпирролидон
ЯМР	ядерный магнитный резонанс
Pd	палладий
Pd/C	палладий на угле
PdCl ₂ (PPh ₃) ₂	бис(трифенилфосфин)палладия(II) дихлорид
Pd ₂ (dba) ₃	трис(дибензилиденацетон)дипалладий(0)
Pd(dppf)Cl ₂ или Pd(dppf)Cl ₂ -CH ₂ Cl ₂	[1,1'- бис(дифенилфосфино)ферроцен]дихлорпалладий(II), комплекс с дихлорметаном
PhMe	толуол
Psi	давление в фунтах на квадратный дюйм
QPhos	1,2,3,4,5-пентафенил-1'-(ди- <i>трет</i> - бутилфосфино)ферроцен
Rt или rt	комнатная температура
S-Phos, SPhos или Sphos	2-дициклогексилфосфино-2',6'-диметоксибифенил
S-Phos G ₂	хлор(2-дициклогексилфосфино-2',6'-диметокси-1,1'- бифенил)(2'-амино-1,1'-бифенил-2-ил палладий(II)
TBAF	тетрабутиламмония фторид
TBS	трет-бутилдиметилсилил
TEA, Et ₃ N или NEt ₃	триэтиламин
Tf	трифторметан сульфонил или трифлат
ТФУ	трифторуксусная кислота
ТГФ	тетрагидрофуран
THP	тетрагидропиранил
TIPS	триизопропилсилан

Аббревиатура	Значение
TСХ	тонкослойная хроматография
СВЭЖХ	Сверхэффективная жидкостная хроматография
XPhos Pd G4	лиганд для классических реакций кросс-сочетания (Номер CAS 1599466-81-5)

Пример 1

Получение Соединения 213



Стадия 1: В сухую круглодонную колбу добавляли: 6-бром-3-метилсульфанил-1,2,4-триазин (7,0 г, 34,0 ммоль), 2-[4-хлор-2-(метоксиметокси)фенил]-4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолан (10 г, 33,5 ммоль), K_2CO_3 (9,5 г, 68 ммоль), $PddppfCl_2$ (3,8 г, 5,1 ммоль). Смесь дегазировали аргоном в течение 10 мин, затем добавляли диоксан (100 мл) и воду (20 мл), и реакционную смесь нагревали при 90 °C в течение 16 ч (в течение ночи). Реакционную смесь охлаждали до комнатной температуры, распределяли между EtOAc и водой, органические части сушили над Na_2SO_4 , концентрировали, очищали колоночной хроматографией на силикагеле, элюируя градиентом 0-20% EtOAc в пентанах. Получали 6-[4-хлор-2-(метоксиметокси)фенил]-3-метилсульфанил-1,2,4-триазин (4,5 г, выход 44%) в виде твердого вещества желтого цвета. MS m/z 298,1, 300,1 $[M+H]^+$.

Стадия 2: К суспензии 6-[4-хлор-2-(метоксиметокси)фенил]-3-метилсульфанил-

1,2,4-триазина (350 мг, 1,18 ммоль) добавляли 4,4,5,5-тетраметил-2-(4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолан-2-ил)-1,3,2-диоксаборолан (750 мг, 2,9 ммоль), KOAc (575 мг, 5,86 ммоль), X Phos Pd G4 (175 мг, 0,20 ммоль) в сухом диоксане (5 мл), барботировали аргоном в течение 10 минут, затем нагревали до 90 °C в атмосфере аргона в течение 2 часов, после чего наблюдали полное превращение в 6-(2-(метоксиметокси)-4-(4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолан-2-ил)фенил)-3-(метилтио)-1,2,4-триазин. Затем реакционную смесь охлаждали до комнатной температуры и применяли непосредственно на следующей стадии. MS m/z 390,4 $[M+H]^+$.

Стадия 3: К смеси со стадии 2 выше добавляли: 3-бром-1,2,4-тиадиазол (0,15 г, 0,91 ммоль), (2-дициклогексилфосфино-2',4',6'-триизопропил-1,1'-бифенил)[2-(2'-амино-1,1'-бифенил)]палладия(II) метансульфонат (0,16 г, 0,181 ммоль) и карбонат калия (0,38 г, 2,72 ммоль). Реакцию дегазировали барботированием азота в течение 5 мин и продолжали в атмосфере азота. К смеси добавляли 1,4-диоксан (3 мл) и воду (3 мл), и реакционную смесь перемешивали при 90 °C в течение 2 часов. Реакционную смесь охлаждали до комнатной температуры, разбавляли водой и экстрагировали EtOAc. Объединенные органические слои сушили над MgSO₄, фильтровали и концентрировали при пониженном давлении. Остаток очищали колоночной хроматографией, элюируя градиентом (0-100%) EtOAc/гексан, с получением 3-[3-(метоксиметокси)-4-(3-метилсульфанил-1,2,4-триазин-6-ил)фенил]-1,2,4-тиадиазол (0,2 г, выход 60%). MS m/z 348,2 $[M+H]^+$.

Стадия 4: К раствору 3-[3-(метоксиметокси)-4-(3-метилсульфанил-1,2,4-триазин-6-ил)фенил]-1,2,4-тиадиазола (0,2 г, 0,6 ммоль) в CH₂Cl₂ частями добавляли (5 мл) 3-хлорпероксибензойную кислоту (0,2 г, 1,0 ммоль). Реакционную смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 16 часов. Растворитель удаляли при пониженном давлении, остаток очищали колоночной хроматографией, элюируя градиентом (0-10%) CH₂Cl₂/MeOH, с получением 3-[3-(метоксиметокси)-4-(3-метилсульфонил-1,2,4-триазин-6-ил)фенил]-1,2,4-тиадиазола (0,1 г, выход 50%); MS m/z 380,3 $[M+H]^+$.

Стадия 5: К раствору 3-[3-(метоксиметокси)-4-(3-метилсульфонил-1,2,4-триазин-6-ил)фенил]-1,2,4-тиадиазола (0,1 г, 0,3 ммоль) в ACN (3 мл) добавляли (2S)-2-циклопропилпиперазин (0,07 г, 0,6 ммоль) и N,N-диизопропилэтиламин (0,2 мл, 1 ммоль). Реакционную смесь перемешивали при 80 °C в течение 30 мин. Растворитель удаляли при пониженном давлении, остаток очищали колоночной хроматографией, элюируя градиентом (0-20%) CH₂Cl₂/MeOH, с получением 3-[4-[3-[(3S)-3-

циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил]-3-(метоксиметокси)фенил]-1,2,4-тиадиазола (0,07 г, выход 60%). MS m/z 426,5 $[M+H]^+$.

Стадия 6: К раствору 3-[4-[3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил]-3-(метоксиметокси)фенил]-1,2,4-тиадиазола (0,07 г, 0,2 ммоль) в CH_2Cl_2 (1 мл) и 2 капель MeOH добавляли HCl (4 моль/л) в 1,4-диоксане (0,1 мл, 0,4 ммоль).

Реакционную смесь перемешивали в течение 1 ч, пока СВЭЖХ не показала полное израсходование исходного материала. Растворители удаляли при пониженном давлении, остаток очищали препаративной ВЭЖХ, элюируя градиентом 5-40% ACN в воде (содержащей 0,1% муравьиной кислоты), с получением 2-[3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(1,2,4-тиадиазол-3-ил)фенола (55 мг, выход 90%). MS m/z 382,2 $[M+H]^+$; 1H ЯМР (500 МГц, $DMCO-d_6$) δ : 10,99 (s, 1H), 10,39 (s, 1H), 9,16 (s, 1H), 9,10 (s, 1H), 8,00 (d, $J = 8,1$ Гц, 1H), 7,95 (d, $J = 1,7$ Гц, 1H), 7,87 (dd, $J = 8,1, 1,6$ Гц, 1H), 4,83 – 4,67 (m, 2H), 3,59 – 3,35 (m, 3H), 3,18 – 3,07 (m, 1H), 2,77 – 2,63 (m, 1H), 1,04 (tt, $J = 8,4, 3,9$ Гц, 1H), 0,67 (ddp, $J = 17,3, 8,5, 4,2$ Гц, 2H), 0,56 (dq, $J = 9,9, 4,7$ Гц, 1H), 0,45 (dq, $J = 8,8, 4,5$ Гц, 1H).

Используя методику, описанную выше для Примера 1, можно получить дополнительные соединения, описанные в настоящем документе, путем замены соответствующего исходного материала, подходящих реагентов и условий реакции с получением соединений, таких как соединения, выбранные из:

Соед	Данные
1	MS m/z 382,4 $[M+H]^+$; 1H ЯМР (500 МГц, метанол- d_4) δ : 9,05 (s, 1H), 7,98 (s, 1H), 7,83 (d, $J = 8,7$ Гц, 1H), 7,18-7,23 (m, 2H), 4,80 (br d, $J = 12,4$ Гц, 1H), 4,64 (d, $J = 13,7$ Гц, 1H), 3,12-3,22 (m, 2H), 3,01 (dd, $J = 12,9, 10,9$ Гц, 1H), 2,79-2,89 (m, 1H), 1,94-2,03 (m, 1H), 0,82-0,95 (m, 1H), 0,57-0,67 (m, 2H), 0,31-0,43 (m, 2H); 3H не наблюдались (2 NH и OH).
2	MS m/z 409,5 $[M+H]^+$; 1H ЯМР (500 МГц, метанол- d_4) δ : 9,10 (s, 1H), 8,81 (s, 1H), 7,98 (d, $J = 8,2$ Гц, 1H), 7,70 (s, 1H), 7,68 (br d, $J = 8,2$ Гц, 1H), 7,33 (s, 1H), 4,83 (br d, $J = 13,3$ Гц, 1H), 4,72 (d, $J = 13,4$ Гц, 1H), 3,12-3,24 (m, 2H), 3,02 (dd, $J = 12,8, 10,7$ Гц, 1H), 2,83 (td, $J = 12,2, 2,5$ Гц, 1H), 1,98 (td, $J = 9,2, 2,7$ Гц, 1H), 0,83-0,95 (m, 1H), 0,57-0,67 (m, 2H), 0,30-0,43 (m, 2H); 2H не наблюдались (NH и OH).
3	MS m/z 384,1 $[M+H]^+$; 1H ЯМР (500 МГц, метанол- d_4) δ : 8,93 (s, 1H), 7,86 (s, 1H), 7,72 (d, $J = 8,6$ Гц, 1H), 7,11 – 7,07 (m, 2H), 4,73 – 4,52 (m, 2H), 3,09 – 2,95 (m, 2H), 2,77 – 2,65 (m, 2H), 2,34 (ddd, $J = 10,4, 7,0, 3,0$ Гц, 1H), 1,62 (h, $J = 6,9$ Гц, 1H), 0,95 (dd, $J = 6,9, 1,9$ Гц, 6H); 3H не наблюдались (2 NH и OH).

Соед	Данные
4	MS m/z 400,4 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 9,07 (s, 1H), 7,98 (d, J=1,8 Гц, 1H), 7,85 (d, J=8,5 Гц, 1H), 7,16-7,26 (m, 2H), 4,91-4,95 (m, 1H), 4,75 (d, J=13,3 Гц, 1H), 3,20 (d, J=13,0 Гц, 1H), 3,08 (td, J=12,4, 2,5 Гц, 1H), 2,81-2,94 (m, 2H), 2,66 (br d, J=10,1 Гц, 1H), 1,31 (d, J=12,4 Гц, 6H); 4H не наблюдались (2 NH и 2OH).
5	MS m/z 364,3 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 9,79 (d, J = 10,5 Гц, 1H), 9,43 (d, J = 10,8 Гц, 1H), 9,14 (s, 1H), 8,10 (s, 2H), 7,87 (d, J = 8,0 Гц, 1H), 7,21-7,27 (m, 2H), 4,61-4,80 (m, 2H), 3,45-3,60 (m, 2H), 3,41 (dt, J = 12,8, 2,9 Гц, 1H), 2,99-3,11 (m, 1H), 2,61-2,72 (m, 1H), 1,10 (ddt, J = 13,0, 8,0, 4,4 Гц, 1H), 0,56-0,73 (m, 3H), 0,38-0,47 (m, 1H); 1H не наблюдался.
6	MS m/z 380,5 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 9,08-9,15 (s, 1H), 8,31-8,43 (s, 2H), 8,01 (s, 2H), 7,78-7,87 (m, 1H), 7,21-7,25 (m, 1H), 7,18-7,21 (m, 1H), 4,97-5,09 (m, 2H), 3,47-3,59 (m, 2H), 3,37-3,46 (m, 1H), 3,23-3,31 (m, 1H), 2,87-2,96 (m, 1H), 0,92-1,05 (m, 2H), 0,76-0,88 (m, 2H); 2H не наблюдались (NH и OH).
7	MS m/z 382,4 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 9,06 (br s, 1H), 7,98 (br s, 1H), 7,84 (d, J=7,8 Гц, 1H), 7,21 (br s, 2H), 4,80 (br d, J=12,5 Гц, 1H), 4,69 (d, J=12,5 Гц, 1H), 3,11-3,23 (m, 2H), 3,00 (br dd, J=10,6, 9,8 Гц, 1H), 2,73-2,90 (m, 1H), 1,87-2,09 (m, 1H), 0,78-0,97 (m, 1H), 0,55-0,71 (m, 2H), 0,27-0,48 (m, 2H); 3H не наблюдались (2 NH и OH).
8	MS m/z 427,4 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 9,12 (s, 1H), 8,81 (s, 1H), 7,95-8,08 (m, 1H), 7,63-7,78 (m, 2H), 7,34 (s, 1H), 4,95-5,07 (m, 1H), 4,03-4,14 (m, 1H), 3,12-3,21 (m, 2H), 2,91-3,08 (m, 2H), 2,71-2,89 (m, 1H), 1,34 (br d, J=13,9 Гц, 6H); 3H не наблюдались (NH и 2OH).
9	MS m/z 381,5 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 9,66 (d, J = 10,5 Гц, 1H), 9,36 (d, J = 10,8 Гц, 1H), 9,12 (s, 1H), 8,17 (s, 1H), 7,83-7,89 (m, 2H), 7,15-7,22 (m, 2H), 4,60-4,82 (m, 2H), 3,38-3,57 (m, 3H), 3,07 (q, J = 11,3 Гц, 1H), 2,63-2,71 (m, 1H), 1,05-1,15 (m, 1H), 0,55-0,73 (m, 3H), 0,39-0,47 (m, 1H).
10	MS m/z 411,5 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 9,10 (br s, 1H), 8,81 (s, 1H), 7,98 (br s, 1H), 7,61-7,77 (m, 2H), 7,33 (s, 1H), 4,64-4,78 (m, 2H), 3,12-3,22 (m, 2H), 2,81-2,95 (m, 2H), 2,38-2,57 (m, 1H), 1,72-1,82 (m, 1H), 0,95-1,18 (m, 6H); 2H не наблюдались (NH и OH).
12	MS m/z 378,5 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 9,05 (s, 1H), 8,01 (s, 1H), 7,86 (s, 1H), 7,81 (d, J=8,1 Гц, 1H), 7,19 (br d, J=8,4 Гц, 1H), 7,16 (s, 1H), 4,79 (d, J=13,3 Гц, 1H), 4,68 (br d, J=13,3 Гц, 1H), 3,95 (s, 3H), 3,08-3,21 (m, 2H), 3,00 (dd, J=13,5, 12,1 Гц, 1H), 2,82 (td, J=12,8, 2,5 Гц, 1H), 1,96 (br td, J=8,5, 1,8 Гц, 1H), 0,81-0,96 (m, 1H), 0,54-0,70 (m, 2H), 0,30-0,42 (m, 2H); 2H не наблюдались (NH и OH).
13	MS m/z 382,3 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 8,47 - 8,40 (m, 1H), 8,35 (br s, 1H), 7,70 (d, J = 8,1 Гц, 1H), 7,38 - 7,19 (m, 2H), 6,03 (br s, 1H), 5,20 - 4,98 (m, 1H), 4,39 - 4,25 (m, 1H), 3,78 - 3,38 (m, 5H), 1,48 - 1,37 (m, 6H); 4H не наблюдались (2 NH и 2OH).

Соед	Данные
15	MS m/z 384,1 $[M+H]^+$; 1H ЯМР (500 МГц, метанол- d_4) δ : 8,97 (s, 1H), 7,91 – 7,85 (m, 1H), 7,74 – 7,70 (m, 1H), 7,12 – 7,02 (m, 2H), 4,84 (d, $J = 13,0$ Гц, 1H), 4,74 – 4,69 (m, 1H), 3,30 – 3,25 (m, 1H), 3,20 – 3,16 (m, 1H), 2,98 (td, $J = 12,9, 9,6$ Гц, 2H), 2,77 (ddd, $J = 11,2, 7,5, 3,3$ Гц, 1H), 1,80 (h, $J = 6,9$ Гц, 1H), 1,02 (dd, $J = 6,7, 1,9$ Гц, 6H); 3H не наблюдались (2 NH и OH).
16	MS m/z 380,3 $[M+H]^+$; 1H ЯМР (500 МГц, метанол- d_4) δ : 9,13 (s, 1H), 8,07 (s, 2H), 7,84 (d, $J=8,1$ Гц, 1H), 7,26 (d, $J=8,5$ Гц, 1H), 7,22 (s, 1H), 5,13 (br d, $J=14,2$ Гц, 1H), 5,00 (d, $J=14,3$ Гц, 1H), 3,57 (d, $J=12,8$ Гц, 1H), 3,45 (td, $J=13,5, 3,1$ Гц, 1H), 3,23-3,33 (m, 2H), 3,18 (dd, $J=11,3, 2,1$ Гц, 1H), 1,19 (s, 9H); 3H не наблюдались (2 NH и OH).
17	MS m/z 425,6 $[M+H]^+$; 1H ЯМР (500 МГц, метанол- d_4) δ : 9,07 (s, 1H), 8,79 (s, 1H), 7,95 (d, $J=8,2$ Гц, 1H), 7,67 (s, 1H), 7,64 (d, $J=8,2$ Гц, 1H), 7,29 (s, 1H), 4,91 (br d, $J=13,0$ Гц, 1H), 4,76 (br d, $J=13,0$ Гц, 1H), 3,19 (br d, $J=12,1$ Гц, 1H), 3,08 (td, $J=12,7, 2,9$ Гц, 1H), 2,78-2,92 (m, 2H), 2,46 (br d, $J=9,3$ Гц, 1H), 1,06 (s, 9H); 2H не наблюдались (NH и OH).
19	MS m/z 399,5 $[M+H]^+$; 1H ЯМР (500 МГц, метанол- d_4) δ : 9,07 (s, 1H), 8,02 (s, 1H), 7,86 (s, 1H), 7,83 (d, $J=7,9$ Гц, 1H), 7,20 (dd, $J=8,4, 1,4$ Гц, 1H), 7,17 (d, $J=1,4$ Гц, 1H), 4,93 (br d, $J=12,1$ Гц, 1H), 4,78 (d, $J=13,2$ Гц, 1H), 3,24 (d, $J=13,1$ Гц, 1H), 3,11 (td, $J=12,1, 3,5$ Гц, 1H), 2,92 (t, $J=12,1$ Гц, 2H), 2,73 (br d, $J=11,4$ Гц, 1H), 1,34 (s, 3H), 1,31 (s, 3H); 3H не наблюдались (NH и 2OH).
20	MS m/z 366,2 $[M+H]^+$; 1H ЯМР (500 МГц, метанол- d_4) δ : 9,01 (s, 1H), 8,10 - 7,92 (m, 2H), 7,79 (d, $J = 8,1$ Гц, 1H), 7,18 (s, 2H), 4,85 - 4,72 (m, 1H), 4,69 - 4,61 (m, 1H), 3,17 - 3,06 (m, 2H), 2,88 - 2,77 (m, 2H), 2,48 - 2,42 (m, 1H), 1,73 (qd, $J = 6,8, 13,7$ Гц, 1H), 1,06 (dd, $J = 3,4, 6,8$ Гц, 6H); 3H не наблюдались (2 NH и OH).
21	MS m/z 394,5 $[M+H]^+$; 1H ЯМР (500 МГц, метанол- d_4) δ : 9,05 (s, 1H), 8,02 (s, 1H), 7,86 (s, 1H), 7,82 (d, $J=8,2$ Гц, 1H), 7,19 (d, $J=8,2$ Гц, 1H), 7,17 (s, 1H), 4,89-4,93 (m, 1H), 4,73 (d, $J=12,8$ Гц, 1H), 3,96 (s, 3H), 3,18 (br d, $J=12,7$ Гц, 1H), 3,07 (td, $J=12,7, 2,5$ Гц, 1H), 2,85 (dd, $J=12,7, 10,2$ Гц, 2H), 2,45 (br d, $J=10,2$ Гц, 1H), 1,06 (s, 9H); 2H не наблюдались (NH и OH).
22	MS m/z 366,6 $[M+H]^+$; 1H ЯМР (500 МГц, метанол- d_4) δ : 9,04 (s, 1H), 8,01 (br s, 2H), 7,81 (d, $J = 8,2$ Гц, 1H), 7,26 - 7,15 (m, 2H), 4,81 (d, $J = 13,0$ Гц, 1H), 4,68 (d, $J = 13,7$ Гц, 1H), 3,19 - 3,08 (m, 2H), 2,90 - 2,79 (m, 2H), 2,52 - 2,43 (m, 1H), 1,80 - 1,68 (m, 1H), 1,07 (d, $J = 6,7$ Гц, 6H); 3H не наблюдались (2 NH и OH).
23	MS m/z 352,2 $[M+H]^+$; 1H ЯМР (500 МГц, метанол- d_4) δ : 9,02 (s, 1H), 8,06 - 7,92 (m, 2H), 7,78 (d, $J = 8,1$ Гц, 1H), 7,21 - 7,16 (m, 2H), 4,78 - 4,64 (m, 2H), 3,15 (s, 2H), 2,94 - 2,85 (m, 1H), 2,84 - 2,75 (m, 1H), 2,74 - 2,65 (m, 1H), 1,56 (s, 2H), 1,06 (t, $J = 7,6$ Гц, 3H); 3H не наблюдались (2 NH и OH).
24	MS m/z 352,2 $[M+H]^+$; 1H ЯМР (500 МГц, метанол- d_4) δ : 8,61 (s, 2H), 7,73 (d, $J = 8,2$ Гц, 1H), 7,43 - 7,29 (m, 2H), 6,04 (s, 1H), 4,42 - 4,14 (m, 2H), 3,82 - 3,40 (m, 5H), 1,92 - 1,77 (m, 2H), 1,24 - 1,10 (m, 3H); 3H не наблюдались (2 NH и OH).

Соед	Данные
25	MS m/z 400,4 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 9,06 (s, 1H), 7,98 (d, J=1,4 Гц, 1H), 7,84 (d, J=8,7 Гц, 1H), 7,16-7,26 (m, 2H), 4,91 (d, J=13,4 Гц, 1H), 4,75 (d, J=13,4 Гц, 1H), 3,21 (d, J=12,8 Гц, 1H), 3,08 (td, J=12,8, 3,1 Гц, 1H), 2,82-2,93 (m, 2H), 2,67 (d, J=11,0 Гц, 1H), 1,31 (d, J=12,8 Гц, 6H); 4H не наблюдались (2 NH и 2OH).
26	MS m/z 441,5 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 9,11 (s, 1H), 8,81 (s, 1H), 7,98 (d, J=8,2 Гц, 1H), 7,71 (d, J=2,0 Гц, 1H), 7,68 (dd, J=8,1, 2,0 Гц, 1H), 7,34 (s, 1H), 4,61 (dd, J=13,8, 4,3 Гц, 1H), 4,25-4,38 (m, 1H), 3,37-3,51 (m, 2H), 3,09-3,26 (m, 1H), 2,74-2,85 (m, 1H), 2,59 (s, 3H), 2,46 (dd, J=8,9, 4,3 Гц, 1H), 1,30 (d, J=6,4 Гц, 6H); 2H не наблюдались (2OHs).
27	MS m/z 378,4 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 9,14 (d, J = 10,9 Гц, 1H), 8,96 (s, 1H), 8,09 (s, 2H), 7,87 (dd, J = 10,1, 4,0 Гц, 1H), 7,15-7,37 (m, 3H), 4,75-4,84 (m, 2H), 3,45-3,64 (m, 3H), 3,08-3,15 (m, 1H), 2,94 (s, 3H), 2,60-2,73 (m, 1H), 1,08-1,17 (m, 1H), 0,82-0,89 (m, 1H), 0,69-0,80 (m, 1H), 0,66-0,63 (m, 1H), 0,31-0,39 (m, 1H).
28	MS m/z 426,5 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 8,82 (s, 2H), 8,51 (s, 1H), 7,57 (s, 1H), 7,52 (d, J=12,1 Гц, 1H), 7,35 (s, 1H), 5,00 (d, J=13,3 Гц, 1H), 4,81 - 4,80 (m, 1H), 4,07 (m, 3H), 3,37-3,39 (m, 2H), 3,07-3,13 (m, 2H), 2,86-2,90 (m, 1H), 1,89-1,93 (m, 1H), 1,13 (d, J=6,85 Гц, 6H); 2H не наблюдались (NH и OH), 1H из соли муравьиной кислоты.
29	MS m/z 394,5 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 9,11 (s, 1H), 8,31 (s, 1H), 8,02 (s, 2H), 7,77-7,89 (m, 1H), 7,16-7,28 (m, 1H), 4,95-5,05 (m, 2H), 3,48-3,56 (m, 1H), 3,35-3,45 (m, 2H), 3,36 (s, 3H), 3,25-3,31 (m, 2H), 1,10-1,26 (m, 2H), 0,81-0,94 (m, 2H); 3H не наблюдались (2 NH и OH).
30	MS m/z 378,2 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 9,03 (s, 1H), 8,07 - 7,88 (m, 2H), 7,79 (d, J = 8,1 Гц, 1H), 7,22 - 7,16 (m, 2H), 4,72 - 4,63 (m, 2H), 3,24 - 3,13 (m, 2H), 2,97 - 2,87 (m, 1H), 2,85 - 2,72 (m, 2H), 2,47 - 2,37 (m, 1H), 2,19 - 2,09 (m, 2H), 2,05 - 1,84 (m, 4H); 3H не наблюдались (2 NH и OH).
31	MS m/z 366,3 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 9,13 (s, 1H), 8,14 (s, 2H), 7,87 (d, J = 8,5 Гц, 1H), 7,27 - 7,23 (m, 2H), 4,80 - 4,65 (m, 2H), 3,60 - 3,49 (m, 1H), 3,41 - 3,25 (m, 3H), 3,16 - 3,04 (m, 1H), 1,76 - 1,61 (m, 2H), 1,53 - 1,36 (m, 2H), 0,94 (t, J = 7,2 Гц, 3H); 3H не наблюдались (2 NH и OH).
32	MS m/z 400,3 [M+H] ⁺ ; [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 8,71-8,69 (m, 1H), 8,42 (s, 1H), 7,91 (d, J=1,6 Гц, 1H), 6,97-7,0 (m, 1H), 6,90 (d, J=12,4 Гц, 1H), 4,79-4,82 (m, 1H), 4,69 - 4,72 (m, 1H), 3,26-3,31 (m, 2H), 3,07-3,16 (m, 1H), 2,89-2,95 (m, 1H), 2,18-2,22 (m, 1H), 0,84-0,87 (m, 1H), 0,58-0,62 (m, 2H), 0,36-0,39 (m, 2H); 3H не наблюдались (2 NH и OH), 1H из соли муравьиной кислоты.
33	MS m/z 380,2 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 9,14 (s, 1H), 8,14 (s, 2H), 7,87 (d, J = 8,5 Гц, 1H), 7,26 - 7,24 (m, 2H), 4,83 - 4,72 (m, 2H), 3,57 - 3,48 (m, 1H), 3,40 - 3,32 (m, 1H), 3,31 - 3,22 (m, 2H), 3,17 (s, 1H), 1,93 - 1,84 (m, 1H), 1,62 - 1,51 (m, 1H), 1,39 - 1,29 (m, 1H), 1,07 - 1,03 (m, 3H), 0,93 (t, J = 7,3 Гц, 3H); 3H не наблюдались (2 NH и OH).

Соед	Данные
34	MS m/z 380,3 $[M+H]^+$; 1H ЯМР (500 МГц, метанол- d_4) δ : 9,04 (s, 1H), 8,13 - 7,88 (m, 2H), 7,81 (d, $J = 8,1$ Гц, 1H), 7,24 - 7,17 (m, 2H), 4,74 - 4,61 (m, 2H), 3,22 (d, $J = 2,6$ Гц, 1H), 3,05 - 2,88 (m, 2H), 2,45 - 2,39 (m, 1H), 2,39 - 2,36 (m, 3H), 2,31 - 2,23 (m, 1H), 2,07 - 2,00 (m, 1H), 1,10 (d, $J = 6,9$ Гц, 3H), 1,02 (d, $J = 6,9$ Гц, 3H); 2H не наблюдались (NH и OH).
35	MS m/z 380,2 $[M+H]^+$; 1H ЯМР (500 МГц, метанол- d_4) δ : 8,93 (s, 1H), 7,90 (s, 1H), 7,74 (s, 1H), 7,69 (d, $J = 8,2$ Гц, 1H), 7,07 (dd, $J = 8,1, 1,8$ Гц, 1H), 7,04 (d, $J = 1,7$ Гц, 1H), 4,71 (d, $J = 12,7$ Гц, 1H), 4,58 (d, $J = 14,9$ Гц, 1H), 3,83 (s, 3H), 3,09 - 2,96 (m, 2H), 2,80 - 2,70 (m, 2H), 2,39 (ddd, $J = 10,4, 7,1, 3,0$ Гц, 1H), 1,64 (h, $J = 6,9$ Гц, 1H), 0,96 (dd, $J = 6,8, 2,0$ Гц, 6H); 2H не наблюдались (NH и OH).
36	MS m/z 400,3 $[M+H]^+$; 1H ЯМР (500 МГц, метанол- d_4) δ : 9,23 (s, 0,5H), 8,49 (s, 1H), 8,39 (s, 1H), 7,94 (d, $J = 8,2$ Гц, 0,5H), 7,71 (d, $J = 8,2$ Гц, 0,5H), 7,27-7,36 (m, 2H), 6,02 (s, 0,5H), 4,80-4,87 (m, 1H), 4,12-4,33 (m, 1H), 3,42-3,88 (m, 5H), 2,05-2,23 (m, 1H), 1,85-2,00 (m, 1H), 1,65-1,83 (m, 1H); 3H не наблюдались (2 NH и OH).
37	MS m/z 366,3 $[M+H]^+$; 1H ЯМР (500 МГц, метанол- d_4) δ : 9,13 (s, 1H), 8,02 (s, 2H), 7,85 - 7,82 (m, 1H), 7,25 - 7,19 (m, 2H), 5,00 - 4,88 (m, 2H), 3,58 - 3,49 (m, 2H), 3,37 (s, 1H), 3,32 - 3,23 (m, 2H), 1,81 - 1,70 (m, 2H), 1,65 - 1,51 (m, 2H), 1,07 (t, $J = 7,3$ Гц, 3H); 3H не наблюдались (2 NH и OH).
38	MS m/z 350,2 $[M+H]^+$; 1H ЯМР (500 МГц, метанол- d_4) δ : 9,11 (s, 0,5 H), 8,35 (s, 1H), 8,26 (s, 1H), 7,82 (d, $J = 8,2$ Гц, 0,5H), 7,59 (d, $J = 8,2$ Гц, 0,5H), 7,14-7,26 (m, 2H), 5,83-5,95 (m, 1,5H), 5,49-5,69 (m, 2H), 4,80-4,87 (m, 1H), 3,91-4,09 (m, 2H), 3,31-3,69 (m, 4H); 3H не наблюдались (2 NH и OH).
39	MS m/z 369,3 $[M+H]^+$; 1H ЯМР (500 МГц, метанол- d_4) δ : 9,13 (s, 1H), 8,04 (s, 1H), 7,87 (s, 1H), 7,83 (d, $J = 8,2$ Гц, 1H), 7,22 (d, $J = 7,9$ Гц, 1H), 7,18 (s, 1H), 4,93-5,01 (m, 2H), 3,48-3,61 (m, 2H), 3,24-3,38 (m, 3H), 1,73-1,92 (m, 2H), 1,16 (t, $J = 7,6$ Гц, 3H); 2 H не наблюдались (NH и OH).
40	MS m/z 366,2 $[M+H]^+$; 1H ЯМР (500 МГц, метанол- d_4) δ : 9,01 (s, 1H), 8,10 - 7,92 (m, 2H), 7,79 (d, $J = 8,1$ Гц, 1H), 7,18 (s, 2H), 4,85 - 4,72 (m, 1H), 4,69 - 4,61 (m, 1H), 3,17 - 3,06 (m, 2H), 2,88 - 2,77 (m, 2H), 2,48 - 2,42 (m, 1H), 1,73 (qd, $J = 6,8, 13,7$ Гц, 1H), 1,06 (dd, $J = 3,4, 6,8$ Гц, 6H); 3H не наблюдались (2 NH и OH).
41	MS m/z 383,2 $[M+H]^+$; 1H ЯМР (500 МГц, метанол- d_4) δ : 9,13 (s, 1H) 8,01 (s, 1H), 7,87-7,78 (m, 2H) 7,22-7,17 (m, 1H) 7,16 (s, 1H) 5,10-5,01 (m, 1H) 4,98-4,92 (m, 1H) 3,56 - 3,12 (m, 4H), 2,25-2,13 (m, 1H), 2,06-1,95 (m, 1H), 1,17 (d, $J = 6,9$ Гц, 6H); 2H не наблюдались (NH и OH).
42	MS m/z 338,2 $[M+H]^+$; 1H ЯМР (500 МГц, метанол- d_4) δ : 9,09 (s, 1H), 7,96 (s, 2H), 7,81 (d, $J = 8,1$ Гц, 1H), 7,25 - 7,14 (m, 2H), 4,95 - 4,86 (m, 2H), 3,59 - 3,42 (m, 3H), 3,31 - 3,20 (m, 2H), 1,46 (d, $J = 6,6$ Гц, 3H); 3H не наблюдались (2 NH и OH).

Соед	Данные
43	MS m/z 378,4 $[M+H]^+$; 1H ЯМР (500 МГц, метанол- d_4) δ : 9,05 (s, 1H), 7,94-8,13 (m, 2H), 7,82 (d, $J=8,2$ Гц, 1H), 7,23 (dd, $J=8,2, 1,8$ Гц, 1H), 7,20 (d, $J=1,5$ Гц, 1H), 3,94 (dd, $J=6,8, 5,1$ Гц, 2H), 3,79-3,83 (m, 2H), 3,02 (dd, $J=6,8, 4,6$ Гц, 2H), 1,71-1,85 (m, 6H), 1,57-1,65 (m, 2H); 3H не наблюдались (2 NH и OH).
44	MS m/z 391,3 $[M+H]^+$; 1H ЯМР (500 МГц, ДМСО- d_6) δ : 9,15 (s, 1H), 8,82 (d, $J=6,4$ Гц, 1H), 8,31 (s, 1H), 8,19 - 8,15 (m, 1H), 8,09 (d, $J=8,1$ Гц, 1H), 7,66 - 7,60 (m, 2H), 4,94 - 4,69 (m, 2H), 3,62 - 3,50 (m, 1H), 3,44 - 3,37 (m, 1H), 3,37 - 3,26 (m, 1H), 3,16 - 3,08 (m, 2H), 2,82 (s, 3H), 2,14 - 2,01 (m, 1H), 1,08 (t, $J=6,9$ Гц, 6H); 2H не наблюдались (NH и OH).
46	MS m/z 380,2 $[M+H]^+$; 1H ЯМР (500 МГц, метанол- d_4) δ : 9,10 (s, 1H), 7,95 (s, 2H), 7,81 (d, $J=8,1$ Гц, 1H), 7,25 - 7,14 (m, 2H), 5,02 - 4,85 (m, 2H), 3,61 - 3,47 (m, 2H), 3,43 - 3,36 (m, 1H), 3,28 (s, 2H), 1,94 - 1,82 (m, 1H), 1,72 - 1,56 (m, 2H), 1,05 (d, $J=6,6$ Гц, 6H); 3H не наблюдались (2 NH и OH).
47	MS m/z 383,5 $[M+H]^+$; 1H ЯМР (500 МГц, метанол- d_4) δ : 9,06 (s, 1H), 8,02 (s, 1H), 7,86 (s, 1H), 7,82 (d, $J=8,1$ Гц, 1H), 7,19 (d, $J=8,2$ Гц, 1H), 7,16 (s, 1H), 4,83 (d, $J=12,8$ Гц, 1H), 4,70 (d, $J=14,0$ Гц, 1H), 3,11-3,21 (m, 2H), 2,79-2,93 (m, 2H), 2,44-2,58 (m, 1H), 1,76 (h, $J=6,9$ Гц, 1H), 1,08 (d, $J=6,9$ Гц, 6H); 2H не наблюдались (NH и OH).
48	MS m/z 352,2 $[M+H]^+$; 1H ЯМР (500 МГц, метанол- d_4) δ : 9,02 (s, 1H), 8,06 - 7,92 (m, 2H), 7,78 (d, $J=8,1$ Гц, 1H), 7,21 - 7,16 (m, 2H), 4,78 - 4,64 (m, 2H), 3,15 (s, 2H), 2,94 - 2,85 (m, 1H), 2,84 - 2,75 (m, 1H), 2,74 - 2,65 (m, 1H), 1,56 (s, 2H), 1,06 (t, $J=7,6$ Гц, 3H); 3H не наблюдались (2 NH и OH).
49	MS m/z 369,3 $[M+H]^+$; 1H ЯМР (500 МГц, метанол- d_4) δ : 9,13 (s, 1H), 8,01 (s, 1H), 7,85 (s, 1H), 7,84 (d, $J=8,1$ Гц, 1H), 7,20 (d, $J=6,6$ Гц, 1H), 7,16 (d, $J=1,5$ Гц, 1H), 5,05 (dd, $J=14,3, 2,7$ Гц, 2H), 3,43-3,52 (m, 2H), 3,04 (dd, $J=14,5, 11,6$ Гц, 2H), 1,44 (d, $J=6,6$ Гц, 6H); 2H не наблюдались (NH и OH).
50	MS m/z 364,3 $[M+H]^+$; 1H ЯМР (500 МГц, метанол- d_4) δ : 9,05 (s, 1H), 8,07 (br s, 1H), 7,93 (br s, 1H), 7,82 (d, $J=8,2$ Гц, 1H), 7,22 (d, $J=8,1$ Гц, 1H), 7,19 (s, 1H), 3,93 (s, 2H), 3,85-3,91 (m, 2H), 2,87-2,96 (m, 2H), 2,00-2,09 (m, 2H), 1,94 (td, $J=14,2, 7,2$ Гц, 4H); 3H не наблюдались (2 NH и OH).
51	MS m/z 383,5 $[M+H]^+$; 1H ЯМР (500 МГц, метанол- d_4) δ : 9,03 (s, 1H), 7,99 (s, 1H), 7,84 (s, 1H), 7,76 (d, $J=7,0$ Гц, 1H), 7,09-7,19 (m, 2H), 4,64 (br d, $J=12,8$ Гц, 2H), 2,80-2,91 (m, 2H), 2,30 - 2,38 (m, 4H), 1,23 (d, $J=6,1$ Гц, 6H); 2H не наблюдались (NH и OH).
53	MS m/z 368,2 $[M+H]^+$; 1H ЯМР (500 МГц, метанол- d_4) δ : 8,98 (s, 1H), 7,95 (s, 2H), 7,79 - 7,73 (m, 1H), 7,18 - 7,15 (m, 2H), 4,65 (t, $J=14,2$ Гц, 2H), 3,51 - 3,41 (m, 2H), 3,41 - 3,40 (m, 3H), 3,19 - 3,10 (m, 2H), 3,04 - 2,97 (m, 1H), 2,96 - 2,82 (m, 2H); 3H не наблюдались (2 NH и OH).

Соед	Данные
55	MS m/z 350,2 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 9,11 (s, 1H), 8,14 (s, 2H), 7,87 (d, J = 7,9 Гц, 1H), 7,27 - 7,22 (m, 2H), 4,23 - 4,14 (m, 2H), 4,03 (s, 2H), 3,35 - 3,29 (m, 1H), 1,19 - 1,02 (m, 3H), 0,97 - 0,92 (m, 2H); 3H не наблюдались (2 NH и OH).
56	MS m/z 352,3 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 9,09-9,18 (m, 1H), 8,02-8,08 (m, 2H), 7,85 (d, J=8,2 Гц, 1H), 7,26 (dd, J=8,1, 1,7 Гц, 1H), 7,22 (d, J=1,5 Гц, 1H), 4,23 (br t, J=5,3 Гц, 2H), 4,06 (s, 2H), 3,44 (br d, J=5,5 Гц, 1H), 3,40-3,47 (m, 1H), 1,50 (s, 6H); 3H не наблюдались (2 NH и OH).
57	MS m/z 368,3 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 9,05 (s, 1H), 7,98 (s, 1H), 7,85 (d, J=8,5 Гц, 1H), 7,16-7,26 (m, 2H), 3,97-4,06 (m, 2H), 3,66-3,72 (m, 1H), 3,02-3,13 (m, 2H), 0,84-0,98 (m, 1H), 0,63-0,78 (m, 4H); 3H не наблюдались (2 NH и OH).
58	MS m/z 381,2[M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 9,03 (s, 1H), 7,99 (s, 1H), 7,84 (s, 1H), 7,80 (d, J=8,1 Гц, 1H), 7,17 (br d, J=8,2 Гц, 1H), 7,14 (s, 1H), 4,36 (br d, J=12,5 Гц, 2H), 3,38 (s, 2H), 3,27 (s, 1H), 2,41 (s, 3H), 2,06-2,18 (m, 3H), 1,70 (br d, J=7,9 Гц, 2H); 1H не наблюдался (OH).
59	MS m/z 380,4 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 9,07 (s, 1H), 8,09 (br s, 1H), 7,95 (br s, 1H), 7,84 (d, J=8,2 Гц, 1H), 7,24 (dd, J=8,2, 1,5 Гц, 1H), 7,21 (d, J=1,5 Гц, 1H), 4,93 (dd, J=13,7, 1,5 Гц, 1H), 4,81 (dd, J=13,7, 1,8 Гц, 1H), 4,43-4,51 (m, 1H), 3,54 (dd, J=9,8, 6,7 Гц, 1H), 3,12-3,24 (m, 2H), 2,84 (t, J=11,4 Гц, 1H), 2,39-2,55 (m, 2H), 2,18-2,27 (m, 1H), 1,82-1,91 (m, 2H); 3H не наблюдались (2 NH и OH).
60	MS m/z 366,4 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 9,11 (s, 1H), 8,00 - 7,94 (m, 2H), 7,85 - 7,81 (m, 1H), 7,73 (s, 1H), 7,25 - 7,16 (m, 2H), 5,05 (d, J = 13,9 Гц, 2H), 3,69 - 3,52 (m, 5H), 3,28 - 3,15 (m, 2H), 1,46 (d, J = 6,6 Гц, 6H); 1H не наблюдался (NH или OH).
61	MS m/z 400,2 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 9,16 (s, 1H), 8,13 (s, 2H), 7,88 (d, J = 7,9 Гц, 1H), 7,73 (d, J = 7,2 Гц, 2H), 7,57 - 7,45 (m, 3H), 7,28 - 7,21 (m, 2H), 4,92 - 4,79 (m, 2H), 4,57 (br s, 1H), 3,79 - 3,61 (m, 2H), 3,54 - 3,47 (m, 1H), 3,36 - 3,24 (m, 1H); 3H не наблюдались (2 NH и OH).
62	MS m/z 401,3 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 9,17 (s, 1H), 9,15 - 9,00 (m, 2H), 8,49 - 8,33 (m, 2H), 8,15 (s, 2H), 7,95 - 7,77 (m, 1H), 7,26 (s, 2H), 5,02 - 4,78 (m, 3H), 3,89 - 3,70 (m, 2H), 3,66 - 3,55 (m, 1H), 3,36 - 3,25 (m, 1H); 3H не наблюдались (2 NH и OH).
63	MS m/z 364,4 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 9,07 (s, 1H), 8,28 - 7,91 (m, 2H), 7,85 (d, J = 8,1 Гц, 1H), 7,26 - 7,17 (m, 2H), 3,81 (br s, 4H), 2,66 (br s, 4H), 1,69 (br s, 1H), 0,47 (d, J = 5,8 Гц, 2H), 0,39 (d, J = 2,0 Гц, 2H); 2H не наблюдались (NH и OH).
64	MS m/z 380,4 [M+H] ⁺

Соед	Данные
96	MS m/z 394,5 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 9,11 (s, 1H), 8,31 (s, 1H), 8,02 (s, 2H), 7,77-7,89 (m, 1H), 7,16-7,28 (m, 1H), 4,95-5,05 (m, 2H), 3,48-3,56 (m, 1H), 3,35-3,45 (m, 2H), 3,36 (s, 3H), 3,25-3,31 (m, 2H), 1,10-1,26 (m, 2H), 0,81-0,94 (m, 2H); 3H не наблюдались (2 NH и OH).
123	MS m/z 370,2 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 9,09 (s, 1H), 8,23 - 8,20 (m, 1H), 7,88 (d, J = 8,1 Гц, 1H), 7,25 - 7,22 (m, 1H), 7,20 (d, J = 8,2 Гц, 1H), 4,79 - 4,63 (m, 2H), 3,60 - 3,49 (m, 1H), 3,42 - 3,34 (m, 1H), 3,34 - 3,27 (m, 1H), 3,27 - 3,18 (m, 1H), 3,16 - 3,04 (m, 1H), 1,85 - 1,64 (m, 2H), 1,03 (t, J = 7,5 Гц, 3H); 3H не наблюдались (2 NH и OH).
125	MS m/z 398,5 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 9,06 (s, 1H), 7,98 (s, 1H), 7,85 (br d, J=8,4 Гц, 1H), 7,18-7,28 (m, 2H), 4,90 (d, J=13,2 Гц, 1H), 4,74 (d, J=13,3 Гц, 1H), 3,18 (d, J=12,5 Гц, 1H), 3,07 (t, J=12,5 Гц, 1H), 2,85 (t, J=11,6 Гц, 2H), 2,46 (d, J=11,6 Гц, 1H), 1,06 (s, 9H); 3H не наблюдались (2 NH и OH).
127	MS m/z 380,3 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 8,40 (s, 1H), 8,36 (s, 1H), 7,85 (s, 2H), 6,99 (s, 1H), 6,88 (s, 1H), 4,90 (d, J=13,2 Гц, 1H), 4,81 - 4,80 (m, 1H), 3,28-3,31 (m, 2H), 3,00-3,07 (m, 2H), 2,81-2,84 (m, 1H), 2,12, (s, 3H), 1,80-1,84 (m, 1H), 1,02 (dd, J=5,85, 0,85 Гц, 6H); 3H не наблюдались (2 NH и OH), 1H из соли муравьиной кислоты.
133	MS m/z 397,4 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 9,21 (s, 1H), 9,00 (s, 1H), 8,09 (d, J=8,1 Гц, 1H), 7,61-7,70 (m, 2H), 7,51 (s, 1H), 4,99 (d, J=13,6 Гц, 1H), 4,91 (d, J=16,0 Гц, 1H), 3,53-3,61 (m, 2H), 3,47 (br s, 1H), 3,34-3,38 (m, 2H), 1,78-1,86 (m, 2H), 1,18 (t, J=7,2 Гц, 3H); 2H не наблюдались (NH и OH).
134	MS m/z 378,2 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 9,09 (s, 1H), 8,02 (s, 2H), 7,82 (d, J = 8,2 Гц, 1H), 7,23 (dd, J = 8,2, 1,7 Гц, 1H), 7,19 (s, 1H), 4,99 - 4,93 (m, 2H), 3,50 - 3,44 (m, 1H), 3,19 (td, J = 12,5, 3,6 Гц, 1H), 2,60 (dd, J = 11,6, 3,2 Гц, 1H), 1,23 (s, 3H), 0,76 - 0,66 (m, 2H), 0,65 - 0,55 (m, 2H); 5H не наблюдались (2 NH и OH; CH ₂ сигнал перекрывался с MeOH сигналом).
135	MS m/z 350,3 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 9,10-9,17 (m, 1H), 8,33 (s, 1H), 8,02 (s, 2H), 7,80-7,90 (m, 1H), 7,19-7,30 (m, 1H), 4,68-4,78 (m, 2H), 4,21-4,30 (m, 2H), 3,42-3,53 (m, 2H), 2,13-2,22 (m, 2H), 2,00-2,10 (m, 2H); 3H не наблюдались (2 NH и OH).
136	MS m/z 364,4 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 9,78 (d, J = 10,5 Гц, 1H), 9,44 (d, J = 10,8 Гц, 1H), 9,16 (s, 1H), 8,13 (s, 2H), 7,87 (d, J = 8,0 Гц, 1H), 7,23-7,29 (m, 2H), 4,59-4,72 (m, 2H), 3,45-3,61 (m, 2H), 3,34-3,54 (m, 1H), 2,99-3,14 (m, 1H), 2,66-2,71 (m, 1H), 1,06-1,12 (m, 1H), 0,55-0,72 (m, 3H), 0,38-0,46 (m, 1H); 1H не наблюдался (OH или NHs).
137	MS m/z 364,4 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 9,76 (d, J = 10,0 Гц, 1H), 9,42 (d, J = 11,0 Гц, 1H), 9,18 (s, 1H), 8,17 (s, 2H), 7,88 (d, J = 8,0 Гц, 1H), 7,26-7,31 (m, 2H), 4,57-4,71 (m, 2H), 3,48-3,63 (m, 2H), 3,34-3,59 (m, 1H), 2,97-3,13 (m, 1H), 2,64-2,71 (m, 1H), 1,09-1,18 (m, 1H), 0,57-0,73 (m, 3H), 0,37-0,46 (m, 1H); 1H не наблюдался (OH или NHs).

Соед	Данные
143	MS m/z 392,3 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 9,10 (s, 1H), 9,05 (s, 1H), 8,54 (s, 1H), 7,99 (d, J = 8,1 Гц, 1H), 7,83 (s, 1H), 7,74 (d, J = 8,2 Гц, 1H), 4,92 - 4,71 (m, 2H), 3,57 - 3,48 (m, 1H), 3,43 - 3,36 (m, 1H), 3,33 - 3,24 (m, 1H), 3,16 - 3,09 (m, 2H), 2,59 (s, 3H), 2,12 - 2,01 (m, 1H), 1,11 - 1,06 (m, 6H); 2H не наблюдались (NH и OH).
144	MS m/z 378,3 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 9,26 (s, 1H), 9,12 (s, 1H), 8,77 - 8,74 (m, 1H), 8,65 (d, J = 2,3 Гц, 1H), 8,01 (d, J = 8,2 Гц, 1H), 7,84 - 7,82 (m, 1H), 7,76 (dd, J = 1,5, 8,2 Гц, 1H), 4,91 - 4,73 (m, 2H), 3,48 - 3,37 (m, 2H), 3,28 (dd, J = 11,3, 13,9 Гц, 1H), 3,20 - 3,09 (m, 2H), 2,09-2,02 (m, 1H), 1,11 - 1,04 (m, 6H); 2H не наблюдались (NH и OH).
145	MS m/z 392,3 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 9,11 (s, 2H), 8,64 (s, 1H), 7,99 (d, J = 8,1 Гц, 1H), 7,81 - 7,78 (m, 1H), 7,71 (dd, J = 1,4, 8,2 Гц, 1H), 4,85 (d, J = 13,4 Гц, 1H), 4,81 - 4,73 (m, 1H), 3,52 (s, 1H), 3,43 - 3,35 (m, 1H), 3,27 (d, J = 14,0 Гц, 1H), 3,17 (s, 2H), 2,55 (s, 3H), 2,11 - 2,01 (m, 1H), 1,10 - 1,04 (m, 6H); 2H не наблюдались (NH и OH).
146	MS m/z 406,1 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 9,02 (s, 1H), 8,00 (s, 2H), 7,76 (d, J = 8,1 Гц, 1H), 7,17 (d, J = 1,7 Гц, 1H), 7,15 (s, 1H), 4,90 - 4,81 (m, 1H), 4,74 - 4,64 (m, 1H), 3,48 - 3,41 (m, 1H), 3,19 - 3,05 (m, 2H), 2,71 - 2,51 (m, 2H); 5H не наблюдались (2 NH и OH; CH ₂ сигнал перекрывался с MeOH сигналом).
148	MS m/z 366,3 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 9,14 (s, 1H), 8,14 (s, 2H), 7,87 (d, J = 8,2 Гц, 1H), 7,30 - 7,19 (m, 2H), 4,94 - 4,78 (m, 2H), 3,42 - 3,32 (m, 1H), 3,24 - 3,18 (m, 2H), 3,17 - 3,10 (m, 1H), 1,89 - 1,79 (m, 1H), 1,77 - 1,66 (m, 1H), 1,39 (d, J = 6,4 Гц, 3H), 1,09 - 0,98 (m, 3H); 3H не наблюдались (2 NH и OH).
149	MS m/z 392,3 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 9,14 (s, 1H), 9,13 - 9,11 (m, 1H), 8,05 - 7,99 (m, 2H), 7,91 (s, 1H), 7,79 (d, J = 8,2 Гц, 1H), 4,90 - 4,73 (m, 2H), 3,56 - 3,47 (m, 1H), 3,43 - 3,37 (m, 1H), 3,28 (dd, J = 11,2, 13,8 Гц, 1H), 3,17 - 3,10 (m, 2H), 2,57 (s, 3H), 2,11 - 1,99 (m, 1H), 1,11 - 1,04 (m, 6H); 2H не наблюдались (NH и OH).
150	MS m/z 406,4 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 9,15 (s, 1H), 9,10 (s, 1H), 8,01 (d, J = 8,1 Гц, 1H), 7,99 - 7,97 (m, 1H), 7,90 (s, 1H), 7,82 - 7,78 (m, 1H), 4,86 - 4,65 (m, 2H), 3,49 - 3,40 (m, 1H), 3,18 - 2,98 (m, 2H), 2,98 - 2,87 (m, 1H), 2,83 (q, J = 7,6 Гц, 2H), 1,97 - 1,84 (m, 1H), 1,30 (t, J = 7,6 Гц, 3H), 1,08 - 1,01 (m, 7H); 2H не наблюдались (NH и OH).
151	MS m/z 378,2 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 9,07 (s, 1H), 8,93 (d, J = 4,9 Гц, 2H), 8,08 (s, 1H), 8,02 - 7,97 (m, 2H), 7,48 (t, J = 4,8 Гц, 1H), 4,82 - 4,62 (m, 2H), 3,48 - 3,41 (m, 1H), 3,28 - 3,18 (m, 2H), 3,07 - 2,88 (m, 2H), 1,89 - 1,78 (m, 1H), 1,02 (dd, J = 3,2, 6,7 Гц, 6H); 2H не наблюдались (NH и OH).
152	MS m/z 401,4 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 9,09 (s, 1H), 8,52 (br. s, 1H), 8,07 (d, J=1,45 Гц, 1H), 7,91 (s, 1H), 7,67 (d, J=12,4 Гц, 1H), 7,21 (d, J=6,55 Гц, 1H), 4,96 (d, J=13,2 Гц, 1H), 4,81 - 4,83 (m, 1H), 3,28-3,31 (m, 2H), 3,05-3,11 (m, 2H), 2,84-2,88 (m, 1H), 1,89-1,93 (m, 1H), 1,12 (d, J=6,7 Гц, 6H); 2H не наблюдались (NH и OH), 1H из соли муравьиной кислоты.

Соед	Данные
156	MS m/z 415,4 $[M+H]^+$; 1H ЯМР (500 МГц, метанол- d_4) δ : 8,92 (s, 1H), 8,43 (s, 1H), 7,94 (d, $J=1,45$ Гц, 1H), 7,79 (s, 1H), 7,54 (d, $J=12,4$ Гц, 1H), 7,07 (d, $J=6,55$ Гц, 1H), 4,83 (d, $J=13,2$ Гц, 1H), 4,68 (d, $J=13,5$ Гц, 1H), 3,13-3,16 (m, 1H), 3,05-3,11 (m, 1H), 2,79-2,87 (m, 2H), 2,50-2,52 (m, 1H), 0,96 (s, 9H); 2H не наблюдались (NH и OH), 1H из соли муравьиной кислоты.
158	MS m/z 384,3, $[M+H]^+$; 1H ЯМР (500 МГц, метанол- d_4) δ : 8,97 (s, 1H), 8,40 (s, 1H), 7,95 (br. s, 2H), 7,58 (d, $J=12,1$ Гц, 1H), 7,14 (d, $J=6,55$ Гц, 1H), 4,85 (d, $J=13,2$ Гц, 1H), 4,69 - 4,72 (m, 1H), 3,26-3,30 (m, 1H), 3,15-3,18 (m, 1H), 2,92-2,99 (m, 2H), 2,70-2,73 (m, 1H), 1,74-1,79 (m, 1H), 1,00 (d, $J=6,8$ Гц, 6H); 3H не наблюдались (2 NH и OH), 1H из соли муравьиной кислоты.
160	MS m/z 391,4 $[M+H]^+$; 1H ЯМР (500 МГц, метанол- d_4) δ : 9,14 (s, 1H), 8,74 - 8,68 (m, 1H), 8,04 (dd, $J = 2,3, 8,1$ Гц, 1H), 7,95 (d, $J = 7,9$ Гц, 1H), 7,43 (d, $J = 8,1$ Гц, 1H), 7,28 - 7,25 (m, 2H), 5,07 (br d, $J = 13,1$ Гц, 1H), 4,97 (br d, $J = 14,3$ Гц, 1H), 3,60 - 3,51 (m, 2H), 3,31 - 3,22 (m, 2H), 3,13 (ddd, $J = 3,2, 7,4, 10,9$ Гц, 1H), 2,62 (s, 3H), 2,16 - 2,05 (m, 1H), 1,19 (dd, $J = 4,3, 6,8$ Гц, 6H); 2H не наблюдались (NH и OH).
161	MS m/z 377,4 $[M+H]^+$; 1H ЯМР (500 МГц, метанол- d_4) δ : 9,04 (s, 1H), 8,60 (d, $J = 5,6$ Гц, 2H), 7,93 (d, $J = 8,1$ Гц, 1H), 7,73 (d, $J = 6,0$ Гц, 2H), 7,36 - 7,32 (m, 2H), 4,80 (br d, $J = 12,8$ Гц, 1H), 4,67 (br d, $J = 13,7$ Гц, 1H), 3,17 - 3,06 (m, 2H), 2,88 - 2,76 (m, 2H), 2,44 (ddd, $J = 2,8, 7,2, 10,3$ Гц, 1H), 1,72 (qd, $J = 6,8, 13,6$ Гц, 1H), 1,06 (d, $J = 6,7$ Гц, 6H); 2H не наблюдались (NH и OH).
163	MS m/z 398,1 $[M+H]^+$; 1H ЯМР (500 МГц, метанол- d_4) δ : 8,79 (s, 1H), 7,76 (s, 1H), 7,59 (d, $J=8,2$ Гц, 1H), 6,92-7,07 (m, 2H), 4,53 (br d, $J=13,1$ Гц, 1H), 4,36 (d, $J=14,6$ Гц, 1H), 2,84-2,94 (m, 2H), 2,73 (dd, $J=13,1, 10,7$ Гц, 1H), 2,50-2,60 (m, 1H), 1,65-1,70 (m, 1H), 0,53-0,67 (m, 1H), 0,28-0,37 (m, 2H), 0,05-0,16 (m, 2H); 3H не наблюдались (2 NH и OH).
164	MS m/z 398,3 $[M+H]^+$; 1H ЯМР (500 МГц, метанол- d_4) δ : 8,96 (s, 1H), 8,41 (s, 1H), 7,95 (br. s, 2H), 7,57 (d, $J=12,1$ Гц, 1H), 7,13 (d, $J=6,55$ Гц, 1H), 4,89 (d, $J=13,2$ Гц, 1H), 4,69 - 4,72 (m, 1H), 3,13-3,16 (m, 1H), 3,05-3,11 (m, 1H), 2,86-3,00 (m, 2H), 2,62-2,65 (m, 1H), 0,99 (s, 9H); 3H не наблюдались (2 NH и OH), 1H из соли муравьиной кислоты.
165	MS m/z 338,0 $[M+H]^+$; 1H ЯМР (500 МГц, метанол- d_4) δ : 9,16 (s, 1H), 8,10 (s, 2H), 7,87 (d, $J=8,2$ Гц, 1H), 7,27 (dd, $J=8,2, 1,8$ Гц, 1H), 7,24 (d, $J=1,8$ Гц, 1H), 4,89-4,95 (m, 2H), 4,17-4,28 (m, 2H), 3,40-3,66 (m, 3H), 1,46 (d, $J=6,0$ Гц, 3H); 3 H не наблюдались (2 NH и OH).
166	MS m/z 338,0 $[M+H]^+$; 1H ЯМР (500 МГц, метанол- d_4) δ : 9,18 (s, 1H), 8,14-8,11 (m, 2H), 7,89 (d, $J=8,1$ Гц, 1H), 7,29 (br d, $J=7,3$ Гц, 1H), 7,25 (br d, $J=6,7$ Гц, 1H), 4,91-4,98 (m, 2H), 4,09-4,36 (m, 2H), 3,42-3,73 (m, 3H), 1,46 (br d, $J=5,8$ Гц, 3H); 3 H не наблюдались (2 NH и OH).

Соед	Данные
170	MS m/z 382,0 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 9,14 (s, 1H), 8,81 (s, 1H), 8,04 (d, J = 8,1 Гц, 1H), 7,62-7,70 (m, 2H), 4,93 (d, J = 13,7 Гц, 1H), 4,75-4,87 (m, 1H), 3,37 (t, J = 12,3 Гц, 2H), 3,26 (dd, J = 13,8, 10,6 Гц, 1H), 3,00-3,09 (m, 1H), 2,35 (d, J = 10,8 Гц, 1H), 0,89-1,04 (m, 1H), 0,68-0,78 (m, 2H), 0,45-0,51 (m, 2H); 2H не наблюдались (OH and NH).
177	MS m/z 375,3 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 9,21 (s, 1H), 8,92 - 8,86 (m, 2H), 8,43 (d, J = 6,3 Гц, 2H), 8,17 - 8,11 (m, 1H), 7,67 - 7,53 (m, 2H), 5,06 - 4,97 (m, 1H), 4,96 - 4,89 (m, 1H), 3,64 - 3,49 (m, 3H), 3,29 - 3,21 (m, 1H), 2,76 - 2,66 (m, 1H), 1,16 - 1,06 (m, 1H), 0,89 - 0,76 (m, 2H), 0,66 - 0,51 (m, 2H); 2H не наблюдались (NH и OH).
178	MS m/z 393,3 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 9,09 (s, 1H), 8,79 (d, J = 2,3 Гц, 1H), 8,59 (d, J = 5,0 Гц, 1H), 8,00 (d, J = 8,1 Гц, 1H), 7,80 - 7,71 (m, 1H), 7,38 (s, 1H), 7,30 (d, J = 8,1 Гц, 1H), 4,80 - 4,67 (m, 2H), 3,64 - 3,49 (m, 2H), 3,46 - 3,36 (m, 1H), 3,07 (br d, J = 11,7 Гц, 1H), 2,72 - 2,61 (m, 1H), 1,17 - 1,10 (m, 1H), 0,71 - 0,59 (m, 3H), 0,46 - 0,40 (m, 1H); 2H не наблюдались (NH и OH).
179	MS m/z 403,2 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 9,11 (s, 1H), 7,92 (d, J = 8,1 Гц, 1H), 7,70 (br d, J = 8,2 Гц, 2H), 7,34 - 7,21 (m, 4H), 4,79 - 4,65 (m, 2H), 3,60 - 3,47 (m, 3H), 3,46 - 3,40 (m, 1H), 3,07 (br d, J = 9,8 Гц, 1H), 2,87 (s, 3H), 2,69 - 2,62 (m, 1H), 0,71 - 0,59 (m, 3H), 0,47 - 0,39 (m, 1H); 2H не наблюдались (NH и OH).
185	MS m/z 383,5 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 9,10 (s, 1H), 7,99 - 7,93 (m, 1H), 7,92 (d, J = 3,3 Гц, 1H), 7,66 (d, J = 3,2 Гц, 1H), 7,58 (d, J = 7,3 Гц, 2H), 4,88-4,91 (m, 1H), 4,75 (d, J = 13,4 Гц, 1H), 3,13-3,24 (m, 2H), 2,91 (dd, J = 13,5, 10,3 Гц, 2H), 2,56 (t, J = 8,0 Гц, 1H), 1,72-1,83 (m, 1H), 1,09 (d, J = 6,8 Гц, 6H); 2H не наблюдались (OH and NH).
186	MS m/z 433,5 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 9,09 (s, 1H), 7,94-7,99 (m, 2H), 7,57-7,63 (m, 2H), 6,77-7,03 (m, 1H), 4,86-4,93 (m, 1H), 4,74 (d, J = 13,3 Гц, 1H), 3,12-3,23 (m, 2H), 2,87-2,92 (m, 2H), 2,52-2,56 (m, 1H), 1,77 (h, J = 6,9 Гц, 1H), 1,09 (d, J = 6,8 Гц, 6H); 2H не наблюдались (OH and NH).
187	MS m/z 394,1 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: ¹ H ЯМР (ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 12,93 (br s, 1H), 11,31 (br s, 1H), 9,09 (s, 1H), 7,96-8,19 (m, 2H), 7,82-7,89 (m, 1H), 7,17-7,27 (m, 2H), 4,68 (dd, J=8,2, 5,8 Гц, 1H), 4,51-4,64 (m, 3H), 4,36 (d, J=12,8 Гц, 1H), 4,26 (d, J=12,5 Гц, 1H), 3,19-3,35 (m, 2H), 2,88 (dd, J=13,0, 9,3 Гц, 1H), 2,81 (dt, J=11,5, 3,1 Гц, 1H), 2,54 (dd, J=9,5, 2,7 Гц, 1H), 2,29 (td, J=11,5, 4,0 Гц, 1H), 2,11 (s, 3H).
188	MS m/z 417,3, 419,3 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 11,15 (s, 1H), 9,00 (s, 1H), 7,97 (d, J = 8,1 Гц, 1H), 7,84 (s, 1H), 7,56 (d, J = 1,8 Гц, 1H), 7,51 (dd, J = 8,1, 1,8 Гц, 1H), 4,65 (d, J = 12,6 Гц, 1H), 4,56 (d, J = 12,6 Гц, 1H), 2,97-3,09 (m, 2H), 2,62-2,83 (m, 2H), 2,29-2,42 (m, 1H), 1,66 (h, J = 6,7 Гц, 1H), 0,97 (d, J = 6,8 Гц, 6H); 1H не наблюдался (OH или NH).

Соед	Данные
189	MS m/z 417,3, 419,3 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 11,22 (s, 1H), 9,00 (s, 1H), 7,94-8,02 (m, 2H), 7,52 (d, J = 1,8 Гц, 1H), 7,46 (dd, J = 8,1, 1,8 Гц, 1H), 4,64 (d, J = 12,5 Гц, 1H), 4,55 (d, J = 12,5 Гц, 1H), 2,95-3,08 (m, 2H), 2,61-2,81 (m, 2H), 2,33-2,36 (m, 1H), 1,65 (h, J = 6,8 Гц, 1H), 0,97 (d, J = 6,8 Гц, 6H); 1H не наблюдался (ОН или NH).
192	MS m/z 376,2 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 9,22 - 9,19 (m, 1H), 9,08 (s, 1H), 8,80 (d, J = 5,5 Гц, 1H), 7,99 - 7,96 (m, 2H), 7,81 - 7,77 (m, 1H), 7,75 (dd, J = 1,7, 8,2 Гц, 1H), 4,82 - 4,79 (m, 1H), 4,79 - 4,64 (m, 1H), 3,22 - 3,12 (m, 2H), 3,02 (dd, J = 10,6, 13,2 Гц, 1H), 2,84 (dt, J = 3,4, 12,2 Гц, 1H), 2,01 - 1,93 (m, 1H), 0,94 - 0,80 (m, 1H), 0,61 (td, J = 4,0, 7,6 Гц, 2H), 0,41 - 0,31 (m, 2H); 2H не наблюдались (NH и OH).
196	MS m/z 401,4 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 11,19 (s, 1H), 9,00 (s, 1H), 7,95 (d, J = 8,1 Гц, 1H), 7,79 (d, J = 3,1 Гц, 1H), 7,49 (d, J = 1,8 Гц, 1H), 7,42 (dd, J = 8,1, 1,8 Гц, 1H), 4,64 (d, J = 12,6 Гц, 1H), 4,55 (d, J = 12,6 Гц, 1H), 2,96-3,08 (m, 2H), 2,65-2,79 (m, 2H), 2,32-2,37 (m, 1H), 1,65 (h, J = 6,7 Гц, 1H), 0,97 (d, J = 6,8 Гц, 6H); 1H не наблюдался (ОН или NH).
199	MS m/z 408,5 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 11,20 (s, 1H), 9,00 (s, 1H), 8,02 (d, J = 8,1 Гц, 1H), 7,57 (d, J = 1,6 Гц, 1H), 7,54 (dd, J = 8,1, 1,7 Гц, 1H), 4,67 (d, J = 12,5 Гц, 1H), 4,57 (d, J = 12,7 Гц, 1H), 3,00-3,10 (m, 2H), 2,69-2,83 (m, 2H), 2,29-2,37 (m, 1H), 1,58-1,73 (m, 1H), 1,07-1,31 (m, 5H), 0,98 (d, J = 6,9, 6H); 1H не наблюдался (ОН или NH).
200	MS m/z 413,4 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 11,11 (s, 1H), 9,00 (s, 1H), 7,94 (d, J = 8,1 Гц, 1H), 7,52 (d, J = 1,8 Гц, 1H), 7,46 (dd, J = 8,2, 1,8 Гц, 1H), 6,67 (s, 1H), 4,65 (d, J = 12,7 Гц, 1H), 4,56 (d, J = 12,6 Гц, 1H), 3,89 (s, 3H), 2,98-3,09 (m, 2H), 2,62-2,83 (m, 2H), 2,37 (s, 1H), 1,66 (h, J = 6,8 Гц, 1H), 0,98 (d, J = 6,9, 6H); 1H не наблюдался (ОН или NH).
203	MS m/z 378,4 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 9,02 (s, 1H), 8,09 - 7,88 (m, 2H), 7,79 (d, J = 8,2 Гц, 1H), 7,23 - 7,15 (m, 2H), 4,75 (d, J = 13,4 Гц, 1H), 4,64 (d, J = 13,1 Гц, 1H), 3,23 (dt, J = 3,1, 12,9 Гц, 1H), 2,97 - 2,90 (m, 2H), 2,82 (dd, J = 10,8, 13,3 Гц, 1H), 2,35 (dt, J = 3,2, 12,1 Гц, 1H), 2,22 - 2,06 (m, 2H), 1,86 (br d, J = 12,7 Гц, 1H), 1,79 - 1,64 (m, 3H), 1,47 - 1,30 (m, 2H); 2H не наблюдались (NH и OH).
204	MS m/z 414,4 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 11,15 (s, 1H), 8,95-9,12 (m, 1H), 7,97 (d, J = 8,2 Гц, 1H), 7,24-7,63 (m, 3H), 4,73 (d, J = 13,1 Гц, 1H), 4,64 (d, J = 13,0 Гц, 1H), 4,20 (s, 3H), 3,17 (s, 3H), 2,81-3,02 (m, 2H), 1,76 (s, 1H), 1,00 (d, J = 6,8 Гц, 6H).
205	MS m/z 434,4 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 11,33 (s, 1H), 9,03 (s, 1H), 8,04 (d, J = 8,1 Гц, 1H), 7,51-7,81 (m, 3H), 4,66 (d, J = 12,6 Гц, 1H), 4,56 (d, J = 12,7 Гц, 1H), 2,97-3,09 (m, 2H), 2,77 (dd, J = 12,6, 10,5 Гц, 1H), 2,62-2,71 (m, 1H), 2,28-2,41 (m, 1H), 1,65 (h, J = 6,7 Гц, 1H), 0,97 (d, J = 6,8, 6H); 1H не наблюдался (ОН или NH).

Соед	Данные
207	MS m/z 438,5 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 11,21 (s, 1H), 9,05 (s, 1H), 7,97 (d, J = 8,2 Гц, 1H), 7,81 (d, J = 1,8 Гц, 1H), 7,73 (dd, J = 8,3, 1,8 Гц, 1H), 7,11 (s, 1H), 4,65 (d, J = 12,6 Гц, 1H), 4,55 (d, J = 12,6 Гц, 1H), 4,01 (s, 3H), 3,96 (s, 3H), 2,90-3,10 (m, 2H), 2,76 (dd, J = 12,7, 10,4 Гц, 1H), 2,61-2,72 (m, 1H), 2,33-2,40 (m, 1H), 1,65 (h, J = 6,7 Гц, 1H), 0,97 (d, J = 6,8 Гц, 6H); 1H не наблюдался (ОН или NH).
208	MS m/z 392,3 [M+H] ⁺ .
209	MS m/z 393,2 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 9,13 (s, 1H), 8,28 (d, J = 5,3 Гц, 1H), 7,99 (d, J = 8,1 Гц, 1H), 7,63 (d, J = 5,3 Гц, 1H), 7,43 - 7,34 (m, 3H), 5,00 - 4,78 (m, 1H), 3,43 (d, J = 6,7 Гц, 2H), 3,37 - 3,29 (m, 2H), 3,11 (dt, J = 3,5, 12,9 Гц, 1H), 2,45 (dt, J = 3,1, 10,0 Гц, 1H), 1,02 (tdd, J = 4,5, 8,5, 12,9 Гц, 1H), 0,81 - 0,71 (m, 2H), 0,58 - 0,46 (m, 2H); 2H не наблюдались (NH и OH).
210	MS m/z 431,4 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 9,04 (s, 1H), 8,46 (s, 1H), 7,89 (d, J = 8,2 Гц, 1H), 7,57 - 7,51 (m, 2H), 6,68 (s, 1H), 4,79 (d, J = 12,1 Гц, 1H), 4,68 (d, J = 13,1 Гц, 1H), 4,20 (t, J = 7,6 Гц, 4H), 3,20 - 3,10 (m, 2H), 2,98 (dd, J = 10,9, 12,7 Гц, 1H), 2,85 - 2,77 (m, 1H), 2,50 (quin, J = 7,6 Гц, 2H), 1,97 - 1,90 (m, 1H), 0,86 (dt, J = 4,1, 8,5 Гц, 1H), 0,64 - 0,57 (m, 2H), 0,41 - 0,31 (m, 2H); 2H не наблюдались (NH и OH).
215	MS m/z 396,0 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (400 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ 9,03 (s, 1H), 7,98 (s, 1H), 7,82 (d, J=8,8 Гц, 1H), 7,20 (d,J=6,8 Гц, 2H), 4,83 (d, J=13,2 Гц, 1H), 4,70 (d, J=12,8 Гц, 1H), 2,84 (t, J=12,0 Гц, 2H), 2,66 (t, J=12,0, 1H), 1,94 (t, J=9,2 Гц, 1H), 1,21 (d, J=6,4 Гц, 3H), 0,85 (q, J=3,2 Гц, 1H), 0,60 (d, J=8,0 Гц, 2H), 0,36 (q, J=14,8 Гц, 2H); 3H не наблюдались (2 NH и OH).
216	MS m/z: 380,0 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (400 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 9,03 (s, 1H), 8,01(s, 2H), 7,80(d, J= 8,4 Гц, 1H), 7,22-7,18(m, 2H), 4,89-4,84 (m, 1H), 4,71-4,68 (m, 1H), 2,93-2,81 (m, 1H), 2,69-2,59 (m, 2H), 2,49-2,46 (m, 1H), 1,73-1,71 (m, 1H), 1,21 (d, J= 6,4 Гц, 3H), 1,07 (d, J= 6,2 Гц, 6H); 3H не наблюдались (2 NH и OH).
217	MS m/z: 398,0 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (400 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ 9,03 (s, 1H), 7,95 (d, J=2,0 Гц, 1H), 7,80 (d, J=8,4 Гц, 1H), 7,18 (d, J=6,8 Гц, 2H), 4,76 (t, J=14,4 Гц, 1H), 4,60 (s, 1H), 2,97 (s, 1H), 2,69 (m, 3H), 1,76 (q, J=6,8 Гц, 1H), 1,24 (d, J=6,4 Гц, 3H), 1,08 (t, J=6,4 Гц, 6H); 3H не наблюдались (2 NH и OH).
218	MS m/z: 384,0 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (400 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ 9,03 (s, 1H), 7,97 (d, J=1,6 Гц, 1H), 7,82 (d, J=8,8 Гц, 1H), 7,20 (d,J=6,4 Гц, 2H), 4,83 (d, J=12,8 Гц, 1H), 4,73 (d, J=12,8 Гц, 1H), 2,91 (m, 1H), 2,63 (q, J=11,2 Гц, 3H), 1,55 (m, 2H), 1,20 (d, J=6,0 Гц, 3H), 1,07 (t, J=7,6 Гц, 3H); 3H не наблюдались (2 NH и OH).
219	MS m/z: 450,1 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (400 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 9,08 (s, 1H), 7,93 (d, J = 7,6 Гц, 1H), 7,71 (s, 1H), 7,66 (d, J = 9,2 Гц, 1H), 6,96 (s, 1H), 4,75 (d, J = 12,8 Гц, 1H), 4,10 (s, 3H), 4,01 (s, 3H), 2,90-2,84 (m, 2H), 2,68 (t, J = 11,8 Гц, 1H), 1,98 (t, J = 11,2 Гц, 1H), 1,31 (s, 1H), 1,22 (d, J = 5,2 Гц, 3H), 0,91-0,86 (m, 1H), 0,61 (d, J = 7,6 Гц, 2H), 0,36 (d, J = 14,8 Гц, 2H); 2H не наблюдались (NH и OH).

Соед	Данные
220	MS m/z: 450,1 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (400 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 9,08 (s, 1H), 7,93 (d, J = 7,6 Гц, 1H), 7,71 (s, 1H), 7,66 (d, J = 9,2 Гц, 1H), 6,96 (s, 1H), 4,75 (d, J = 12,4 Гц, 1H), 4,10 (s, 3H), 4,01 (s, 3H), 2,90-2,84 (m, 2H), 2,68 (t, J = 12,0 Гц, 1H), 1,98 (t, J = 11,2 Гц, 1H), 1,31 (s, 1H), 1,22 (d, J = 6,4 Гц, 3H), 0,90-0,83 (m, 1H), 0,61 (d, J = 8,0 Гц, 2H), 0,42-0,33 (m, 2H); 3H не наблюдались (2 NH и OH).
221	MS m/z: 396,0 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (400 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 7,45 (s, 1H), 6,40 (d, J=2,0 Гц, 1H), 6,23 (t, J=6,8 Гц, 1H), 5,61 (d, J=6,4 Гц, 2H), 4,82 (t, J=1,2 Гц, 1H), 4,67 (d, J=12,8 Гц, 1H), 2,82 (m, 2H), 2,63 (q, J=2,4 Гц, 1H), 1,94 (m, 1H), 1,19 (d, J=6,4 Гц, 3H), 0,82 (m, 1H), 0,58 (m, 2H), 0,35 (m, 2H); 3H не наблюдались (2 NH и OH).
222	MS m/z: 398,0 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (400 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 9,03 (s, 1H), 7,97 (d, J=2,0 Гц, 1H), 7,82 (d, J=8,8 Гц, 1H), 7,20 (d, J=6,8 Гц, 2H), 4,86 (s, 1H), 4,69 (t, J=12,0 Гц, 1H), 2,88 (m, 1H), 2,66 (m, 2H), 2,50 (m, 1H), 1,72 (m, 1H), 1,21 (d, J=6,4 Гц, 3H), 1,08 (q, J=0,8 Гц, 6H); 3H не наблюдались (2 NH и OH).
223	MS m/z: 384. [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (400 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ 9,05 (s, 1H), 7,98 (s, 1H), 7,83 (d, J=8,8 Гц, 1H), 7,21 (d, J=6,8 Гц, 2H), 4,84 (d, J=13,6 Гц, 1H), 4,74 (d, J=13,2 Гц, 1H), 2,91 (s, 1H), 2,63 (q, J=12,4 Гц, 3H), 1,56 (s, 2H), 1,21 (d, J=6,0 Гц, 3H), 1,07 (t, J=7,2 Гц, 3H); 3H не наблюдались (2 NH и OH).
224	MS m/z: 378,1 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (400 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 9,04 (s, 1 H), 8,10-7,89 (m, 2H), 7,80 (d, J = 8,0 Гц, 1 H), 7,18(dd, J = 1,6 Гц, 1H), 7,18(d, J = 1,6 Гц, 1H), 4,87-4,82 (m, 1H), 4,72-4,66 (m, 1H), 2,86-2,84 (m, 2H), 2,71-2,58 (m, 1H), 2,02-1,92 (m, 1H), 1,21(d, J = 6,0 Гц, 3H), 0,91-0,80(m, 1H), 0,60-0,59 (m, 2H), 0,41-0,27 (m, 2H); 3H не наблюдались (2 NH и OH).
225	MS m/z: 378. [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (400 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 9,04 (s, 1H), 8,09-7,91(m, 2H), 7,08(d, J = 8,0 Гц, 1H), 7,21(dd, J = 1,8 Гц, 1H), 7,18(d, J = 1,6 Гц, 1H), 4,85-4,82 (m, 1H), 4,72-4,68 (m, 1H), 2,84-2,81(m, 2H), 2,72-2,62(m, 1H), 1,99-1,92(m, 1H), 1,21(d, J = 6,4 Гц, 3H), 0,90-0,78(m, 1H), 0,60-0,58 (m, 2H), 0,38-0,31 (m, 2H); 3H не наблюдались (2 NH и OH).
226	MS m/z: 420,1 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 11,17 (s, 1H), 9,04 (s, 1H), 8,87 (s, 1H), 7,96 (d, J = 8,4 Гц, 1H), 7,82 (d, J = 1,6 Гц, 1H), 7,75 (q, J = 8,0 Гц, 1H), 7,47 (s, 1H), 4,65 (q, J = 11,2 Гц, 2H), 3,98 (s, 3H), 2,54-2,76 (m, 4H), 1,93 (d, J = 19,6 Гц, 1H), 1,08 (d, J = 6,4 Гц, 3H), 0,76-0,79 (m, 1H), 0,44 (d, J = 4,8 Гц, 2H), 0,24-0,31 (m, 2H).
227	MS m/z: 422,1 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 11,21 (s, 1H), 9,05 (s, 1H), 8,89 (d, J=0,8 Гц, 1H), 7,98 (d, J = 8,0 Гц, 1H), 7,84 (d, J = 1,6 Гц, 1H), 7,76 (q, J = 8,0 Гц, 1H), 7,49 (d, J=1,2 Гц, 1H), 4,67 (q, J = 36,0 Гц, 2H), 4,01 (d, J=7,6 Гц, 3H), 2,75-2,77 (m, 1H), 2,57-2,66 (m, 2H), 2,42-2,46 (m, 2H), 1,64-1,69 (m, 1H), 1,10 (d, J = 6,4 Гц, 3H), 1,00 (d, J = 3,6 Гц, 3H), 0,98 (d, J=3,6 Гц, 3H).

Соед	Данные
228	MS m/z: 408,2 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (400 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 8,97 (s, 1H), 8,75 (s, 1H), 7,85 (d, J=8,4 Гц, 1H), 7,57 (t, J = 6,0 Гц, 2H), 7,17 (s, 1H), 4,75 (q, J= 48,0 Гц, 2H), 4,02 (s, 3H), 2,88-2,93 (m, 1H), 2,57-2,71 (m, 3H), 1,48-1,55 (m, 2H), 1,18 (d, J = 6,4 Гц, 3H), 1,03 (d, J = 7,6 Гц, 3H); 2H не наблюдались (NH и OH).
229	MS m/z: 380,0 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 9,06 (s, 1 H), 8,13-7,92(m, 2H), 7,83(d, J= 8,4 Гц, 1H), 7,23(dd, J= 1,0 Гц, 1H), 7,20 (s, 1H), 4,87-4,86 (m, 1H), 4,71-4,70 (m, 1H), 2,93-2,82 (m, 1H), 2,69-2,64 (m, 2H), 2,53-2,48 (m, 1H), 1,77-1,70 (m, 1H), 1,22(d, J= 3,0 Гц, 3H), 1,09-1,07(m, 6H); 3H не наблюдались (2 NH и OH).
230	MS m/z: 422,0 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (400 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 9,02 (s, 1H), 8,80 (s, 1H), 7,90 (d, J=8,4 Гц, 1H), 7,62 (q, J = 14,8 Гц, 2H), 7,22 (s, 1H), 4,92 (q, J= 12,4 Гц, 1H), 4,76 (d, J= 11,6 Гц, 1H), 4,07 (s, 3H), 2,94 (s, 1H), 2,65-2,76 (m, 2H), 2,55-2,56 (m, 1H), 1,73-1,75 (m, 1H), 1,24 (d, J = 6,0 Гц, 3H), 1,08 (d, J = 6,4 Гц, 6H); 2H не наблюдались (NH и OH).
231	MS m/z 392,3 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 11,31 (s, 1H), 9,08 (s, 1H), 8,22 (s, 1H), 7,93 (s, 1H), 7,84 (d, J = 8,0 Гц, 1H), 7,22 (d, J = 8,0 Гц, 1H), 7,21 (s, 1H), 4,69-4,52 (m, 2H), 4,12-4,08 (m, 1H), 3,17 (d, J = 5,0 Гц, 3H), 2,08-1,78 (m, 6H), 1,28-1,00 (m, 4H); 2H не наблюдались (2 NHs).
232	MS m/z 379,5 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ 11,01 (s, 1H), 9,14 (s, 1H), 9,07 (s, 1H), 7,96 (d, J = 8,1 Гц, 1H), 7,58 (d, J = 1,7 Гц, 1H), 7,53 (dd, J = 8,1, 1,6 Гц, 1H), 7,03 (s, 1H), 4,81 – 4,65 (m, 2H), 3,45 (ddt, J = 17,6, 14,2, 6,9 Гц, 3H), 3,15 – 3,07 (m, 1H), 2,73 – 2,64 (m, 1H), 2,41 (s, 3H), 1,04 (tp, J = 8,7, 4,7 Гц, 1H), 0,67 (ttt, J = 13,4, 8,7, 4,7 Гц, 2H), 0,56 (dq, J = 9,9, 4,7 Гц, 1H), 0,44 (dq, J = 8,6, 4,5 Гц, 1H).
233	MS m/z 365,4 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ 9,05 (s, 1H), 8,26 (s, 1H), 7,98 (d, J = 8,1 Гц, 1H), 7,63 (d, J = 1,7 Гц, 1H), 7,58 (dd, J = 8,1, 1,6 Гц, 1H), 7,42 (s, 1H), 4,76 – 4,60 (m, 2H), 3,42 – 3,21 (m, 3H), 2,96 (td, J = 12,9, 3,5 Гц, 1H), 2,43 (td, J = 9,9, 3,3 Гц, 1H), 1,01 – 0,92 (m, 1H), 0,60 (dt, J = 13,1, 8,6, 4,0 Гц, 2H), 0,47 (dq, J = 9,6, 4,5 Гц, 1H), 0,41 – 0,34 (m, 1H); 2H не наблюдались (NH и OH).
234	MS m/z: 408,1 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (400 МГц, метанол- <i>d</i> ₄ and CDCl ₃) δ: 9,05 (s, 1H), 8,81 (d, J=0,8 Гц, 1H), 7,93 (d, J=8,4 Гц, 1H), 7,62-7,65 (m, 2H), 7,24 (d, J=0,8 Гц, 1H), 4,86 (d, J= 12,8 Гц, 1H), 4,78 (d, J= 13,6 Гц, 1H), 4,07 (s, 3H), 2,93-2,97 (m, 1H), 2,63-2,75 (m, 3H), 1,53-1,59 (m, 2H), 1,23 (d, J = 6,4 Гц, 3H), 1,08 (t, J = 7,6 Гц, 3H); 2H не наблюдались (NH и OH).
235	MS m/z: 420,0 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (400 МГц, метанол- <i>d</i> ₄ and CDCl ₃) δ: 9,06 (s, 1H), 8,79 (s, 1H), 7,93 (d, J=8,0 Гц, 1H), 7,61-7,65 (m, 2H), 7,25 (d, J=0,8 Гц, 1H), 4,87 (q, J= 16,0 Гц, 2H), 4,06 (s, 3H), 4,92 (t, J=3,0 Гц, 2H), 2,68-2,74 (m, 1H), 1,98-2,04 (m, 1H), 1,23 (q, J = 16,0 Гц, 3H), 0,83-0,89 (m, 1H), 0,60-0,63 (m, 2H), 0,36-0,37 (m, 2H); 2H не наблюдались (NH и OH).

Соед	Данные
236	MS m/z 410,3 $[M+H]^+$; 1H ЯМР (500 МГц, метанол- d_4) δ : 9,02 (s, 1H), 7,97 (s, 1H), 7,82 (d, $J = 8,5$ Гц, 1H), 7,20 (d, $J = 8,5$ Гц, 1H), 7,19 (s, 1H), 4,73-4,69 (m, 2H), 2,95-2,86 (m, 1H), 2,78-2,73 (m, 1H), 2,62 (t, $J = 11,5$ Гц, 1H), 2,52 (t, $J = 13,0$ Гц, 1H), 2,41-2,32 (m, 1H), 2,17-2,10 (m, 2H), 2,03-1,86 (m, 4H), 1,20 (d, $J = 6,0$ Гц, 3H); 3H не наблюдались (2 NH и OH).
238	MS m/z 409,4 $[M+H]^+$; 1H ЯМР (500 МГц, метанол- d_4) δ : 9,03 (s, 1H), 7,99 (s, 1H), 7,84 (s, 1H), 7,80 (d, $J = 8,5$ Гц, 1H), 7,17 (d, $J = 8,0$ Гц, 1H), 7,14 (s, 1H), 4,77-4,67 (m, 2H), 2,92-2,86 (m, 1H), 2,76 (t, $J = 9,5$ Гц, 1H), 2,63 (t, $J = 13,0$ Гц, 1H), 2,53 (t, $J = 13,0$ Гц, 1H), 2,41-2,32 (m, 1H), 2,16-2,09 (m, 2H), 2,02-1,85 (m, 4H), 1,20 (d, $J = 6,5$ Гц, 3H); 2H не наблюдались (NH и OH).
239	MS m/z 384,5 $[M+H]^+$; 1H ЯМР (500 МГц, ДМСО- d_6) δ 11,00 (s, 1H), 10,39 (s, 1H), 9,10 (s, 1H), 8,01 (d, $J = 8,1$ Гц, 1H), 7,95 (s, 1H), 7,88 (d, $J = 1,5$ Гц, 1H), 4,83 (dd, $J = 38,0, 13,7$ Гц, 2H), 3,49 – 3,38 (m, 2H), 3,21 (tt, $J = 19,0, 11,0$ Гц, 3H), 1,98 (h, $J = 6,8$ Гц, 1H), 1,07 (dd, $J = 6,9, 4,3$ Гц, 6H); 1 H не наблюдался (NH или OH).
240	MS m/z 406,4 $[M+H]^+$; 1H ЯМР (500 МГц, метанол- d_4) δ : 9,06 (s, 1H), 7,85 (d, $J = 8,5$ Гц, 1H), 7,63 (s, 1H), 7,40 (d, $J = 8,5$ Гц, 1H), 7,39 (s, 1H), 6,66 (s, 1H), 4,75 (d, $J = 13,5$ Гц, 2H), 3,96 (s, 3H), 2,96-2,90 (m, 1H), 2,82-2,76 (m, 1H), 2,66 (t, $J = 13,0$ Гц, 1H), 2,55 (t, $J = 13,0$ Гц, 1H), 2,42-2,33 (m, 1H), 2,18-2,11 (m, 2H), 2,04-1,86 (m, 4H), 1,22 (d, $J = 6,5$ Гц, 3H); 2H не наблюдались (NH и OH).
245	MS m/z 396,3 $[M+H]^+$; 1H ЯМР (500 МГц, ДМСО- d_6) δ 10,95 (s, 1H), 9,09 (s, 1H), 7,98 (d, $J = 8,1$ Гц, 1H), 7,89 (d, $J = 1,5$ Гц, 1H), 7,82 (dd, $J = 8,2, 1,6$ Гц, 1H), 4,80 – 4,68 (m, 2H), 3,52 – 3,32 (m, 4H), 3,11 (dq, $J = 14,2, 8,1$ Гц, 1H), 2,80 (s, 3H), 2,70 (t, $J = 6,2$ Гц, 1H), 1,05 (tp, $J = 8,8, 4,8$ Гц, 1H), 0,68 (dtq, $J = 17,2, 8,6, 4,6, 4,0$ Гц, 2H), 0,56 (dq, $J = 9,8, 4,6$ Гц, 1H), 0,45 (dq, $J = 8,7, 4,5$ Гц, 1H); 1H не наблюдался (NH or OH).
246	MS m/z 395,3 $[M+H]^+$; 1H ЯМР (500 МГц, ДМСО- d_6) δ 9,11 (s, 1H), 7,98 (s, 1H), 7,91 (d, $J = 8,2$ Гц, 1H), 7,63 (d, $J = 1,6$ Гц, 1H), 7,55 (dd, $J = 8,3, 1,6$ Гц, 1H), 4,78 – 4,66 (m, 2H), 3,45 (td, $J = 14,1, 13,3, 6,2$ Гц, 3H), 3,11 (dtd, $J = 12,8, 8,8, 4,4$ Гц, 1H), 2,74 (s, 3H), 2,71 – 2,64 (m, 1H), 1,04 (tt, $J = 8,3, 3,9$ Гц, 1H), 0,67 (dtq, $J = 17,2, 8,6, 4,4$ Гц, 2H), 0,56 (dq, $J = 10,0, 4,7$ Гц, 1H), 0,44 (dq, $J = 8,7, 4,5$ Гц, 1H); 2H не наблюдались (NH и OH).
247	MS m/z 394,3 $[M+H]^+$; 1H ЯМР (500 МГц, метанол- d_4) δ : 9,02 (s, 1H), 8,10-7,90 (s, 2H), 7,80 (d, $J = 8,5$ Гц, 1H), 7,21 (d, $J = 8,5$ Гц, 1H), 7,19 (s, 1H), 4,86 (d, $J = 12,5$ Гц, 1H), 4,68 (d, $J = 12,5$ Гц, 1H), 2,93-2,84 (m, 1H), 2,76 (t, $J = 11,5$ Гц, 1H), 2,62 (t, $J = 12,5$ Гц, 1H), 2,50 (t, $J = 13,0$ Гц, 1H), 1,21 (d, $J = 6,5$ Гц, 3H), 1,06 (s, 9H); 3H не наблюдались (2 NH и OH).
248	MS m/z 412,5 $[M+H]^+$; 1H ЯМР (500 МГц, метанол- d_4) δ : 9,00 (s, 1H), 7,95 (s, 1H), 7,80 (d, $J = 9,0$ Гц, 1H), 7,18 (d, $J = 9,0$ Гц, 1H), 7,17 (s, 1H), 4,68 (d, $J = 13,0$ Гц, 1H), 3,74 (t, $J = 5,5$ Гц, 1H), 3,67 (q, $J = 5,0$ Гц, 2H), 3,58 (t, $J = 5,0$ Гц, 1H), 2,94-2,86 (m, 1H), 2,77 (t, $J = 12,0$ Гц, 1H), 2,63 (t, $J = 12,5$ Гц, 1H), 2,52 (dd, $J = 10,5, 2,0$ Гц, 1H), 1,22 (d, $J = 6,5$ Гц, 3H), 1,05 (s, 9H).

Соед	Данные
249	MS m/z 364,3 $[M+H]^+$; 1H ЯМР (500 МГц, метанол- d_4) δ : 9,03 (s, 1H), 8,10-7,90 (s, 2H), 7,80 (d, $J = 8,0$ Гц, 1H), 7,21 (d, $J = 8,0$ Гц, 1H), 7,18 (s, 1H), 5,94-5,86 (m, 1H), 5,40 (d, $J = 17,5$ Гц, 1H), 5,28 (d, $J = 11,0$ Гц, 1H), 4,77-4,70 (m, 2H), 3,42-3,39 (m, 1H), 2,98-2,91 (m, 1H), 2,77 (t, $J = 12,5$ Гц, 1H), 2,65 (t, $J = 12,5$ Гц, 1H), 1,21 (d, $J = 6,5$ Гц, 3H); 3H не наблюдались (2 NH и OH).
250	MS m/z 383,3 $[M+H]^+$; 1H ЯМР (500 МГц, ДМСО- d_6) δ : 11,23 (br s, 1H), 9,40 (s, 1H), 9,15 (s, 1H), 9,12 (br s, 1H), 9,06 (s, 1H), 7,96 (d, $J = 8,1$ Гц, 1H), 7,44 (dd, $J = 8,2, 1,8$ Гц, 1H), 7,40 (s, 1H), 4,85 (d, $J = 13,8$ Гц, 1H), 4,77 (d, $J = 14,1$ Гц, 1H), 3,55 – 3,33 (m, 2H), 3,32 – 3,06 (m, 3H), 2,12 – 1,88 (m, 1H), 1,07 (app t, $J = 6,0$ Гц, 6H).
251	MS m/z 405,3 $[M+H]^+$; 1H ЯМР (500 МГц, ДМСО- d_6) δ 9,12 (s, 1H), 8,27 (d, $J = 5,3$ Гц, 1H), 7,97 (d, $J = 8,1$ Гц, 1H), 7,40 (dd, $J = 8,1, 1,8$ Гц, 1H), 7,35 (d, $J = 1,8$ Гц, 1H), 7,30 (dd, $J = 5,3, 1,6$ Гц, 1H), 7,09 (d, $J = 1,5$ Гц, 1H), 4,81 – 4,65 (m, 2H), 3,52 – 3,38 (m, 3H), 3,18 (s, 3H), 3,15 – 3,05 (m, 1H), 2,75 – 2,63 (m, 1H), 1,04 (tq, $J = 8,7, 4,3$ Гц, 1H), 0,68 (dddd, $J = 15,3, 12,6, 8,2, 4,4$ Гц, 2H), 0,56 (dq, $J = 9,8, 4,6$ Гц, 1H), 0,44 (dq, $J = 8,5, 4,5$ Гц, 1H); 2H не наблюдались (NH и OH).
252	MS m/z 381,2 $[M+H]^+$; 1H ЯМР (500 МГц, ДМСО- d_6) δ 11,04 (s, 1H), 9,19 (d, $J = 4,7$ Гц, 1H), 9,12 (s, 1H), 8,00 – 7,93 (m, 2H), 7,71 (d, $J = 1,6$ Гц, 1H), 7,65 (dd, $J = 8,2, 1,7$ Гц, 1H), 4,81 – 4,65 (m, 2H), 3,51 – 3,40 (m, 3H), 3,16 – 3,04 (m, 1H), 2,70 (d, $J = 9,9$ Гц, 1H), 1,04 (ddt, $J = 13,0, 8,6, 4,5$ Гц, 1H), 0,67 (dt, $J = 21,3, 8,6, 4,2$ Гц, 2H), 0,56 (dq, $J = 9,8, 4,6$ Гц, 1H), 0,45 (dq, $J = 8,4, 4,5$ Гц, 1H); 1H не наблюдался (NH или OH).
253	MS m/z 397,3 $[M+H]^+$; 1H ЯМР (500 МГц, ДМСО- d_6) δ : 11,18 (br s, 1H), 9,01 (s, 1H), 8,48 (s, 1H), 7,97 (d, $J = 7,9$ Гц, 1H), 7,18 – 7,12 (m, 2H), 4,65 (d, $J = 12,6$ Гц, 1H), 4,55 (d, $J = 12,7$ Гц, 1H), 3,16 – 2,96 (m, 2H), 2,75 (dd, $J = 12,6, 10,5$ Гц, 1H), 2,68 (td, $J = 11,6, 3,3$ Гц, 1H), 2,40 (s, 3H), 2,37-2,33 (m, 1H), 1,65 (q, $J = 6,7$ Гц, 1H), 0,97 (dd, $J = 6,8, 2,2$ Гц, 6H); 1 H не наблюдался (NH или OH).
254	MS m/z 344,3 $[M+H]^+$; 1H ЯМР (500 МГц, ДМСО- d_6) δ : 9,37 (s, 1H), 8,27 (s, 1H), 7,15 (d, $J = 8,5$ Гц, 1H), 7,12 (s, 1H), 7,12 (d, $J = 8,5$ Гц, 1H), 4,09 (d, $J = 13,0$ Гц, 1H), 3,91 (d, $J = 13,0$ Гц, 1H), 2,93 (t, $J = 5,0$ Гц, 1H), 2,87-2,84 (m, 1H), 2,77 (t, $J = 5,0$ Гц, 1H), 2,11-2,04 (m, 1H), 1,98 (t, $J = 12,5$ Гц, 1H), 1,83 (t, $J = 13,0$ Гц, 1H), 1,70 (d, $J = 11,0$ Гц, 1H), 0,39 (d, $J = 4,0$ Гц, 2H), 0,25 (s, 9H).
255	MS m/z 344,3 $[M+H]^+$; 1H ЯМР (500 МГц, ДМСО- d_6) δ : 9,19 (s, 1H), 9,09 (s, 1H), 8,87 (s, 1H), 8,49 (s, 1H), 7,97 (d, $J = 8,0$ Гц, 1H), 7,88 (s, 1H), 7,75 (d, $J = 8,0$ Гц, 1H), 7,45 (s, 1H), 4,95 (d, $J = 13,5$ Гц, 1H), 4,80 (d, $J = 13,5$ Гц, 1H), 3,98 (s, 3H), 3,40-3,25 (m, 3H), 3,17-3,09 (m, 1H), 1,50 (d, $J = 6,0$ Гц, 3H), 1,12 (s, 9H).
256	MS m/z : 419,0 $[M+H]^+$; 1H ЯМР (400 МГц, ДМСО- d_6) δ : 11,25 (m, 1H), 9,03 (s, 1H), 8,24 (d, $J = 5,2$ Гц, 1H), 7,94 (d, $J = 8,4$ Гц, 1H), 7,33 (m, 3H), 7,08 (d, $J = 0,8$ Гц, 1H), 4,63 (q, $J = 34,4$ Гц, 2H), 3,90 (s, 3H), 2,74 (q, $J = 1,6$ Гц, 2H), 2,55 (d, $J = 12,4$ Гц, 1H), 1,93 (m, 1H), 1,07 (d, $J = 6,4$ Гц, 3H), 0,77 (m, 1H), 0,45 (m, 2H), 0,27 (m, 3H).

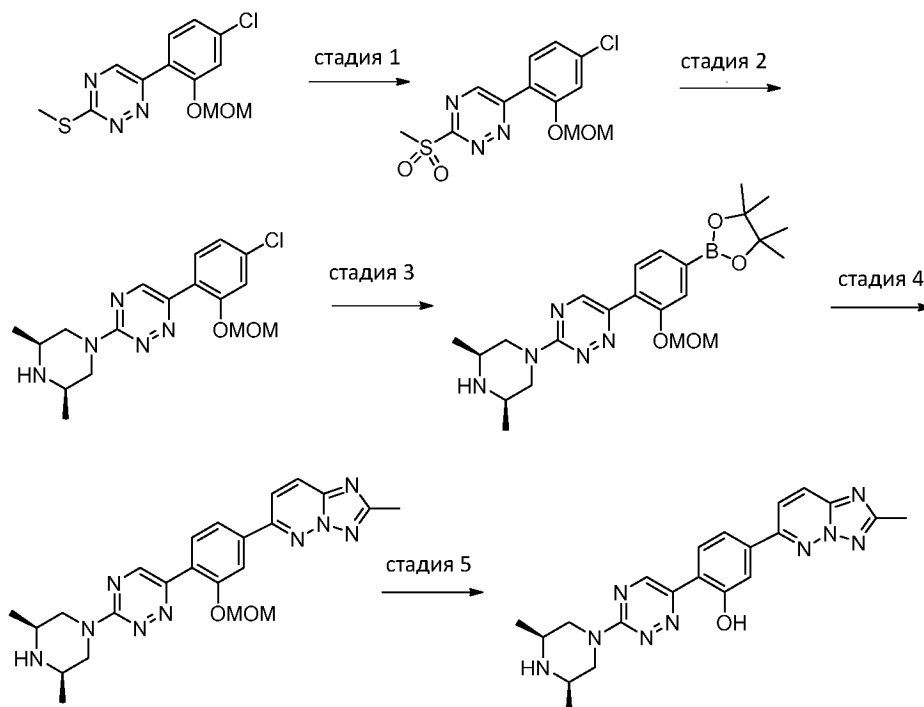
Соед	Данные
257	MS m/z: 421,0 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 11,28 (s, 1H), 9,03 (s, 1H), 8,24 (d, J=5,2 Гц, 1H), 7,95 (d, J=8,4 Гц, 1H), 7,33 (m, 3H), 7,08 (d, J=0,8 Гц, 1H), 4,64 (q, J=25,6 Гц, 2H), 3,87 (s, 3H), 2,74 (m, 1H), 2,59 (q, J=12,4 Гц, 1H), 2,43 (m, 2H), 1,64 (m, 1H), 1,07 (t, J=6,4 Гц, 3H), 0,97 (m, 6H); 1 H не наблюдался.
258	MS m/z 398,3 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 10,21 (s, 1H), 9,20 (s, 1H), 8,02 (d, J=8,2 Гц, 1H), 7,98 (s, 1H), 7,97 (br s, 1H), 5,22 (br d, J=11,9 Гц, 1H), 5,09 (d, J=14,0 Гц, 1H), 3,57 (d, J=11,9 Гц, 1H), 3,35-3,48 (m, 2H), 3,19-3,29 (m, 2H), 1,25 (s, 9H); 2 H не наблюдались (NH и OH).
259	MS m/z 381,4 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ: 11,35 (br s, 1H), 9,45 (br s, 1H), 9,13 (s, 1H), 8,62 (s, 1H), 7,98 (d, J = 8,1 Гц, 1H), 7,74 (s, 1H), 7,72 – 7,60 (m, 1H), 4,91 (d, J = 13,9 Гц, 1H), 4,83 (d, J = 14,2 Гц, 1H), 4,00 (s, 3H), 3,58-3,52 (m, 2H), 3,50 – 3,42 (m, 2H), 3,35-3,32 (m, 1H), 2,10 (q, J = 6,8 Гц, 1H), 1,13 (t, J = 6,3 Гц, 6H).
260	MS m/z 381,4 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 11,03 (br s, 1H), 9,27 (br s, 1H), 9,15 (br s, 1H), 8,56 (s, 1H), 7,92 (d, J = 8,0 Гц, 1H), 7,54 (s, 1H), 7,42 (d, J = 8,1 Гц, 1H), 4,85 (d, J = 13,9 Гц, 1H), 4,77 (d, J = 14,1 Гц, 1H), 4,11 (s, 3H), 3,54 – 3,34 (m, 2H), 3,28-3,23 (m, 1H), 3,15 (d, J = 10,4 Гц, 2H), 2,14 – 1,94 (m, 1H), 1,08 (t, J = 6,1 Гц, 6H).
261	MS m/z 381,3 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 11,17 (br s, 1H), 9,21-9,36 (m, 1H), 9,10 (s, 1H), 7,99 (d, J = 8,3 Гц, 1H), 7,97 (s, 1H), 7,25-7,23 (m, 2H), 4,86 (d, J = 13,9 Гц, 1H), 4,78 (d, J = 14,5 Гц, 1H), 4,13 (s, 3H), 3,55 – 3,36 (m, 3H), 3,30-3,25 (m 1H), 3,17-3,15 (m, 1H), 2,04 (h, J = 6,8 Гц, 1H), 1,08 (t, J = 6,5 Гц, 6H).
262	MS m/z 381,3 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 11,17 (br s, 1H), 9,36 (br s, 1H), 9,10 (s, 1H), 8,30 – 7,74 (m, 2H), 7,25-7,23 (m, J = 7,9 Гц, 2H), 4,86 (d, J = 13,9 Гц, 1H), 4,78 (d, J = 14,5 Гц, 1H), 4,13 (s, 3H), 3,49 (t, J = 13,0 Гц, 1H), 3,42-3,39 (m, 2H), 3,29-3,25 (m, 1H), 3,15-3,13 (m, 1H), 2,04 (q, J = 6,8 Гц, 1H), 1,08 (t, J = 6,5 Гц, 6H).
265	MS m/z 384,3 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 11,21 (br s, 1H), 9,47 (s, 1H), 9,12 (s, 1H), 8,74 (br s, 1H), 8,03 (d, J = 8,4 Гц, 1H), 7,77-7,77 (m, 2H), 4,83 (d, J = 13,7 Гц, 1H), 4,75 (d, J = 13,9 Гц, 1H), 3,35-3,32 (m, 2H), 3,18-3,10 (m, 3H), 1,94-1,92 (m, 1H), 1,05 (dd, J = 7,0, 3,9 Гц, 6H).
266	MS m/z: 407,1 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (400 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 9,07 (s, 1H), 8,18 (d, J=6,0 Гц, 1H), 7,94 (d, J=8,0 Гц, 1H), 7,30-7,33 (m, 2H), 7,26 (q, J=8,0 Гц, 1H), 7,07 (d, J=0,8 Гц, 1H), 4,83-4,89 (m, 1H), 4,74 (d, J=11,6 Гц, 1H), 3,96 (s, 3H), 2,85-2,89 (m, 1H), 2,58-2,67 (m, 3H), 1,52-1,57 (m, 2H), 1,19 (d, J = 6,4 Гц, 3H), 1,06 (t, J=7,4 Гц, 3H); 2H не наблюдались (NH и OH).
267	MS m/z: 384,0 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 9,00 (d, J=9,6 Гц, 2H), 8,02 (d, J=8,0 Гц, 1H), 7,62-7,66 (m, 2H), 4,66 (q, J=24,0 Гц, 2H), 2,75 (d, J=6,8 Гц, 1H), 2,52-2,57 (m, 2H), 1,38-1,45 (m, 2H), 1,23 (s, 1H), 1,07 (d, J = 6,0 Гц, 3H), 0,95 (t, J=7,4 Гц, 3H); 2H не наблюдались (NH и OH).

Соед	Данные
268	MS m/z : 397,9 $[M+H]^+$; 1H ЯМР (400 МГц, ДМСО- d_6) δ : 11,28 (s, 1H), 8,99 (d, $J=9,6$ Гц, 2H), 8,02 (d, $J=8,0$ Гц, 1H), 7,64 (t, $J=12,6$ Гц, 2H), 4,67 (q, $J=7,8$ Гц, 2H), 2,75 (s, 1H), 2,56-2,65 (m, 2H), 2,41-2,49 (m, 1H), 1,64-1,66 (m, 1H), 1,23 (s, 1H), 1,08 (d, $J=6,0$ Гц, 3H), 0,97 (t, $J=5,2$ Гц, 6H).
269	MS m/z : 396,1 $[M+H]^+$; 1H ЯМР (400 МГц, ДМСО- d_6) δ : 11,24 (s, 1H), 9,04 (s, 1H), 8,99 (s, 1H), 8,02 (d, $J=8,0$ Гц, 1H), 7,65 (d, $J=16,4$ Гц, 2H), 4,70 (d, $J=24,0$ Гц, 2H), 2,85 (s, 2H), 1,22 (s, 2H), 1,14 (s, 3H), 0,81 (s, 1H), 0,50 (s, 2H), 0,31 (d, $J=19,6$ Гц, 2H); 1 H не наблюдался (NH или OH).
270	MS m/z 383,1 $[M+H]^+$; 1H ЯМР (500 МГц, ДМСО- d_6) δ : 9,59 (s, 1H), 9,34 (s, 1H), 9,08 (s, 1H), 8,62 (s, 1H), 7,96 (d, $J=8,5$ Гц, 1H), 7,80 (s, 1H), 7,37 (s, 2H), 4,84 (d, $J=13,9$ Гц, 1H), 4,76 (d, $J=14,1$ Гц, 1H), 3,51 (t, $J=12,6$ Гц, 1H), 3,39 (d, $J=12,8$ Гц, 1H), 3,28 (dd, $J=13,8, 11,0$ Гц, 1H), 3,17 – 3,09 (m, 2H), 2,06 (h, $J=6,8$ Гц, 1H), 1,07 (d, $J=6,8$ Гц, 6H).
271	MS m/z 421,2 $[M+H]^+$; 1H ЯМР (500 МГц, ДМСО- d_6) δ : 9,72 (s, 1H), 9,43 (s, 1H), 9,12 (s, 1H), 7,99 (d, $J=8,0$ Гц, 1H), 7,46 – 7,40 (m, 2H), 7,31 (s, 1H), 7,06 (s, 1H), 4,85 – 4,76 (m, 2H), 3,98 (s, 3H), 3,59 – 3,50 (m, 1H), 3,43 – 3,35 (m, 1H), 3,30 (dd, $J=14,0, 11,1$ Гц, 1H), 3,13 (d, $J=10,6$ Гц, 2H), 2,52 (s, 3H), 2,08 (h, $J=6,9$ Гц, 1H), 1,08 (d, $J=7,0$ Гц, 6H).
272	MS m/z 408,3 $[M+H]^+$; 1H ЯМР (500 МГц, ДМСО- d_6) δ : 9,25 (s, 1H), 8,69 (s, 1H), 7,91 (d, $J=7,9$ Гц, 1H), 7,38 (s, 1H), 7,26 (br d, $J=7,9$ Гц, 1H), 4,62 (d, $J=12,2$ Гц, 1H), 4,52 (br d, $J=11,9$ Гц, 1H), 2,91-3,04 (m, 2H), 2,71 (dd, $J=12,5, 10,5$ Гц, 1H), 2,64 (td, $J=11,6, 3,6$ Гц, 1H), 2,31 (ddd, $J=10,0, 6,7, 3,4$ Гц, 1H), 1,63 (dq, $J=13,4, 6,7$ Гц, 1H), 0,96 (dd, $J=6,7, 1,2$ Гц, 6H); 2 H не наблюдались (NH и OH).
273	MS m/z 408,4 $[M+H]^+$; 1H ЯМР (500 МГц, ДМСО- d_6) δ : 9,10 (s, 1H), 8,72 (s, 1H), 7,98 (d, $J=7,6$ Гц, 1H), 7,68 (s, 1H), 7,62 (d, $J=8,5$ Гц, 1H), 4,84 (d, $J=13,4$ Гц, 1H), 4,76 (d, $J=14,2$ Гц, 1H), 3,49 (t, $J=12,4$ Гц, 1H), 3,39 (d, $J=12,5$ Гц, 1H), 3,26 (dd, $J=13,1, 11,0$ Гц, 1H), 3,06-3,18 (m, 2H), 2,04 (dq, $J=14,0, 6,7$ Гц, 1H), 1,08 (t, $J=6,7$ Гц, 6H); 2 H не наблюдались (NH и OH).
275	MS m/z 419,5 $[M+H]^+$; 1H ЯМР (500 МГц, метанол- d_4) δ : 8,75 (s, 1H), 7,53 (d, $J=7,9$ Гц, 1H), 7,28 (s, 1H), 6,72 (dd, $J=8,2, 1,5$ Гц, 1H), 6,70 (s, 1H), 4,53 (d, $J=12,8$ Гц, 1H), 4,42 (br d, $J=12,8$ Гц, 1H), 3,93 (dd, $J=8,5, 8,0$ Гц, 2H), 3,64 (dd, $J=8,5, 8,0$ Гц, 2H), 2,86-2,99 (m, 2H), 2,76 (dd, $J=12,8, 10,7$ Гц, 1H), 2,64 (s, 3H), 2,59 (td, $J=12,5, 3,2$ Гц, 1H), 1,74 (td, $J=11,0, 3,7$ Гц, 1H), 0,56-0,72 (m, 1H), 0,35-0,44 (m, 2H), 0,02-0,20 (m, 2H); 2 H не наблюдались (NH и OH).
276	MS m/z 404,4 $[M+H]^+$; 1H ЯМР (500 МГц, метанол- d_4) δ : 9,11 (s, 1H), 7,93 (s, 1H), 7,82 (d, $J=8,2$ Гц, 1H), 7,15 (d, $J=8,2$ Гц, 1H), 7,11 (s, 1H), 4,95 (dd, $J=14,5, 2,5$ Гц, 1H), 4,86-4,89 (m, 1H), 4,14-4,23 (m, 2H), 3,61-3,77 (m, 1H), 3,52-3,59 (m, 1H), 3,48 (dd, $J=14,0, 10,7$ Гц, 1H), 3,14-3,22 (m, 3H), 2,72-2,81 (m, 2H), 2,67 (td, $J=10,2, 3,4$ Гц, 1H), 1,05-1,15 (m, 1H), 0,75-0,88 (m, 2H), 0,51-0,69 (m, 2H); 2 H не наблюдались (NH и OH).

Соед	Данные
277	MS m/z 418,5 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 9,13 (s, 1H), 7,86 (d, J=8,2 Гц, 1H), 7,74 (s, 1H), 7,08 (d, J=1,7 Гц, 2H), 4,92-5,03 (m, 1H), 4,83-4,86 (m, 1H), 4,19 (t, J=6,1 Гц, 2H), 3,36-3,56 (m, 3H), 3,12-3,26 (m, 1H), 3,04 (t, J=6,3 Гц, 2H), 2,52-2,69 (m, 1H), 2,06-2,19 (m, 2H), 1,93-2,00 (m, 2H), 0,97-1,16 (m, 1H), 0,76-0,92 (m, 2H), 0,38-0,65 (m, 2H); 2H не наблюдались (NH и OH).
278	MS m/z 406,5 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 11,22 (s, 1H), 9,04 (s, 1H), 7,90 (s, 1H), 7,84 (d, J = 8,0 Гц, 1H), 7,08-7,15 (m, 2H), 4,63 (d, J = 12,7 Гц, 1H), 4,53 (d, J = 12,6 Гц, 1H), 4,11 (t, J = 7,3 Гц, 2H), 2,91-3,19 (m, 4H), 2,60-2,81 (m, 4H), 2,37 (s, 1H), 1,63-1,68 (m, 1H), 0,98 (d, J = 6,9 Гц, 6H); 1H не наблюдался (OH или NH).
279	MS m/z 406,4 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 11,23 (s, 1H), 9,03 (s, 1H), 7,87 (d, J = 8,0 Гц, 1H), 7,30 (s, 1H), 7,16 (d, J = 8,6 Гц, 2H), 4,63 (d, J = 12,7 Гц, 1H), 4,54 (d, J = 12,7 Гц, 1H), 4,22 (t, J = 7,0 Гц, 2H), 2,89-3,13 (m, 2H), 2,67-2,89 (m, 4H), 2,55-2,65 (m, 2H), 2,35-2,43 (m, 1H), 1,66 (h, J = 6,8 Гц, 1H), 0,98 (d, J = 6,9 Гц, 6H); 1H не наблюдался (OH или NH).
280	MS m/z 418,1 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ: 12,31 (s, 1H), 8,81 (s, 1H), 7,85 (s, 1H), 7,61 (d, J = 8,3 Гц, 1H), 7,14 (d, J = 1,6 Гц, 1H), 7,07 (dd, J = 8,2, 1,7 Гц, 1H), 4,74-4,65 (m, 2H), 4,19 (t, J = 7,3 Гц, 2H), 3,22-3,17 (m, 1H), 3,14 (t, J = 12 Гц, 2H), 3,08 (td, J = 11,7, 3,1 Гц, 1H), 3,00 (t, J = 12 Гц, 1H), 2,85 (td, J = 11,7, 3,0 Гц, 1H), 2,76 – 2,67 (m, 2H), 1,95 (dd, J = 10,9, 2,8 Гц, 1H), 1,25 (s, 1H), 1,12 (s, 3H), 0,52-0,45 (m, 1H), 0,42-0,32 (m, 3H).
281	MS m/z 418,1 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ: 12,31 (s, 1H), 8,81 (s, 1H), 7,85 (s, 1H), 7,61 (d, J = 8,3 Гц, 1H), 7,14 (d, J = 1,6 Гц, 1H), 7,07 (dd, J = 8,2, 1,7 Гц, 1H), 4,74-4,65 (m, 2H), 4,19 (t, J = 7,3 Гц, 2H), 3,22-3,17 (m, 1H), 3,14 (t, J = 12 Гц, 2H), 3,08 (td, J = 11,7, 3,1 Гц, 1H), 3,00 (t, J = 12 Гц, 1H), 2,85 (td, J = 11,7, 3,0 Гц, 1H), 2,76 – 2,67 (m, 2H), 1,95 (dd, J = 10,9, 2,8 Гц, 1H), 1,25 (s, 1H), 1,12 (s, 3H), 0,52-0,45 (m, 1H), 0,42-0,32 (m, 3H).
282	MS m/z 422,4 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 11,01 (s, 1H), 9,09 (s, 1H), 7,83 (d, J = 8,2 Гц, 1H), 7,77 (s, 1H), 7,24 (d, J = 1,8 Гц, 1H), 7,20 (dd, J = 8,3, 1,6 Гц, 1H), 4,80 (d, J = 13,6 Гц, 1H), 4,68-4,75 (m, 1H), 4,46 (t, J = 5,2 Гц, 2H), 4,15 (t, J = 6,1 Гц, 2H), 3,38 (s, 2H), 2,93-3,20 (m, 3H), 2,23-2,28 (m, 2H), 1,80-2,01 (m, 1H), 1,05 (d, J = 6,8 Гц, 6H); 1H не наблюдался (OH или NH).
283	MS m/z 402,2 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 8,71 (s, 1H), 8,36 (s, 1H), 7,91 (d, J=1,6 Гц, 1H), 6,96 (s, 1H), 6,90 (d, J=12,4 Гц, 1H), 4,89 (d, J=13,3 Гц, 1H), 4,81 - 4,80 (m, 1H), 3,26-3,31 (m, 2H), 2,99-3,06 (m, 2H), 2,80-2,84 (m, 1H), 1,80-1,83 (m, 1H), 1,02 (d, J=6,8 Гц, 6H); 3H не наблюдались (2 NH и OH), 1H из соли муравьиной кислоты.
284	MS m/z 364,3 [M+H] ⁺

Пример 2

Получение соединения 100



Стадия 1: К перемешиваемому раствору 6-(4-хлор-2-(метоксиметокси)фенил)-3-(метилтио)-1,2,4-триазина (2,0 г, 6,7 ммоль) в CH_2Cl_2 (35 мл) частями добавляли mCPBA (4,6 г, 20 ммоль), и реакционную смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 5 часов. Затем её гасили насыщенным водным раствором NaHCO_3 . Органические слои сушили над MgSO_4 и концентрировали. Остаток очищали колоночной хроматографией с силикагелем, элюируя градиентом EtOAc/гексан (0-100% EtOAc), с получением 6-(4-хлор-2-(метоксиметокси)фенил)-3-(метилсульфонил)-1,2,4-триазина (1,75 г, выход 79%) в виде рыжевато-коричневого твердого вещества. ^1H ЯМР (500 МГц, CDCl_3) δ : 9,40 (s, 1H), 8,06 (d, $J=8,5$ Гц, 1H), 7,40 (d, $J=1,2$ Гц, 1H), 7,27 (dd, $J=8,5, 1,2$ Гц, 1H), 5,32 (s, 2H), 3,56 (s, 3H), 3,52 (s, 3H).

Стадия 2: К перемешиваемому раствору 6-(4-хлор-2-(метоксиметокси)фенил)-3-(метилсульфонил)-1,2,4-триазина (900 мг, 2,73 ммоль) в ACN (10 мл) добавляли цис-2,6-диметилпиперазин (400 мг, 3,5 ммоль) и DIPEA (1,0 мл, 5,73 ммоль). Реакционную смесь нагревали при 50 °C в течение 1 часа, пока СВЭЖХ не показала полное превращение в желаемый продукт. Растворитель удаляли при пониженном давлении, остаток очищали колоночной хроматографией на силикагеле, элюируя градиентом $\text{CH}_2\text{Cl}_2/\text{MeOH}$ (0-20% MeOH), с получением 6-(4-хлор-2-(метоксиметокси)фенил)-3-(цис-3,5-диметилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазина (993 мг, выход 70,5%) в виде

желтоватого твердого вещества. MS m/z 364,2, 366,2 $[M+H]^+$.

Стадия 3: Суспензию 6-(4-хлор-2-(метоксиметокси)фенил)-3-(цис-3,5-диметилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазина (650 мг, 1,79 ммоль), 4,4,5,5-тетраметил-2-(4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолан-2-ил)-1,3,2-диоксаборолана (780 мг, 2,68 ммоль), KOAc (525 мг, 5,35 ммоль), X Phos Pd G4 (80 мг, 0,09 ммоль) в сухом диоксане (12 мл) барботировали аргоном в течение 10 минут, затем нагревали до 90 °C в атмосфере аргона в течение 2 часов, после чего наблюдали полное превращение в 3-(цис-3,5-диметилпиперазин-1-ил)-6-(2-(метоксиметокси)-4-(4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолан-2-ил)фенил)-1,2,4-триазин. Реакционную смесь затем охлаждали до комнатной температуры, концентрировали и очищали колоночной хроматографией на силикагеле, элюируя градиентом $CH_2Cl_2/MeOH$ (0-15% MeOH), с получением 3-(цис-3,5-диметилпиперазин-1-ил)-6-(2-(метоксиметокси)-4-(4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолан-2-ил)фенил)-1,2,4-триазина (800 мг, 98% выход) в виде коричневых кристаллов. MS m/z 456,5 $[M+H]^+$.

Стадия 4: Смесь 3-(цис-3,5-диметилпиперазин-1-ил)-6-(2-(метоксиметокси)-4-(4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолан-2-ил)фенил)-1,2,4-триазина (60 мг, 0,13 ммоль), 6-бром-2-метил-[1,2,4]триазоло[1,5-*b*]пиридазина (42,0 мг, 0,20 ммоль), [1,1'-бис(дифенилфосфино)ферроцен]дихлорпалладия(II) (9,5 мг, 0,013 ммоль) и водного раствора карбоната калия (0,2 мл, 2 М) в диоксане (1 мл) дегазировали аргоном в течение 10 минут, затем нагревают до 90 °C в течение 1 часа. Смесь охлаждали до комнатной температуры и очищали непосредственно колоночной хроматографией на силикагеле, элюируя градиентом 0-20% метанола в дихлорметане, с получением 6-[4-[3-[цис-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил]-3-(метоксиметокси)фенил]-2-метил-[1,2,4]триазоло[1,5-*b*]пиридазина (50 мг, выход 83%). MS m/z 462,4 $[M+H]^+$.

Стадия 5: 6-[4-[3-[цис-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил]-3-(метоксиметокси)фенил]-2-метил-[1,2,4]триазоло[1,5-*b*]пиридазин (50 мг, 0,11 ммоль) растворяли в метаноле (2 мл), и добавляли HCl (4 моль/л) в 1,4-диоксане (0,2 мл, 0,8 ммоль). Реакционную смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 2 ч, концентрировали и очищали колоночной хроматографией на силикагеле, элюируя градиентом $CH_2Cl_2/MeOH$ (10-30% MeOH), с получением 2-[3-[цис-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(2-метил-[1,2,4]триазоло[1,5-*b*]пиридазин-6-ил)фенола дигидрохлорида в виде твердого вещества желтого цвета (30 мг, выход 47%). MS m/z 418,4 $[M+H]^+$; 1H ЯМР (500 МГц, $DMCO-d_6$) δ : 9,90 (s, 1H), 9,57 (s, 1H), 9,11 (s, 1H), 8,41 (d, $J = 9,5$ Гц, 1H), 8,18 (d, $J = 9,0$ Гц, 1H), 8,04 (d, $J = 8,5$ Гц,

1H), 7,80 (s, 1H), 7,71 (d, J = 8,0 Гц, 1H), 4,85 (d, J = 14,0 Гц, 2H), 3,35-3,38 (m, 2H), 3,19-3,23 (m, 2H), 3,17 (s, 3H), 1,38 (d, J = 6,0 Гц, 6H).

Используя методику, описанную выше для Примера 2, можно получить дополнительные соединения, описанные в настоящем документе, путем замены соответствующего исходного материала, подходящих реагентов и условий реакции с получением соединений, таких как соединения, выбранные из:

Соед	Данные
54	MS m/z 444,5 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 9,19 (s, 1H), 8,31 (br s, 1H), 8,07 - 8,09 (m, 1H), 7,95 - 7,97 (m, 1H), 3,53 - 3,57 (m, 4H), 3,44 - 3,53 (m, 2H), 3,19 - 3,26 (m, 1H), 2,65 - 2,68 (m, 6H), 1,06 - 1,11 (m, 1H), 0,81 - 0,85 (m, 2H), 0,57 - 0,60 (m, 2H); 3 H не наблюдались (2 NH и OH).
65	MS m/z 436,4 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 8,45 (s, 1H), 7,86 (s, 1H), 7,73 (d, J = 8,2 Гц, 1H), 7,39 (d, J = 12,7 Гц, 1H), 7,32 (d, J = 8,4 Гц, 1H), 7,27 (s, 1H), 6,05 (s, 1H), 4,41 - 4,20 (m, 5H), 4,01 - 3,90 (m, 1H), 3,76-3,59 (m, 4H), 1,40 (t, J = 6,8 Гц, 2H); 3H не наблюдались (NH and 2 OHs).
66	MS m/z 434,5 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 9,19 (s, 1H), 8,92 (s, 1H), 8,01-8,11 (m, 3H), 7,34-7,43 (m, 2H), 5,08 (br d, J=14,0 Гц, 2H), 3,45-3,55 (m, 2H), 3,13 (dd, J=14,2, 11,7 Гц, 2H), 2,61 (s, 3H), 1,48 (d, J=6,4 Гц, 6H); 2H не наблюдались (NH и OH).
67	MS m/z 420,4 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 8,49 - 8,44 (m, 1H), 7,88 (s, 1H), 7,74 (d, J = 8,2 Гц, 1H), 7,41 (d, J = 12,5 Гц, 1H), 7,33 (d, J = 8,4 Гц, 1H), 7,29 (s, 1H), 6,05 (s, 1H), 4,30 (s, 3H), 4,34-4,3 (m, 2H), 4,25 - 4,19 (m, 1H), 3,85 - 3,39 (m, 4H), 1,47-1,51 (m, 3H); 2H не наблюдались (NH и OH).
68	MS m/z 434,4 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 9,08 (s, 1H), 8,58 (s, 1H), 7,93 (d, J=7,9 Гц, 1H), 7,78 (s, 1H), 7,42 (d, J=11,9 Гц, 1H), 7,29 (d, J=7,6 Гц, 1H), 7,26 (s, 1H), 4,76 (q, J=13,5 Гц, 2H), 3,12-3,24 (m, 2H), 2,88 (td, J=12,5, 3,9 Гц, 1H), 2,82 (dd, J=13,0, 10,5 Гц, 1H), 2,63-2,73 (m, 1H), 2,43 (s, 3H), 1,57 (quin, J=7,5 Гц, 2H), 1,07 (t, J=7,5 Гц, 3H); 2H не наблюдались (NH и OH).
69	MS m/z 431,5 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 9,06 (s, 1H), 7,92 (d, J=8,5 Гц, 1H), 7,90 (s, 1H), 7,57-7,63 (m, 2H), 7,53 (s, 1H), 4,77 (d, J=12,6 Гц, 2H), 2,86-3,05 (m, 2H), 2,71 (t, J=12,6 Гц, 2H), 2,67 (s, 3H), 2,49 (s, 3H), 1,24 (d, J=6,4 Гц, 6H); 2H не наблюдались (NH и OH).
70	MS m/z 462,4 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 9,11 (s, 1H), 8,01 (br d, J=8,9 Гц, 1H), 7,72 (s, 1H), 7,71 (s, 1H), 7,49 (s, 1H), 4,84-4,86 (m, 1H), 4,74 (d, J=13,4 Гц, 1H), 4,28 (s, 3H), 3,12-3,23 (m, 2H), 2,79-2,95 (m, 2H), 2,62 (s, 3H), 2,50-2,56 (m, 1H), 1,77 (td, J=13,7, 7,0 Гц, 1H), 1,09 (d, J=6,7 Гц, 6H); 2 H не наблюдались (NH и OH).

Соед	Данные
71	MS m/z 448,4 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 8,43 (s, 1H), 7,86 (s, 1H), 7,75 (d, J = 8,4 Гц, 1H), 7,29 (s, 3H), 6,06 (s, 1H), 4,40 - 4,18 (m, 5H), 3,84 - 3,42 (m, 5H), 2,19 - 2,04 (m, 1H), 1,28 - 1,14 (m, 6H); 2H не наблюдались (NH и OH).
72	MS m/z 416,6 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 9,07 (s, 1H), 8,20 (s, 1H), 7,95 (s, 1H), 7,87 (d, J = 7,9 Гц, 1H), 7,69 (d, J = 9,0 Гц, 1H), 7,66 - 7,62 (m, 1H), 7,31 - 7,27 (m, 2H), 4,87 (br d, J = 13,6 Гц, 2H), 4,24 (s, 3H), 3,16 (br s, 2H), 2,83 (t, J = 12,5 Гц, 2H), 1,32 (d, J = 6,4 Гц, 6H); 2H не наблюдались (NH и OH).
73	MS m/z 420,4 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 9,21 (s, 1H), 8,91 (s, 1H), 8,07 (s, 1H), 7,97-8,03 (m, 2H), 7,35-7,42 (m, 2H), 4,95 - 5,11 (m, 2H), 3,31-3,76 (m, 6H), 3,02 (s, 3H), 2,66 (s, 3H); 1H не наблюдался (OH).
74	MS m/z 434,4 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 8,45 (s, 1H), 7,88 (s, 1H), 7,75 (d, J = 8,2 Гц, 1H), 7,41 (d, J = 12,7 Гц, 1H), 7,34 (d, J = 8,2 Гц, 1H), 7,29 (s, 1H), 6,06 (s, 1H), 4,34-4,20 (m, 5H), 3,83 - 3,41 (m, 5H), 1,94 - 1,76 (m, 2H), 1,24 - 1,10 (m, 3H); 2H не наблюдались (NH и OH).
75	MS m/z 417,2 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 9,07 (s, 1H), 7,93 (s, 3H), 7,69 (d, J = 9,5 Гц, 1H), 7,65 - 7,60 (m, 2H), 4,78 (d, J = 13,1 Гц, 2H), 2,96 (br s, 2H), 2,67 (t, J = 12,1 Гц, 2H), 2,50 (s, 3H), 1,22 (d, J = 6,4 Гц, 6H); 2H не наблюдались (NH и OH).
76	MS m/z 434,4 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 8,42 (s, 1H), 7,86 (s, 1H), 7,74 (d, J = 7,3 Гц, 1H), 7,42 - 7,23 (m, 3H), 6,05 (d, J = 4,3 Гц, 1H), 4,31 (s, 3H), 4,17 - 3,91 (m, 4H), 3,83 - 3,70 (m, 2H), 1,52 - 1,44 (m, 3H), 1,42 - 1,37 (m, 3H); 2H не наблюдались (NH и OH).
77	MS m/z 434,4 [M+H] ⁺
78	MS m/z 446,4 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 9,44 (s, 1H), 9,33-9,41 (m, 1H), 9,17-9,23 (m, 1H), 9,13 (s, 1H), 7,98 (d, J=8,2 Гц, 1H), 7,84 (s, 1H), 7,74 (d, J=8,2 Гц, 1H), 4,85 (d, J=13,5 Гц, 1H), 4,78 (d, J=13,5 Гц, 1H), 3,45-3,55 (m, 1H), 3,41 (br d, J=12,5 Гц, 1H), 3,27 (dd, J=14,3, 10,7 Гц, 1H), 3,10-3,21 (m, 2H), 2,86 (s, 3H), 2,58 (s, 3H), 2,04 (sxt, J=6,4 Гц, 1H), 1,08 (t, J=6,1 Гц, 6H).
79	MS m/z 434,5 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 8,43 - 8,40 (m, 1H), 7,86 (s, 1H), 7,74 (d, J = 8,1 Гц, 1H), 7,41 - 7,30 (m, 2H), 7,29 (s, 1H), 6,06 (s, 1H), 4,40 - 4,32 (m, 1H), 4,28 (s, 3H), 4,26 - 4,18 (m, 1H), 3,73 - 3,59 (m, 2H), 3,52 - 3,39 (m, 2H), 1,54 - 1,45 (m, 6H); 2 H не наблюдались (NH и OH).
80	MS m/z 441,5 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 8,53 - 8,49 (m, 1H), 8,31 (s, 1H), 8,09 (s, 1H), 7,73 (d, J = 8,4 Гц, 1H), 7,31 (d, J = 8,2 Гц, 1H), 7,27 - 7,24 (m, 1H), 6,05 (s, 1H), 4,41 - 4,34 (m, 1H), 4,31 (s, 3H), 4,29 - 4,21 (m, 1H), 3,73-3,63 (m, 2H), 3,54 - 3,38 (m, 2H), 1,48-1,50 (m, 6H); 2 H не наблюдались (NH и OH).

Соед	Данные
81	MS m/z 448,2 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 9,05 (s, 1H), 8,31 (d, J = 2,4 Гц, 1H), 7,86 (d, J = 8,1 Гц, 1H), 7,77 (s, 1H), 7,35 - 7,23 (m, 3H), 4,76 - 4,66 (m, 1H), 4,26 (s, 3H), 3,23 - 3,09 (m, 2H), 2,94 - 2,81 (m, 2H), 2,57 - 2,49 (m, 1H), 1,81 - 1,71 (m, 1H), 1,08 (d, J = 6,9 Гц, 6H); 3H не наблюдались (NH, OH и 1 CH перекрывались с пиком растворителя).
82	MS m/z 403,3 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 7,81 (s, 1H), 7,65 (d, J = 2,1 Гц, 1H), 7,15 (d, J = 2,3 Гц, 1H), 7,05 (s, 1H), 6,66 (d, J = 8,7 Гц, 1H), 6,05 - 6,02 (m, 2H), 3,04 (s, 3H), 2,70-2,80 (m, 4H), 1,35-1,46 (m, 4H), 1,18 (s, 3H); 1H не наблюдался (OH).
83	MS m/z 432,5 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 9,49 (d, J = 10,7 Гц, 1H), 9,05-9,08 (m, 2H), 8,02 (s, 1H), 7,98 (d, J = 8,2 Гц, 1H), 7,70 (d, J = 1,8 Гц, 1H), 7,64 (dd, J = 8,2, 1,8 Гц, 1H), 4,81 (d, J = 13,9 Гц, 2H), 3,35 (s, 2H), 2,96-3,13 (m, 2H), 2,61 (s, 3H), 2,50 (s, 3H), 1,30 (d, J = 6,4 Гц, 6H).
85	MS m/z 431,4 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 11,32 (br s, 1H), 9,22 (s, 1H), 9,15 (s, 1H), 9,07 (br s, 1H), 7,95-8,05 (m, 2H), 7,84 (d, J=9,2 Гц, 1H), 7,42 (br dd, J=7,9, 1,3 Гц, 1H), 7,38 (s, 1H), 4,86 (br d, J=13,7 Гц, 1H), 4,79 (br d, J=14,0 Гц, 1H), 3,35-3,51 (m, 2H), 3,22-3,30 (m, 2H), 3,17 (s, 3H), 3,09-3,16 (m, 1H), 1,97-2,13 (m, 1H), 1,07 (dd, J=7,3, 4,5 Гц, 6H).
86	MS m/z 417,4 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 9,63 (d, J = 10,1 Гц, 1H), 9,40 (d, J = 1,5 Гц, 1H), 9,29 (s, 1H), 9,24 (d, J = 9,5 Гц, 1H), 9,13 (s, 1H), 8,12 (s, 1H), 8,02 (d, J = 8,2 Гц, 1H), 7,78 (d, J = 1,7 Гц, 1H), 7,65 (dd, J = 8,2, 1,8 Гц, 1H), 4,86 (d, J = 13,7 Гц, 2H), 3,35-3,43 (m, 1H), 3,05-3,19 (m, 3H), 2,53 (s, 3H), 1,37 (d, J = 6,4 Гц, 6H).
87	MS m/z 441,2 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 9,16 (s, 1H), 9,09 - 9,06 (m, 1H), 8,27 - 8,22 (m, 1H), 8,01 - 7,95 (m, 1H), 7,90 - 7,85 (m, 1H), 7,36 - 7,30 (m, 2H), 4,68 - 4,55 (m, 2H), 3,60 - 3,57 (m, 2H), 2,86 - 2,73 (m, 2H), 2,41 (s, 3H), 1,11 - 1,04 (m, 6H); 2H не наблюдались (NH и OH).
88	MS m/z 430,5 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 9,71 (br s, 1H), 9,42 (br s, 1H), 9,12 (s, 1H), 8,43 (s, 1H), 8,00 (s, 1H), 7,94 (d, J=8,2 Гц, 1H), 7,70 (d, J=8,5 Гц, 1H), 7,57 (dd, J=8,9, 1,8 Гц, 1H), 7,29-7,37 (m, 2H), 4,85 (br d, J=13,4 Гц, 1H), 4,77 (br d, J=14,0 Гц, 1H), 3,53 (td, J=12,5, 1,2 Гц, 1H), 3,40 (br d, J=12,5 Гц, 1H), 3,29 (dd, J=13,7, 11,3 Гц, 1H), 3,07-3,19 (m, 2H), 2,45 (s, 3H), 2,08 (dq, J=13,6, 6,8 Гц, 1H), 1,08 (t, J=6,8 Гц, 6H).
89	MS m/z 448,4 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 9,06 (s, 1H), 8,57 (s, 1H), 7,92 (br d, J=7,9 Гц, 1H), 7,78 (d, J=2,0 Гц, 1H), 7,41 (d, J=11,6 Гц, 1H), 7,28 (br d, J=7,9 Гц, 1H), 7,25 (s, 1H), 4,48 (br d, J=13,4 Гц, 1H), 4,43 (br d, J=12,8 Гц, 1H), 3,44-3,57 (m, 1H), 3,22 (dd, J=14,0, 8,5 Гц, 1H), 3,08 (dt, J=12,2, 3,0 Гц, 1H), 2,98 (dquin, J=13,7, 6,7 Гц, 1H), 2,62-2,72 (m, 1H), 2,54-2,61 (m, 1H), 2,47-2,53 (m, 1H), 2,46 (s, 3H), 1,21 (d, J=6,1 Гц, 3H), 1,15 (t, J=7,2 Гц, 3H); 1 H не наблюдался (OH).
90	MS m/z 448,5 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 9,61 (d, J = 10,4 Гц, 1H), 9,22 (d, J = 10,8 Гц, 1H), 9,13 (s, 1H), 8,04 (d, J = 8,1 Гц, 1H), 7,73-7,82 (m, 2H), 7,55 (s, 1H), 4,87 (d, J = 13,9 Гц, 2H), 4,22 (s, 3H), 3,37-3,42 (m, 2H), 3,11-3,17 (m, 2H), 2,52 (s, 3H), 1,36 (d, J = 6,5 Гц, 6H).

Соед	Данные
91	MS m/z 432,4 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 9,29 (s, 1H), 9,25 (s, 1H), 9,19 (s, 1H), 8,00 (d, J=7,9 Гц, 1H), 7,76 (s, 1H), 7,71 (br d, J=8,2 Гц, 1H), 5,10 (d, J=13,7 Гц, 1H), 4,99 (d, J=14,0 Гц, 1H), 3,44-3,61 (m, 2H), 3,25-3,32 (m, 2H), 3,14-3,22 (m, 1H), 2,67 (s, 3H), 2,07 (spt, J=6,8 Гц, 1H), 1,20 (d, J=6,8 Гц, 6H); 2H не наблюдались (NH и OH).
92	MS m/z 446,4 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 9,16 (s, 1H), 8,02 (br d, J=7,6 Гц, 1H), 7,99 (s, 1H), 7,67-7,73 (m, 2H), 5,03 (d, J=13,7 Гц, 1H), 4,92 (d, J=13,7 Гц, 1H), 3,37-3,49 (m, 2H), 3,11-3,27 (m, 2H), 2,95-3,03 (m, 1H), 2,74 (s, 3H), 2,64 (s, 3H), 1,88-2,02 (m, 1H), 1,16 (d, J=6,4 Гц, 6H); 2 H не наблюдались (NH и OH).
93	MS m/z 462,4 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 9,17 (s, 1H), 8,83 (s, 1H), 7,96 (br d, J=8,5 Гц, 1H), 7,74 (s, 1H), 7,68 (d, J=8,2 Гц, 1H), 5,09 (d, J=13,7 Гц, 1H), 4,98 (d, J=14,0 Гц, 1H), 4,27-4,36 (m, 2H), 3,70 (s, 3H), 3,43-3,62 (m, 1H), 3,24-3,32 (m, 1H), 3,05-3,20 (m, 1H), 2,62 (s, 3H), 2,02-2,16 (m, 1H), 1,19 (d, J=6,8 Гц, 6H); 2 H не наблюдались (NH и OH).
94	MS m/z 448,4 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 11,10 (br s, 1H), 9,16 (s, 1H), 9,14 (s, 1H), 8,20 (br s, 1H), 8,17 (s, 1H), 8,04 (d, J=8,2 Гц, 1H), 7,36-7,44 (m, J=2,1 Гц, 2H), 4,83 (d, J=10,7 Гц, 2H), 3,43 (s, 3H), 3,32-3,40 (m, 2H), 2,82 (d, J=4,6 Гц, 2H), 2,53 (s, 3H), 1,47 (d, J=5,5 Гц, 6H).
95	MS m/z 446,4 [M+H] ⁺
96	MS m/z 445,4 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 9,20 (s, 1H), 9,19 (s, 1H), 8,18 (s, 1H), 8,02 (d, J=8,2 Гц, 1H), 7,76 (br s, 1H), 7,71 (br d, J=8,2 Гц, 1H), 5,10 (d, J=14,6 Гц, 1H), 4,99 (d, J=14,6 Гц, 1H), 3,50-3,63 (m, 2H), 3,27-3,31 (m, 2H), 3,18-3,27 (m, 1H), 2,99 (s, 3H), 2,66 (s, 3H), 2,10 (qd, J=14,3, 6,7 Гц, 1H), 1,20 (dd, J=6,7, 2,7 Гц, 6H); 2H не наблюдались (NH и OH).
97	MS m/z 417,4 [M+H] ⁺
98	MS m/z 417,4 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 11,07 (s, 1H), 9,27 (br s, 1H), 9,11 (s, 1H), 8,07 (s, 1H), 8,01 (d, J=7,9 Гц, 1H), 7,71 (s, 1H), 7,64 (br d, J=8,2 Гц, 1H), 7,62 (s, 1H), 4,69-4,80 (m, 2H), 3,40-3,52 (m, 2H), 3,22-3,30 (m, 2H), 3,16 (td, J=12,8, 3,9 Гц, 1H), 2,62 (s, 3H), 2,42 (s, 3H), 1,33 (d, J=6,5 Гц, 3H).
99	MS m/z 446,2 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 9,08 (s, 1H), 8,55 (d, J = 2,4 Гц, 1H), 7,94 (d, J = 8,1 Гц, 1H), 7,87 (s, 1H), 7,42 - 7,36 (m, 1H), 7,33 (d, J = 8,2 Гц, 1H), 7,31 - 7,29 (m, 1H), 4,83 (d, J = 2,6 Гц, 2H), 4,23 (s, 3H), 3,22 - 2,99 (m, 3H), 2,80 (br s, 1H), 2,26 - 2,04 (m, 2H), 2,03 - 1,82 (m, 2H), 1,82 - 1,64 (m, 2H), 1,53 - 1,35 (m, 1H); 1H не наблюдался (OH).
101	MS m/z 432,5 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 9,68 (d, J = 10,4 Гц, 1H), 9,43 (s, 1H), 9,30 (d, J = 10,8 Гц, 1H), 9,12 (s, 1H), 7,98 (d, J = 8,2 Гц, 1H), 7,84 (d, J = 1,7 Гц, 1H), 7,73 (dd, J = 8,2, 1,7 Гц, 1H), 4,82-4,89 (m, 2H), 3,38-3,42 (m, 2H), 3,12-3,19 (m, 2H), 2,86 (s, 3H), 2,58 (s, 3H), 1,37 (d, J = 6,5 Гц, 6H).

Соед	Данные
102	MS m/z 417,5 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 11,23 (br s, 1H), 9,36 (br s, 1H), 9,12 (s, 1H), 8,63 (s, 1H), 8,46 (br d, J=9,5 Гц, 1H), 8,19 (s, 1H), 8,15 (br d, J=9,5 Гц, 1H), 8,07 (d, J=8,2 Гц, 1H), 7,80 (d, J=1,2 Гц, 1H), 7,73 (dd, J=8,5, 1,8 Гц, 1H), 4,86 (br d, J=13,7 Гц, 1H), 4,78 (d, J=14,3 Гц, 1H), 3,49-3,59 (m, 1H), 3,41 (d, J=12,5 Гц, 1H), 3,30 (dd, J=14,0, 11,3 Гц, 1H), 3,07-3,17 (m, 2H), 2,07 (dq, J=13,4, 6,4 Гц, 1H), 1,08 (t, J=6,4 Гц, 6H).
103	MS m/z 431,5 [M+H] ⁺
104	MS m/z 417,4 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 9,15-9,25 (m, 1H), 8,08 (br s, 1H), 8,02 (d, J=7,0 Гц, 1H), 7,86 (br s, 1H), 7,63-7,76 (m, 2H), 3,40-3,82 (m, 4H), 3,37 (s, 3H), 3,01 (s, 3H), 2,70-2,76 (m, 4H), 2,56 (s, 3H), 1 H не наблюдался (OH)
105	MS m/z 446,2 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 9,08 (s, 1H), 8,55 (d, J = 2,4 Гц, 1H), 7,94 (d, J = 8,1 Гц, 1H), 7,87 (s, 1H), 7,42 - 7,36 (m, 1H), 7,33 (d, J = 8,2 Гц, 1H), 7,31 - 7,29 (m, 1H), 4,83 (d, J = 2,6 Гц, 2H), 4,23 (s, 3H), 3,22 - 2,99 (m, 3H), 2,80 (br s, 1H), 2,26 - 2,04 (m, 2H), 2,03 - 1,82 (m, 2H), 1,82 - 1,64 (m, 2H), 1,53 - 1,35 (m, 1H); 1H не наблюдался (OH).
106	MS m/z 418,5 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 9,59-9,63 (m, 2H), 9,38 (d, J = 1,4 Гц, 1H), 9,18-9,24 (m, 1H), 9,14 (s, 1H), 8,00 (d, J = 8,2 Гц, 1H), 7,85 (d, J = 1,7 Гц, 1H), 7,76 (dd, J = 8,2, 1,8 Гц, 1H), 4,86 (d, J = 13,7 Гц, 2H), 3,39-3,41 (m, 2H), 3,13 (dd, J = 14,1, 11,5 Гц, 2H), 2,60 (s, 3H), 1,36 (d, J = 6,4 Гц, 6H).
107	MS m/z 434,4 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 8,72-8,78 (m, 1H), 8,20 (s, 1H), 7,94-8,02 (m, 1H), 7,86 (d, J=7,3 Гц, 1H), 7,78 (s, 1H), 7,55 (t, J=7,6 Гц, 1H), 7,39 (d, J=12,5 Гц, 1H), 4,50 (dd, J=27,2, 13,4 Гц, 2H), 3,21-3,27 (m, 1H), 2,80-2,91 (m, 2H), 2,51 (s, 3H), 2,26 (s, 3H), 2,21 (td, J=11,6, 3,4 Гц, 1H), 2,09-2,16 (m, 1H), 1,10 (d, J=6,1 Гц, 3H); 1H не наблюдался (OH).
108	MS m/z 456,4 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 9,16 (br s, 1H), 8,19 (s, 1H), 8,11 (s, 1H), 8,01 (br d, J=7,0 Гц, 1H), 7,57-7,70 (m, 2H), 5,02 (d, J=8,9 Гц, 2H), 3,43-3,53 (m, 4H), 2,99 (s, 3H), 2,56 (s, 3H), 1,58 (d, J=6,0 Гц, 6H); 1H не наблюдался (OH).
109	MS m/z 458,5 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 9,60 (d, J = 10,6 Гц, 1H), 9,34 (s, 1H), 9,21 (d, J = 10,5 Гц, 1H), 9,12 (s, 1H), 7,96 (d, J = 8,2 Гц, 1H), 7,80 (d, J = 1,8 Гц, 1H), 7,70 (dd, J = 8,2, 1,7 Гц, 1H), 4,82-4,89 (m, 2H), 3,40 (s, 2H), 3,13 (dd, J = 14,1, 11,5 Гц, 2H), 2,81 (td, J = 8,2, 4,2 Гц, 1H), 2,58 (s, 3H), 1,41 - 1,32 (m, 8H), 1,30 - 1,25 (m, 2H).
110	MS m/z 403,3 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 9,09 (s, 1H), 7,97 - 7,91 (m, 3H), 7,68 (d, J = 9,5 Гц, 1H), 7,65 - 7,61 (m, 2H), 4,03 (br s, 4H), 2,69 (br s, 4H), 2,52 - 2,49 (m, 3H), 2,46 (s, 3H); 1H не наблюдался (OH).
111	MS m/z 445,4 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 9,23 (s, 1H), 8,33 (s, 1H), 8,26 (s, 1H), 8,11 (d, J=7,9 Гц, 1H), 7,68-7,84 (m, 2H), 5,08 (d, J=13,4 Гц, 2H), 3,44-3,57 (m, 2H), 3,03 (s, 3H), 2,76-2,87 (m, 2H), 2,68 (s, 3H), 2,05 (s, 3H), 1,57 (d, J=6,0 Гц, 6H); 1 H не наблюдался (OH).

Соед	Данные
112	MS m/z 418,5 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 9,68 (d, J = 2,4 Гц, 1H), 9,63 (d, J = 10,3 Гц, 1H), 9,21-9,29 (m, 1H), 9,18 (d, J = 2,4 Гц, 1H), 9,16 (s, 1H), 8,03 (d, J = 8,1 Гц, 1H), 7,47 (dd, J = 8,1, 1,9 Гц, 1H), 7,44 (d, J = 1,9 Гц, 1H), 4,86 (d, J = 13,8 Гц, 2H), 3,41 (s, 2H), 3,09-3,19 (m, 2H), 2,55 (s, 3H), 1,36 (d, J = 6,4 Гц, 6H).
113	MS m/z 417,5 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 9,28 (s, 1H), 9,23 (s, 1H), 9,21 (s, 1H), 8,26 (s, 1H), 8,06 (s, 1H), 8,03 (d, J=8,2 Гц, 1H), 7,76 (s, 1H), 7,71 (d, J=7,6 Гц, 1H), 5,11 (d, J=13,7 Гц, 1H), 5,01 (d, J=14,0 Гц, 1H), 3,58 (d, J=12,5 Гц, 1H), 3,45-3,53 (m, 1H), 3,27-3,32 (m, 2H), 3,17-3,24 (m, 1H), 2,06 (dq, J=13,4, 6,8 Гц, 1H), 1,20 (d, J=6,8 Гц, 6H); 2H не наблюдались (NH и OH).
114	MS m/z 416,5 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 9,19 (s, 1H), 9,08 (s, 1H), 8,19 (s, 1H), 8,10 (dd, J=9,5, 0,9 Гц, 1H), 8,03 (d, J=8,2 Гц, 1H), 7,93 (d, J=1,2 Гц, 1H), 7,91 (d, J=9,5 Гц, 1H), 7,39 (dd, J=8,2, 1,2 Гц, 1H), 7,37 (s, 1H), 5,09 (br d, J=13,4 Гц, 1H), 4,98 (d, J=14,9 Гц, 1H), 3,50-3,62 (m, 2H), 3,27-3,32 (m, 2H), 3,17-3,26 (m, 1H), 2,10 (qd, J=13,7, 6,9 Гц, 1H), 1,20 (dd, J=6,9, 3,8 Гц, 6H); 2 H не наблюдались (NH и OH).
115	MS m/z 448,4 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 9,23 (s, 1H), 9,05 (s, 1H), 8,81 (s, 1H), 7,92 (d, J=7,9 Гц, 1H), 7,82 (s, 2H), 7,29 (s, 1H), 7,26 (s, 1H), 4,82 (d, J=12,5 Гц, 1H), 4,69 (d, J=14,3 Гц, 1H), 3,09-3,20 (m, 2H), 2,80-2,91 (m, 2H), 2,44-2,54 (m, 1H), 1,75 (dq, J=13,7, 7,0 Гц, 1H), 1,07 (dd, J=6,7, 3,4 Гц, 6H); 2H не наблюдались (NH и OH).
116	MS m/z 448,4 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 9,58 (s, 1H), 9,22 (s, 1H), 9,03 (s, 1H), 8,18 (s, 1H), 8,03 (d, J = 8,1 Гц, 1H), 7,86 (d, J = 1,8 Гц, 1H), 7,76 (dd, J = 8,2, 1,8 Гц, 1H), 4,81 (d, J = 13,9 Гц, 2H), 3,34 (s, 2H), 3,09 – 3,03 (m, 2H), 2,95 (s, 3H), 2,72 (s, 3H), 1,30 (d, J = 6,5 Гц, 6H).
117	MS m/z 432,2 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 9,90 (s, 1H), 9,58 (s, 1H), 8,96-9,14 (m, 1H), 7,90-8,03 (m, 1H), 7,80-7,86 (m, 1H), 7,21 (s, 1H), 6,93-7,05 (m, 1H), 4,85 (d, J = 14,0 Гц, 2H), 3,35-3,38 (m, 2H), 3,19-3,23 (m, 2H), 2,90 (s, 3H), 2,61 (s, 3H), 1,38 (t, J = 5,9 Гц, 6H).
118	MS m/z 471,4 [M+H] ⁺
119	MS m/z 435,4 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 11,21 (s, 1H), 9,49 (s, 1H), 9,10 (s, 1H), 8,73 (s, 1H), 8,07 (d, J = 8,1 Гц, 1H), 7,84 (d, J = 1,8 Гц, 1H), 7,76 (dd, J = 8,2, 1,8 Гц, 1H), 4,89 (d, J = 13,8 Гц, 2H), 3,42 (s, 2H), 3,11 (dd, J = 14,1, 11,5 Гц, 2H), 2,69 (s, 3H), 1,36 (d, J = 6,5 Гц, 6H).
120	MS m/z 417,4 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 9,70 (d, J = 10,1 Гц, 1H), 9,34 (d, J = 11,1 Гц, 1H), 9,13 (s, 1H), 8,47 (d, J = 8,3 Гц, 1H), 8,06 (d, J = 8,2 Гц, 1H), 7,78 (s, 1H), 7,74 (dd, J = 8,2, 1,7 Гц, 1H), 7,70 (d, J = 1,8 Гц, 1H), 7,56 (d, J = 8,6 Гц, 1H), 4,86 (d, J = 13,8 Гц, 2H), 3,37-3,42 (m, 2H), 3,11-3,20 (m, 2H), 2,74 (s, 3H), 1,37 (d, J = 6,5 Гц, 6H).

Соед	Данные
128	MS m/z 418,5 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 9,75 (d, J = 1,5 Гц, 1H), 9,54 (d, J = 1,4 Гц, 1H), 9,45 (d, J = 10,6 Гц, 1H), 9,25 (d, J = 10,9 Гц, 1H), 9,15 (s, 1H), 8,80 (s, 1H), 8,01 (d, J = 8,2 Гц, 1H), 7,88 (d, J = 1,7 Гц, 1H), 7,79 (dd, J = 8,2, 1,8 Гц, 1H), 4,72-4,92 (m, 2H), 3,51 (td, J = 13,2, 3,1 Гц, 1H), 3,38-3,45 (m, 1H), 3,28 (dd, J = 14,1, 11,1 Гц, 1H), 3,14-3,17 (m, 2H), 2,05 (h, J = 6,8 Гц, 1H), 1,08 (dd, J = 6,9, 5,5 Гц, 6H).
129	MS m/z 432,5 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 9,75 (d, J = 1,4 Гц, 1H), 9,54 (d, J = 1,4 Гц, 1H), 9,34 (d, J = 10,7 Гц, 1H), 9,15 (s, 1H), 8,93 (d, J = 11,2 Гц, 1H), 8,80 (s, 1H), 8,01 (d, J = 8,2 Гц, 1H), 7,88 (d, J = 1,7 Гц, 1H), 7,79 (dd, J = 8,2, 1,8 Гц, 1H), 4,96 (d, J = 13,5 Гц, 1H), 4,84 (d, J = 14,0 Гц, 1H), 3,45-3,55 (m, 1H), 3,42 (d, J = 12,3 Гц, 1H), 3,17-3,29 (m, 3H), 1,11 (s, 9H).
130	MS m/z 416,5 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 9,73-9,81 (m, 2H), 9,54 (d, J = 1,4 Гц, 1H), 9,43 (d, J = 10,4 Гц, 1H), 9,15 (s, 1H), 8,80 (s, 1H), 8,00 (d, J = 8,2 Гц, 1H), 7,88 (d, J = 1,7 Гц, 1H), 7,79 (dd, J = 8,2, 1,8 Гц, 1H), 4,67-4,87 (m, 2H), 3,47-3,61 (m, 2H), 3,39-3,46 (m, 1H), 3,07 (dt, J = 15,8, 8,5 Гц, 1H), 2,60-2,75 (m, 1H), 1,06-1,17 (m, 1H), 0,73 – 0,57 (m, 3H), 0,41-0,46 (m, 1H).
131	MS m/z 444,4 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 9,54 (br s, 1H), 9,32 (br s, 1H), 9,16 (s, 1H), 9,14 (s, 1H), 8,12 (s, 2H), 8,04 (d, J=8,2 Гц, 1H), 7,40 (br s, 1H), 7,38 (s, 1H), 4,85 (d, J=14,0 Гц, 1H), 4,77 (d, J=12,8 Гц, 1H), 3,48-3,57 (m, 1H), 3,41 (d, J=13,7 Гц, 1H), 3,24-3,34 (m, 1H), 3,07-3,20 (m, 2H), 2,68 (s, 3H), 2,55 (s, 3H), 2,06 (dq, J=13,7, 6,8 Гц, 1H), 1,08 (t, J=6,8 Гц, 6H).
138	MS m/z 458,5 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 9,11 (s, 1H), 8,54 (s, 1H), 7,92 (d, J=8,2 Гц, 1H), 7,66 (s, 1H), 7,41 (s, 1H), 7,29 (br d, J=8,2 Гц, 1H), 7,25 (s, 1H), 3,25-3,50 (m, 4H), 3,11-3,18 (m, 2H), 3,03 (q, J=7,4 Гц, 2H), 2,95 (br t, J=7,5 Гц, 1H), 2,46 (s, 3H), 1,97 (dq, J=14,0, 6,7 Гц, 1H), 1,42 (t, J=7,4 Гц, 3H), 1,15 (dd, J=6,7, 2,7 Гц, 6H); 2H не наблюдались (NH и OH).
139	MS m/z 498,4 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 9,13 (s, 1H), 9,07 (s, 1H), 8,16 (s, 1H), 7,98 (s, 1H), 7,96 (s, 1H), 7,36 (dd, J=8,2, 1,8 Гц, 1H), 7,32 (s, 1H), 5,06 (d, J=14,0 Гц, 1H), 4,96 (d, J=14,0 Гц, 1H), 3,43-3,64 (m, 2H), 3,28-3,32 (m, 1H), 3,27 (d, J=4,0 Гц, 1H), 3,18 (ddd, J=10,4, 7,9, 3,7 Гц, 1H), 2,54 (s, 3H), 2,09 (dq, J=13,7, 6,7 Гц, 1H), 1,19 (dd, J=6,7, 3,7 Гц, 6H); 2 H не наблюдались (NH и OH).
140	MS m/z 444,4 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 9,02 (s, 1H), 8,22 (s, 1H), 7,84 (d, J=8,2 Гц, 1H), 7,78 (s, 1H), 7,39 (s, 1H), 7,26 (dd, J=8,2, 1,2 Гц, 1H), 7,24 (s, 1H), 4,77 (br d, J=12,2 Гц, 1H), 4,65 (d, J=13,7 Гц, 1H), 4,24 (s, 3H), 3,09-3,17 (m, 2H), 2,73-2,89 (m, 2H), 2,64 (s, 3H), 2,43 (ddd, J=11,3, 6,8, 2,8 Гц, 1H), 1,72 (dq, J=13,7, 6,8 Гц, 1H), 1,05 (dd, J=6,8, 3,7 Гц, 6H); 2 H не наблюдались (NH и OH).

Соед	Данные
141	MS m/z 431,5 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 9,41 (s, 1H), 9,36 (s, 1H), 9,21 (s, 1H), 8,23 (s, 1H), 8,04 (d, J=8,2 Гц, 1H), 7,77 (s, 1H), 7,74 (br d, J=8,2 Гц, 1H), 5,09 (d, J=13,7 Гц, 1H), 4,99 (d, J=15,0 Гц, 1H), 3,35-3,64 (m, 4H), 3,16-3,25 (m, 1H), 2,68 (s, 3H), 2,02-2,18 (m, 1H), 1,20 (dd, J=6,7, 3,1 Гц, 6H); 2 H не наблюдались (NH и OH).
147	MS m/z 431,3 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 9,08-9,18 (m, 1H), 8,31-8,37 (m, 1H), 8,00-8,06 (m, 1H), 7,87-7,95 (m, 1H), 7,51-7,58 (m, 2H), 6,06-6,14 (m, 1H), 4,97-5,14 (m, 1H), 4,19-4,41 (m, 2H), 3,69-3,82 (m, 1H), 3,54-3,65 (m, 1H), 3,36-3,53 (m, 2H), 2,79 (s, 3H), 2,04-2,18 (m, 1H), 1,17-1,24 (m, 6H); 2H не наблюдались (NH и OH).
167	MS m/z 418,4 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 11,13 (s, 1H), 9,63 (d, J = 1,4 Гц, 1H), 9,38 (d, J = 1,4 Гц, 1H), 9,20 (d, J = 10,0 Гц, 1H), 9,15 (s, 1H), 8,00 (d, J = 8,2 Гц, 1H), 7,84 (d, J = 1,8 Гц, 1H), 7,76 (dd, J = 8,2, 1,8 Гц, 1H), 4,90 (d, J = 13,9 Гц, 2H), 3,45 (s, 2H), 3,03 (dd, J = 14,2, 11,4 Гц, 2H), 2,60 (s, 3H), 1,33 (d, J = 6,4 Гц, 6H).
168	MS m/z 430,4 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 11,34 (s, 1H), 9,12 (d, J = 2,0 Гц, 1H), 9,10 (s, 1H), 8,68 (d, J = 2,0 Гц, 1H), 8,00 (d, J = 2,0 Гц, 1H), 7,45 (d, J = 8,0 Гц, 1H), 7,42 (s, 1H), 4,67 (d, J = 12,5 Гц, 1H), 4,58 (s, 3H), 3,16 (t, J = 10,5 Гц, 2H), 3,06 (t, J = 11,5 Гц, 1H), 2,78 (t, J = 8,5 Гц, 1H), 2,13 (t, J = 8,5 Гц, 1H), 0,93-0,84 (m, 1H), 0,56-0,47 (m, 2H), 0,42-0,35 (m, 1H), 0,32-0,28 (m, 1H).
169	MS m/z 430,4 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 11,27 (s, 1H), 9,47 (s, 1H), 9,28 (s, 1H), 9,16 (s, 1H), 9,04 (d, J = 2,0 Гц, 1H), 8,70 (d, J = 2,0 Гц, 1H), 8,04 (d, J = 8,0 Гц, 1H), 7,49 (d, J = 9,0 Гц, 1H), 7,47 (s, 1H), 4,76 (d, J = 13,5 Гц, 1H), 4,70 (d, J = 14,5 Гц, 1H), 4,41 (s, 3H), 3,55-3,43 (m, 1H), 3,12-3,07 (m, 2H), 2,71-2,63 (m, 1H), 1,11-1,05 (m, 1H), 0,71-0,64 (m, 1H), 0,60-0,56 (m, 1H), 0,46-0,41 (m, 1H), 0,35-0,27 (m, 1H).
171	MS m/z 430,4 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 11,04 (s, 1H), 9,89 (s, 1H), 9,49 (s, 1H), 9,12 (s, 1H), 8,50 (d, J = 8,5 Гц, 1H), 8,23 (d, J = 8,5 Гц, 1H), 8,01 (d, J = 8,0 Гц, 1H), 7,94 (d, J = 1,5 Гц, 1H), 7,81 (dd, J = 8,0, 1,5 Гц, 1H), 4,76 (d, J = 14,0 Гц, 1H), 4,70 (d, J = 14,0 Гц, 1H), 4,38 (s, 3H), 3,60-3,49 (m, 2H), 3,42 (d, J = 10,5 Гц, 1H), 3,10-3,04 (m, 1H), 2,67-2,63 (m, 1H), 1,14-1,07 (m, 1H), 0,68-0,58 (m, 3H), 0,45-0,41 (m, 1H); 1H из HCl соли.
172	MS m/z 430,4 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 11,13 (s, 1H), 9,57 (s, 1H), 9,08 (s, 1H), 8,47 (d, J = 1,5 Гц, 1H), 7,97 (d, J = 8,5 Гц, 1H), 7,88 (d, J = 1,5 Гц, 1H), 7,79 (dd, J = 8,5, 2,0 Гц, 1H), 4,66 (d, J = 12,5 Гц, 1H), 4,61 (s, 3H), 4,57 (d, J = 12,5 Гц, 1H), 3,14 (t, J = 9,0 Гц, 2H), 3,02 (t, J = 11,5 Гц, 1H), 2,75 (t, J = 11,5 Гц, 1H), 2,09 (t, J = 8,0 Гц, 1H), 0,90-0,82 (m, 1H), 0,54-0,46 (m, 2H), 0,38-0,34 (m, 1H), 0,31-0,27 (m, 1H); 1H не наблюдался (NH или OH).

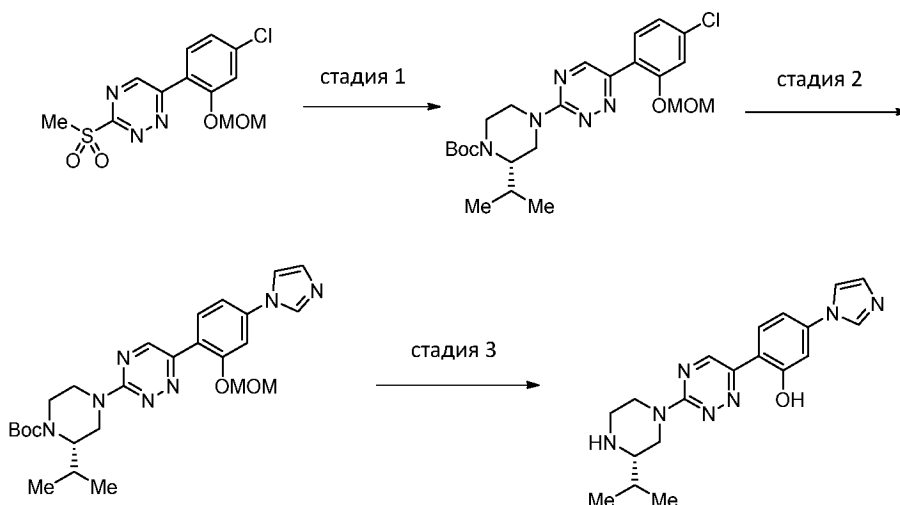
Соед	Данные
173	MS m/z 430,4 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 11,13 (s, 1H), 10,04 (s, 1H), 9,59 (s, 1H), 9,11 (s, 1H), 8,63 (d, J = 9,0 Гц, 1H), 8,08 (d, J = 9,0 Гц, 1H), 7,95 (s, 1H), 7,84 (d, J = 10,0 Гц, 1H), 4,76 (d, J = 13,0 Гц, 1H), 4,69 (d, J = 13,0 Гц, 1H), 4,36 (s, 3H), 3,62-3,51 (m, 2H), 3,40 (d, J = 12,5 Гц, 1H), 3,08-3,01 (m, 1H), 2,67-2,61 (m, 1H), 1,17-1,09 (m, 1H), 0,69-0,64 (m, 3H), 0,44-0,40 (m, 1H).
174	MS m/z 430,4 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 11,08 (s, 1H), 9,80 (s, 1H), 9,53 (s, 1H), 9,43 (s, 1H), 9,15 (s, 1H), 8,53 (s, 1H), 8,02 (d, J = 8,5 Гц, 1H), 7,97 (d, J = 1,5 Гц, 1H), 7,83 (dd, J = 8,5, 1,5 Гц, 1H), 4,76 (d, J = 16,0 Гц, 1H), 4,69 (d, J = 13,5 Гц, 1H), 4,40 (s, 3H), 3,58-3,41 (m, 3H), 3,09-3,03 (m, 1H), 2,70-2,63 (m, 1H), 1,14-1,07 (m, 1H), 0,72-0,58 (m, 3H), 0,45-0,41 (m, 1H); 1H из HCl соли.
176	MS m/z 352,3 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 7,70 (s, 1H), 6,65 (br s, 2H), 6,46 (d, J = 8,2 Гц, 1H), 5,87 (dd, J = 8,1, 1,8 Гц, 1H), 5,84 (d, J = 1,7 Гц, 1H), 3,59 (t, J = 6,0 Гц, 1H), 3,25 (dd, J = 12,8, 2,6 Гц, 1H), 1,84 – 1,66 (m, 2H), 1,61 – 1,48 (m, 2H), 0,01 (d, J = 6,9 Гц, 3H), 0,10 (d, J = 6,0 Гц, 3H); 3H не наблюдались (2 NH и OH).
190	MS m/z 352,3 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ 9,54 (br s, 1H), 9,11 (s, 1H), 8,09 (s, 2H), 7,86 (d, J = 8,0 Гц, 1H), 7,32 (s, 1H), 7,27 – 7,19 (m, 2H), 7,12 (s, 1H), 5,05 (t, J = 7,2 Гц, 1H), 4,50 (d, J = 14,3 Гц, 1H), 3,77 (s, 1H), 3,59 (dd, J = 14,5, 3,7 Гц, 1H), 3,4-3,42 (m, 1H), 3,22 – 3,11 (m, 1H), 1,39 (d, J = 6,9 Гц, 3H), 1,32 (d, J = 6,8 Гц, 3H).
191	MS m/z 434,5 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 11,14 (s, 1H), 9,11 (s, 1H), 8,76-8,99 (m, 1H), 8,66 (dd, J = 4,6, 1,5 Гц, 1H), 8,49 (dd, J = 8,2, 1,5 Гц, 1H), 8,06 (d, J = 8,1 Гц, 1H), 7,80 (d, J = 1,8 Гц, 1H), 7,73 (dd, J = 8,1, 1,8 Гц, 1H), 7,65 (dd, J = 8,2, 4,6 Гц, 1H), 4,88 (d, J = 13,5 Гц, 1H), 4,80 (d, J = 14,0 Гц, 1H), 3,38-3,48 (m, 2H), 3,16-3,28 (m, 3H), 1,98 (h, J = 6,8 Гц, 1H), 1,07 (d, J = 6,9 Гц, 6H).
193	MS m/z 429,4 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 11,28-11,58 (m, 1H), 9,33 (s, 1H), 9,10 (s, 1H), 8,21 (s, 1H), 8,02 (d, J=9,5 Гц, 1H), 7,99 (d, J=8,2 Гц, 1H), 7,68 (dd, J=9,5, 1,2 Гц, 1H), 7,46 (dd, J=8,1, 1,7 Гц, 1H), 7,41 (d, J=1,5 Гц, 1H), 4,64 (br d, J=12,2 Гц, 1H), 4,55 (br d, J=11,3 Гц, 1H), 3,00-3,13 (m, 2H), 2,90 (br dd, J=12,7, 10,5 Гц, 1H), 2,62-2,71 (m, 1H), 2,58 (s, 3H), 1,90-1,98 (m, 1H), 0,78-0,85 (m, 1H), 0,42-0,51 (m, 2H), 0,23-0,34 (m, 2H).
194	MS m/z 428,4 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 11,14-11,41 (m, 1H), 9,09 (s, 1H), 8,63 (s, 1H), 8,31 (s, 1H), 8,16 (s, 1H), 7,96 (d, J=7,9 Гц, 1H), 7,61 (d, J=9,5 Гц, 1H), 7,30 (dd, J=8,1, 1,7 Гц, 1H), 7,27 (d, J=1,5 Гц, 1H), 7,01 (dd, J=9,5, 1,2 Гц, 1H), 4,67 (br d, J=12,2 Гц, 1H), 4,58 (br d, J=12,8 Гц, 1H), 3,10-3,21 (m, 2H), 2,97-3,09 (m, 1H), 2,71-2,83 (m, 1H), 2,44 (s, 3H), 2,12 (br t, J=8,4 Гц, 1H), 0,81-0,94 (m, 1H), 0,47-0,60 (m, 2H), 0,26-0,41 (m, 2H).

Соед	Данные
195	MS m/z 428,4 $[M+H]^+$; 1H ЯМР (500 МГц, ДМСО- d_6) δ : 9,08 (s, 1H), 8,20 (s, 2H), 8,17 (d, $J=7,6$ Гц, 1H), 7,95 (d, $J=8,2$ Гц, 1H), 7,88 (s, 1H), 7,31-7,41 (m, 3H), 7,04 (dd, $J=7,5$, 1,7 Гц, 1H), 4,64 (br d, $J=12,2$ Гц, 1H), 4,49-4,59 (m, 1H), 3,04-3,11 (m, 1H), 2,92 (br dd, $J=12,7$, 10,5 Гц, 1H), 2,64-2,73 (m, 2H), 2,63 (s, 3H), 1,92-2,02 (m, 1H), 0,78-0,89 (m, 1H), 0,42-0,53 (m, 2H), 0,23-0,36 (m, 2H).
197	MS m/z 418,4 $[M+H]^+$; 1H ЯМР (500 МГц, ДМСО- d_6) δ : 9,13 (d, $J = 2,1$ Гц, 1H), 9,08 (s, 1H), 8,69 (d, $J = 2,1$ Гц, 1H), 8,01 (d, $J = 8,2$ Гц, 1H), 7,45 (dd, $J = 1,7$, 8,1 Гц, 1H), 7,41 (d, $J = 1,8$ Гц, 1H), 4,59 (s, 5H), 2,78 (ddd, $J = 3,1$, 6,5, 10,1 Гц, 2H), 2,56 - 2,52 (m, 2H), 1,07 (d, $J = 6,1$ Гц, 6H); 2H не наблюдались (NH и OH).
198	MS m/z 418,4 $[M+H]^+$; 1H ЯМР (500 МГц, ДМСО- d_6) δ : 9,57 (s, 1H), 9,06 (s, 1H), 8,47 (s, 1H), 7,97 (d, $J = 8,2$ Гц, 1H), 7,90 - 7,87 (m, 1H), 7,80 - 7,77 (m, 1H), 4,65 - 4,57 (m, 5H), 2,78 (dd, $J = 3,1$, 6,3 Гц, 2H), 2,58 - 2,52 (m, 2H), 1,11 - 1,03 (m, 6H); 2H не наблюдались (NH и OH).
201	MS m/z 418,2 $[M+H]^+$; 1H ЯМР (500 МГц, ДМСО- d_6) δ : 9,06 (s, 1H), 8,53 (d, $J = 9,0$ Гц, 1H), 8,12 (d, $J = 8,9$ Гц, 1H), 8,01 (d, $J = 8,2$ Гц, 1H), 7,90 - 7,86 (m, 1H), 7,82 - 7,77 (m, 1H), 4,70 - 4,60 (m, 5H), 2,91 - 2,78 (m, 2H), 2,63 - 2,54 (m, 2H), 1,12 - 1,07 (m, 6H); 2H не наблюдались (NH и OH).
202	MS m/z 430,4 $[M+H]^+$; 1H ЯМР (500 МГц, ДМСО- d_6) δ : 11,15 (s, 1H), 9,06 (s, 1H), 8,52 (d, $J = 9,0$ Гц, 1H), 8,11 (d, $J = 9,0$ Гц, 1H), 8,00 (d, $J = 8,5$ Гц, 1H), 7,87 (s, 1H), 7,78 (d, $J = 9,5$ Гц, 1H), 4,65 (d, $J = 9,5$ Гц, 1H), 4,56 (s, 3H), 4,55 (d, $J = 12,0$ Гц, 1H), 4,15-4,03 (m, 1H), 3,07 (t, $J = 11,5$ Гц, 2H), 2,92 (t, $J = 11,0$ Гц, 1H), 2,71-2,65 (m, 1H), 1,97 (t, $J = 8,5$ Гц, 1H), 0,85-0,78 (m, 1H), 0,51-0,43 (m, 2H), 0,32-0,24 (m, 2H).
206	MS m/z 417,2 $[M+H]^+$; 1H ЯМР (500 МГц, ДМСО- d_6) δ : 9,32 (s, 1H), 9,08 (s, 1H), 8,03 - 7,97 (m, 2H), 7,68 (d, $J = 9,3$ Гц, 1H), 7,45 (dd, $J = 1,6$, 8,2 Гц, 1H), 7,39 (d, $J = 1,5$ Гц, 1H), 4,60 (d, $J = 11,9$ Гц, 2H), 2,77 (ddd, $J = 3,1$, 6,4, 10,0 Гц, 2H), 2,58 (s, 3H), 1,09 - 1,03 (m, 7H); 3H не наблюдались (NH, OH и 1 CH перекрывались с пиком растворителя).
211	MS m/z 446,4 $[M+H]^+$; 1H ЯМР (500 МГц, ДМСО- d_6) δ : 11,22 (s, 1H), 9,33 (d, $J = 9,0$ Гц, 1H), 9,15 (s, 1H), 9,12 (s, 1H), 8,92 (d, $J = 9,0$ Гц, 1H), 8,68 (s, 1H), 8,01 (d, $J = 8,0$ Гц, 1H), 7,46 (d, $J = 8,0$ Гц, 1H), 7,45 (s, 1H), 4,95 (d, $J = 13,5$ Гц, 1H), 4,83 (d, $J = 14,0$ Гц, 1H), 4,58 (s, 3H), 3,49 (t, $J = 12,5$ Гц, 2H), 3,27-3,18 (m, 3H), 1,10 (s, 9H); 1H из HCl соли.
212	MS m/z 432,3 $[M+H]^+$; 1H ЯМР (500 МГц, ДМСО- d_6) δ : 11,42 (s, 1H), 9,14 (s, 1H), 9,08 (s, 1H), 8,67 (d, $J = 2,0$ Гц, 1H), 8,00 (d, $J = 2,0$ Гц, 1H), 7,47 (d, $J = 7,5$ Гц, 1H), 7,42 (s, 1H), 4,91-4,48 (m 2H), 4,61 (s, 3H), 3,54-3,46 (m, 3H), 3,11 (t, $J = 11,5$ Гц, 1H), 2,70 (t, $J = 9,0$ Гц, 1H), 2,44-2,35 (m, 1H), 1,09-1,02 (m, 1H), 0,99 (d, $J = 6,0$ Гц, 6H).
214	MS m/z 432,4 $[M+H]^+$; 1H ЯМР (500 МГц, ДМСО- d_6) δ : 11,27 (s, 1H), 9,61 (s, 1H), 9,49 (s, 1H), 9,14 (s, 1H), 9,13 (d, $J = 8,5$ Гц, 1H), 8,68 (s, 1H), 8,01 (d, $J = 8,5$ Гц, 1H), 4,93 (d, $J = 12,5$ Гц, 1H), 4,85 (d, $J = 12,5$ Гц, 1H), 4,58 (s, 3H), 3,39-3,37 (m, 1H), 3,25-3,13 (m, 4H), 1,87-1,79 (m, 1H), 1,75-1,68 (m, 1H), 1,39 (d, $J = 6,0$ Гц, 3H), 1,04 (d, $J = 7,5$ Гц, 3H).

Соед	Данные
241	MS m/z 444,0 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ: 12,46 (s, 1H), 9,10 (d, J = 2,2 Гц, 1H), 8,87 (s, 1H), 8,38 (d, J = 2,2 Гц, 1H), 7,77 (d, J = 8,3 Гц, 1H), 7,39 (d, J = 1,9 Гц, 1H), 7,27-7,24 (m, 1H), 4,78-4,70 (m, 2H), 4,60 (s, 3H), 3,23-3,18 (m, 1H), 3,11 (td, J = 11,7, 3,1 Гц, 1H), 3,03 (t, J = 12, 1H), 2,87 (td, J = 11,7, 3,1 Гц, 1H), 1,96 (dd, J = 10,8, 2,9 Гц, 1H), 1,13 (s, 3H), 0,53-0,46 (m, 1H), 0,43 – 0,32 (m, 3H); 1H не наблюдался (NH или OH).
242	MS m/z 444,0 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ: 12,46 (s, 1H), 9,10 (d, J = 2,2 Гц, 1H), 8,87 (s, 1H), 8,38 (d, J = 2,2 Гц, 1H), 7,77 (d, J = 8,3 Гц, 1H), 7,39 (d, J = 1,9 Гц, 1H), 7,27-7,24 (m, 1H), 4,78-4,70 (m, 2H), 4,60 (s, 3H), 3,23-3,18 (m, 1H), 3,11 (td, J = 11,7, 3,1 Гц, 1H), 3,03 (t, J = 12 Гц, 1H), 2,87 (td, J = 11,7, 3,1 Гц, 1H), 1,96 (dd, J = 10,8, 2,9 Гц, 1H), 1,13 (s, 3H), 0,53-0,46 (m, 1H), 0,43 – 0,32 (m, 3H); 1H не наблюдался (NH или OH).
243	MS m/z 417,5 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 11,09 (s, 1H), 9,22 (dd, J = 7,0, 1,7 Гц, 1H), 9,15 (s, 1H), 8,94 – 8,86 (m, 1H), 8,81 (s, 1H), 8,78 (s, 1H), 8,73-8,72 (m, 1H), 7,96 – 7,92 (m, 2H), 7,74 (d, J = 8,2, 1H), 7,17 (dd, J = 7,1, 4,1 Гц, 1H), 4,85 (d, J = 12,5 Гц, 1H), 4,78 (d, J = 13,9 Гц, 1H), 3,56 – 3,26 (m, 2H), 3,22-3,18 (m, 3H), 1,98 (q, J = 6,7 Гц, 1H), 1,07 (dd, J = 6,9, 3,9 Гц, 6H); 1H из HCl соли.
244	MS m/z 416,4 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 11,21 (s, 1H), 9,06 (s, 1H), 8,77 (d, J = 7,0 Гц, 1H), 8,43 (s, 1H), 8,01 (d, J = 9,0 Гц, 1H), 7,94 (d, J = 8,5 Гц, 1H), 7,39 (dd, J = 9,0, 6,8 Гц, 1H), 7,33-7,32 (m, 2H), 7,00 (t, J = 6,9 Гц, 1H), 4,64 (d, J = 11,4 Гц, 1H), 4,54 (d, J = 12,6 Гц, 1H), 3,21 – 2,90 (m, 2H), 2,86 – 2,61 (m, 2H), 2,37-2,33 (m, 2H), 1,72 – 1,62 (m, 1H), 0,98 (d, J = 6,8 Гц, 5H); 1 H не наблюдался (NH или OH).
263	MS m/z 434,4 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 11,16 (br s, 1H), 9,16 (s, 1H), 9,04 (br s, 2H), 8,37 (s, 1H), 8,23 (d, J = 9,1 Гц, 1H), 8,09 (d, J = 9,7 Гц, 1H), 8,03 (d, J = 8,1 Гц, 1H), 7,51 (d, J = 8,2 Гц, 1H), 7,47 (s, 1H), 4,87 (d, J = 13,7 Гц, 1H), 4,80 (d, J = 14,1 Гц, 1H), 3,51 – 3,44 (m, 2H), 3,31 – 3,00 (m, 3H), 2,07 – 1,97 (m, 1H), 1,08 (dd, J = 6,8, 4,6 Гц, 6H); 1H из HCl соли.
264	MS m/z 435,4 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 11,29 (br s, 1H), 9,52 (d, J = 2,3 Гц, 1H), 9,44 (br s, 1H), 9,25 (br s, 1H), 9,17 (s, 1H), 8,82 (d, J = 2,3 Гц, 1H), 8,06 (d, J = 8,1 Гц, 1H), 7,59 (d, J = 8,0 Гц, 1H), 7,56 (s, 1H), 4,87 (d, J = 14,2 Гц, 1H), 4,79 (d, J = 14,3 Гц, 1H), 3,61 – 3,39 (m, 3H), 3,29 (dd, J = 14,0, 11,1 Гц, 1H), 3,16-3,13 (m, 1H), 2,06 (h, J = 6,8 Гц, 1H), 1,09 (t, J = 6,0 Гц, 6H); 1H из HCl соли.

Пример 3

Получение соединения 142



Стадия 1: К раствору 6-(4-хлор-2-(метоксиметокси)фенил)-3-(метилсульфонил)-1,2,4-триазина (1,0 г, 3,2 ммоль) и (*S*)-1-Бос-2-Изопропилпиперазина (873 мг, 3,81 ммоль) в ACN (6 мл) добавляли DIPEA (1,1 мл, 6,4 ммоль). Смесь нагревали при 70°C в течение 3 ч до тех пор, пока СВЭЖХ не показала полное израсходование исходного материала. Реакционную смесь затем охлаждали до комнатной температуры, концентрировали и очищали колоночной хроматографией на силикагеле, элюируя градиентом CH₂Cl₂/MeOH (0-15% MeOH), с получением трет-бутил-(*S*)-4-(6-(4-хлор-2-(метоксиметокси)фенил)-1,2,4-триазин-3-ил)-2-изопропилпиперазин-1-карбоксилата (1,02 г, выход 67%) в виде почти белой пены. MS *m/z* 478,4 [M+H]⁺.

Стадия 2: Смесь Pd₂(dba)₃ (10,0 мг, 0,01 ммоль), Me4tButylXphos (10 мг, 0,01 ммоль), 1,4-диоксана (0,2 мл) и толуола (0,8 мл) продували Ar и затем нагревали при 120 °C в течение 10 минут. Реакционную смесь охлаждали до комнатной температуры и затем переносили во флакон, содержащий трет-бутил-(*S*)-4-(6-(4-хлор-2-(метоксиметокси)фенил)-1,2,4-триазин-3-ил)-2-изопропилпиперазин-1-карбоксилат (100 мг, 0,21 ммоль), K₃PO₄ (90 мг, 0,42 ммоль) и имидазол (28 мг, 0,42 ммоль). Затем объединенную смесь продували аргоном и затем нагревали при 120°C в течение 4 часов. Затем реакционную смесь охлаждали до комнатной температуры, концентрировали и очищали колоночной хроматографией на силикагеле, элюируя градиентом CH₂Cl₂/MeOH (0-10% MeOH), с получением трет-бутил-(*S*)-4-(6-(4-(1H-имидазол-1-ил)-2-(метоксиметокси)фенил)-1,2,4-триазин-3-ил)-2-изопропилпиперазин-1-карбоксилата (76 мг, выход 71%) в виде твердого вещества желтого цвета. MS *m/z* 510,4 [M+H]⁺.

Стадия 3: К раствору трет-бутил-(S)-4-(6-(4-(1H-имидазол-1-ил)-2-(метоксиметокси)фенил)-1,2,4-триазин-3-ил)-2-изопропилпиперазин-1-карбоксилату (76 мг, 0,15 ммоль) в метаноле (2 мл) добавляли HCl (4 моль/л) в 1,4-диоксане (0,2 мл, 0,8 ммоль). Реакционную смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 2 часов, концентрировали и очищали колоночной хроматографией на силикагеле, элюируя градиентом CH₂Cl₂/MeOH/NH₄OH (10–30% MeOH/NH₄OH), с получением (S)-5-(1H-имидазол-1-ил)-2-(3-(3-изопропилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил)фенола (30 мг, выход 47%).

MS *m/z* 366,3 [M+H]⁺; ¹H ЯМР (500 МГц, метанол-*d*₄) δ: 9,14 (s, 1H), 8,22 (s, 1H), 8,01 (d, J = 8,4 Гц, 1H), 7,61 (s, 1H), 7,22 - 7,17 (m, 3H), 5,08 (br d, J = 13,6 Гц, 1H), 5,02 - 4,93 (m, 1H), 3,59 - 3,45 (m, 2H), 3,31 - 3,23 (m, 2H), 3,18 - 3,11 (m, 1H), 2,11 - 2,02 (m, 1H), 1,19 (d, J = 6,9 Гц, 6H); 2H не наблюдались (NH и OH).

Используя методику, описанную выше для Примера 3, можно получить дополнительные соединения, описанные в настоящем документе, путем замены соответствующего исходного материала, подходящих реагентов и условий реакции с получением соединений, таких как соединения, выбранные из:

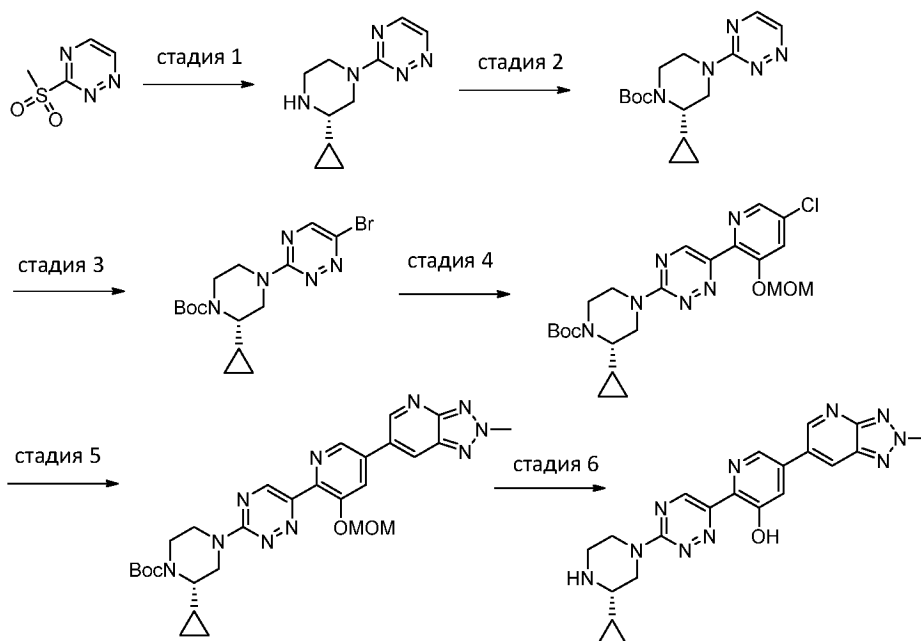
Соед	Данные
159	MS <i>m/z</i> 430,5 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 9,18 (s, 1H), 8,35 (br s, 1H), 8,07 (d, J=8,5 Гц, 1H), 8,04 (d, J=8,5 Гц, 1H), 7,86 (d, J=3,4 Гц, 1H), 7,19-7,25 (m, 2H), 6,79 (d, J=3,4 Гц, 1H), 5,07 (br d, J=13,7 Гц, 1H), 4,97 (br d, J=14,3 Гц, 1H), 3,49-3,55 (m, 1H), 3,40-3,48 (m, 1H), 3,20-3,30 (m, 2H), 3,11 (ddd, J=10,6, 7,4, 3,1 Гц, 1H), 2,67 (s, 3H), 1,96-2,08 (m, 1H), 1,18 (d, J=7,0 Гц, 6H); 2H не наблюдались (NH и OH).
54	MS <i>m/z</i> 353,3 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 9,13 (s, 1H), 8,01 (s, 1H), 7,85 (s, 1H), 7,84 (d, J=8,09 Гц, 1H), 7,20 (d, J=6,56 Гц, 1H), 7,16 (d, J=1,53 Гц, 1H), 5,05 (dd, J=14,34, 2,75 Гц, 2H), 3,48 (m, 2H), 3,04 (dd, J=14,50, 11,60 Гц, 2H), 1,44 (d, J=6,56 Гц, 6H); 2H не наблюдались (NH и OH).
52	MS <i>m/z</i> 367,4 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 9,08 (s, 1H), 7,97 (d, J=9,3 Гц, 1H), 7,96 (s, 2H), 7,70-7,73 (m, 2H), 4,69 (br d, J=14,6 Гц, 2H), 2,90 (dd, J=13,4, 11,1 Гц, 2H), 2,34-2,41 (m, 5H), 1,26 (s, 3H), 1,25 (s, 3H); 1H не наблюдался (OH).
45	MS <i>m/z</i> 355,3 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 9,08 (s, 1H), 7,97 (d, J=9,0 Гц, 1H), 7,96 (s, 2H), 7,71 (s, 2H), 4,79 (br d, J=11,4 Гц, 1H), 4,67 (d, J=12,8 Гц, 1H), 3,57-3,69 (m, 2H), 3,14-3,22 (m, 2H), 2,85-2,96 (m, 3H); 3H не наблюдались (NH и 2 OH).

Соед	Данные
274	MS m/z 436,5 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 9,05 (s, 1H), 8,45-8,60 (s, 1H), 7,73-7,83 (m, 1H), 6,70-6,79 (m, 1H), 6,59-6,66 (m, 1H), 4,89-4,95 (m, 1H), 4,74-4,82 (m, 1H), 4,56 (s, 2H), 4,21-4,29 (m, 2H), 3,88-3,97 (m, 2H), 3,34-3,38 (m, 1H), 3,21-3,30 (m, 1H), 2,97-3,10 (m, 2H), 2,74-2,86 (m, 1H), 2,38 (s, 3H), 1,82-1,93 (m, 1H), 1,05-1,18 (m, 6H); 2H не наблюдались (NH и OH).
155	MS m/z 431,5 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 9,59 (br d, J=9,5 Гц, 1H), 9,34 (br d, J=8,9 Гц, 1H), 9,08 (s, 1H), 8,60 (s, 1H), 8,52 (d, J=8,9 Гц, 1H), 8,04 (d, J=8,5 Гц, 1H), 7,59 (d, J=9,2 Гц, 1H), 7,56 (d, J=2,1 Гц, 1H), 7,47 (dd, J=8,5, 2,1 Гц, 1H), 4,86 (br d, J=13,4 Гц, 1H), 4,78 (br d, J=14,0 Гц, 1H), 3,47-3,56 (m, 1H), 3,39-3,45 (m, 1H), 3,29 (dd, J=14,0, 11,3 Гц, 1H), 3,09-3,18 (m, 2H), 2,73 (s, 3H), 2,01-2,12 (m, 1H), 1,04-1,12 (m, 6H).
237	MS m/z 393,3 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 11,30 (s, 1H), 8,98 (s, 1H), 8,14 (s, 1H), 7,99 (d, J = 8,5 Гц, 1H), 7,68 (s, 1H), 7,63 (d, J = 8,5 Гц, 1H), 4,69-4,51 (m, 2H), 2,76-2,44 (m, 4H), 2,29-2,21 (m, 1H), 2,04-1,98 (m, 2H), 1,91-1,76 (m, 4H), 1,09 (d, J = 5,0 Гц, 3H); 2H не наблюдались (NH и OH).
162	MS m/z 418,5 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 9,76 (br, d, J=9,46 Гц, 1H), 9,56 (s, 1H), 9,46 (br, d, J=9,54 Гц, 1H), 9,25 (s, 1H), 9,08 (s, 1H), 8,76 (s, 1H), 8,03 - 8,06 (m, 3H), 7,93 (dd, J=8,7, 1,98 Гц, 1H), 4,77 (br d, J=14,04 Гц, 2H), 4,85 (br, d, J=13,43 Гц, 1H), 3,52 - 3,57 (m, 1H), 3,38 - 3,41 (m, 1H), 3,27 - 3,30 (m, 2H), 2,05 - 2,12 (m, 1H), 1,07 - 1,10 (t, J=6,82 Гц, 6H); 1H из HCl соли.
183	MS m/z 379,5 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 9,77 (br s, 1H), 9,42 - 9,43 (m, 1H), 9,05 (s, 1H), 7,98 (d, J=8,54 Гц, 1H), 7,92 (s, 1H), 7,68 (d, J=2,14 Гц, 1H), 7,58 (dd, J=8,54, 2,14 Гц, 1H), 4,68 - 4,77 (m, 2H), 3,41 - 3,58 (m, 2H), 3,03 - 3,10 (m, 1H), 2,65 - 2,69 (m, 1H), 2,38 (s, 2H), 2,27 (s, 3H), 1,05 - 1,14 (m, 1H), 0,60 - 0,68 (m, 2H), 0,42 - 0,44 (m, 1H).
184	MS m/z 381,4 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 9,45 (s, 1H), 9,27 (s, 1H), 9,05 (s, 1H), 7,98 (d, J=8,54 Гц, 1H), 7,92 (s, 1H), 7,68 - 7,70 (m, 1H), 7,58 (dd, J=8,54, 2,14 Гц, 1H), 4,76 - 4,86 (m, 2H) 3,44 - 3,53 (m, 3H), 3,39 - 3,42 (m, 1H), 3,24 - 3,29 (m, 1H), 2,38 (s, 3H), 2,02 - 2,27 (m, 1H), 1,06 - 1,09 (m, 6H).
11	MS m/z 365,3 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 9,08 (s, 1H), 7,99 (d, J=9,2 Гц, 1H), 7,96 (s, 2H), 7,67-7,74 (m, 2H), 4,82 (br d, J=13,5 Гц, 1H), 4,71 (d, J=13,6 Гц, 1H), 3,11-3,23 (m, 2H), 3,01 (dd, J=12,9, 10,2 Гц, 1H), 2,82 (td, J=12,9, 3,5 Гц, 1H), 1,96 (td, J=10,2, 3,5 Гц, 1H), 0,83-0,96 (m, 1H), 0,58-0,65 (m, 2H), 0,31-0,42 (m, 2H); 2H не наблюдались (NH и OH).
14	MS m/z 383,5 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 9,09 (s, 1H), 8,00 (d, J=9,0 Гц, 1H), 7,96 (s, 2H), 7,70-7,75 (m, 2H), 4,95 (d, J=13,5 Гц, 1H), 4,79 (d, J=13,5 Гц, 1H), 3,17-3,27 (m, 1H), 3,11 (td, J=13,2, 3,7 Гц, 1H), 2,86-2,96 (m, 2H), 2,64-2,75 (m, 1H), 1,32 (d, J=13,0 Гц, 6H); 3H не наблюдались (NH и 2OH).

Соед	Данные
18	MS m/z 381,5 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 9,06 (s, 1H), 7,89-8,03 (m, 3H), 7,66 (s, 2H), 4,91 (d, J=12,7 Гц, 1H), 4,74 (br d, J=12,7 Гц, 1H), 3,57-3,80 (m, 1H), 3,00-3,22 (m, 2H), 2,85 (br t, J=11,1 Гц, 1H), 2,45 (d, J=11,1 Гц, 1H), 1,06 (s, 9H); 2H не наблюдались (NH и OH).
132	MS m/z 353,3 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 9,09 (s, 1H), 7,99 (d, J=9,0 Гц, 1H), 7,96 (s, 2H), 7,69-7,74 (m, 2H), 4,81 (br d, J=12,8 Гц, 1H), 4,74 (d, J=12,9 Гц, 1H), 3,16-3,25 (m, 2H), 2,90-2,97 (m, 1H), 2,83-2,89 (m, 1H), 2,72-2,81 (m, 1H), 1,59 (quin, J=7,4 Гц, 2H), 1,08 (t, J=7,4 Гц, 3H); 2H не наблюдались (NH и OH).
153	MS m/z 365,3 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 9,09 (s, 1H), 7,98-8,02 (m, 1H), 7,96 (s, 2H), 7,68-7,75 (m, 2H), 4,93 (d, J=11,1 Гц, 1H), 4,84 (d, J=14,3 Гц, 1H), 3,14-3,28 (m, 3H), 2,85-2,93 (m, 1H), 2,29 (d, J=9,0 Гц, 2H), 2,13-2,23 (m, 1H), 1,83-2,05 (m, 3H), 1,51-1,63 (m, 1H); 1H не наблюдался (OH).
154	MS m/z 367,3 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, метанол- <i>d</i> ₄) δ: 9,17 (s, 1H), 7,99-8,05 (m, 1H), 7,97 (s, 2H), 7,73-7,76 (m, 2H), 5,04 (d, J=14,6 Гц, 1H), 4,94 (d, J=11,4 Гц, 1H), 3,50 (d, J=12,2 Гц, 1H), 3,46 (br d, J=9,6 Гц, 1H), 3,21-3,29 (m, 2H), 3,12-3,20 (m, 1H), 1,96-2,08 (m, 1H), 1,18 (d, J=6,9 Гц, 6H); 2H не наблюдались (NH и OH).

Пример 4

Получение соединения 180



Стадия 1: В колбу, содержащую мешалку, 3-(метилсульфонил)-1,2,4-триазин (3,3 г, 21,0 ммоль, 1,0 экв.) и HCl-соль (*S*)-2-циклопропилпиперазина (5,0 г, 25,1 ммоль, 1,2 экв.) добавляли ДМФА (100 мл), затем DIPEA (11 мл, 63,0 ммоль, 3,0 экв.) и перемешивали в течение 12 часов при 22°C. После этого растворитель удаляли, а

неочищенное масло очищали хроматографией на силикагеле с использованием градиента от 100% CH_2Cl_2 до 20% $\text{MeOH}/\text{CH}_2\text{Cl}_2$ с получением (*S*)-3-(3-циклопропилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазина (4,1 г, 20,1 ммоль, выход 96%) в виде коричневого твердого вещества. MS m/z 206,3 $[\text{M}+\text{H}]^+$.

Стадия 2: В колбу, содержащую (*S*)-3-(3-циклопропилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин (4,1 г, 20,1 ммоль, 1,0 экв.), добавляли Woc_2O (6,0 г, 27,0 ммоль, 1,3 экв.), NEt_3 (8,6 мл, 68,0 ммоль, 3,0 экв.) и CH_2Cl_2 (100 мл). Затем добавляли DMAP (0,5 г, 4,0 ммоль, 0,2 экв.), и смесь перемешивали при 22°C в течение 12 часов. Растворитель удаляли, а неочищенное масло очищали хроматографией на силикагеле, используя градиент от 100% гексана до 50% $\text{EtOAc}/\text{гексан}$, с получением *трет*-бутил (*S*)-2-циклопропил-4-(1,2,4-триазин-3-ил)пиперазин-1-карбоксилата (3,4 г, 11,3 ммоль, выход 55%) в виде масла. MS m/z 306,3 $[\text{M}+\text{H}]^+$.

Стадия 3: В колбу, содержащую *трет*-бутил (*S*)-2-циклопропил-4-(1,2,4-триазин-3-ил)пиперазин-1-карбоксилат (3,4 г, 11,3 ммоль, 1,0 экв.), добавляли ацетонитрил (90 мл) и воду (30 мл), и добавляли NBS (2,4 г, 13,0 ммоль, 1,2 экв.), и смесь перемешивали в течение 12 часов при 22°C. Далее смесь разбавляли EtOAc и водой. Органический слой отделяли, сушили над MgSO_4 , фильтровали и концентрировали. Очищали хроматографией на силикагеле с применением градиента от 100% гексана до 50% $\text{EtOAc}/\text{гексан}$ с получением *трет*-бутил-(*S*)-4-(6-бром-1,2,4-триазин-3-ил)-2-циклопропилпиперазин-1-карбоксилат (2,9 г, 7,5 ммоль, выход 67%) в виде оранжевого масла. MS m/z 384,1, 386,1 $[\text{M}+\text{H}]^+$.

Стадия 4: В колбу, содержащую *трет*-бутил (*S*)-4-(6-бром-1,2,4-триазин-3-ил)-2-циклопропилпиперазин-1-карбоксилат (1,0 г, 2,6 ммоль, 1,0 экв.), трибутил(4-хлор-2-(метоксиметокси)фенил)станнан (1,4 г, 3,0 ммоль, 1,2 экв.), $\text{PdCl}_2(\text{PPh}_3)_2$ (0,2 г, 0,3 ммоль, 0,1 экв.), CuI (0,1 г, 0,5 ммоль, 0,2 экв.) добавляли диоксан (20 мл) и продували Ar . Колбу перемешивали в течение 2 ч при 100°C в атмосфере Ar . После охлаждения смесь фильтровали, и фильтрат концентрировали и очищали хроматографией на силикагеле с использованием градиента от 100% гексана до 50% $\text{EtOAc}/\text{гексан}$ с получением *трет*-бутил (*S*)-4-(6-(5-хлор-3-(метоксиметокси)пиридин-2-ил)-1,2,4-триазин-3-ил)-2-циклопропилпиперазин-1-карбоксилата (0,4 г, 0,9 ммоль, выход 34%) в виде желтого масла. MS m/z 477,1, 479,1 $[\text{M}+\text{H}]^+$.

Стадия 5: К флакону, содержащему *трет*-бутил-(*S*)-4-(6-(5-хлор-3-(метоксиметокси)пиридин-2-ил)-1,2,4-триазин-3-ил)-2-циклопропилпиперазин-1-карбоксилат (0,05 г, 0,1 ммоль, 1,0 экв.) добавляли (2-метил-2H-[1,2,3]триазоло[4,5-

б]пиридин-6-ил)бороновую кислоту (0,04 г, 0,2 ммоль, 1,5 экв.), K_2CO_3 (0,05 г, 0,4 ммоль, 3,0 экв.), XPhos Pd G₃ (0,01 г, 0,01 ммоль, 0,1 экв.), диоксан (1 мл) и воду (1 мл). Смесь перемешивали при 100°C в течение 1 часа. После охлаждения смесь очищали хроматографией на силикагеле с использованием градиента от 100 % гексана до 50 % EtOAc/гексан с получением *трет*-бутил (*S*)-2-циклопропил-4-(6-(3-(метоксиметокси)-5-(2-метил-2Н-[1,2,3]триазоло[4,5-*b*]пиридин-6-ил)пиридин-2-ил)-1,2,4-триазин-3-ил)пиперазин-1-карбоксилата (0,02 г, 0,03 ммоль, выход 28%) в виде твердого вещества желтого цвета. MS *m/z* 475,4 [*M*+H]⁺.

Стадия 6: К флакону, содержащему *трет*-бутил (*S*)-2-циклопропил-4-(6-(3-(метоксиметокси)-5-(2-метил-2Н-[1,2,3]триазоло[4,5-*b*]пиридин-6-ил)пиридин-2-ил)-1,2,4-триазин-3-ил)пиперазин-1-карбоксилат (0,02 г, 0,03 ммоль, 1,0 экв.), растворенный в MeOH (1 мл), и добавляли 4,0 М HCl/диоксан. Смеси давали возможность перемешиваться в течение 1 ч при 22°C. Затем смесь концентрировали и очищали хроматографией на силикагеле с использованием градиента от 100% CH₂Cl₂ до 15% MeOH/CH₂Cl₂ с получением HCl соли (*S*)-2-(3-(3-циклопропилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил)-5-(2-метил-2Н-[1,2,3]триазоло[4,5-*b*]пиридин-6-ил)пиридин-3-ола (0,01 г, 0,02 ммоль, выход 58%) в виде белого твердого вещества при сушке. MS *m/z* 431,4 [*M*+H]⁺; ¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-*d*₆) δ: 12,02 (s, 1H), 9,45 (s, 1H), 9,25 (s, 1H), 9,16 (s, 1H), 8,90 (s, 1H), 8,78 (s, 1H), 7,99 (s, 1H), 4,77 (d, J = 14,0 Гц, 1H), 4,72 (d, J = 15,0 Гц, 1H), 4,60 (s, 3H), 3,54-3,46 (m, 3H), 3,11 (t, J = 11,5 Гц, 1H), 2,70 (t, J = 9,0 Гц, 1H), 1,09-1,02 (m, 1H), 0,72-0,64 (m, 2H), 0,57-0,54 (m, 1H), 0,46-0,43 (m, 1H).

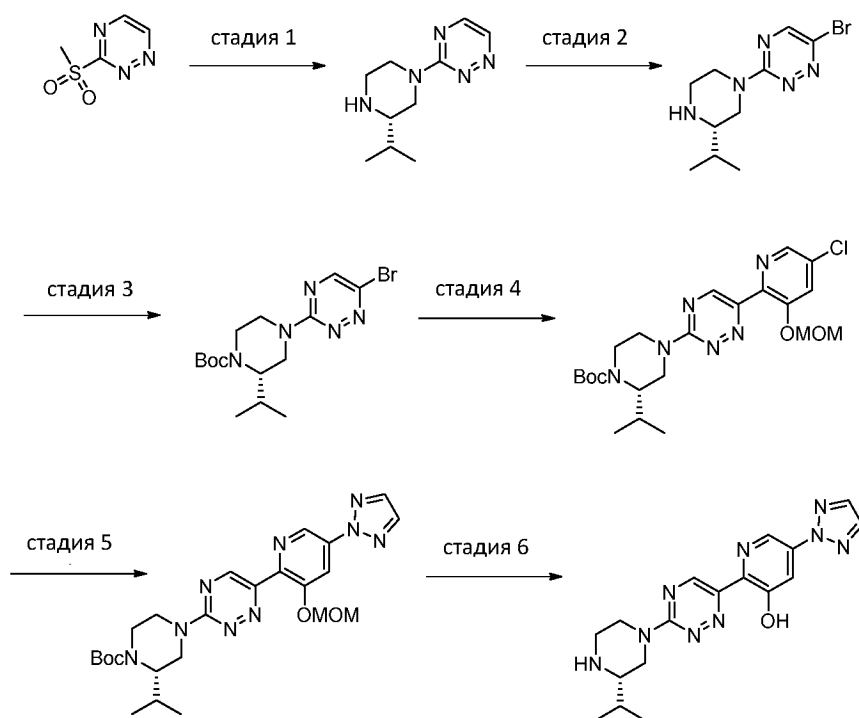
Используя методику, описанную выше для Примера 4, можно получить дополнительные соединения, описанные в настоящем документе, путем замены соответствующего исходного материала, подходящих реагентов и условий реакции с получением соединений, таких как соединения, выбранные из:

Соед	Данные
181	MS <i>m/z</i> 447,4 [<i>M</i> +H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 12,02 (s, 1H), 11,13 (s, 1H), 9,36 (s, 1H), 8,65 (d, J = 2,0 Гц, 1H), 8,58 (d, J = 2,0 Гц, 1H), 8,03 (d, J = 1,0 Гц, 1H), 7,75 (d, J = 2,0 Гц, 1H), 7,55 (d, J = 14,5 Гц, 1H), 4,68 (d, J = 12,0 Гц, 1H), 4,60 (d, J = 12,5 Гц, 1H), 4,23 (s, 3H), 3,25-3,08 (m, 3H), 2,79 (t, J = 11,5 Гц, 1H), 2,23-2,12 (m, 1H), 0,93-0,85 (m, 1H), 0,56-0,48 (m, 2H), 0,39-0,36 (m, 1H), 0,33-0,30 (m, 1H).

Соед	Данные
157	MS m/z 449,5 [M+H] ⁺ ; ¹ H (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 12,07 (s, 1H), 9,34 (s, 1H), 8,64 (d, J = 2,0 Гц, 1H), 8,58 (d, J = 2,0 Гц, 1H), 8,03 (s, 1H), 7,77 (d, J = 2,0 Гц, 1H), 7,55 (d, J = 14,0 Гц, 1H), 4,67-4,55 (m, 2H), 4,23 (s, 3H), 3,05 (t, J = 11,5 Гц, 2H), 2,81 (t, J = 11,5 Гц, 1H), 2,70 (t, J = 12,0 Гц, 1H), 2,43-2,36 (m, 1H), 1,70-1,63 (m, 1H), 0,97 (d, J = 7,0 Гц, 6H); 1H не наблюдался (NH или OH).
121	MS m/z 433,4 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 12,04 (s, 1H), 9,35 (s, 1H), 8,65 (s, 1H), 8,38 (s, 1H), 7,77 (s, 1H), 7,69 (s, 1H), 6,98 (s, 1H), 4,17 (s, 3H), 4,02 (s, 3H), 3,90 (t, J = 5,0 Гц, 4H), 2,45 (t, J = 5,0 Гц, 4H), 2,25 (s, 3H).
122	MS m/z 421,4 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 11,55 (s, 1H), 9,41 (s, 1H), 8,98 (s, 1H), 8,66 (s, 1H), 7,85 (s, 1H), 7,84 (d, J = 12,0 Гц, 1H), 7,82 (s, 1H), 4,80 (m, 4H), 3,16 (s, 3H), 2,78 (m, 4H), 2,39 (s, 3H).
124	MS m/z 339,2 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 13,21 (s, 1H), 12,00 (s, 1H), 9,31 (s, 1H), 8,57 (s, 1H), 8,41 (s, 1H), 8,10 (s, 1H), 7,67 (s, 1H), 3,88 (s, 2H), 3,30 (s, 2H), 2,49 (s, 3H), 2,45 (s, 2H), 2,24 (s, 2H).
126	MS m/z 417,4 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 12,04 (s, 1H), 11,59 (s, 1H), 9,42 (s, 1H), 9,20 (s, 1H), 8,69 (s, 1H), 7,99 (s, 1H), 7,87 (s, 1H), 4,87-4,76 (m, 2H), 3,66-3,48 (m, 4H), 3,22-3,10 (m, 2H), 2,79 (s, 3H), 2,64 (s, 3H), 2,52 (s, 3H).

Пример 5

Получение соединения 175



Стадия 1: К раствору 3-(метилсульфонил)-1,2,4-триазина (3,0 г, 18,8 ммоль) и HCl соли (*S*)-2-изопропилпиперазина (4,5 г, 22,6 ммоль) в ДМФА (100 мл) добавляли

добавили DIPEA (33 мл, 187 ммоль). Реакционную смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 12 ч, пока СВЭЖХ не показала полную конверсию. Растворитель удаляли, а неочищенное масло очищали хроматографией на силикагеле, элюируя градиентом $\text{CH}_2\text{Cl}_2/\text{MeOH}$ (0-20% MeOH), с получением (*S*)-3-(3-изопропилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазина (1,8 г, выход 46%) в виде твердого вещества коричневого цвета. MS m/z 208,3 $[\text{M}+\text{H}]^+$.

Стадия 2: К раствору (*S*)-3-(3-изопропилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазина (1,8 г, 8,7 ммоль) в воде (100 мл) и MeOH (25 мл) по каплям добавляли бром (0,7 мл, 13,0 ммоль), и смесь перемешивали в течение 1 часа. Добавляли насыщенный водный раствор тиосульфата натрия, затем воду и EtOAc. Водный слой затем экстрагировали EtOAc 3 раза. Органический слой промывали водой, солевым раствором, и сушили над MgSO_4 , фильтровали и концентрировали. Неочищенное масло очищали хроматографией на силикагеле, элюируя градиентом $\text{CH}_2\text{Cl}_2/\text{MeOH}$ (0-10% MeOH), с получением (*S*)-6-бром-3-(3-изопропилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазина (1,7 г, выход 69%) в виде коричневого твердого вещества. MS m/z 286,1, 288,1 $[\text{M}+\text{H}]^+$.

Стадия 3: В колбу, содержащую (*S*)-6-бром-3-(3-изопропилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин (1,7 г, 6,0 ммоль), Et_3N (2,5 мл, 18,0 ммоль) и Woc_2O (1,7 г, 7,8 ммоль) добавляли CH_2Cl_2 (100 мл). Добавляли DMAP (0,2 г, 1,2 ммоль), и смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 12 часов. Растворитель удаляли, а неочищенное масло очищали хроматографией на силикагеле, элюируя градиентом гексан/EtOAc (0-100% EtOAc), с получением *трет*-бутил (*S*)-4-(6-бром-1,2,4-триазин-3-ил)-2-изопропилпиперазин-1-карбоксилата (2,1 г, выход 90%) в виде белого твердого вещества. MS m/z 386,1, 388,1 $[\text{M}+\text{H}]^+$.

Стадия 4: Во флакон, содержащий *трет*-бутил (*S*)-4-(6-бром-1,2,4-триазин-3-ил)-2-изопропилпиперазин-1-карбоксилат (1,3 г, 3,4 ммоль), добавляли трибутил(4-хлор-2-(метоксиметокси)фенил)станнан (1,9 г, 4,1 ммоль), CuI (0,1 г, 0,7 ммоль) и $\text{PdCl}_2(\text{PPh}_3)_2$ (0,2 г, 0,3 ммоль), а затем диоксан (10 мл). Смесь продували Ag и перемешивали при 100°C в течение 2 часов. Неочищенную смесь фильтровали и концентрировали. Остаточное масло очищали хроматографией на силикагеле, элюируя градиентом гексан/EtOAc (0-100% EtOAc), с получением *трет*-бутил (*S*)-4-(6-(5-хлор-3-(метоксиметокси)пиридин-2-ил)-1,2,4-триазин-3-ил)-2-изопропилпиперазин-1-карбоксилата (0,8 г, выход 51%) в виде бесцветного масла. MS m/z 479,2, 481,2 $[\text{M}+\text{H}]^+$.

Стадия 5: Во флакон, содержащий *t*BuXPhos (0,01 г, 0,01 ммоль), $\text{Pd}_2(\text{dba})_3$ (0,01 г, 0,01 ммоль), добавляли толуол (1 мл) и продували смесь Ag . Реакционную смесь

нагревали до 110°C в течение 10 мин, затем охлаждали до комнатной температуры. Раствор катализатора добавляли во флакон, содержащий *трет*-бутил (*S*)-4-(6-(5-хлор-3-(метоксиметокси)пиридин-2-ил)-1,2,4-триазин-3-ил)-2-изопропилпиперазин-1-карбоксилат (0,06 г, 0,1 ммоль), триазол (0,01 г, 0,15 ммоль), K₃PO₄ (0,05 г, 0,2 ммоль) в толуоле (5 мл). Реакционной смеси давали возможность перемешиваться при 110°C в течение 4 часов. Неочищенную смесь фильтровали, концентрировали и очищали, элюируя градиентом гексан/EtOAc (0-50% EtOAc), с получением *трет*-бутил (*S*)-2-изопропил-4-(6-(3-(метоксиметокси)-5-(2Н-1,2,3-триазол-2-ил)пиридин-2-ил)-1,2,4-триазин-3-ил)пиперазин-1-карбоксилат (0,04 г, выход 72%) в виде бесцветного масла. MS *m/z* 512,5 [M+H]⁺

Стадия 6: К флакону, содержащему *трет*-бутил (*S*)-2-изопропил-4-(6-(3-(метоксиметокси)-5-(2Н-1,2,3-триазол-2-ил)пиридин-2-ил)-1,2,4-триазин-3-ил)пиперазин-1-карбоксилат (0,04 г, 0,08 ммоль) и мешалку добавляли MeOH (2 мл). Добавляли 4,0 М HCl/диоксан (2 мл) и перемешивали смесь при комнатной температуре в течение 1 часа. Растворитель удаляли, а неочищенное твердое вещество очищали хроматографией на силикагеле с использованием градиента CH₂Cl₂/MeOH (0-10% MeOH) с получением (*S*)-2-(3-(3-изопропилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил)-5-(2Н-1,2,3-триазол-2-ил)пиридин-3-ола (0,02 г, выход 73%) в виде белого твердого вещества после сушки. MS *m/z* 368,3 [M+H]⁺; ¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-*d*₆) δ: 9,26 (s, 1H), 8,90 (d, J = 2,0 Гц, 1H), 8,24 (s, 2H), 7,93 (d, J = 2,0 Гц, 1H), 4,65 (d, J = 11,0 Гц, 1H), 4,57 (d, J = 11,0 Гц, 1H), 3,05 (t, J = 11,0 Гц, 2H), 2,82 (t, J = 11,5 Гц, 1H), 2,70 (t, J = 10,5 Гц, 1H), 2,39-2,36 (m, 1H), 1,71-1,60 (m, 1H), 0,97 (d, J = 6,5 Гц, 6H); 2H не наблюдались (NH и OH).

Используя методику, описанную выше для Примера 5, можно получить дополнительные соединения, описанные в настоящем документе, путем замены соответствующего исходного материала, подходящих реагентов и условий реакции с получением соединений, таких как:

Соед	Данные
182	MS <i>m/z</i> 366,3 [M+H] ⁺ ; ¹ H ЯМР (500 МГц, ДМСО- <i>d</i> ₆) δ: 12,14 (s, 1H), 9,34 (s, 1H), 9,09 (s, 2H), 8,94 (s, 1H), 8,26 (s, 2H), 7,97 (s, 1H), 4,77 (d, J = 14,5 Гц, 1H), 4,71 (d, J = 14,0 Гц, 1H), 3,53-3,44 (m, 3H), 3,17-3,08 (m, 1H), 2,74-2,68 (m, 1H), 1,06-1,00 (m, 1H), 0,72-0,63 (m, 2H), 0,57-0,53 (m, 1H), 0,47-0,42 (m, 1H); 1H из HCl соли.

БИОЛОГИЧЕСКИЕ ПРИМЕРЫ

Следующие биологические примеры *in vitro* демонстрируют пригодность соединений согласно настоящему описанию для лечения болезни Хантингтона.

Чтобы описать более подробно и помочь в понимании настоящего описания, предложены следующие неограничивающие биологические примеры для более полной иллюстрации объема описания, и их не следует толковать как конкретным образом ограничивающие его объем. Такие вариации настоящего описания, которые могут быть известны на данный момент или разработаны позже, которые будут находиться в пределах компетенции специалиста в данной области техники, считаются подпадающими под объем настоящего описания и заявленным ниже.

Соединения формулы (I) протестировали с использованием анализа Meso Scale Discovery (MSD), представленного в международной заявке № PCT/US2016/066042, поданной 11 декабря 2016 г. в которой испрашивается приоритет предварительной заявки США 62/265652, поданной 10 декабря 2015 г., полное содержание которой включено в настоящий документ посредством ссылки.

Анализ эндогенного белка хантингтина, использованный в Биологическом примере 1, был разработан с применением платформы электрохемилюминесцентного анализа MSD на основе ELISA.

Биологический пример 1

Анализ эндогенного белка хантингтина

96-луночные или 384-луночные планшеты Meso Scale Discovery (MSD) покрывали в течение ночи при 4°C моноклональным антителом MW1 (расширенный полиглутамин) или MAB2166 (для захвата) в концентрации 1 мкг/мл в PBS (30 мкл на лунку). Затем планшеты трижды промывали 300 мкл промывочного буфера (0,05% Tween-20 в PBS) и блокировали (100 мкл блокирующего буфера; 5% BSA в PBS) в течение 4-5 часов при комнатной температуре при вращательном встряхивании, а затем трижды промывали промывочным буфером.

Образцы (25 мкл) переносили на планшет MSD, покрытый антителами, и инкубировали в течение ночи при 4°C. После удаления лизатов планшет трижды промывали промывочным буфером и добавляли 25 мкл вторичного антитела #5656S (Cell signaling; моноклональное кроличье) (разбавленного до 0,25 мкг/мл в 0,05% Tween-20 в блокирующем буфере) в каждую лунку и инкубировали при встряхивании в течение 1 часа при комнатной температуре. После инкубации со вторичным антителом

лунки промывали промывочным буфером, после чего 25 мкл вторичного детектирующего антитела козы против кроличьего SULFO TAG (необходимый аспект системы MSD) (разбавленного до 0,25 мкг/мл в 0,05% Tween-20 в блокирующем буфере) добавляли в каждую лунку и инкубировали при встряхивании в течение 1 часа при комнатной температуре. После трехкратной промывки промывочным буфером в каждую пустую лунку добавляли по 150 мкл буфера Т для считывания с поверхностно-активным веществом (MSD) и планшет визуализировали на планшет-ридере SI 6000 (MSD) в соответствии с инструкциями производителей, предоставленными для 96- или 384 -луночных планшетов. Полученные значения IC_{50} (нМ) для протестированных соединений представлены в Таблицах 2 и 3.

Таблица 2. Величины IC_{50} (нМ) для соединений 1-284

Соед	IC_{50} (нМ)	Соед	IC_{50} (нМ)	Соед	IC_{50} (нМ)
1	2,1	95	8,3	189	461,2
2	3,9	96	8,6	190	166,4
3	4,4	97	9,8	191	621,0
4	4,5	98	10,2	192	34,2
5	6	99	10,5	193	4,8
6	6,7	100	10,9	194	19,3
7	6,9	101	13,0	195	9,1
8	8,7	102	13,4	196	491,5
9	9,5	103	13,4	197	11,6
10	9,5	104	14,6	198	12,5
11	9,6	105	15,3	199	525,7
12	10,9	106	16,5	200	30,1
13	11,4	107	16,8	201	11,1
14	12,2	108	19,8	202	3,7
15	12,8	109	22,1	203	42,5
16	13,2	110	24,9	204	162,5
17	14,1	111	27,5	205	903,6
18	15,1	112	34,0	206	33,7
19	17,1	113	36,0	207	10,0
20	17,1	114	54,4	210	975,4
21	20,8	115	179,5	212	3,3
22	22,3	116	678,5	213	7,7
23	22,7	117	неактивное	214	36,6

24	23,4
25	24,6
26	24,9
27	25,1
28	26,2
29	28,5
30	33,3
31	34,3
32	40,2
33	41,4
34	42
35	46,1
36	47,7
37	50,7
38	56,2
39	63,7
40	68,2
41	109,8
42	110,9
43	116,2
44	137,7
45	141,5
46	150,3
47	154,5
48	166,9
49	256,1
50	312,2
51	329,9
52	335,5
53	435,1
54	439,8
55	547,9
56	654,2
57	668,3
58	678,1
59	875,6
60	1007,2
61	1437,5

118	неактивное
119	неактивное
120	неактивное
121	16,1
122	41,2
123	11,2
124	608,6
125	7,3
126	100,0
127	672,3
128	26,7
129	18,6
130	12,0
131	7,6
132	38,9
133	13,0
134	14,9
135	184,7
136	50,5
137	7,5
138	19,9
139	18,0
140	5,8
141	2,3
142	60,3
143	634,4
144	466,3
145	479,5
146	538,8
147	38,8
148	53,4
149	90,7
150	138,7
151	204,4
152	15,0
153	438,4
154	18,7
155	19,5

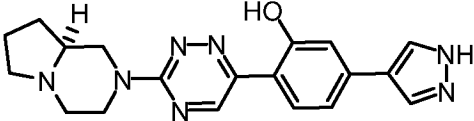
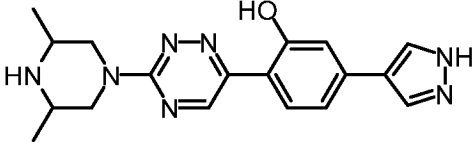
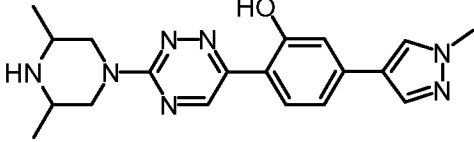
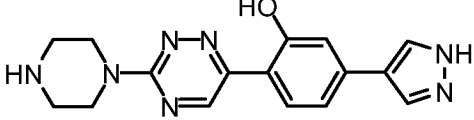
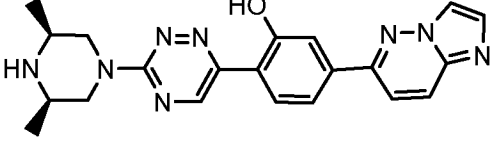
215	113,5
216	218,4
217	67,9
218	73,8
219	13,7
220	88,3
221	4,4
222	9,4
223	7,0
224	232,1
225	13,4
226	130,1
227	37,3
228	73,1
229	18,2
230	11,3
231	21,9
232	147,1
233	17,7
234	8,7
235	8,1
236	9,5
237	103,5
238	55,1
239	12,4
240	171,1
241	5,7
242	106,0
243	218,0
244	381,5
245	11,5
246	28,4
247	201,2
248	74,9
249	318,9
250	140,0
251	18,6
252	16,5

62	2390,1
63	неактивное
64	неактивное
65	1,6
66	3,7
67	2,1
68	2,2
69	3,6
70	3,8
71	4,0
72	4,1
73	4,1
74	4,3
75	4,3
76	4,3
77	4,9
78	5,1
79	5,2
80	5,3
81	5,4
82	5,5
83	5,6
83	5,6
84	5,9
85	6,0
86	6,0
87	6,4
88	6,5
89	6,7
90	6,8
91	7,3
92	7,9
94	8,3

156	12,5
157	7,8
158	5,6
159	62,2
160	788,6
161	60,5
162	25,4
163	4,2
164	4,0
165	123,6
166	191,7
167	14,2
168	1,7
169	354,7
170	21,5
171	14,1
172	4,0
173	21,3
174	607,3
175	235,6
176	619,2
177	29,0
178	299,9
179	113,2
180	27,6
181	6,2
182	173,1
183	18,8
184	49,0
185	158,1
186	77,7
187	401,2
188	105,4

253	375,5
254	555,6
255	340,7
256	12,4
257	19,8
258	10,8
259	337,8
260	417,3
261	992,7
262	94,2
263	214,1
264	125,1
265	291,7
266	19,4
267	145,0
268	124,5
269	53,9
270	29,2
271	943,4
272	356,5
273	645,7
274	291,0
275	755,2
276	3,7
277	24,8
278	8,3
279	5,2
280	4,5
281	198,2
282	131,0
283	7,3
284	91,4

Таблица 3. Величины IC₅₀ (нМ) для выбранных соединений из WO/2019/191229 A1

WO/2019/191229 A1	IC ₅₀ (нМ)
Соед 116 	91,4
Соед 262 	72,8
Соед 263 	352,1
Соед 328 	106,3
Соед 385 	33,1

В Таблице 2, где соединения указаны как «неактивные», результаты превышают предел обнаружения анализа и соединения считаются неактивными.

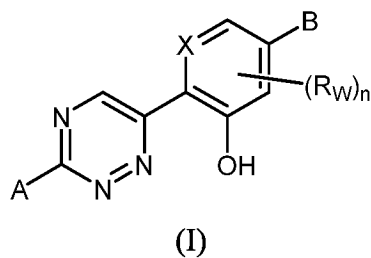
Независимо от того, был ли цитируемый в настоящей заявке документ специально и отдельно указан как включенный путем ссылки, все документы, упомянутые в настоящем документе, включены посредством ссылки в настоящую заявку для любых и всех целей в той же степени, как если бы каждая отдельная ссылка была полностью изложена в настоящем документе.

После полного описания объекта формулы изобретения специалистам в данной области техники будет понятно, что то же самое может быть выполнено в широком диапазоне эквивалентов, не влияя на объем объекта изобретения или конкретные аспекты, описанные в настоящем документе. Подразумевается, что прилагаемая

формула изобретения должна интерпретироваться как включающая все такие эквиваленты.

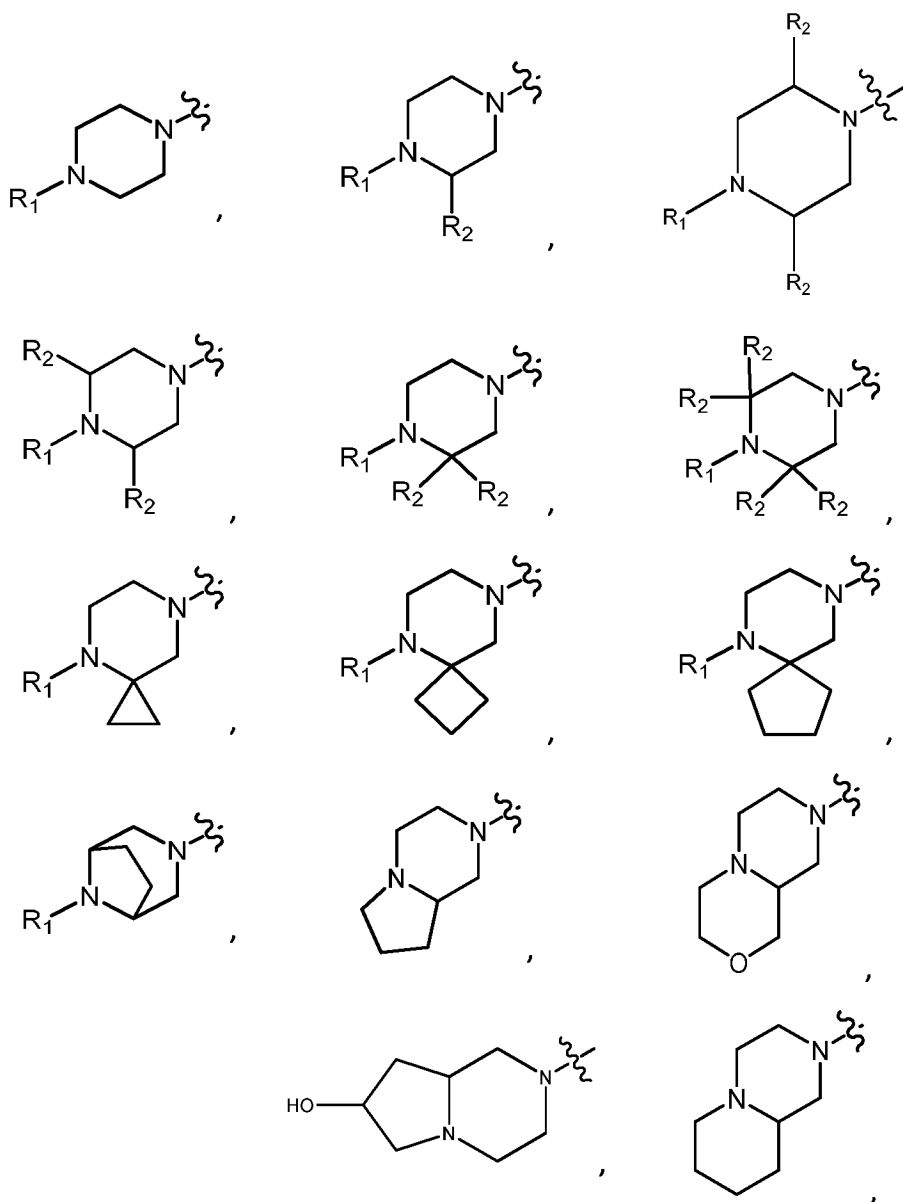
ФОРМУЛА ИЗОБРЕТЕНИЯ:

1. Соединение Формулы (I) или его форма:



где:

А выбран из группы, состоящей из:



и любого их стереоизомера;

R₁ выбран из группы, состоящей из водорода, C₁₋₄-алкила и C₃₋₆-циклоалкила;

R₂ независимо выбран из группы, состоящей из галогена, C₁₋₄алкила, дейтеро-C₁₋₄алкила, галоген-C₁₋₄алкила, гидроксил-C₁₋₄алкила, C₁₋₄алкокси-C₁₋₄алкила, C₂₋₄алкенила, C₃₋₆циклоалкила, фенила, пиридинила и гетероциклила, причем гетероциклил представляет собой 3-6-членный радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 1 или 2 гетероатомных члена в кольце, выбранных из N, O и S, и

причем в каждом случае C₁₋₄алкил, C₃₋₆циклоалкил, фенил, пиридинил и гетероциклил необязательно замещен одним или двумя заместителями R₃;

R₃ независимо выбран из группы, состоящей из галогена, гидроксила, C₁₋₄алкила, C₁₋₄алкокси и C₃₋₆циклоалкила;

B выбран из группы, состоящей из:

фенила, необязательно замещенного одним или двумя независимо выбранными заместителями R₄;

гетероарила, причем гетероарил представляет собой 5- или 6-членный моноциклический ароматический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 1, 2 или 3 гетероатома, выбранных из N, O и S, необязательно замещенный одним R₄ заместителем, или причем гетероарил представляет собой 9- или 10-членный бициклический ароматический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 1, 2, 3 или 4 гетероатомных члена в кольце, независимо выбранных из N, O или S, необязательно замещенный одним или двумя независимо выбранными R₄ заместителями; и

гетероциклила, причем гетероциклил представляет собой 8-10-членный бициклический ароматический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 1, 2, 3 или 4 гетероатомных члена в кольце, независимо выбранных из N, O или S, необязательно замещенный одним или двумя независимо выбранными R₄ заместителями;

R₄ выбран из группы, состоящей из галогена, циано, C₁₋₄алкила, дейтеро-C₁₋₄алкила, галоген-C₁₋₄алкила, C₁₋₄алкокси, дейтеро-C₁₋₄алкокси, amino, C₁₋₄алкил-amino, (C₁₋₄алкил)₂-amino, C₃₋₆циклоалкила и гетероциклила, причем гетероциклил представляет собой 3-6-членный моноциклический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 1 или 2 гетероатомных члена в кольце, независимо выбранных из N, O или S;

X выбран из группы, состоящей из CH, CF и N;

R_w выбран из группы, состоящей из галогена, гидроксила, циано, C_{1-4} алкила, дейтеро- C_{1-4} алкила, галоген- C_{1-4} алкила, amino, C_{1-4} алкил-amino,

$(C_{1-4}$ алкил) $_2$ -amino, C_{1-4} алкокси, и галоген- C_{1-4} алкокси; и

n выбран из группы, состоящей из 0 или 1;

причем форма соединения выбрана из группы, состоящей из его соли, гидрата, сольвата и таутомерной формы.

2. Соединение по п. 1, отличающееся тем, что В представляет собой 5- или 6-членный моноциклический ароматический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 1, 2 или 3 гетероатома, выбранных из N, O и S.
3. Соединение по п. 1, отличающееся тем, что В представляет собой 9- или 10-членную бициклическую ароматическую кольцевую систему, содержащую 1, 2, 3 или 4 гетероатомных члена в кольце, независимо выбранных из N, O или S.
4. Соединение по п. 1, отличающееся тем, что В представляет собой гетероциклил, причем гетероциклил представляет собой 8-10-членный бициклический ароматический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 1, 2, 3 или 4 гетероатомных члена в кольце, независимо выбранных из N, O или S.
5. Соединение по п. 1, отличающееся тем, что В выбран из группы, состоящей из: фенила, необязательно замещенного одним или двумя независимо выбранными заместителями R_4 ; гетероарила,

причем гетероарил представляет собой 5- или 6-членный моноциклический ароматический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий по меньшей мере один атом N; или

причем гетероарил представляет собой 9-членный бициклический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий по меньшей мере 2 атома N; и

 гетероциклила,

причем гетероциклил представляет собой 8- или 9-членный бициклический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий по меньшей мере один атом N.

6. Соединение по п. 1, отличающееся тем, что В выбран из группы, состоящей из: фенила, необязательно замещенного одним R₄ заместителем; гетероарила,

причем гетероарил представляет собой 5- или 6-членный моноциклический ароматический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 1, 2 или 3 атома N, и необязательно, когда кольцевая структура содержит 1 или 2 N, второй гетероатом, выбранный из O и S, необязательно замещенный одним R₄ заместителем, или

причем гетероарил представляет собой 9-членный бициклический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 2, 3 или 4 атома N, необязательно, когда кольцевая структура содержит 2 или 3 N, содержащий второй гетероатомный член в кольце, выбранный из O или S, и необязательно замещенный одним или двумя независимо выбранными R₄ заместителями; и гетероциклила,

причем гетероциклил представляет собой 8- или 9-членный бициклический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 2, 3 или 4 атома N, и необязательно, когда кольцевая структура содержит 2 или 3 N, содержащий второй гетероатомный член в кольце, выбранный из O или S, необязательно замещенный одним или двумя независимо выбранными R₄ заместителями.

7. Соединение по п. 1, отличающееся тем, что В представляет собой гетероарил или гетероцикл,

причем гетероарил представляет собой 5- или 6-членный моноциклический ароматический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 1, 2 или 3 атома N, необязательно замещенный одним R₄ заместителем, или

причем гетероарил представляет собой 9-членный бициклический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 2, 3 или 4 атома N, и необязательно замещенный одним или двумя независимо выбранными R₄ заместителями; и

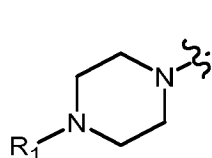
причем гетероциклил представляет собой 8- или 9-членный бициклический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода,

содержащий 2, 3 или 4 N, и необязательно замещенный одним или двумя независимо выбранными R₄ заместителями.

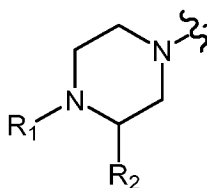
8. Соединение по п. 1, отличающееся тем, что В представляет собой гетероарил, причем гетероарил представляет собой 5- или 6-членный моноциклический ароматический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 1, 2 или 3 атома N, и необязательно замещенный одним R₄ заместителем, или

причем гетероарил представляет собой 9-членный бициклический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 2, 3 или 4 атома N, и необязательно замещенный одним или двумя независимо выбранными R₄ заместителями.

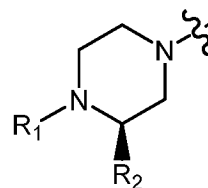
9. Соединение по любому из предшествующих пунктов, отличающееся тем, что А выбран из группы, состоящей из:



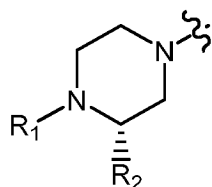
A1



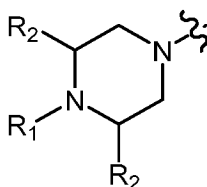
A2



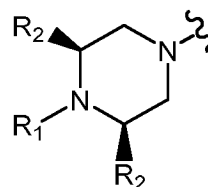
A3



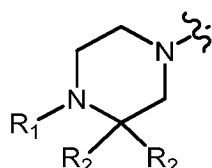
A4



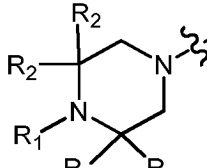
A5



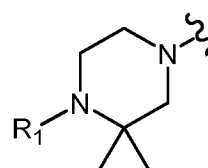
A6



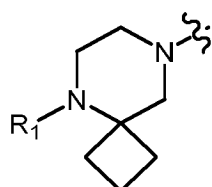
A8



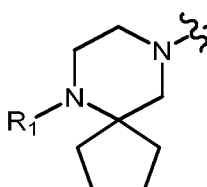
A9



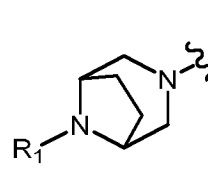
A10



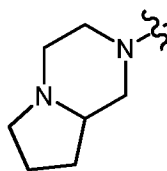
A11



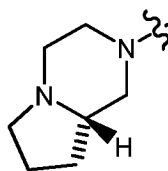
A12



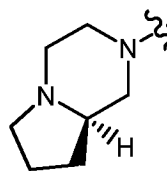
A13



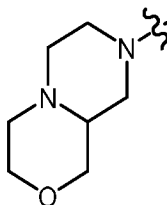
A14



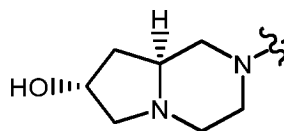
A15.



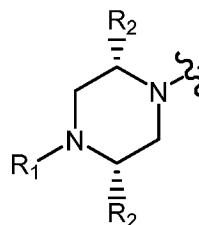
A16



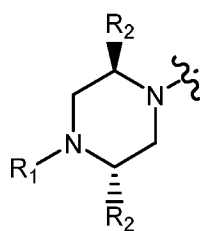
A17



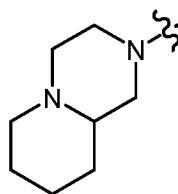
A18



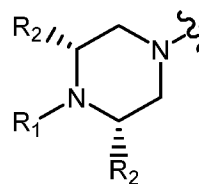
A20



A21

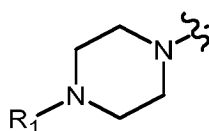


A23 и

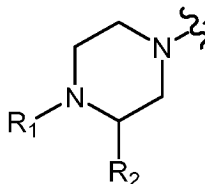


A24.

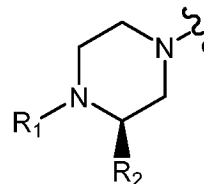
10. Соединение по любому из предшествующих пунктов, отличающееся тем, что **A** выбран из группы, состоящей из:



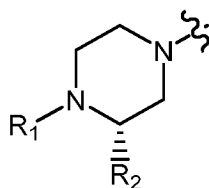
A1



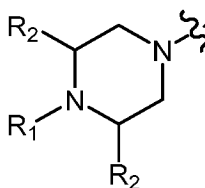
A2



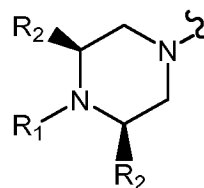
A3



A4

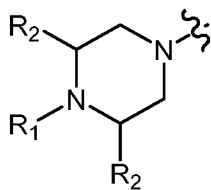


A5 и



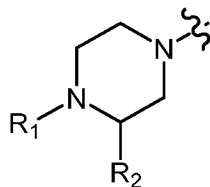
A6.

11. Соединение по любому из предшествующих пунктов, отличающееся тем, что **A**



представляет собой или любой его стереоизомер.

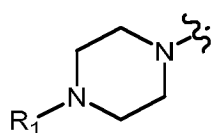
12. Соединение по любому из пп. 1-11, отличающееся тем, что А представляет



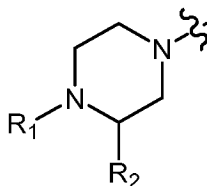
собой или любой его стереоизомер.

13. Соединение по любому из предшествующих пунктов, отличающееся тем, что R₁ представляет собой водород или C₁₋₄алкил.
14. Соединение по любому из предшествующих пунктов, отличающееся тем, что R₁ представляет собой водород.
15. Соединение по любому из предшествующих пунктов, отличающееся тем, что X представляет собой СН.
16. Соединение по любому из пп. 1-14, отличающееся тем, что X представляет собой N.
17. Соединение по любому из пп. 1-14, отличающееся тем, что X представляет собой CF.
18. Соединение по любому из предшествующих пунктов, отличающееся тем, что n представляет собой 0.
19. Соединение по любому из предшествующих пунктов, отличающееся тем, что R₂ представляет собой C₁₋₄алкил, галоген-C₁₋₄алкил, гидроксил-C₁₋₄алкил, циклопропил, циклобутил, фенил или оксетанил, каждый необязательно замещенный одним или двумя R₃ заместителями.
20. Соединение по любому из предшествующих пунктов, отличающееся тем, что R₂ представляет собой незамещенный C₁₋₄алкил, незамещенный галоген-C₁₋₄алкил, незамещенный гидроксил-C₁₋₄алкил, незамещенный циклопропил, незамещенный циклобутил, незамещенный фенил или незамещенный оксетанил.
21. Соединение по любому из предшествующих пунктов, отличающееся тем, что В является замещенным.

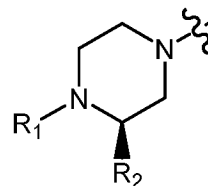
22. Соединение по любому из предшествующих пунктов, отличающееся тем, что R_4 представляет собой галоген, циано, C_{1-4} алкил, дейтеро- C_{1-4} алкил, галоген- C_{1-4} алкил, C_{1-4} алкокси, дейтеро- C_{1-4} алкокси, C_{1-4} алкил-амино, C_{3-6} циклоалкил и гетероцикл.
23. Соединение по любому из предшествующих пунктов, отличающееся тем, что R_4 представляет собой галоген, циано, метил, этил, $(^2H_3)$ метил, $(^2H_3)$ этил, дифторметил, трифторметил, метокси, этокси, $(^2H_3)$ метокси, метиламино, этиламино, циклопропил и азетидинил.
24. Соединение по любому из предшествующих пунктов, отличающееся тем, что R_4 представляет собой хлор, фтор, циано, метил, этил, $(^2H_3)$ метил, дифторметил, трифторметил, метокси, этокси, $(^2H_3)$ метокси, метиламино и циклопропил.
25. Соединение по любому из пп. 1-20, отличающееся тем, что В является незамещенным.
26. Соединение по п. 1, отличающееся тем, что:
 n представляет собой 0;
 X представляет собой С;
 R_2 представляет собой C_{1-4} алкил, галоген- C_{1-4} алкил, гидроксил- C_{1-4} алкил, циклопропил, циклобутил, фенил или оксетанил, каждый необязательно замещенный одним или двумя R_3 заместителями;
 R_4 выбран из группы, состоящей из галогена, циано, C_{1-4} алкила, дейтеро- C_{1-4} алкила, галоген- C_{1-4} алкила, C_{1-4} алкокси, дейтеро- C_{1-4} алкокси, C_{1-4} алкил-амино, C_{3-6} циклоалкила и гетероциклила;
 R_1 представляет собой водород или C_{1-4} алкил;
 A выбран из группы, состоящей из:



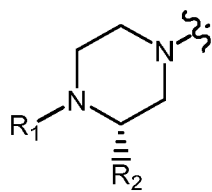
A1



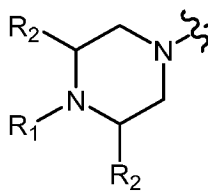
A2



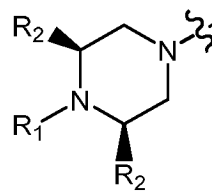
A3



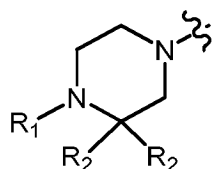
A4



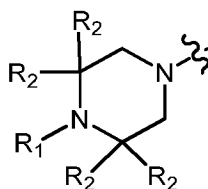
A5



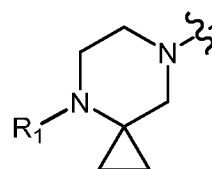
A6



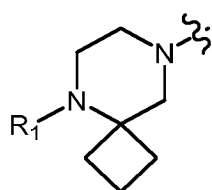
A8



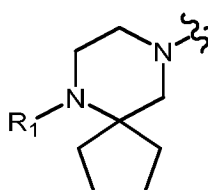
A9



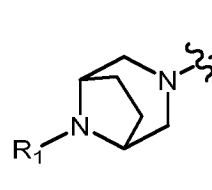
A10



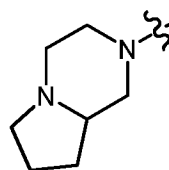
A11



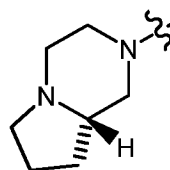
A12



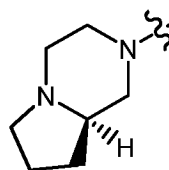
A13



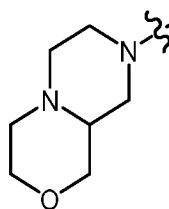
A14



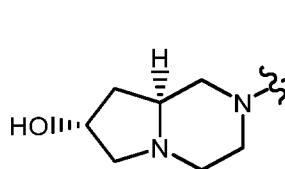
A15.



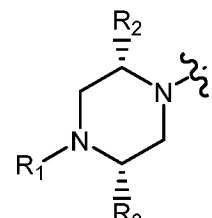
A16



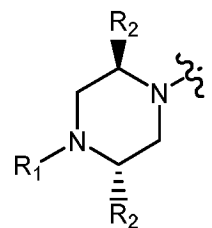
A17



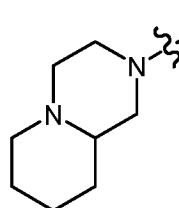
A18



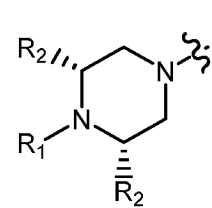
A20



A21



A23 и



A24; и

В выбран из группы, состоящей из:

фенила, незамещенного или замещенного одним R_4 заместителем;
гетероарила,

причем гетероарил представляет собой 5- или 6-членный моноциклический ароматический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 1, 2 или 3 атома N, и необязательно, когда кольцевая структура содержит 1 или 2 N, второй гетероатом, выбранный из O и S, необязательно замещенный одним R₄ заместителем, или

причем гетероарил представляет собой 9-членный бициклический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 2, 3 или 4 атома N, необязательно, когда кольцевая структура содержит 2 или 3 N, содержащий второй гетероатомный член в кольце, выбранный из O или S, и необязательно замещенный одним или двумя независимо выбранными R₄ заместителями; и

гетероциклила,

причем гетероциклил представляет собой 8- или 9-членный бициклический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 2, 3 или 4 атома N, и необязательно, когда кольцевая структура содержит 2 или 3 N, содержащий второй гетероатомный член в кольце, выбранный из O или S, необязательно замещенный одним или двумя независимо выбранными R₄ заместителями.

27. Соединение, выбранное из группы, состоящей из:

2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(3-фтор-1H-пиразол-4-ил)фенол;

2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-{6-[(²H₃)метилокси]пиримидин-4-ил}фенол;

5-(3-фтор-1H-пиразол-4-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол;

5-(3-фтор-1H-пиразол-4-ил)-2-{3-[3-(2-гидроксипропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол;

2-[3-(3-циклопропилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(1H-пиразол-4-ил)фенол;

2-{3-[3-(1-гидроксициклопропил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1H-пиразол-4-ил)фенол;

2-{3-[(3R)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(3-фтор-1H-пиразол-4-ил)фенол;

2-{3-[3-(2-гидроксипропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-{6-[(²H₃)метилокси]пиримидин-4-ил}фенол;

2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-[1-(²H₃)метил-1H-пиразол-4-ил]фенол;

5-{6-[(²H₃)метилокси]пиримидин-4-ил}-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол;

2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2H-1,2,3-триазол-2-ил)фенол;

2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1-метил-1H-пиразол-4-ил)фенол;

2-{3-[3-(2-гидроксипропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1H-пиразол-4-ил)фенол;

2-{3-[3-(2-гидроксипропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2H-1,2,3-триазол-2-ил)фенол;

5-(3-фтор-1H-пиразол-4-ил)-2-{3-[3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол;

2-{3-[(3S)-3-трет-бутилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1H-пиразол-4-ил)фенол;

2-{3-[(3S)-3-трет-бутилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-{6-[(²H₃)метилокси]пиримидин-4-ил}фенол;

2-{3-[(3S)-3-трет-бутилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2H-1,2,3-триазол-2-ил)фенол;

2-{3-[3-(2-гидроксипропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-[1-(²H₃)метил-1H-пиразол-4-ил]фенол;

2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1H-пиразол-4-ил)фенол;

2-{3-[(3S)-3-трет-бутилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1-метил-1H-пиразол-4-ил)фенол;

2-{3-[3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1H-пиразол-4-ил)фенол;

2-{3-[(3S)-3-этилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1H-пиразол-4-ил)фенол;

2-[3-(3-этилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(1H-пиразол-4-ил)фенол;

5-(3-фтор-1H-пиразол-4-ил)-2-{3-[(3R)-3-(2-гидроксипропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол;

2-{3-[3-(2-гидроксипропан-2-ил)-4-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-{6-[(²H₃)метилокси]пиримидин-4-ил}фенол;

2-[3-(3-циклопропил-4-метилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(1H-пиразол-4-ил)фенол;

3-фтор-5-(6-метоксипиримидин-4-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол;

2-{3-[3-(1-метоксициклопропил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1H-пиразол-4-ил)фенол;

2-[3-(3-циклобутилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(1H-пиразол-4-ил)фенол;

2-[3-(3-пропилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(1H-пиразол-4-ил)фенол;

2-[3-(3-циклопропилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-3-фтор-5-(5-фтор-1H-пиразол-4-ил)фенол;

- 2-{3-[3-(бутан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1H-пиразол-4-ил)фенол;
- 2-{3-[4-метил-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1H-пиразол-4-ил)фенол;
- 5-(1-метил-1H-пиразол-4-ил)-2-{3-[3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенол;
- 2-{3-[3-(2,2-дифторциклопропил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1H-пиразол-4-ил)фенол;
- 2-{3-[(3S)-3-пропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1H-пиразол-4-ил)фенол;
- 2-[3-(3-этиллипиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(1H-пиразол-4-ил)фенол;
- 2-[3-(3-этиллипиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-[1-(²H₃)метил-1H-пиразол-4-ил]фенол;
- 2-{3-[(3R)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1H-пиразол-4-ил)фенол;
- 5-[1-(²H₃)метил-1H-пиразол-4-ил]-2-{3-[3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенол;
- 2-[3-(3-метилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(1H-пиразол-4-ил)фенол;
- 2-[3-(6,9-диазаспиро[4.5]декан-9-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(1H-пиразол-4-ил)фенол;
- 5-(2-метилпиридин-4-ил)-2-{3-[3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенол;
- 2-{3-[(3S)-3-(гидроксиметил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2H-1,2,3-триазол-2-ил)фенол;
- 2-{3-[3-(2-метилпропил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1H-пиразол-4-ил)фенол;
- 5-[1-(²H₃)метил-1H-пиразол-4-ил]-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенол;
- 2-{3-[(3R)-3-этиллипиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1H-пиразол-4-ил)фенол;
- 2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-[1-(²H₃)метил-1H-пиразол-4-ил]фенол;
- 2-[3-(5,8-диазаспиро[3.5]нонан-8-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(1H-пиразол-4-ил)фенол;
- 5-[1-(²H₃)метил-1H-пиразол-4-ил]-2-{3-[(3R,5S)-3,4,5-триметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенол;
- 5-(2H-1,2,3-триазол-2-ил)-2-{3-[(3R,5S)-3,4,5-триметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенол;
- 2-{3-[(3R)-3-(метоксиметил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1H-пиразол-4-ил)фенол;
- 2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2H-1,2,3-триазол-2-ил)фенол;
- 2-[3-(4,7-диазаспиро[2.5]октан-7-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(1H-пиразол-4-ил)фенол;

2-[3-(3,3-диметилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(1H-пиразол-4-ил)фенол;
 2-[3-(4,7-дiazаспиро[2.5]октан-7-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(3-фтор-1H-пиразол-4-ил)фенол;
 2-[3-(8-метил-3,8-дiazабицикло[3.2.1]октан-3-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-[1-(²H₃)метил-1H-пиразол-4-ил]фенол;
 (7R,8aS)-2-{6-[2-гидрокси-4-(1H-пиразол-4-ил)фенил]-1,2,4-триазин-3-ил}октагидропирроло[1,2-a]пиазин-7-ол;
 2-{3-[4-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1H-пиразол-4-ил)фенол;
 2-[3-(3-фенилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(1H-пиразол-4-ил)фенол;
 5-(1H-пиразол-4-ил)-2-{3-[3-(пиридин-4-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол;
 2-[3-(4-циклопропилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(1H-пиразол-4-ил)фенол;
 2-[3-(гексагидропиазино[2,1-с][1,4]оксазин-8(1H)-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(1H-пиразол-4-ил)фенол;
 5-(7-фтор-2-метил-2H-индазол-5-ил)-2-{3-[3-(гидроксиметил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол;
 2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(8-фтор-2-метилимидазо[1,2-a]пиридин-6-ил)фенол;
 5-(7-фтор-2-метил-2H-индазол-5-ил)-2-[3-(3-метилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]фенол;
 2-[3-(3-этилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(8-фтор-2-метилимидазо[1,2-a]пиридин-6-ил)фенол;
 5-(2,8-диметилимидазо[1,2-b]пиридазин-6-ил)-2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол;
 5-(8-метокси-2-метил[1,2,4]триазоло[1,5-b]пиридазин-6-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол;
 5-(7-фтор-2-метил-2H-индазол-5-ил)-2-{3-[3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол;
 2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2-метил-2H-индазол-5-ил)фенол;
 5-(8-фтор-2-метилимидазо[1,2-a]пиридин-6-ил)-2-[3-(4-метилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]фенол;
 2-[3-(3-этилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(7-фтор-2-метил-2H-индазол-5-ил)фенол;
 2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2-метилимидазо[1,2-b]пиридазин-6-ил)фенол;
 2-{3-[(3R,5R)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(7-фтор-2-метил-2H-индазол-5-ил)фенол;
 2-[3-(4-этилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(8-фтор-2-метилимидазо[1,2-a]пиридин-6-ил)фенол;

5-(2,8-диметил[1,2,4]триазоло[1,5-а]пиразин-6-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенол;

2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(7-фтор-2-метил-2Н-индазол-5-ил) фенол;

5-(4-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-3-гидроксифенил)-2-метил-2Н-индазол-7-карбонитрил;

5-(7-фтор-2-метил-2Н-индазол-5-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенол;

5-(2-метилимидазо[1,2-б]пиридазин-6-ил)-2-[3-(4-метилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил] фенол;

2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2,8-диметил[1,2,4]триазоло[1,5-б]пиридазин-6-ил) фенол;

2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(6,8-диметил-7Н-пурин-2-ил) фенол;

5-(2-метил[1,2,4]триазоло[1,5-а]пиридин-6-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенол;

2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2-метилимидазо[1,2-а]пиразин-6-ил) фенол;

6-(4-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-3-гидроксифенил)-2-метилимидазо[1,2-а]пиридин-8-карбонитрил;

5-(2-метил-2Н-индазол-5-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенол;

2-{3-[(3R)-4-этил-3-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(8-фтор-2-метилимидазо[1,2-а]пиридин-6-ил) фенол;

2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(8-метокси-2-метил[1,2,4]триазоло[1,5-б]пиридазин-6-ил) фенол;

5-(2-метил[1,2,4]триазоло[1,5-а]пиразин-6-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенол;

5-(2,8-диметил[1,2,4]триазоло[1,5-б]пиридазин-6-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенол;

5-(8-метокси-2-метил[1,2,4]триазоло[1,5-а]пиразин-6-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенол;

5-(8-фтор-2-метилимидазо[1,2-а]пиридин-6-ил)-2-{3-[(3R,5S)-3,4,5-триметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенол;

5-(7-фтор-2-метил-2Н-индазол-5-ил)-2-[3-(гексагидропирроло[1,2-а]пиразин-2(1Н)-ил)-1,2,4-триазин-6-ил] фенол;

5-(2,8-диметилимидазо[1,2-а]пиразин-6-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенол;

2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2-метил-2Н-пиразоло[3,4-б]пиридин-5-ил) фенол;

5-(2,8-диметилимидазо[1,2-б]пиридазин-6-ил)-2-{3-[(3R)-3-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенол;

5-(7-фтор-2-метил-2Н-индазол-5-ил)-2-{3-[(8aS)-гексагидропирроло[1,2-а]пиразин-2(1Н)-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенол;

2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2-метил[1,2,4]триазоло[1,5-b]пиридазин-6-ил)фенол;

2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2,8-диметил[1,2,4]триазоло[1,5-a]пиразин-6-ил)фенол;

5-(имидазо[1,2-b]пиридазин-6-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол;

5-(2,8-диметилимидазо[1,2-a]пиразин-6-ил)-2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол;

5-(2,8-диметилимидазо[1,2-b]пиридазин-6-ил)-2-[3-(4-метилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]фенол;

5-(7-фтор-2-метил-2Н-индазол-5-ил)-2-{3-[(8aR)-гексагидропирроло[1,2-a]пиразин-2(1H)-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол;

2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2-метил[1,2,4]триазоло[1,5-a]пиразин-6-ил)фенол;

2-{3-[(3R)-3,4-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(8-фтор-2-метилимидазо[1,2-a]пиридин-6-ил)фенол;

6-(3-гидрокси-4-{3-[(3R,5S)-3,4,5-триметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенил)-2-метилимидазо[1,2-b]пиридазин-8-карбонитрил;

5-(8-циклопропил-2-метил[1,2,4]триазоло[1,5-a]пиразин-6-ил)-2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол;

2-[3-(4-метилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(2-метил-2Н-пиразоло[3,4-b]пиридин-5-ил)фенол;

5-(2,8-диметилимидазо[1,2-b]пиридазин-6-ил)-2-{3-[(3R,5S)-3,4,5-триметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол;

2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2-метил[1,2,4]триазоло[1,5-a]пиримидин-6-ил)фенол;

5-(имидазо[1,2-a]пиразин-6-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол;

5-(имидазо[1,2-a]пиридин-6-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол;

2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-([1,2,4]триазоло[4,3-a]пиридин-6-ил)фенол;

2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(4,6-диметил[1,3]тиазоло[5,4-с]пиридин-2-ил)фенол;

2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(5,7-диметил[1,2,4]триазоло[1,5-a]пиримидин-2-ил)фенол;

2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-[2-(трифторметил)имидазо[1,2-b]пиридазин-6-ил]фенол;

2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(6-метил[1,3]тиазоло[4,5-b]пиразин-2-ил)фенол;

2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(5-метилфуро[3,2-b]пиридин-2-ил)фенол;

5-(7-метокси-2-метил-2Н-индазол-5-ил)-2-[3-(4-метилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]пиридин-3-ол;

- 5-(8-фтор-2-метилимидазо[1,2-а]пиридин-6-ил)-2-[3-(4-метилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]пиридин-3-ол;
- 2-{3-[(3S)-3-этилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(3-фтор-1Н-пиразол-4-ил)фенол;
- 2-[3-(4-метилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(1Н-пиразол-4-ил)пиридин-3-ол;
- 2-{3-[(3S)-3-трет-бутилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(3-фтор-1Н-пиразол-4-ил)фенол;
- 5-(2,8-диметилимидазо[1,2-а]пиридин-6-ил)-2-[3-(4-метилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]пиридин-3-ол;
- 3-метил-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенол;
- 2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-([1,2,4]триазоло[1,5-а]пиразин-6-ил)фенол;
- 2-{3-[(3S)-3-трет-бутилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-([1,2,4]триазоло[1,5-а]пиразин-6-ил)фенол;
- 2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-([1,2,4]триазоло[1,5-а]пиразин-6-ил)фенол;
- 5-(2,8-диметилимидазо[1,2-а]пиридин-6-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол;
- 2-{3-[(3S)-3-этилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2Н-1,2,3-триазол-2-ил)фенол;
- 2-{3-[(3S)-3-этилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-{6-[(²H₃)метилокси]пиримидин-4-ил}фенол;
- 2-{3-[3-(1-метилциклопропил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенол;
- 2-[3-(3,8-диазабицикло[3.2.1]октан-3-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенол;
- 2-{3-[(3R)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенол;
- 2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенол;
- 5-(8-этил-2-метилимидазо[1,2-а]пиридин-6-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол;
- 5-[2-метил-8-(трифторметил)имидазо[1,2-а]пиридин-6-ил]-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол;
- 5-(2,7-диметил-2Н-индазол-5-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол;
- 5-(2-метилимидазо[1,2-а]пиразин-6-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол;
- 5-(1Н-имидазол-1-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол;
- 5-(6-метилпиразин-2-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол;

- 2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(пиразин-2-ил)фенол;
- 5-(5-метилпиразин-2-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенол;
- 5-(1H-пиразол-4-ил)-2-{3-[3-(2,2,2-трифторэтил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенол;
- 5-(2-метил[1,2,4]триазоло[1,5-а]пиридин-7-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенол;
- 2-{3-[rac-(3S,5R)-3-этил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1H-пиразол-4-ил)фенол;
- 5-(6-метилпиримидин-4-ил)-2-{3-[(3RS)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенол;
- 5-(6-этилпиримидин-4-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенол;
- 2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(пиримидин-2-ил)фенол;
- 4-фтор-5-[1-(²H₃)метил-1H-пиразол-4-ил]-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенол;
- 2-{3-[(8aS)-гексагидропирроло[1,2-а]пиразин-2(1H)-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2H-1,2,3-триазол-2-ил)фенол;
- 2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2H-1,2,3-триазол-2-ил)фенол;
- 5-(5-метил-1H-пиразоло[4,3-b]пиридин-1-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенол;
- 2-{3-[(3S)-3-трет-бутилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-4-фтор-5-[1-(²H₃)метил-1H-пиразол-4-ил]фенол;
- 5-(7-фтор-2-метил-2H-индазол-5-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} пиридин-3-ол;
- 4-фтор-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1H-пиразол-4-ил)фенол;
- 5-(5-метил-1H-пирроло[3,2-b]пиридин-1-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенол;
- 5-(6-метилпиридин-3-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенол;
- 2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(пиридин-4-ил)фенол;
- 2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1H-пиразоло[3,4-d]пиримидин-1-ил)фенол;
- 5-(3-хлор-1H-пиразол-4-ил)-2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенол;
- 2-{3-[(3S)-3-трет-бутилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-4-фтор-5-(1H-пиразол-4-ил)фенол;
- 2-{3-[(3S)-3-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1H-пиразол-4-ил)фенол;

- 2-{3-[(3R)-3-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1H-пиразол-4-ил)фенол;
- 2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2-метил[1,2,4]триазоло[1,5-а]пиперазин-6-ил)фенол;
- 2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2-метил-2H-[1,2,3]триазоло[4,5-b]пиридин-6-ил)фенол;
- 2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1-метил-1H-[1,2,3]триазоло[4,5-b]пиридин-6-ил)фенол;
- 2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1,2,4-тиадиазол-5-ил)фенол;
- 2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1-метил-1H-[1,2,3]триазоло[4,5-b]пиридин-5-ил)фенол;
- 2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2-метил-2H-[1,2,3]триазоло[4,5-с]пиридин-6-ил)фенол;
- 2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(3-метил-3H-[1,2,3]триазоло[4,5-b]пиридин-5-ил)фенол;
- 2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1-метил-1H-[1,2,3]триазоло[4,5-с]пиридин-6-ил)фенол;
- 2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2H-1,2,3-триазол-2-ил)пиридин-3-ол;
- 2-{3-[(2S,5S)-2,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1H-пиразол-4-ил)фенол;
- 2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(пиридин-4-ил)фенол;
- 2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(3-фторпиридин-4-ил)фенол;
- 4-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-4'-(метиламино)[1,1'-бифенил]-3-ол;
- 2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2-метил-2H-[1,2,3]триазоло[4,5-b]пиридин-6-ил)пиридин-3-ол;
- 2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(7-фтор-2-метил-2H-индазол-5-ил)пиридин-3-ол;
- 2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2H-1,2,3-триазол-2-ил)пиридин-3-ол;
- 2-{3-[(3R)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(4-метил-2H-1,2,3-триазол-2-ил)фенол;
- 5-(4-метил-2H-1,2,3-триазол-2-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол;
- 2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1,3-тиазол-2-ил)фенол;
- 5-[4-(дифторметил)-1,3-тиазол-2-ил]-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол;
- 2-{3-[4-метил-3-(оксетан-3-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1H-пиразол-4-ил)фенол;

5-(4-хлор-1,3-тиазол-2-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенол;

5-(5-хлор-1,3-тиазол-2-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенол;

2-{3-[(2R,5S)-2,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1H-пиразол-4-ил)фенол;

2-{3-[(2S,5R)-2,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1H-пиразол-4-ил)фенол;

2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-([1,3]тиазоло[5,4-b]пиридин-2-ил)фенол;

2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(пиримидин-4-ил)фенол;

2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(3-метил[1,2,3]триазоло[1,5-a]пиридин-6-ил)фенол;

2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1-метилимидазо[1,5-a]пиридин-6-ил)фенол;

2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(3-метилимидазо[1,5-a]пиридин-7-ил)фенол;

5-(5-фтор-1,3-тиазол-2-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенол;

2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2-метил-2H-[1,2,3]триазоло[4,5-b]пиридин-6-ил)фенол;

2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2-метил-2H-[1,2,3]триазоло[4,5-c]пиридин-6-ил)фенол;

5-(5-циклопропил-1,3,4-оксадиазол-2-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенол;

5-(4-метокси-1,3-тиазол-2-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенол;

2-{3-[rac-(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2-метил-2H-[1,2,3]триазоло[4,5-b]пиридин-5-ил)фенол;

2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2-метил-2H-[1,2,3]триазоло[4,5-b]пиридин-5-ил)фенол;

2-[3-(октагидро-2H-пиридо[1,2-a]пиазин-2-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(1H-пиразол-4-ил)фенол;

5-(5-метокси-1,3,4-тиадиазол-2-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенол;

5-[5-(дифторметил)-1,3,4-тиадиазол-2-ил]-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенол;

2-{3-[rac-(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(3-метил[1,2,3]триазоло[1,5-a]пиридин-6-ил)фенол;

5-(2,6-диметокси-пиримидин-4-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенол;

2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1-этил-1H-пиразол-4-ил)фенол;

- 2-{3-[(3RS)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2-фторпиридин-4-ил)фенол;
- 5-[6-(азетидин-1-ил)пиримидин-4-ил]-2-{3-[(3RS)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол;
- 2-{3-[(3S)-3-трет-бутилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2-метил-2Н-[1,2,3]триазоло[4,5-*b*]пиридин-6-ил)фенол;
- 5-(2-метил-2Н-[1,2,3]триазоло[4,5-*b*]пиридин-6-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол;
- 2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1,2,4-тиадиазол-3-ил)фенол;
- 2-{3-[(3S,5R)-3-этил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2-метил-2Н-[1,2,3]триазоло[4,5-*b*]пиридин-6-ил)фенол;
- 2-{3-[(3R,5S)-3-циклопропил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(5-фтор-1Н-пиразол-4-ил)фенол;
- 2-{3-[(3S,5R)-3-метил-5-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенол;
- 5-(5-фтор-1Н-пиразол-4-ил)-2-{3-[(3S,5R)-3-метил-5-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол;
- 2-{3-[(3R,5S)-3-этил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(5-фтор-1Н-пиразол-4-ил)фенол;
- 2-{3-[(3S,5R)-3-циклопропил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2,6-диметоксипиримидин-4-ил)фенол;
- 2-{3-[(3R,5S)-3-циклопропил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2,6-диметоксипиримидин-4-ил)фенол;
- 2-{3-[(3S,5R)-3-циклопропил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(5-фтор-1Н-пиразол-4-ил)фенол;
- 5-(5-фтор-1Н-пиразол-4-ил)-2-{3-[(3R,5S)-3-метил-5-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол;
- 2-{3-[(3S,5R)-3-этил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(5-фтор-1Н-пиразол-4-ил)фенол;
- 2-{3-[(3R,5S)-3-циклопропил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенол;
- 2-{3-[(3S,5R)-3-циклопропил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенол;
- 2-{3-[(3R,5S)-3-циклопропил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(6-метоксипиримидин-4-ил)фенол;
- 5-(6-метоксипиримидин-4-ил)-2-{3-[(3S,5R)-3-метил-5-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол;
- 2-{3-[(3R,5S)-3-этил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(6-метоксипиримидин-4-ил)фенол;
- 2-{3-[(3R,5S)-3-метил-5-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенол;
- 5-(6-метоксипиримидин-4-ил)-2-{3-[(3R,5S)-3-метил-5-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенол;

- 2-{3-[(3S,5R)-3-циклобутил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1H-пиразол-4-ил)фенол;
- 2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(5-метил-1,3-оксазол-2-ил)фенол;
- 2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1,3-оксазол-2-ил)фенол;
- 2-{3-[(3S,5R)-3-этил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(6-метоксипиримидин-4-ил)фенол;
- 2-{3-[(3S,5R)-3-циклопропил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(6-метоксипиримидин-4-ил)фенол;
- 2-{3-[(3S,5R)-3-циклобутил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(3-фтор-1H-пиразол-4-ил)фенол;
- 2-{3-[(3S,5R)-3-циклобутил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2H-1,2,3-триазол-2-ил)фенол;
- 2-{3-[(3S,5R)-3-циклобутил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-[1-(²H₃)метил-1H-пиразол-4-ил]фенол;
- 2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1,2,4-тиадиазол-3-ил)фенол;
- 2-{3-[(3S,5R)-3-циклобутил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1-метил-1H-пиразол-3-ил)фенол;
- 2-{3-[(3S)-3-(1-метилциклопропил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2-метил-2H-[1,2,3]триазоло[4,5-b]пиридин-6-ил)фенол;
- 2-{3-[(3R)-3-(1-метилциклопропил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2-метил-2H-[1,2,3]триазоло[4,5-b]пиридин-6-ил)фенол;
- 2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(пиразоло[1,5-a]пиримидин-3-ил)фенол;
- 2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(пиразоло[1,5-a]пиридин-3-ил)фенол;
- 2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(5-метил-1,2,4-тиадиазол-3-ил)фенол;
- 2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2-метил-1,3-тиазол-4-ил)фенол;
- 2-{3-[(3S,5R)-3-трет-бутил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1H-пиразол-4-ил)фенол;
- 2-{3-[(3S,5R)-3-трет-бутил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(3-фтор-1H-пиразол-4-ил)фенол;
- 2-{3-[(3S,5R)-3-этинил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1H-пиразол-4-ил)фенол;
- 2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1,2-тиазол-4-ил)фенол;
- 2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2-метоксипиримидин-4-ил)фенол;
- 2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1,2-тиазол-3-ил)фенол;

- 5-(4-метил-1,2-тиазол-5-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенол;
- 2-{3-[(3S,5R)-3-трет-бутил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1,2,4-тиадиазол-3-ил) фенол;
- 2-{3-[(3S,5R)-3-трет-бутил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(6-метоксипиримидин-4-ил) фенол;
- 2-{3-[(3S,5R)-3-циклопропил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2-метоксипиридин-4-ил) фенол;
- 5-(2-метоксипиридин-4-ил)-2-{3-[(3R,5S)-3-метил-5-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенол;
- 2-{3-[(3S)-3-трет-бутилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1,2,4-тиадиазол-3-ил) фенол;
- 5-(1-метил-1H-1,2,4-триазол-3-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенол;
- 5-(1-метил-1H-1,2,3-триазол-4-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенол;
- 5-(1-метил-1H-1,2,3-триазол-5-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенол;
- 5-(2-метил-2H-1,2,3-триазол-4-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенол;
- 5-(2,1,3-бензотиадиазол-5-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенол;
- 2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-([1,2,5]тиадиазоло[3,4-b]пиридин-6-ил) фенол;
- 2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1,2,5-тиадиазол-3-ил) фенол;
- 2-{3-[(3S,5R)-3-этил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2-метоксипиридин-4-ил) фенол;
- 2-{3-[(3R,5S)-3-этил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2-метоксипиридин-4-ил) фенол;
- 2-{3-[(3S,5R)-3-этил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1,2,4-тиадиазол-5-ил) фенол;
- 2-{3-[(3R,5S)-3-этил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1,2,4-тиадиазол-5-ил) фенол;
- 2-{3-[(3R,5S)-3-метил-5-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1,2,4-тиадиазол-5-ил) фенол;
- 2-{3-[(3S,5R)-3-метил-5-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1,2,4-тиадиазол-5-ил) фенол;
- 2-{3-[(3S,5R)-3-циклопропил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1,2,4-тиадиазол-5-ил) фенол;
- 2-{3-[(3R,5S)-3-циклопропил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1,2,4-тиадиазол-5-ил) фенол;
- 2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1,2-тиазол-5-ил) фенол;

5-(2-метокси-6-метилпиридин-4-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенол;
 2-(3-гидрокси-4-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенил)-1,3-тиазол-5-карбонитрил;
 2-(3-гидрокси-4-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенил)-1,3-тиазол-4-карбонитрил;
 5-(2-метил-5,6-дигидро[1,2,4]триазоло[1,5-а]пиразин-7(8H)-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенол;
 2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1-метил-2,3-дигидро-1H-имидазо[1,2-b]пиразол-7-ил) фенол;
 2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(5,6-дигидро-4H-пирроло[1,2-b]пиразол-3-ил) фенол;
 2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(4,5,6,7-тетрагидропиразоло[1,5-а]пиридин-3-ил) фенол;
 2-{3-[(3R)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(4,5,6,7-тетрагидропиразоло[1,5-а]пиридин-3-ил) фенол;
 5-(5,6-дигидро-4H-пирроло[1,2-b]пиразол-3-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенол;
 5-(6,7-дигидро-5H-пирроло[1,2-а]имидазол-3-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенол;
 5-(5,6-дигидро-4H-пирроло[1,2-b]пиразол-3-ил)-2-{3-[(3S)-3-(1-метилциклопропил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенол;
 5-(5,6-дигидро-4H-пирроло[1,2-b]пиразол-3-ил)-2-{3-[(3R)-3-(1-метилциклопропил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенол;
 5-(6,7-дигидро-5H-пиразоло[5,1-b][1,3]оксазин-3-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенол;
 3-фтор-5-(5-фтор-1H-пиразол-4-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенол; и
 2-[3-(гексагидропирроло[1,2-а]пиразин-2(1H)-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(1H-пиразол-4-ил) фенол;

причем форма соединения выбрана из группы, состоящей из его соли, гидрата, сольвата и таутомерной формы.

28. Соединение по п. 27, отличающееся тем, что форма соединения представляет собой форму соли или ее гидрат, сольват и таутомер, выбранные из группы, состоящей из следующих:

2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(3-фтор-1H-пиразол-4-ил) фенола дигидрохлорид;
 2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-{6-[(²H₃)метилокси]пиримидин-4-ил} фенола дигидрохлорид;
 5-(3-фтор-1H-пиразол-4-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенола дигидрохлорид;

- 5-(3-фтор-1Н-пиразол-4-ил)-2-{3-[3-(2-гидроксипропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенола дигидрохлорид;
- 2-[3-(3-циклопропилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(1Н-пиразол-4-ил) фенола дигидрохлорид;
- 2-{3-[3-(1-гидроксициклопропил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1Н-пиразол-4-ил) фенола диформиат;
- 2-{3-[(3R)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(3-фтор-1Н-пиразол-4-ил) фенола дигидрохлорид;
- 2-{3-[3-(2-гидроксипропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-{6-[(²H₃)метилокси]пиримидин-4-ил} фенола дигидрохлорид;
- 2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-[1-(²H₃)метил-1Н-пиразол-4-ил] фенола дигидрохлорид;
- 5-{6-[(²H₃)метилокси]пиримидин-4-ил}-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенола дигидрохлорид;
- 2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2Н-1,2,3-триазол-2-ил) фенола дигидрохлорид;
- 2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1-метил-1Н-пиразол-4-ил) фенола дигидрохлорид;
- 2-{3-[3-(2-гидроксипропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1Н-пиразол-4-ил) фенола дигидрохлорид;
- 2-{3-[3-(2-гидроксипропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2Н-1,2,3-триазол-2-ил) фенола дигидрохлорид;
- 5-(3-фтор-1Н-пиразол-4-ил)-2-{3-[3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенола дигидрохлорид;
- 2-{3-[(3S)-3-трет-бутилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1Н-пиразол-4-ил) фенола дигидрохлорид;
- 2-{3-[(3S)-3-трет-бутилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-{6-[(²H₃)метилокси]пиримидин-4-ил} фенола дигидрохлорид;
- 2-{3-[(3S)-3-трет-бутилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2Н-1,2,3-триазол-2-ил) фенола дигидрохлорид;
- 2-{3-[3-(2-гидроксипропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-[1-(²H₃)метил-1Н-пиразол-4-ил] фенола дигидрохлорид;
- 2-{3-[(3S)-3-трет-бутилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1-метил-1Н-пиразол-4-ил) фенола дигидрохлорид;
- 2-[3-(3-этилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(1Н-пиразол-4-ил) фенола дигидрохлорид;
- 5-(3-фтор-1Н-пиразол-4-ил)-2-{3-[(3R)-3-(2-гидроксипропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенола дигидрохлорид;
- 2-{3-[3-(2-гидроксипропан-2-ил)-4-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-{6-[(²H₃)метилокси]пиримидин-4-ил} фенола дигидрохлорид;
- 2-[3-(3-циклопропил-4-метилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(1Н-пиразол-4-ил) фенола дигидрохлорид;
- 3-фтор-5-(6-метокси-пиримидин-4-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенола формиат;

- 2-{3-[3-(1-метоксициклопропил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенола диформиат;
- 2-[3-(3-пропилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенола дигидрохлорид;
- 2-[3-(3-циклопропилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-3-фтор-5-(5-фтор-1Н-пиразол-4-ил)фенола формиат;
- 2-{3-[3-(бутан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенола дигидрохлорид;
- 5-(1-метил-1Н-пиразол-4-ил)-2-{3-[3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенола дигидрохлорид;
- 2-{3-[3-(2,2-дифторциклопропил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенола дигидрохлорид;
- 2-[3-(3-этилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенола дигидрохлорид;
- 2-[3-(3-этилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-[1-(²H₃)метил-1Н-пиразол-4-ил]фенола дигидрохлорид;
- 5-[1-(²H₃)метил-1Н-пиразол-4-ил]-2-{3-[3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенола дигидрохлорид;
- 2-[3-(6,9-диазаспиро[4.5]декан-9-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенола дигидрохлорид;
- 5-(2-метилпиридин-4-ил)-2-{3-[3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенола дигидрохлорид;
- 2-{3-[(3S)-3-(гидроксиметил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2Н-1,2,3-триазол-2-ил)фенола дигидрохлорид;
- 5-[1-(²H₃)метил-1Н-пиразол-4-ил]-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенола дигидрохлорид;
- 2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-[1-(²H₃)метил-1Н-пиразол-4-ил]фенола дигидрохлорид;
- 2-[3-(5,8-диазаспиро[3.5]нонан-8-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенола дигидрохлорид;
- 5-[1-(²H₃)метил-1Н-пиразол-4-ил]-2-{3-[(3R,5S)-3,4,5-триметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенола дигидрохлорид;
- 5-(2Н-1,2,3-триазол-2-ил)-2-{3-[(3R,5S)-3,4,5-триметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенола дигидрохлорид;
- 2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2Н-1,2,3-триазол-2-ил)фенола дигидрохлорид;
- 2-[3-(4,7-диазаспиро[2.5]октан-7-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенола дигидрохлорид;
- 2-[3-(3,3-диметилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенола дигидрохлорид;
- 2-[3-(4,7-диазаспиро[2.5]октан-7-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(3-фтор-1Н-пиразол-4-ил)фенола дигидрохлорид;
- 2-[3-(8-метил-3,8-диазабикло[3.2.1]октан-3-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-[1-(²H₃)метил-1Н-пиразол-4-ил]фенола дигидрохлорид;

(7R,8aS)-2-{6-[2-гидрокси-4-(1H-пиразол-4-ил)фенил]-1,2,4-триазин-3-ил}октагидропирроло[1,2-a]пиразин-7-ола дигидрохлорид;

2-[3-(3-фенилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(1H-пиразол-4-ил)фенола дигидрохлорид;

5-(1H-пиразол-4-ил)-2-{3-[3-(пиридин-4-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенола дигидрохлорид;

5-(7-фтор-2-метил-2H-индазол-5-ил)-2-{3-[3-(гидроксиметил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенола дигидрохлорид;

2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(8-фтор-2-метилимидазо[1,2-a]пиридин-6-ил)фенола дигидрохлорид;

5-(7-фтор-2-метил-2H-индазол-5-ил)-2-[3-(3-метилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]фенола дигидрохлорид;

2-[3-(3-этилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(8-фтор-2-метилимидазо[1,2-a]пиридин-6-ил)фенола дигидрохлорид;

5-(2,8-диметилимидазо[1,2-b]пиридазин-6-ил)-2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенола дигидрохлорид;

5-(8-метокси-2-метил[1,2,4]триазоло[1,5-b]пиридазин-6-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенола дигидрохлорид;

5-(7-фтор-2-метил-2H-индазол-5-ил)-2-{3-[3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенола дигидрохлорид;

5-(8-фтор-2-метилимидазо[1,2-a]пиридин-6-ил)-2-[3-(4-метилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]фенола дигидрохлорид;

2-[3-(3-этилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(7-фтор-2-метил-2H-индазол-5-ил)фенола дигидрохлорид;

2-[3-(4-этилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(8-фтор-2-метилимидазо[1,2-a]пиридин-6-ил)фенола дигидрохлорид;

5-(2,8-диметил[1,2,4]триазоло[1,5-a]пиразин-6-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенола дигидрохлорид;

5-(4-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-3-гидроксифенил)-2-метил-2H-индазол-7-карбонитрила дигидрохлорид;

5-(7-фтор-2-метил-2H-индазол-5-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенола дигидрохлорид;

2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2,8-диметил[1,2,4]триазоло[1,5-b]пиридазин-6-ил)фенола дигидрохлорид;

2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(6,8-диметил-7H-пурин-2-ил)фенола диформиат;

5-(2-метил[1,2,4]триазоло[1,5-a]пиридин-6-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенола дигидрохлорид;

2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2-метилимидазо[1,2-a]пиразин-6-ил)фенола дигидрохлорид;

5-(2-метил-2H-индазол-5-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенола дигидрохлорид;

2-{3-[(3R)-4-этил-3-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(8-фтор-2-метилимидазо[1,2-a]пиридин-6-ил)фенола дигидрохлорид;

2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(8-метокси-2-метил[1,2,4]триазоло[1,5-b]пиридазин-6-ил)фенола дигидрохлорид;

5-(2-метил[1,2,4]триазоло[1,5-a]пиразин-6-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенола дигидрохлорид;

5-(2,8-диметил[1,2,4]триазоло[1,5-b]пиридазин-6-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенола дигидрохлорид;

5-(8-метокси-2-метил[1,2,4]триазоло[1,5-a]пиразин-6-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенола дигидрохлорид;

5-(8-фтор-2-метилимидазо[1,2-a]пиридин-6-ил)-2-{3-[(3R,5S)-3,4,5-триметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенола дигидрохлорид;

5-(7-фтор-2-метил-2H-индазол-5-ил)-2-[3-(гексагидропирроло[1,2-a]пиразин-2(1H)-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]фенола дигидрохлорид;

5-(2,8-диметилимидазо[1,2-a]пиразин-6-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенола дигидрохлорид;

5-(2,8-диметилимидазо[1,2-b]пиридазин-6-ил)-2-{3-[(3R)-3-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенола дигидрохлорид;

2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2-метил[1,2,4]триазоло[1,5-b]пиридазин-6-ил)фенола дигидрохлорид;

2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2,8-диметил[1,2,4]триазоло[1,5-a]пиразин-6-ил)фенола дигидрохлорид;

5-(имидазо[1,2-b]пиридазин-6-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенола дигидрохлорид;

5-(2,8-диметилимидазо[1,2-a]пиразин-6-ил)-2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенола дигидрохлорид;

5-(2,8-диметилимидазо[1,2-b]пиридазин-6-ил)-2-[3-(4-метилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]фенола дигидрохлорид;

5-(7-фтор-2-метил-2H-индазол-5-ил)-2-{3-[(8aR)-гексагидропирроло[1,2-a]пиразин-2(1H)-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенола дигидрохлорид;

2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2-метил[1,2,4]триазоло[1,5-a]пиразин-6-ил)фенола дигидрохлорид;

2-{3-[(3R)-3,4-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(8-фтор-2-метилимидазо[1,2-a]пиридин-6-ил)фенола дигидрохлорид;

6-(3-гидрокси-4-{3-[(3R,5S)-3,4,5-триметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенил)-2-метилимидазо[1,2-b]пиридазин-8-карбонитрила дигидрохлорид;

5-(8-циклопропил-2-метил[1,2,4]триазоло[1,5-a]пиразин-6-ил)-2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенола дигидрохлорид;

5-(2,8-диметилимидазо[1,2-b]пиридазин-6-ил)-2-{3-[(3R,5S)-3,4,5-триметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенола дигидрохлорид;

2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2-метил[1,2,4]триазоло[1,5-a]пиримидин-6-ил)фенола дигидрохлорид;

5-(имидазо[1,2-a]пиразин-6-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенола дигидрохлорид;

5-(имидазо[1,2-a]пиридин-6-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенола дигидрохлорид;

- 2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-([1,2,4]триазоло[4,3-а]пиридин-6-ил)фенола дигидрохлорид;
- 2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(4,6-диметил[1,3]тиазоло[5,4-с]пиридин-2-ил)фенола дигидрохлорид;
- 2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(5,7-диметил[1,2,4]триазоло[1,5-а]пиримидин-2-ил)фенола дигидрохлорид;
- 2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-[2-(трифторметил)имидазо[1,2-б]пиридазин-6-ил]фенола дигидрохлорид;
- 2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(6-метил[1,3]тиазоло[4,5-б]пиразин-2-ил)фенола дигидрохлорид;
- 2-{3-[(3R,5S)-3,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(5-метилфуро[3,2-б]пиридин-2-ил)фенола дигидрохлорид;
- 5-(7-метокси-2-метил-2Н-индазол-5-ил)-2-[3-(4-метилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]пиридин-3-ола гидрохлорид;
- 5-(8-фтор-2-метилимидазо[1,2-а]пиридин-6-ил)-2-[3-(4-метилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]пиридин-3-ола гидрохлорид;
- 2-{3-[(3S)-3-этилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(3-фтор-1Н-пиразол-4-ил)фенола дигидрохлорид;
- 2-[3-(4-метилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(1Н-пиразол-4-ил)пиридин-3-ола гидрохлорид;
- 2-{3-[(3S)-3-трет-бутилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(3-фтор-1Н-пиразол-4-ил)фенола дигидрохлорид;
- 5-(2,8-диметилимидазо[1,2-а]пиридин-6-ил)-2-[3-(4-метилпиперазин-1-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]пиридин-3-ола гидрохлорид;
- 3-метил-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенола формиат;
- 2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-([1,2,4]триазоло[1,5-а]пиразин-6-ил)фенола дигидрохлорид;
- 2-{3-[(3S)-3-трет-бутилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-([1,2,4]триазоло[1,5-а]пиразин-6-ил)фенола дигидрохлорид;
- 2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-([1,2,4]триазоло[1,5-а]пиразин-6-ил)фенола дигидрохлорид;
- 5-(2,8-диметилимидазо[1,2-а]пиридин-6-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенола дигидрохлорид;
- 2-{3-[(3S)-3-этилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2Н-1,2,3-триазол-2-ил)фенола дигидрохлорид;
- 2-{3-[(3S)-3-этилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-{6-[(²H₃)метилокси]пиримидин-4-ил}фенола дигидрохлорид;
- 2-{3-[3-(1-метилциклопропил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенола формиат;
- 2-[3-(3,8-диазабицикло[3.2.1]октан-3-ил)-1,2,4-триазин-6-ил]-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенола диформиат;
- 2-{3-[(3R)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенола дигидрохлорид;

- 2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1H-пиразол-4-ил)фенола дигидрохлорид;
- 5-(8-этил-2-метилимидазо[1,2-а]пиридин-6-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенола дигидрохлорид;
- 5-[2-метил-8-(трифторметил)имидазо[1,2-а]пиридин-6-ил]-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенола дигидрохлорид;
- 5-(2,7-диметил-2H-индазол-5-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенола дигидрохлорид;
- 5-(2-метилимидазо[1,2-а]пиперазин-6-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенола дигидрохлорид;
- 5-(1H-пиразол-4-ил)-2-{3-[3-(2,2,2-трифторэтил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенола диформиат;
- 5-(2-метил[1,2,4]триазоло[1,5-а]пиридин-7-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенола дигидрохлорид;
- 2-{3-[rac-(3S,5R)-3-этил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1H-пиразол-4-ил)фенола дигидрохлорид;
- 5-(6-метилпиримидин-4-ил)-2-{3-[(3R)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенола дигидрохлорид;
- 4-фтор-5-[1-(²H₃)метил-1H-пиразол-4-ил]-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенола формиат;
- 2-{3-[(8aS)-гексагидропирроло[1,2-а]пиперазин-2(1H)-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2H-1,2,3-триазол-2-ил)фенола дигидрохлорид;
- 2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2H-1,2,3-триазол-2-ил)фенола дигидрохлорид;
- 5-(5-метил-1H-пиразоло[4,3-b]пиридин-1-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенола дигидрохлорид;
- 2-{3-[(3S)-3-трет-бутилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-4-фтор-5-[1-(²H₃)метил-1H-пиразол-4-ил]фенола формиат;
- 5-(7-фтор-2-метил-2H-индазол-5-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} пиридин-3-ола гидрохлорид;
- 4-фтор-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1H-пиразол-4-ил)фенола формиат;
- 5-(5-метил-1H-пирроло[3,2-b]пиридин-1-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенола формиат;
- 2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1H-пиразоло[3,4-d]пиримидин-1-ил)фенола дигидрохлорид;
- 5-(3-хлор-1H-пиразол-4-ил)-2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенола дигидрохлорид;
- 2-{3-[(3S)-3-трет-бутилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-4-фтор-5-(1H-пиразол-4-ил)фенола формиат;
- 2-{3-[(3S)-3-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1H-пиразол-4-ил)фенола дигидрохлорид;
- 2-{3-[(3R)-3-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1H-пиразол-4-ил)фенола дигидрохлорид;

- 2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2-метил-2Н-[1,2,3]триазоло[4,5-*b*]пиридин-6-ил)фенола дигидрохлорид;
- 2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1-метил-1Н-[1,2,3]триазоло[4,5-*b*]пиридин-6-ил)фенола дигидрохлорид;
- 2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1-метил-1Н-[1,2,3]триазоло[4,5-*b*]пиридин-5-ил)фенола дигидрохлорид;
- 2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2-метил-2Н-[1,2,3]триазоло[4,5-*c*]пиридин-6-ил)фенола дигидрохлорид;
- 2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(3-метил-3Н-[1,2,3]триазоло[4,5-*b*]пиридин-5-ил)фенола дигидрохлорид;
- 2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1-метил-1Н-[1,2,3]триазоло[4,5-*c*]пиридин-6-ил)фенола дигидрохлорид;
- 2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2Н-1,2,3-триазол-2-ил)пиридин-3-ола дигидрохлорид;
- 2-{3-[(2S,5S)-2,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенола дигидрохлорид;
- 2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(пиридин-4-ил)фенола дигидрохлорид;
- 2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(3-фторпиридин-4-ил)фенола дигидрохлорид;
- 4-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-4'-(метиламино)[1,1'-бифенил]-3-ола дигидрохлорид;
- 2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2-метил-2Н-[1,2,3]триазоло[4,5-*b*]пиридин-6-ил)пиридин-3-ола трифторацетат;
- 2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(7-фтор-2-метил-2Н-индазол-5-ил)пиридин-3-ола гидрохлорид;
- 2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2Н-1,2,3-триазол-2-ил)пиридин-3-ола трифторацетат;
- 2-{3-[(3R)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(4-метил-2Н-1,2,3-триазол-2-ил)фенола дигидрохлорид;
- 5-(4-метил-2Н-1,2,3-триазол-2-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенола дигидрохлорид;
- 2-{3-[4-метил-3-(оксетан-3-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенола формиат;
- 2-{3-[(2R,5S)-2,5-диметилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенол или энантиомер трифторацетат;
- 2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-([1,3]тиазоло[5,4-*b*]пиридин-2-ил)фенола трифторацетат;
- 2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(3-метил[1,2,3]триазоло[1,5-*a*]пиридин-6-ил)фенола формиат;
- 2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1-метилимидазо[1,5-*a*]пиридин-6-ил)фенола формиат;
- 2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(3-метилимидазо[1,5-*a*]пиридин-7-ил)фенола формиат;

- 2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2-метил-2Н-[1,2,3]триазоло[4,5-*b*]пиридин-5-ил)фенола дигидрохлорид;
- 2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1-этил-1Н-пиразол-4-ил)фенола дигидрохлорид;
- 2-{3-[(3S)-3-трет-бутилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2-метил-2Н-[1,2,3]триазоло[4,5-*b*]пиридин-6-ил)фенола дигидрохлорид;
- 5-(2-метил-2Н-[1,2,3]триазоло[4,5-*b*]пиридин-6-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил} фенола дигидрохлорид;
- 2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1,2,4-тиадиазол-3-ил)фенола трифторацетат;
- 2-{3-[(3S,5R)-3-циклобутил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенола дигидрохлорид;
- 2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(5-метил-1,3-оксазол-2-ил)фенола трифторацетат;
- 2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1,3-оксазол-2-ил)фенола трифторацетат;
- 2-{3-[(3S,5R)-3-циклобутил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(3-фтор-1Н-пиразол-4-ил)фенола дигидрохлорид;
- 2-{3-[(3S,5R)-3-циклобутил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2Н-1,2,3-триазол-2-ил)фенола дигидрохлорид;
- 2-{3-[(3S,5R)-3-циклобутил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-[1-(²Н₃)метил-1Н-пиразол-4-ил]фенола гидрохлорид;
- 2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1,2,4-тиадиазол-3-ил)фенола трифторацетат;
- 2-{3-[(3S,5R)-3-циклобутил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1-метил-1Н-пиразол-3-ил)фенола гидрохлорид;
- 2-{3-[(3S)-3-(1-метилциклопропил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2-метил-2Н-[1,2,3]триазоло[4,5-*b*]пиридин-6-ил)фенола гидрохлорид;
- 2-{3-[(3R)-3-(1-метилциклопропил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2-метил-2Н-[1,2,3]триазоло[4,5-*b*]пиридин-6-ил)фенола гидрохлорид;
- 2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(пиразоло[1,5-*a*]пиримидин-3-ил)фенола трифторацетат;
- 2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(5-метил-1,2,4-тиадиазол-3-ил)фенола трифторацетат;
- 2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2-метил-1,3-тиазол-4-ил)фенола трифторацетат;
- 2-{3-[(3S,5R)-3-трет-бутил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенола дигидрохлорид;
- 2-{3-[(3S,5R)-3-трет-бутил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(3-фтор-1Н-пиразол-4-ил)фенола дигидрохлорид;
- 2-{3-[(3S,5R)-3-этинил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1Н-пиразол-4-ил)фенола дигидрохлорид;
- 2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1,2-тиазол-4-ил)фенола гидрохлорид;

2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(2-метоксипиридин-4-ил)фенола трифторацетат;

2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1,2-тиазол-3-ил)фенола трифторацетат;

2-{3-[(3S,5R)-3-трет-бутил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1,2,4-тиадиазол-3-ил)фенола гидрохлорид;

2-{3-[(3S,5R)-3-трет-бутил-5-метилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(6-метоксипиримидин-4-ил)фенола гидрохлорид;

5-(1-метил-1Н-1,2,3-триазол-4-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенола дигидрохлорид;

5-(1-метил-1Н-1,2,3-триазол-5-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенола дигидрохлорид;

5-(2-метил-2Н-1,2,3-триазол-4-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенола дигидрохлорид;

5-(2,1,3-бензотиадиазол-5-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенола гидрохлорид;

2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-([1,2,5]тиадиазоло[3,4-*b*]пиридин-6-ил)фенола дигидрохлорид;

2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1,2,5-тиадиазол-3-ил)фенола трифторацетат;

2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1,2-тиазол-5-ил)фенола дигидрохлорид;

5-(2-метокси-6-метилпиридин-4-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенола дигидрохлорид;

2-(3-гидрокси-4-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенил)-1,3-тиазол-5-карбонитрила гидрохлорид;

2-(3-гидрокси-4-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенил)-1,3-тиазол-4-карбонитрила гидрохлорид;

5-(2-метил-5,6-дигидро[1,2,4]триазоло[1,5-*a*]пиазин-7(8Н)-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенола формиат;

2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(1-метил-2,3-дигидро-1Н-имидазо[1,2-*b*]пиазол-7-ил)фенола дигидрохлорид;

2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(5,6-дигидро-4Н-пирроло[1,2-*b*]пиазол-3-ил)фенола дигидрохлорид;

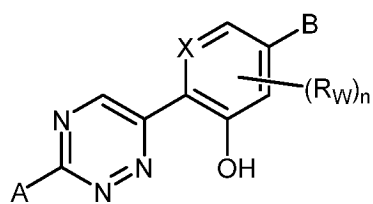
2-{3-[(3S)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(4,5,6,7-тетрагидропиазоло[1,5-*a*]пиридин-3-ил)фенола дигидрохлорид; или

2-{3-[(3R)-3-циклопропилпиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}-5-(4,5,6,7-тетрагидропиазоло[1,5-*a*]пиридин-3-ил)фенол или энантиомера дигидрохлорид;

и

3-фтор-5-(5-фтор-1Н-пиазол-4-ил)-2-{3-[(3S)-3-(пропан-2-ил)пиперазин-1-ил]-1,2,4-триазин-6-ил}фенола формиат.

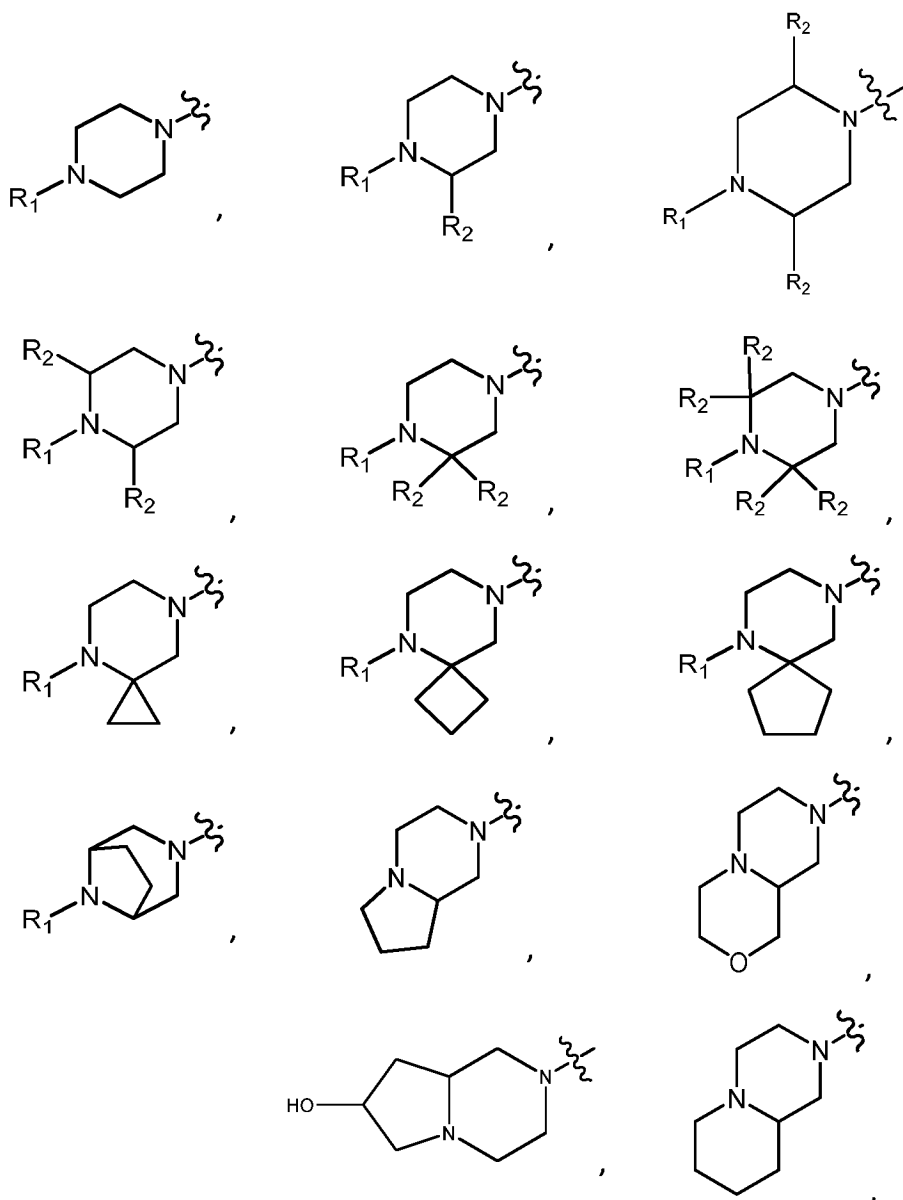
29. Соединение Формулы (I) или его форма:



(I)

где:

A выбран из группы, состоящей из:



и любого их стереоизомера;

R₁ выбран из группы, состоящей из водорода, C₁₋₄алкила, и C₃₋₆циклоалкила;

R₂ независимо выбран из группы, состоящей из галогена, C₁₋₄алкила, дейтеро-

C₁₋₄алкила, галоген-C₁₋₄алкила, гидроксил-C₁₋₄алкила, C₁₋₄алкокси-C₁₋₄алкила,

С₂-алкенила, С₃-циклоалкила, фенила, пиридинила и гетероциклила, причем гетероциклил представляет собой 3-6-членный радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 1 или 2 гетероатомных члена в кольце, выбранных из N, O и S, и

причем в каждом случае С₁-алкил, С₃-циклоалкил, фенил, пиридинил и гетероциклил необязательно замещен одним или двумя заместителями R₃; R₃ независимо выбран из группы, состоящей из галогена, гидроксила, С₁-алкила, С₁-алкокси и С₃-циклоалкила;

В выбран из группы, состоящей из:

фенила, необязательно замещенного одним или двумя независимо выбранными заместителями R₄; и гетероарила, причем гетероарил представляет собой 5- или 6-членный моноциклический ароматический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 1, 2 или 3 гетероатома, выбранных из N, O и S, необязательно замещенный одним R₄ заместителем;

R₄ выбран из группы, состоящей из галогена, циано, С₁-алкила, дейтеро-С₁-алкила, галоген-С₁-алкила, С₁-алкокси, дейтеро-С₁-алкокси, amino, С₁-алкил-amino, (С₁-алкил)₂-amino, С₃-циклоалкила и гетероциклила, причем гетероциклил представляет собой 3-6-членный моноциклический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 1 или 2 гетероатомных члена в кольце, независимо выбранных из N, O или S;

X выбран из группы, состоящей из CH, CF и N;

R_w выбран из группы, состоящей из галогена, гидроксила, циано, С₁-алкила, дейтеро-С₁-алкила, галоген-С₁-алкила, amino, С₁-алкил-amino, (С₁-алкил)₂-amino, С₁-алкокси и галоген-С₁-алкокси; и

n выбран из группы, состоящей из 0 или 1;

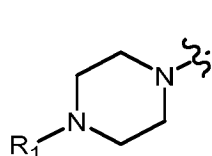
причем форма соединения выбрана из группы, состоящей из его соли, гидрата, сольвата и таутомерной формы.

30. Соединение по п. 29, отличающееся тем, что В представляет собой 5- или 6-членный моноциклический ароматический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 1, 2 или 3 гетероатома, выбранных из N, O и S.
31. Соединение по п. 29, отличающееся тем, что В выбран из группы, состоящей из:

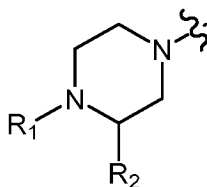
фенила, необязательно замещенного одним или двумя независимо выбранными заместителями R_4 ; и

гетероарила, причем гетероарил представляет собой 5- или 6-членный моноциклический ароматический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий по меньшей мере один атом N.

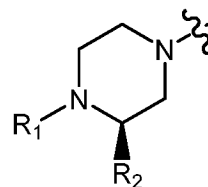
32. Соединение по п. 29, отличающееся тем, что В выбран из группы, состоящей из: фенила, необязательно замещенного одним R_4 заместителем; и гетероарила, причем гетероарил представляет собой 5- или 6-членный моноциклический ароматический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 1, 2 или 3 атома N, и необязательно, когда кольцевая структура содержит 1 или 2 N, второй гетероатом, выбранный из O и S, необязательно замещенный одним R_4 заместителем.
33. Соединение по п. 29, отличающееся тем, что В представляет собой гетероарил, причем гетероарил представляет собой 5- или 6-членный моноциклический ароматический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 1, 2 или 3 атома N, необязательно замещенный одним R_4 заместителем.
34. Соединение по любому из пп. 29-33, отличающееся тем, что А выбран из группы, состоящей из:



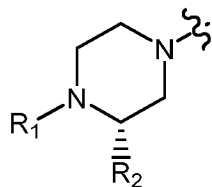
A1



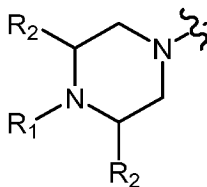
A2



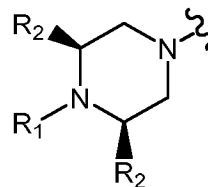
A3



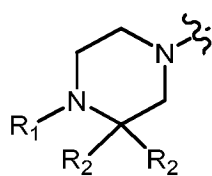
A4



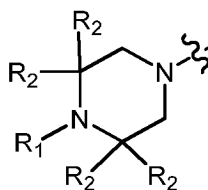
A5



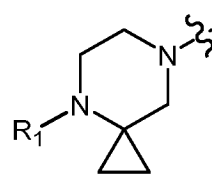
A6



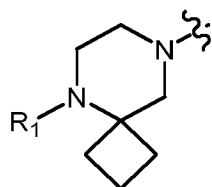
A8



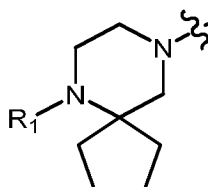
A9



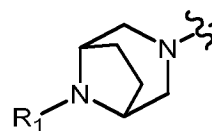
A10



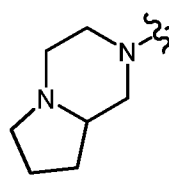
A11



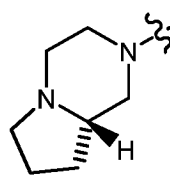
A12



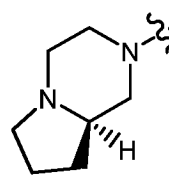
A13



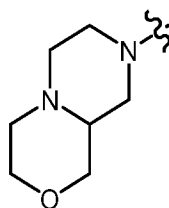
A14



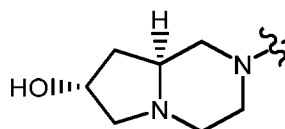
A15.



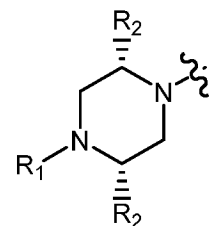
A16



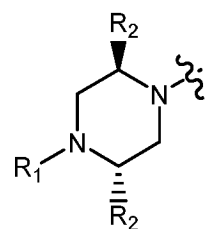
A17



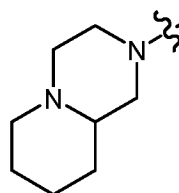
A18



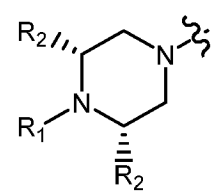
A20



A21

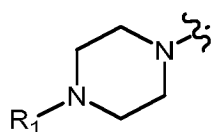


A23 и

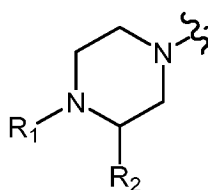


A24.

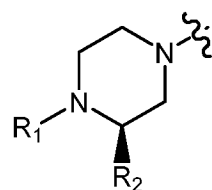
35. Соединение по любому из пп. 29-34, отличающееся тем, что А выбран из группы, состоящей из:



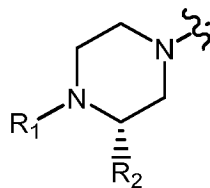
A1



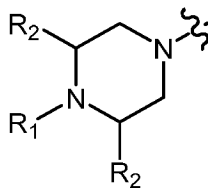
A2



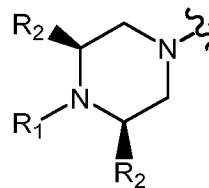
A3



A4

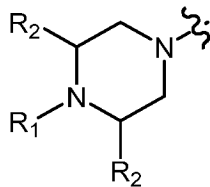


A5 и



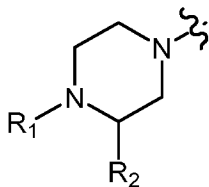
A6.

36. Соединение по любому из пп. 29-35, отличающееся тем, что А представляет



собой , или любой его стереоизомер.

37. Соединение по любому из пп. 29-35, отличающееся тем, что А представляет



собой , или любой его стереоизомер.

38. Соединение по любому из пп. 29-37, отличающееся тем, что R₁ представляет собой водород или C₁-алкил.

39. Соединение по любому одному из пп. 29-38, отличающееся тем, что R₁ представляет собой водород.

40. Соединение по любому из пп. 29-39, отличающееся тем, что X представляет собой CH.

41. Соединение по любому из пп. 29-39, отличающееся тем, что X представляет собой N.

42. Соединение по любому из пп. 29-39, отличающееся тем, что X представляет собой CF.

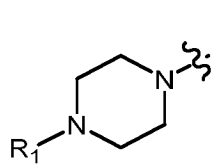
43. Соединение по любому одному из пп. 29-42, отличающееся тем, что n представляет собой 0.

44. Соединение по любому из пп. 29-43, отличающееся тем, что R₂ представляет собой C₁-алкил, галоген-C₁-алкил, гидроксил-C₁-алкил, циклопропил, циклобутил, фенил, или оксетанил, каждый необязательно замещенный одним или двумя R₃ заместителями.

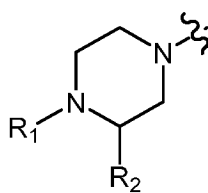
45. Соединение по любому из пп. 29-44, отличающееся тем, что R₂ представляет

- собой незамещенный C₁₋₄алкил, незамещенный галоген-C₁₋₄алкил, незамещенный гидроксил-C₁₋₄алкил, незамещенный циклопропил, незамещенный циклобутил, незамещенный фенил или незамещенный оксетанил.
46. Соединение по любому из пп. 29-45, отличающееся тем, что В является замещенным.
47. Соединение по любому из пп. 29-46, отличающееся тем, что R₄ представляет собой галоген, циано, C₁₋₄алкил, дейтеро-C₁₋₄алкил, галоген-C₁₋₄алкил, C₁₋₄алкокси, дейтеро-C₁₋₄алкокси, C₁₋₄алкил-амино, C₃₋₆циклоалкил и гетероциклил.
48. Соединение по любому из пп. 29-47, отличающееся тем, что R₄ представляет собой галоген, циано, метил, этил, (²H₃)метил, (²H₃)этил, дифторметил, трифторметил, метокси, этокси, (²H₃)метокси, метиламино, этиламино, циклопропил и азетидинил.
49. Соединение по любому из пп. 29-48, отличающееся тем, что R₄ представляет собой хлор, фтор, циано, метил, этил, (²H₃)метил, дифторметил, трифторметил, метокси, этокси, (²H₃)метокси, метиламино и циклопропил.
50. Соединение по любому из пп. 29-45, отличающееся тем, что В является незамещенным.
51. Соединение по п. 29, отличающееся тем, что:
- n представляет собой 0;
 - X представляет собой C;
 - R₂ представляет собой C₁₋₄алкил, галоген-C₁₋₄алкил, гидроксил-C₁₋₄алкил, циклопропил, циклобутил, фенил или оксетанил, каждый необязательно замещенный одним или двумя R₃ заместителями;
 - R₄ выбран из группы, состоящей из галогена, циано, C₁₋₄алкила, дейтеро-C₁₋₄алкила, галоген-C₁₋₄алкила, C₁₋₄алкокси, дейтеро-C₁₋₄алкокси, C₁₋₄алкил-амино, C₃₋₆циклоалкила и гетероциклила;
 - R₁ представляет собой водород или C₁₋₄алкил;

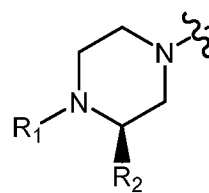
A выбран из группы, состоящей из:



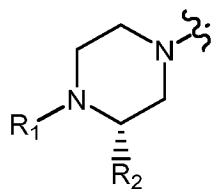
A1



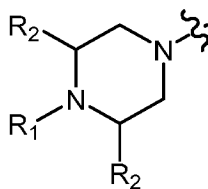
A2



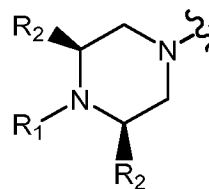
A3



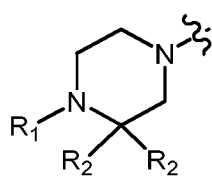
A4



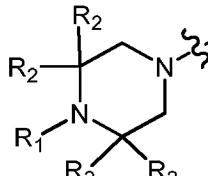
A5



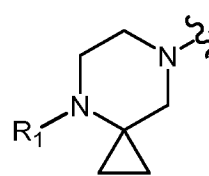
A6



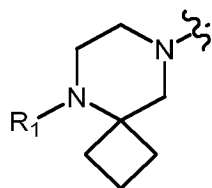
A8



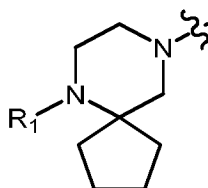
A9



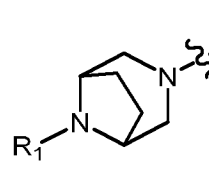
A10



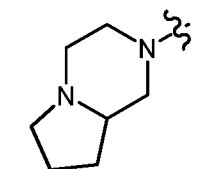
A11



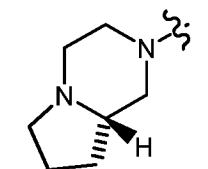
A12



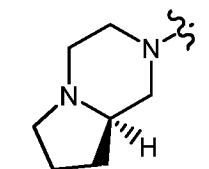
A13



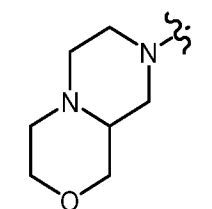
A14



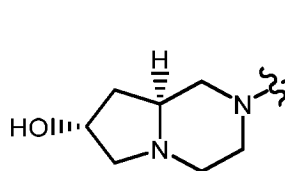
A15.



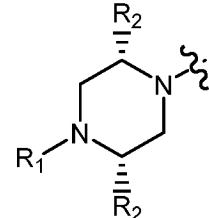
A16



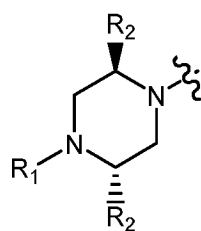
A17



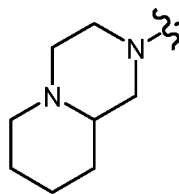
A18



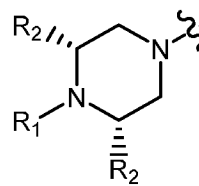
A20



A21



A23 и



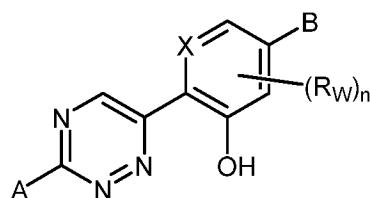
A24; и

В выбран из группы, состоящей из:

фенила, незамещенного или замещенного одним R_4 заместителем; и

гетероарила, причем гетероарил представляет собой 5- или 6-членный моноциклический ароматический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 1, 2 или 3 атома N, необязательно замещенный одним R_4 заместителем.

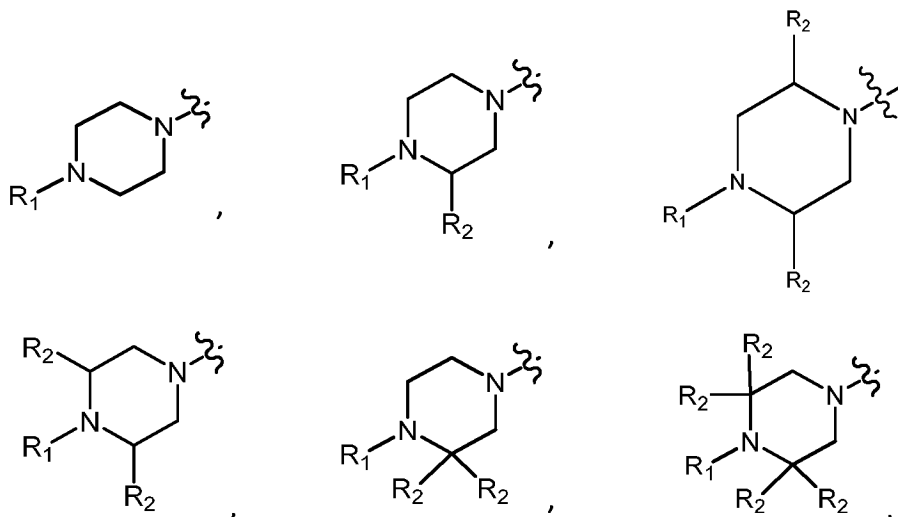
52. Соединение Формулы (I) или его форма:

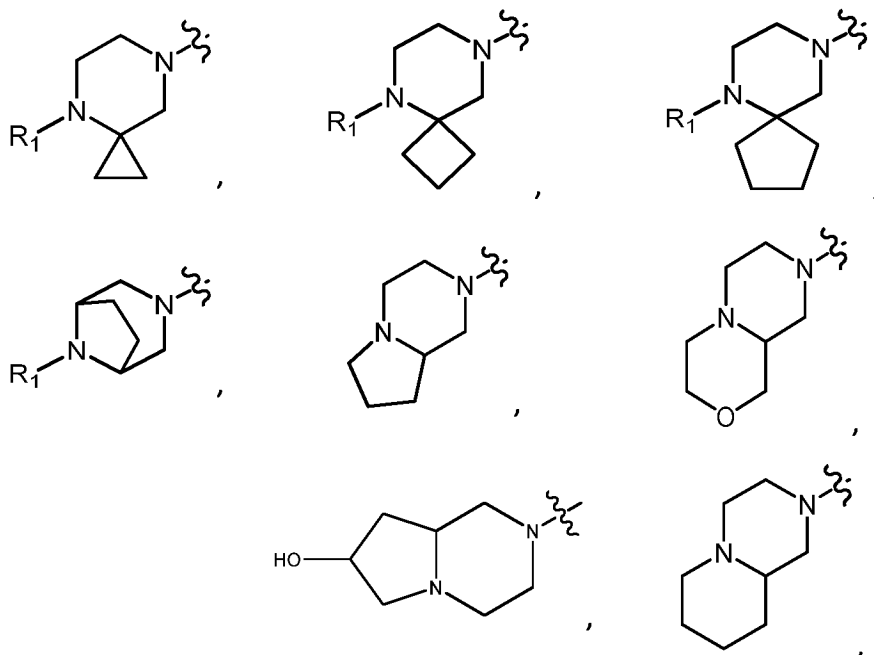


(I)

где:

А выбран из группы, состоящей из:





и любого их стереоизомера;

R_1 выбран из группы, состоящей из водорода, C_{1-4} алкила, и C_{3-6} циклоалкила;

R_2 независимо выбран из группы, состоящей из галогена, C_{1-4} алкила, дейтеро- C_{1-4} алкила, галоген- C_{1-4} алкила, гидроксил- C_{1-4} алкила, C_{1-4} алкокси- C_{1-4} алкила, C_{2-4} алкенила, C_{3-6} циклоалкила, фенила, пиридинила и гетероциклила, причем гетероциклил представляет собой 3-6-членный радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 1 или 2 гетероатомных члена в кольце, выбранных из N, O и S, и

причем в каждом случае C_{1-4} алкил, C_{3-6} циклоалкил, фенил, пиридинил и гетероциклил необязательно замещен одним или двумя заместителями R_3 ;

R_3 независимо выбран из группы, состоящей из галогена, гидроксила, C_{1-4} алкила, C_{1-4} алкокси и C_{3-6} циклоалкила;

B выбран из группы, состоящей из:

гетероарила, причем гетероарил представляет собой 9- или 10-членный бициклический ароматический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 1, 2, 3 или 4 гетероатомных члена в кольце, независимо выбранных из N, O или S, необязательно замещенный одним или двумя независимо выбранными R_4 заместителями; и

гетероциклила, причем гетероциклил представляет собой 8-10-членный бициклический ароматический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 1, 2, 3 или 4 гетероатомных члена в кольце,

независимо выбранных из N, O или S, необязательно замещенный одним или двумя независимо выбранными R₄ заместителями;

R₄ выбран из группы, состоящей из галогена, циано, C₁₋₄алкила, дейтеро-C₁₋₄алкила, галоген-C₁₋₄алкила, C₁₋₄алкокси, дейтеро-C₁₋₄алкокси, amino, C₁₋₄алкил-amino, (C₁₋₄алкил)₂-amino, C₃₋₆циклоалкила и гетероциклила, причем гетероциклил представляет собой 3-6-членный моноциклический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 1 или 2 гетероатомных члена в кольце, независимо выбранных из N, O или S;

X выбран из группы, состоящей из CH, CF и N;

R_w выбран из группы, состоящей из галогена, гидроксила, циано, C₁₋₄алкила, дейтеро-C₁₋₄алкила, галоген-C₁₋₄алкила, amino, C₁₋₄алкил-amino, (C₁₋₄алкил)₂-amino, C₁₋₄алкокси, и галоген-C₁₋₄алкокси; и

n выбран из группы, состоящей из 0 или 1;

причем форма соединения выбрана из группы, состоящей из его соли, гидрата, сольвата и таутомерной формы.

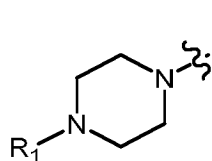
53. Соединение по п. 52, отличающееся тем, что В представляет собой гетероарил, причем гетероарил представляет собой 9- или 10-членную бициклическую ароматическую кольцевую систему, содержащую 1, 2, 3 или 4 гетероатомных члена в кольце, независимо выбранных из N, O или S.
54. Соединение по п. 52, отличающееся тем, что В представляет собой гетероциклил, причем гетероциклил представляет собой 8-10-членный бициклический ароматический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 1, 2, 3 или 4 гетероатомных члена в кольце, независимо выбранных из N, O или S.
55. Соединение по п. 52, отличающееся тем, что В выбран из группы, состоящей из: гетероарила, причем гетероарил представляет собой 9-членный бициклический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий по меньшей мере 2 атома N; и гетероциклила, причем гетероциклил представляет собой 8- или 9-членный бициклический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий по меньшей мере один атом N.

56. Соединение по п. 52, отличающееся тем, что В выбран из группы, состоящей из: гетероарила, причем гетероарил представляет собой 9-членный бициклический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 2, 3 или 4 атома N, необязательно замещенный одним или двумя независимо выбранными R_4 заместителями; и

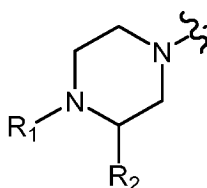
гетероциклила, причем гетероциклил представляет собой 8- или 9-членный бициклический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 2, 3 или 4 N, необязательно замещенный одним или двумя независимо выбранными R_4 заместителями.

57. Соединение по п. 52, отличающееся тем, что В представляет собой гетероарил, причем гетероарил представляет собой 9-членный бициклический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 2, 3 или 4 атома N, и необязательно замещенный одним или двумя независимо выбранными R_4 заместителями.

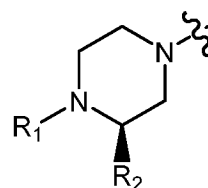
58. Соединение по любому из пп. 52-57, отличающееся тем, что А выбран из группы, состоящей из:



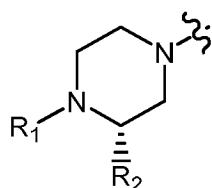
A1



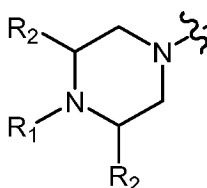
A2



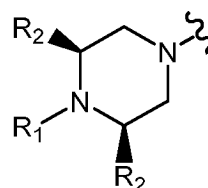
A3



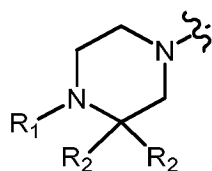
A4



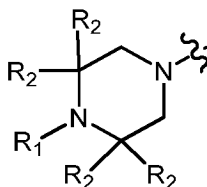
A5



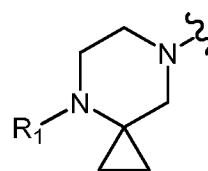
A6



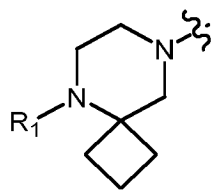
A8



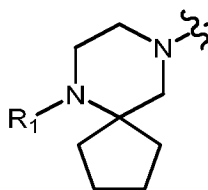
A9



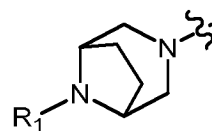
A10



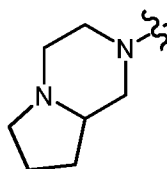
A11



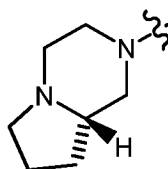
A12



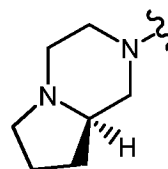
A13



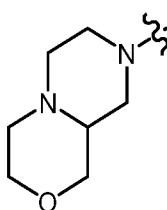
A14



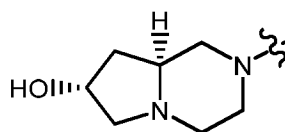
A15.



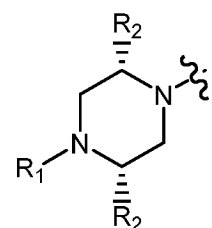
A16



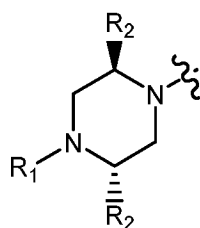
A17



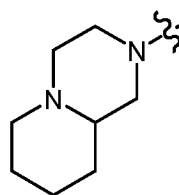
A18



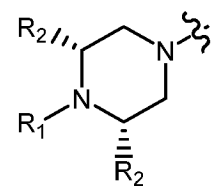
A20



A21

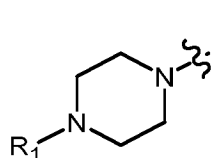


A23 и

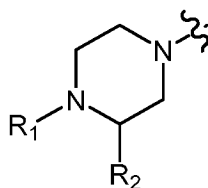


A24.

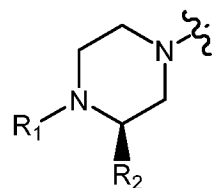
59. Соединение по любому из пп. 52-58, отличающееся тем, что А выбран из группы, состоящей из:



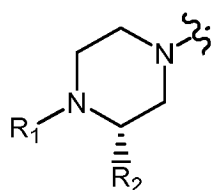
A1



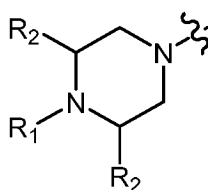
A2



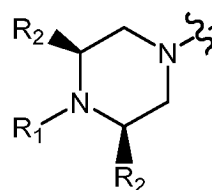
A3



A4

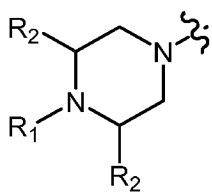


A5 и



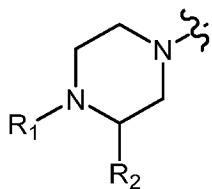
A6.

60. Соединение по любому из пп. 52-59, отличающееся тем, что А представляет



собой , или любой его стереоизомер.

61. Соединение по любому из пп. 52-59, отличающееся тем, что А представляет



собой , или любой его стереоизомер.

62. Соединение по любому из пп. 52-61, отличающееся тем, что R₁ представляет собой водород или C₁₋₄алкил.

63. Соединение по любому одному из пп. 52-62, отличающееся тем, что R₁ представляет собой водород.

64. Соединение по любому из пп. 52-63, отличающееся тем, что Х представляет собой СН.

65. Соединение по любому из пп. 52-63, отличающееся тем, что Х представляет собой N.

66. Соединение по любому из пп. 52-63, отличающееся тем, что Х представляет собой N.

67. Соединение по любому одному из пп. 52-66, отличающееся тем, что n представляет собой 0.

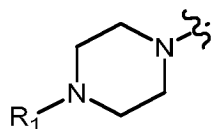
68. Соединение по любому из пп. 52-67, отличающееся тем, что R₂ представляет собой C₁₋₄алкил, галоген-C₁₋₄алкил, гидроксил-C₁₋₄алкил, циклопропил, циклобутил, фенил или оксетанил, каждый необязательно замещенный одним или двумя R₃ заместителями.

69. Соединение по любому из пп. 52-68, отличающееся тем, что R₂ представляет собой незамещенный C₁₋₄алкил, незамещенный галоген-C₁₋₄алкил, незамещенный гидроксил-C₁₋₄алкил, незамещенный циклопропил, незамещенный циклобутил, незамещенный фенил или незамещенный оксетанил.

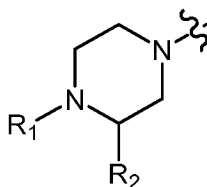
70. Соединение по любому из пп. 52-69, отличающееся тем, что В является

замещенным.

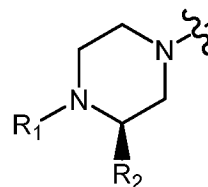
71. Соединение по любому из пп. 52-70, отличающееся тем, что R_4 представляет собой галоген, циано, C_{1-4} алкил, дейтеро- C_{1-4} алкил, галоген- C_{1-4} алкил, C_{1-4} алкокси, дейтеро- C_{1-4} алкокси, C_{1-4} алкил-амино, C_3 -циклоалкил и гетероциклил.
72. Соединение по любому из пп. 52-71, отличающееся тем, что R_4 представляет собой галоген, циано, метил, этил, $(^2H_3)$ метил, $(^2H_3)$ этил, дифторметил, трифторметил, метокси, этокси, $(^2H_3)$ метокси, метиламино, этиламино, циклопропил и азетидинил.
73. Соединение по любому из пп. 52-72, отличающееся тем, что R_4 представляет собой хлор, фтор, циано, метил, этил, $(^2H_3)$ метил, дифторметил, трифторметил, метокси, этокси, $(^2H_3)$ метокси, метиламино и циклопропил.
74. Соединение по любому из пп. 52-69, отличающееся тем, что В является незамещенным.
75. Соединение по п. 52, отличающееся тем, что:
 - n представляет собой 0;
 - X представляет собой C;
 - R_2 представляет собой C_{1-4} алкил, галоген- C_{1-4} алкил, гидроксил- C_{1-4} алкил, циклопропил, циклобутил, фенил или оксетанил, необязательно замещенный одним или двумя R_3 заместителями;
 - R_4 выбран из группы, состоящей из галогена, циано, C_{1-4} алкила, дейтеро- C_{1-4} алкила, галоген- C_{1-4} алкила, C_{1-4} алкокси, дейтеро- C_{1-4} алкокси, C_{1-4} алкил-амино, C_3 -циклоалкила и гетероциклила;
 - R_1 представляет собой водород или C_{1-4} алкил;
 - A выбран из группы, состоящей из:



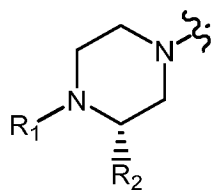
A1



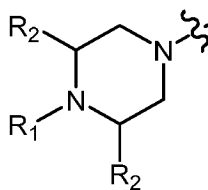
A2



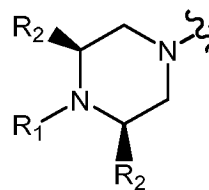
A3



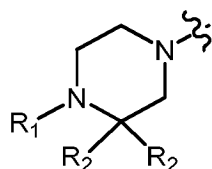
A4



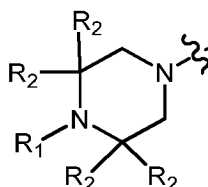
A5



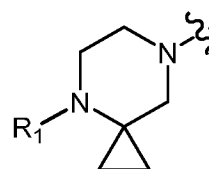
A6



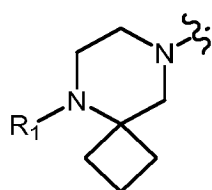
A8



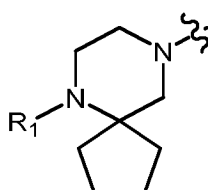
A9



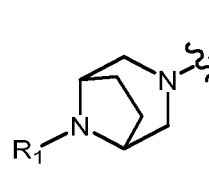
A10



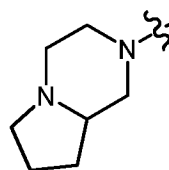
A11



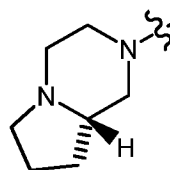
A12



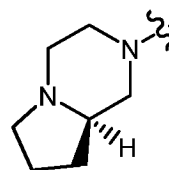
A13



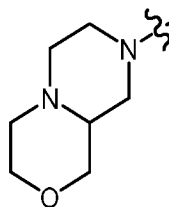
A14



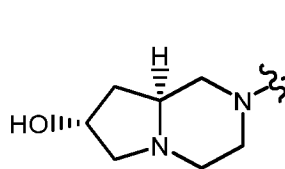
A15.



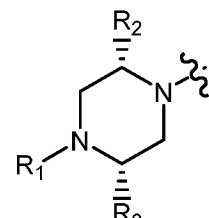
A16



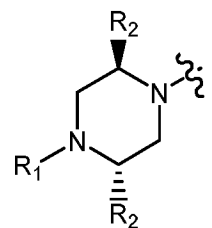
A17



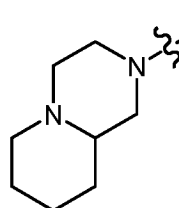
A18



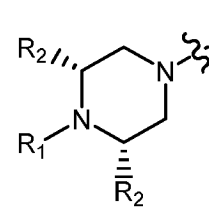
A20



A21



A23 и



A24; и

В выбран из группы, состоящей из:

гетероарила, причем гетероарил представляет собой 9-членный бициклический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 2, 3 или 4 атома N, необязательно, когда кольцевая структура

содержит 2 или 3 N, содержащий второй гетероатомный член в кольце, выбранный из O или S, и необязательно замещенный одним или двумя независимо выбранными R₄ заместителями; и

гетероциклила, причем гетероциклил представляет собой 8- или 9-членный бициклический радикал с кольцевой структурой из атомов углерода, содержащий 2, 3 или 4 атома N, и необязательно, когда кольцевая структура содержит 2 или 3 N, содержащий второй гетероатомный член в кольце, выбранный из O или S, необязательно замещенный одним или двумя независимо выбранными R₄ заместителями.

76. Способ лечения или облегчения БХ у субъекта, нуждающегося в этом, включающий введение субъекту эффективного количества соединения по любому из предшествующих пунктов.
77. Применение соединения по любому из предшествующих пунктов для лечения или облегчения БХ у субъекта, нуждающегося в этом, включающее введение субъекту эффективного количества соединения.
78. Применение соединения по любому из предшествующих пунктов для производства лекарственного средства для лечения или облегчения БХ у субъекта, нуждающегося в этом, включающее введение субъекту эффективного количества лекарственного средства.
79. Фармацевтическая композиция, содержащая соединение по любому из предшествующих пунктов в смеси с одним или более фармацевтически приемлемыми вспомогательными веществами.