

(19)



Евразийское  
патентное  
ведомство

(21) 202390145 (13) A1

## (12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ЕВРАЗИЙСКОЙ ЗАЯВКЕ

(43) Дата публикации заявки  
2023.02.14(22) Дата подачи заявки  
2021.06.28

(51) Int. Cl. *A61P 3/08* (2006.01)  
*A61P 3/10* (2006.01)  
*C07D 209/82* (2006.01)  
*C07D 209/94* (2006.01)  
*C07D 209/10* (2006.01)  
*C07D 403/06* (2006.01)  
*C07D 413/06* (2006.01)

## (54) КОМПОЗИЦИЯ НА ОСНОВЕ СОЕДИНЕНИЙ, КОТОРЫЕ МОДУЛИРУЮТ КЛЕТОЧНЫЙ МЕТАБОЛИЗМ, И СПОСОБЫ ПРИМЕНЕНИЯ

(31) 63/045,079

(32) 2020.06.27

(33) US

(86) PCT/US2021/039470

(87) WO 2021/263246 2021.12.30

(71) Заявитель:

КРЕССЕНТА БИОСАЙЕНСИС (US)

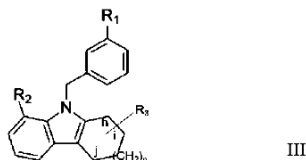
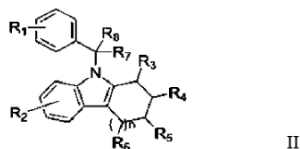
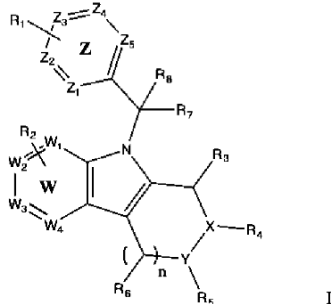
(72) Изобретатель:

Коюнку Емре, Хахн Ким (US)

(74) Представитель:

Силин М.Ю. (RU)

(57) Новый класс соединений в соответствии с формулой I, II или III, где  $W_1$ - $W_4$ ,  $Z_1$ - $Z_4$ ,  $Z_1$ - $Z_5$ , X, Y, n и  $R_1$ - $R_8$  определены в формуле изобретения и описании вариантов осуществления, которые связываются с белком, связывающим жирные кислоты, представляющим собой FABP4, и модулируют метаболизм адипоцитов со стимулированием усиленного использования глюкозы, а также фармацевтические композиции, содержащие соединения данного класса в комбинации с фармацевтически приемлемым разбавителем или носителем и, необязательно, дополнительно в комбинации с терапевтически активным средством, и применение этих соединений в медицине и для получения лекарственного препарата для лечения нарушений с воздействием на FABP4. В ряде примеров кольцо Z содержит  $Z_1$ - $Z_4$ . В других примерах кольцо Z содержит  $Z_1$ - $Z_5$ .



A1

202390145

202390145

A1

## **КОМПОЗИЦИЯ НА ОСНОВЕ СОЕДИНЕНИЙ, КОТОРЫЕ МОДУЛИРУЮТ КЛЕТОЧНЫЙ МЕТАБОЛИЗМ, И СПОСОБЫ ПРИМЕНЕНИЯ**

### **5           Раздел, относящийся к перекрестной ссылке на родственные заявки**

Данная заявка испрашивает приоритет по предварительной заявке на патент США S/N 63/045079, поданной 27 июня 2020 г., полное содержание которой настоящим включено в данный документ посредством ссылки во всей своей полноте.

### **10           Область техники, к которой относится изобретение**

Данное изобретение относится к новым соединениям для лечения или профилактики заболеваний, связанных с метаболизмом и воспалением, включая без ограничения диабет 2 типа, ожирение, сердечно-сосудистое заболевание, астму, рак и другие заболевания. Соединения, представленные в данном изобретении, в частности, взаимодействуют с белком 4, связывающим жирные кислоты (FABP), и обеспечивают улучшение потребления глюкозы в адипоцитах.

### **Предпосылки изобретения**

FABP представляют собой семейство белков, которые обратимо связывают свободные жирные кислоты и другие молекулы липидов и способствуют их транспорту в клетки. К настоящему времени у млекопитающих идентифицировано девять различных изоформ FABP. Изоформы FABP демонстрируют различающиеся паттерны экспрессии в разных тканях. Белок 4, связывающий жирные кислоты (FABP4), также часто обозначаемый в литературе как aP2, главным образом экспрессируется в адипоцитах и макрофагах и опосредует ключевые метаболические и сигнальные воспалительные пути в этих клетках, как например относящиеся к накоплению и деградации липидов, передаче сигналов и продуцированию эйкозаноидов. В дополнение, FABP4 также секретируется в плазму крови, и было высказано предположение, что он действует как фактор жировой ткани, регулирующий системный гомеостаз глюкозы.

В ходе исследований с генетическим нокаутом, проводимых на мышах, была получена информация относительно тканеспецифических и системных функций FABP4. Важно отметить, что когда мыши с наличием гомозиготной делеции гена FABP4 в течение длительного времени получали рацион с высоким содержанием

жиров, у них наблюдался набор веса по сравнению с мышами дикого типа, но при этом они были защищены от развития гипергликемии и резистентности к инсулину (Hotamisligil et al., Science. 1996 Nov 22;274(5291):1377-9). В дополнение, дефицит FABP4 в значительной степени защищал мышей с нокаутом в отношении

- 5 аполипротеина E (ApoE) от развития атеросклероза, которые характеризовались фенотипом, связанным с модуляцией FABP4 воспалительных сигнальных путей в макрофагах. (Makowski et al., Nat Med. 2001 June; 7(6): 699–705). Экспрессия FABP4 также была обнаружена в эпителиальных клетках дыхательных путей, и было показано, что дефицит FABP4 носит защитный характер у мышей в мышинной модели
- 10 аллергического воспаления легких (Shum et al., J Clin Invest. 2006 Aug;116(8):2183-2192).

В литературе было опубликовано несколько сообщений, связывающих уровень экспрессии и функции FABP4 с рядом патологий у людей. Например, сниженный риск диабета 2 типа и ишемической болезни сердца наблюдался у индивидуумов,

- 15 характеризующихся наличием у них генетических вариаций в промоторной области FABP4 (rs77878271), что приводит к сниженной экспрессии этого гена (Tuncman et al., Proc Natl Acad Sci U S A. 2006 May 2;103(18):6970-5). В независимом исследовании аналогичный полиморфизм также был ассоциирован с уменьшением проявлений атеросклеротического заболевания (Saksi et al., Circ Cardiovasc Genet. 2014
- 20 Oct;7(5):588-98). Кроме того, наличие у пациентов с трижды негативным раком молочной железы единичного нуклеотидного полиморфизма в 3'-нетранслируемой области (UTR) FABP4 (генотип rs1054135-GG), который также приводит к сниженной экспрессии FAB4, было ассоциировано со сниженным риском прогрессирования заболевания и увеличенным временем выживаемости без признаков заболевания.
- 25 (Wang et al., Oncotarget. 2016 Apr 5;7(14):18984-98). Повышенная экспрессия FABP4 наблюдалась в плаценте индивидуумов с преэклампсией, и было высказано предположение, что она играет роль в патогенезе преэклампсии (Yan et al., Placenta. 2016 Mar;39:94-100). Аналогично, гранулезные клетки пациентов с синдромом поликистозных яичников также демонстрируют повышенную экспрессию FABP4, и
- 30 это было связано с клинической характеристикой заболевания (Hu and Qiao, Endocrine. 2011 Oct;40(2):196-202). В совокупности, эти исследования продемонстрировали активную роль FABP4 в регуляции системного метаболизма и воспаления, а также указывают на то, что фармакологическое нацеливание на FABP4 можно использовать в

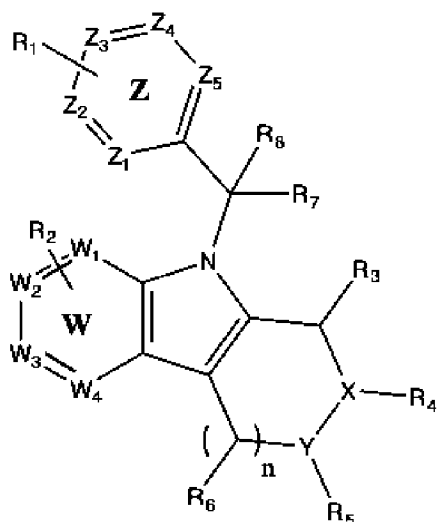
качестве стратегии лечения ряда различных заболеваний, связанных с функциями FABP4.

Адиipoциты играют центральную роль в системном гомеостазе глюкозы. Одной из их основных функций является поглощение избытка глюкозы в плазме крови и хранение ее в форме липидов. Дисфункция адипоцитов ввиду метаболического стресса и воспаления часто приводит к осложнениям, таким как гипергликемия и резистентность к инсулину. Примечательно, что у дефицитных по FABP4 мышей наблюдалось повышенное отложение глюкозы в жировой ткани. Адипоциты, выделенные из организма этих животных, продемонстрировали значительно повышенную скорость превращения глюкозы в жирные кислоты по сравнению с аналогичными им животными дикого типа. (Shaughnessy et al., Diabetes 2000 Jun; 49(6): 904-911). Таким образом, увеличение потребления глюкозы в адипоцитах может быть достигнуто посредством нацеливания на FABP4.

Хотя в литературе и в некоторых патентных заявках из предшествующего уровня техники (например, WO 00/47734, WO 00/15229, WO 00/15230, WO 02/40448, WO 01/54694, WO 00/59506 и WO 2004/063156) представлены различные варианты представления концепции ингибирования FABP, в целом, а также с точки зрения ингибирования FABP4, в частности, ни одно из обсуждений в таких документах из предшествующего уровня техники не предоставляет решения(-й) всех неудовлетворенных потребностей в той мере, в которой это обеспечивает настоящее изобретение. Конкретно, в настоящем изобретении описан новый класс соединений, которые связываются с FABP4 и модулируют метаболизм адипоцитов со стимулированием усиленного использования глюкозы.

### **Сущность изобретения**

Настоящее изобретение в одном из своих вариантов осуществления относится к соединению формулы (I),



формула (I).

где

каждый из W<sub>1-4</sub> и Z<sub>1</sub> - Z<sub>5</sub> независимо представляет собой -C-, -CH-, CH<sub>2</sub>, O, S или N;

5 X независимо представляет собой CH<sub>2</sub>, N или CHR<sub>4</sub>;

Y независимо представляет собой CH<sub>2</sub> или CHR<sub>5</sub>;

n представляет собой число от 0 до 3;

один или несколько R<sub>1</sub> в кольце Z независимо выбраны из группы, состоящей из CN, OH, COOH, OCH<sub>3</sub>, CF<sub>3</sub>, CONH<sub>2</sub>, B(OH)<sub>2</sub>, B(OR)<sub>2</sub>, изомера кислоты, замещенного амина, простых эфиров и галогена, замещенного или незамещенного алкила, замещенного или незамещенного циклического или гетероциклического радикала, замещенного или незамещенного циклоарила или циклогетероарила, где замещенный циклоарил или циклогетероарил может быть замещен водородом, CN, OH, COOH, OCH<sub>3</sub>, CF<sub>3</sub>, CONH<sub>2</sub>, B(OH)<sub>2</sub>, B(OR)<sub>2</sub>, изомером кислоты, замещенным амином, 10 простыми эфирами и галогеном, замещенным или незамещенным алкилом, замещенным или незамещенным циклическим или гетероциклическим радикалом, замещенным или незамещенным циклоариллом или циклогетероариллом, SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>;

один или несколько R<sub>2</sub> в кольце W независимо выбраны из группы, состоящей из CN, OH, CHF<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>F, CF<sub>3</sub>, COOH, CONH<sub>2</sub>, B(OH)<sub>2</sub>, B(OR)<sub>2</sub>, изомера кислоты, галогена и бициклического гетероарила; 20

R<sub>7</sub> представляет собой водород или CN, COOH, CONH<sub>2</sub>, B(OH)<sub>2</sub>, B(OR)<sub>2</sub> или изомер кислоты;

R представляет собой алкил;

каждый из  $R_3$ ,  $R_4$ ,  $R_5$ , или  $R_8$ , или  $R_6$ , когда  $n$  не равняется нулю, независимо выбран из

- (1) водорода;
- (2) алкила или простого эфира, содержащего от 1 до 12 атомов углерода,
- (3) замещенного амина или
- (4)  $-(CH_2)_mG$ , где  $m$  равняется от 1 до 12, и  $G$  независимо выбран из
  - (a) циклоалкила, содержащего от 3 до 6 атомов углерода,
  - (b) арила или гетероарила,
  - (c)  $CF_3$ ,  $CF_2H$  или  $CFH_2$  или
  - (d) гетероцикла,

при условии, что  $R_3$ ,  $R_4$ ,  $R_5$ ,  $R_8$  или  $R_6$  одновременно не представляют собой водород;

или его фармацевтически приемлемым солям или стереоизомерам.

Объектом настоящего изобретения является соединение в соответствии с формулой (I), (II) или (III) для применения в лечении нарушений с воздействием на белок, связывающий жирные кислоты (FABP4).

Еще другим объектом настоящего изобретения является фармацевтическая композиция, содержащая соединение в соответствии с формулой (I), (II) или (III) в качестве активного ингредиента в комбинации с фармацевтически приемлемым разбавителем или носителем, для применения в лечении нарушений с воздействием на FABP4. В данном случае фармацевтическая композиция может дополнительно содержать дополнительное терапевтически активное средство.

Еще другим объектом настоящего изобретения является способ лечения нарушений с воздействием на FABP4, который включает введение субъекту, нуждающемуся в таком лечении (предпочтительно человеку), эффективного количества соединения в соответствии с формулой (I), (II) или (III), включая необязательное совместное введение других терапевтических средств, осуществляемое либо в виде однократного (либо многократного) введения дозы и либо одновременно, либо последовательно.

Еще другим объектом настоящего изобретения является способ ингибирования FABP4, который включает введение субъекту, нуждающемуся в таком лечении (предпочтительно человеку), эффективного количества соединения в соответствии с формулой (I), (II) или (III).

Еще другим объектом настоящего изобретения является применение соединения в соответствии с формулой (I), (II) или (III) для изготовления лекарственного препарата для применения в лечении нарушений с воздействием на белок, связывающий жирные кислоты, представляющий собой FABP4. Примеры таких нарушений включают диабет 2 типа, гипергликемию, метаболический синдром, ожирение, атеросклероз, внутричерепную атеросклеротическую болезнь, неалкогольный стеатогепатит, астму, сосудистую деменцию, рассеянный склероз, болезнь Альцгеймера, другие хронические воспалительные и аутоиммунные/воспалительные заболевания, хроническую болезнь сердца, синдром поликистозных яичников, преэклампсию и рак.

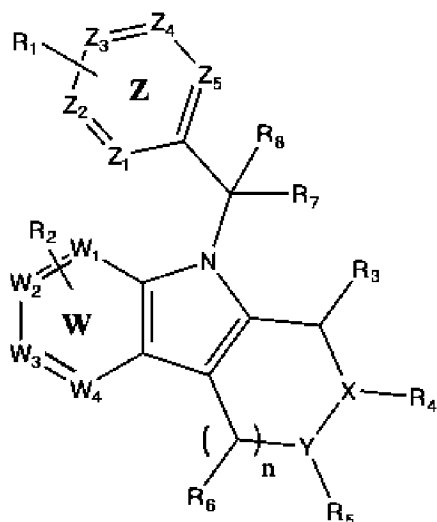
Другие признаки и преимущества настоящего изобретения будут очевидны из подробного описания и формулы изобретения.

#### **Описание предпочтительных вариантов осуществления**

Далее будут описаны предпочтительные варианты осуществления настоящего изобретения со ссылкой на графические материалы. Идентичные элементы на различных фигурах обозначены одинаковыми позиционными обозначениями.

Далее будет приведена подробная ссылка на каждый вариант осуществления настоящего изобретения. Такие варианты осуществления представлены в качестве пояснения настоящего изобретения, в отношении которого не предусматривается то, что оно ограничено ими. Фактически, специалисты в данной области техники смогут понять при прочтении настоящего описания и рассмотрении настоящих графических материалов, что возможны различные модификации и вариации.

Настоящее изобретение в одном варианте осуществления представлено соединением формулы (I), предусматривающей:



формула (I).

где

каждый из  $W_{1-4}$  и  $Z_1 - Z_5$  независимо представляет собой -C-, -CH-,  $CH_2$ , O, S или

5 N;

X независимо представляет собой  $CH_2$ , N или  $CHR_4$ ;

Y независимо представляет собой  $CH_2$  или  $CHR_5$ ;

n представляет собой число от 0 до 3;

один или несколько  $R_1$  в кольце Z независимо выбраны из группы, состоящей из

10 CN, OH, COOH, OCH<sub>3</sub>, CF<sub>3</sub>, CONH<sub>2</sub>, B(OH)<sub>2</sub>, B(OR)<sub>2</sub>, изоостера кислоты, замещенного амина, простых эфиров и галогена, замещенного или незамещенного алкила, замещенного или незамещенного циклического или гетероциклического радикала, замещенного или незамещенного циклоарила или циклогетероарила, где замещенный циклоарил или циклогетероарил может быть замещен водородом, CN, OH, COOH,

15 OCH<sub>3</sub>, CF<sub>3</sub>, CONH<sub>2</sub>, B(OH)<sub>2</sub>, B(OR)<sub>2</sub>, изоостером кислоты, замещенным амином, простыми эфирами и галогеном, замещенным или незамещенным алкилом, замещенным или незамещенным циклическим или гетероциклическим радикалом, замещенным или незамещенным циклоариллом или циклогетероариллом, SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>;

один или несколько  $R_2$  в кольце W независимо выбраны из группы, состоящей

20 из CN, OH, CHF<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>F, CF<sub>3</sub>, COOH, CONH<sub>2</sub>, B(OH)<sub>2</sub>, B(OR)<sub>2</sub>, изоостера кислоты, галогена и бициклического гетероарила;

$R_7$  представляет собой водород или CN, COOH, CONH<sub>2</sub>, B(OH)<sub>2</sub>, B(OR)<sub>2</sub> или изоостер кислоты;

R представляет собой алкил;

каждый из R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub>, R<sub>5</sub>, или R<sub>8</sub>, или R<sub>6</sub>, когда n не равняется нулю, независимо выбран из

(1) водорода;

(2) замещенного или незамещенного алкила или простого эфира,

5 содержащего от 1 до 12 атомов углерода,

(3) замещенного амина или

(4) --(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>G, где m равняется от 1 до 12, и G независимо выбран из

(a) циклоалкила, содержащего от 3 до 6 атомов углерода,

(b) арила или гетероарила,

10 (c) CF<sub>3</sub>, CF<sub>2</sub>H или CFH<sub>2</sub> или

(d) гетероцикла,

при условии, что R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub>, R<sub>5</sub>, R<sub>8</sub> или R<sub>6</sub> одновременно не представляют собой водород;

или его фармацевтически приемлемыми солями или стереоизомерами.

15

В дополнение, предусматривается соединение формулы I, где одновременно присутствуют R<sub>1</sub> и R<sub>2</sub>, каждый из которых независимо представляет собой CN, COOH или CONH<sub>2</sub>.

20 В дополнение, предусматривается соединение формулы I, где формула I предусматривает несколько R<sub>1</sub> и R<sub>2</sub>.

В дополнение, предусматривается соединение формулы I, где каждый из R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub>, R<sub>5</sub>, R<sub>8</sub> или R<sub>6</sub>, когда n не равняется нулю, независимо представляет собой алкил, содержащий 4 атома углерода.

25 В дополнение, предусматривается соединение формулы I, где каждый из R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub>, R<sub>5</sub>, R<sub>8</sub> или R<sub>6</sub>, когда n не равняется нулю, независимо представляет собой алкил, содержащий 5 атомов углерода.

В дополнение, предусматривается соединение формулы I, где каждый из R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub>, R<sub>5</sub>, R<sub>8</sub> или R<sub>6</sub>, когда n не равняется нулю, независимо представляет собой алкил, содержащий 6 атомов углерода.

30 В дополнение, кольцо Z соединения формулы I может иметь различный размер (например, может представлять собой пятичленное кольцо, шестичленное кольцо и т. д.).

В некоторых примерах кольцо Z соединения формулы I содержит Z<sub>1</sub> - Z<sub>4</sub>.

В других примерах кольцо Z соединения формулы I содержит Z<sub>1</sub> - Z<sub>5</sub>.

В ряде примеров один или несколько  $R_1$  в кольце Z представляют собой галоген.

В ряде примеров один или несколько  $R_1$  в кольце Z представляют собой CN.

В ряде примеров один или несколько  $R_1$  в кольце Z представляют собой  $CF_3$ .

В ряде примеров один или несколько  $R_2$  в кольце W представляют собой

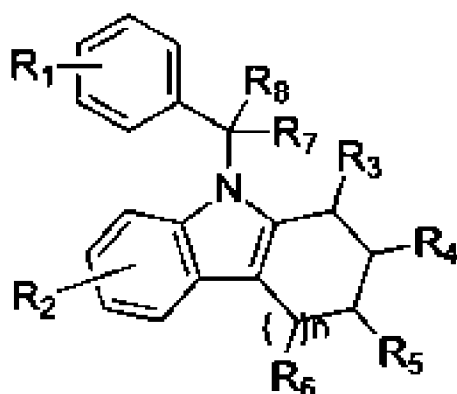
5 галоген.

В ряде примеров один или несколько  $R_1$  в кольце Z предусматривают CN и/или галоген.

В ряде примеров один или несколько  $R_1$  в кольце Z предусматривают CN и/или галоген, и один или несколько  $R_2$  в кольце W предусматривают другой галоген. В

10 некоторых примерах галоген идентичен другому галогену. В других примерах галоген отличается от другого галогена.

В других вариантах осуществления настоящее изобретение представлено соединением формулы (II), предусматривающей:



15 формула (II),

где

n равняется 0, 1 или 2;

$R_1$  выбран из группы, состоящей из CN, COOH, CONH<sub>2</sub>, B(OH)<sub>2</sub>, B(OR)<sub>2</sub>, изостера кислоты и галогена;

20  $R_2$  выбран из группы, состоящей из CN, COOH, CONH<sub>2</sub>, B(OH)<sub>2</sub>, B(OR)<sub>2</sub>, изостера кислоты, галогена и бициклического соединения;

$R_7$  представляет собой водород или CN, COOH, CONH<sub>2</sub>, B(OH)<sub>2</sub>, B(OR)<sub>2</sub> или изостер кислоты;

R представляет собой алкил;

каждый из R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub>, R<sub>5</sub>, или R<sub>8</sub>, или R<sub>6</sub>, когда n не равняется нулю, независимо выбран из

- (1) водорода;
- (2) алкила, содержащего от 1 до 12 атомов углерода, или
- (3)  $-(CH_2)_mG$ , где m равняется от 1 до 12, и G независимо выбран из
  - (a) циклоалкила, содержащего от 3 до 6 атомов углерода,
  - (b) арила или гетероарила или
  - (c) CF<sub>3</sub>, CF<sub>2</sub>H или CFH<sub>2</sub>,

при условии, что G не представляет собой азот- или

кислородсодержащую группу; и

при условии, что R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub>, R<sub>5</sub>, R<sub>8</sub> или R<sub>6</sub> одновременно не представляют собой водород;

или его фармацевтически приемлемыми солями.

В дополнение, предусматривается соединение формулы II, где если

одновременно присутствуют R<sub>1</sub> и R<sub>2</sub>, то каждый из них независимо представляет собой CN, COOH или CONH<sub>2</sub>.

В дополнение, соединение формулы II предусматривает несколько R<sub>1</sub> и R<sub>2</sub>.

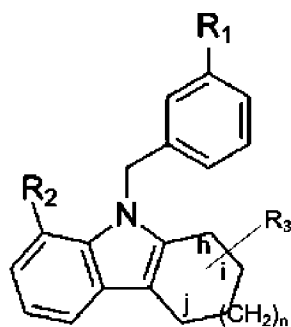
В дополнение, предусматривается соединение формулы II, где каждый из R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub>, R<sub>5</sub>, R<sub>8</sub> или R<sub>6</sub>, когда n не равняется нулю, независимо представляет собой алкил,

содержащий 4 атома углерода.

В дополнение, предусматривается соединение формулы I, где каждый из R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub>, R<sub>5</sub>, R<sub>8</sub> или R<sub>6</sub>, когда n не равняется нулю, независимо представляет собой алкил, содержащий 5 атомов углерода.

В дополнение, предусматривается соединение формулы I, где каждый из R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub>, R<sub>5</sub>, R<sub>8</sub> или R<sub>6</sub>, когда n не равняется нулю, независимо представляет собой алкил, содержащий 6 атомов углерода.

В еще одном варианте осуществления настоящее изобретение представлено соединением формулы (III), предусматривающей:



формула (III).

где

$n$  равняется 0, 1 или 2;

каждый из  $R_1$  и  $R_2$  независимо представляет собой CN, COOH, CONH<sub>2</sub>, B(OH)<sub>2</sub>,

5 B(OR)<sub>2</sub> или изостер

кислоты;

$R$  представляет собой алкил;

$R_3$  независимо выбран из

(1) алкила, содержащего от 1 до 12 атомов углерода;

10 (2)  $-(CH_2)_mG$ , где  $m$  равняется от 1 до 12, и  $G$  независимо выбран из

(а) циклоалкила, содержащего от 3 до 6 атомов углерода; и

(б) фенила; и

при условии, что  $G$  не представляет собой азот- или кислородсодержащую  
группу;

15 или его фармацевтически приемлемыми солями.

Соединение в соответствии с формулой III, где  $n$  равняется 0, и  $R_3$  присоединен  
в h-, i-, или j-положении.

20 Соединение в соответствии с формулой III, где  $n$  равняется 1, и  $R_3$  присоединен  
в h-, i-, или j-положении.

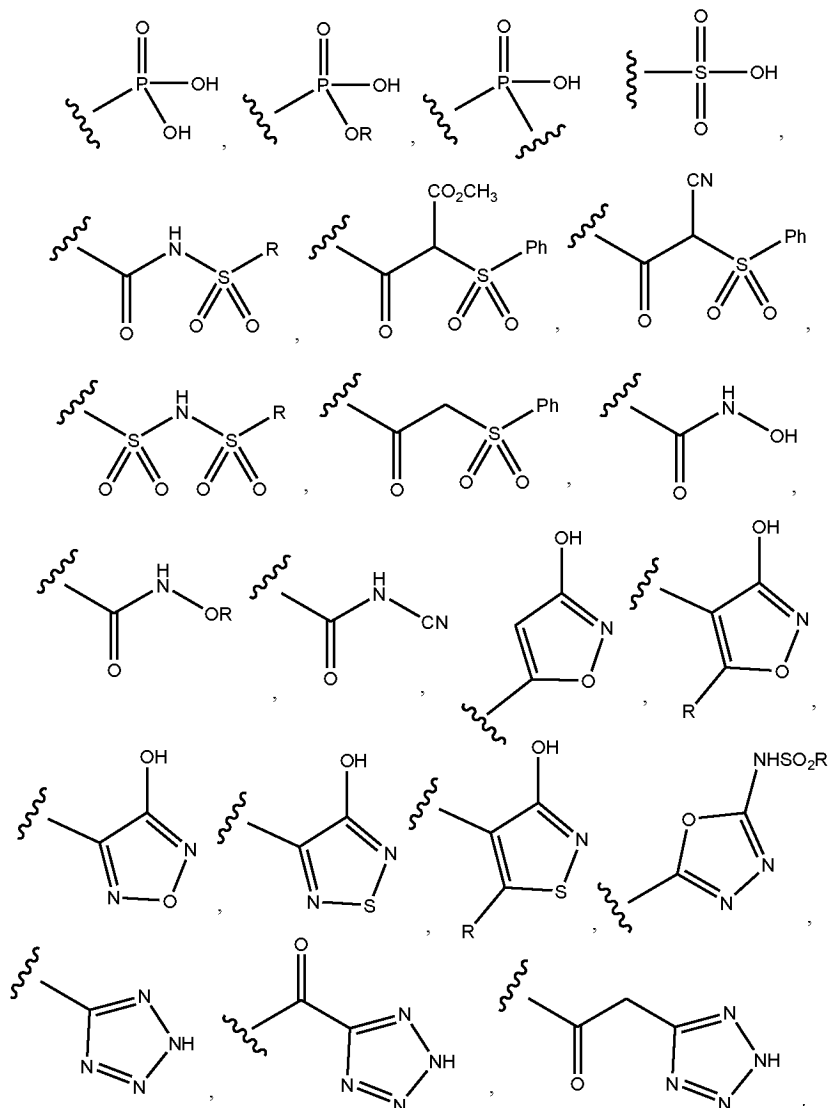
Соединение в соответствии с формулой III, где  $n$  равняется 2, и  $R_3$  присоединен  
в h-, i-, или j-положении.

Соединение в соответствии с формулой III, которое представляет собой чистый  
оптический изомер.

25 Соединение в соответствии с формулой III, которое представляет собой (+)-  
изомер.

## ОПРЕДЕЛЕНИЯ

Применяемый в данном документе термин “изостер кислоты” включает без ограничения следующие функциональные группы, где R представляет собой алкильную группу:



Термин “алкил” относится к насыщенной углеводородной группе с прямой или разветвленной цепью, содержащей от 1 до 10 атомов углерода. Иллюстративные алкильные группы включают без ограничения метил, этил, н-пропил, изопропил, 2-метил-1-пропил, 2-метил-2-пропил, 2-метил-1-бутил, 3-метил-1-бутил, 2-метил-3-бутил, 2,2-диметил-1-пропил, 2-метил-1-пентил, 3-метил-1-пентил, 4-метил-1-пентил, 2-метил-2-пентил, 3-метил-2-пентил, 4-метил-2-пентил, 2,2-диметил-1-бутил, 3,3-диметил-1-бутил, 2-этил-1-бутил, бутил, изобутил, т-бутил, н-пентил, изопентил, неопентил, н-гексил и т. п. и более длинные алкильные группы, такие как гептил,

октил и т. д. Применяемый в данном документе “низший алкил” означает алкил, содержащий от 1 до 6 атомов углерода.

Термин “алкиленил” относится к двухвалентной алкильной группе.

5 Термин “алкокси”, применяемый в данном документе, включает -O-(алкил), где алкил определен выше.

Термин “амино”, применяемый в данном документе, относится к группе  $\text{-NH}_2$ .

10 “Арил” означает моно-, би- или трициклическую ароматическую группу, где все кольца в группе являются ароматическими, и все атомы в кольце представляют собой атомы углерода. В случае би- или трициклических систем отдельные ароматические кольца сочленены друг с другом. Примерами арильных групп являются 6 и 10 членные арилы. Дополнительные примеры арильных групп включают без ограничения фенил, нафталин и антрацен.

Термин “циано”, применяемый в данном документе, означает заместитель, содержащий атом углерода, соединенный с атомом азота тройной связью.

15 Термин “дейтерий”, применяемый в данном документе, означает устойчивый изотоп водорода, содержащий один протон и один нейтрон.

Термин “галоген” представляет собой хлор, фтор, бром или йод. В некоторых вариантах осуществления галоген представляет собой хлор, фтор или бром. Термин “галоген”, применяемый в данном документе, относится к фтору, хлору, бром или йоду.

20

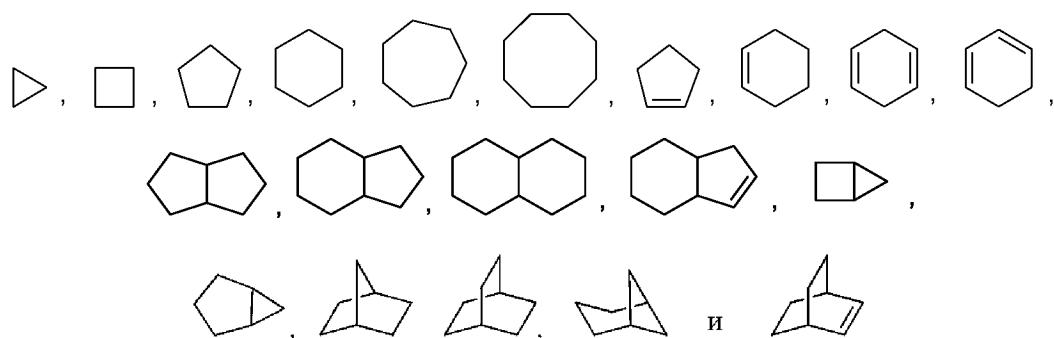
Термин “гидрокси” означает группу -OH.

Термин “оксо” означает группу  $\text{=O}$ , и она может быть присоединена к атому углерода или атому серы.

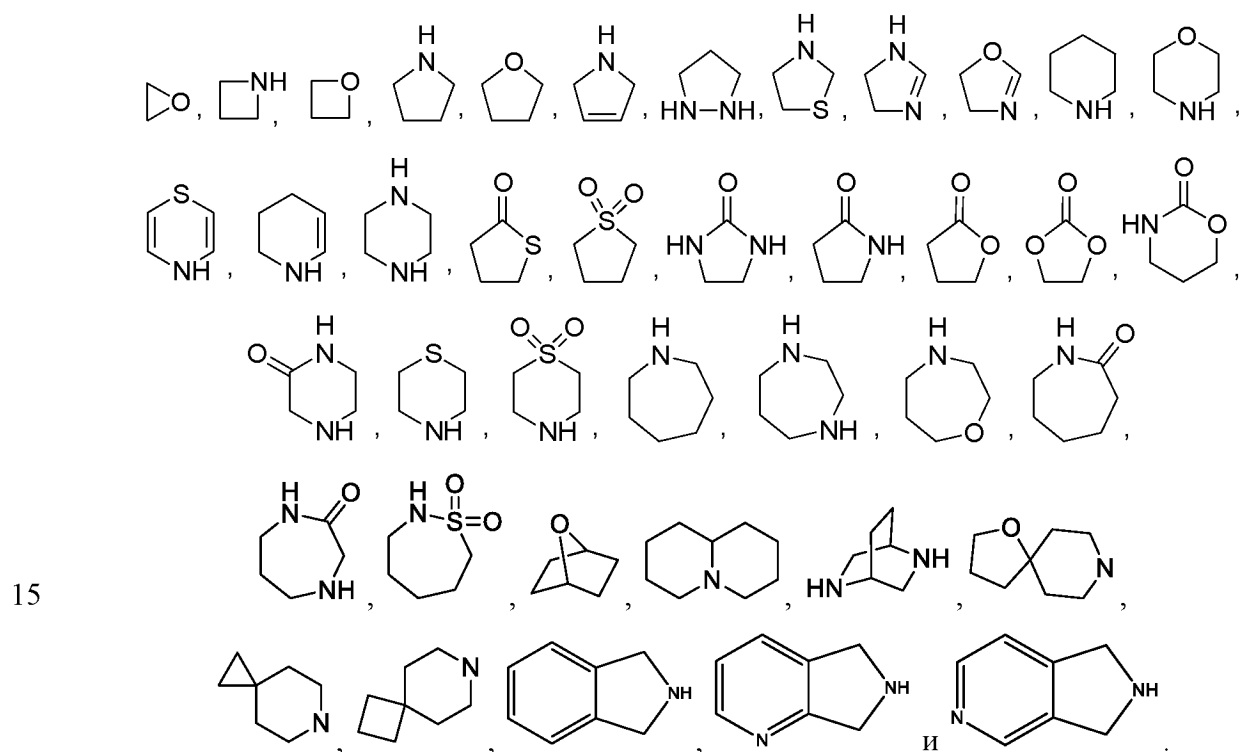
Термин “N-оксид” относится к окисленной форме атома азота.

25 Применяемый в данном документе термин “циклоалкил” относится к насыщенному или частично насыщенному моноциклическому, сочлененному полициклическому, мостиковому полициклическому или спирополициклическому карбоциклу, содержащему от 3 до 15 атомов углерода в кольце. Неограничивающая категория циклоалкильных групп представлена насыщенными или частично

30 насыщенными моноциклическими карбоциклами, содержащими от 3 до 6 атомов углерода. Иллюстративные примеры циклоалкильных групп включают без ограничения следующие фрагменты:



Термин "гетероциклоалкил", применяемый в данном документе, относится к  
 5 моноциклической или сочлененной, мостиковой или спирополициклической кольцевой  
 структуре, которая является насыщенной или частично насыщенной и содержит от  
 трех до 12 атомов в кольце, выбранных из атомов углерода, и не более трех  
 гетероатомов, выбранных из азота, кислорода и серы. Кольцевая структура может  
 необязательно содержать вплоть до двух оксогрупп при членах кольца, которые  
 10 представляют собой углерод или серу, или N-оксид. Иллюстративные  
 гетероциклоалкильные соединения включают без ограничения:



Применяемый в данном документе термин "гетероарил" относится к  
 моноциклическому или сочлененному полициклическому ароматическому  
 гетероциклу, содержащему от трех до 15 атомов в кольце, которые выбраны из  
 20 углерода, кислорода, азота и серы. Подходящие гетероарильные группы не включают  
 кольцевые системы, которые должны быть заряжены, чтобы являться ароматическими,

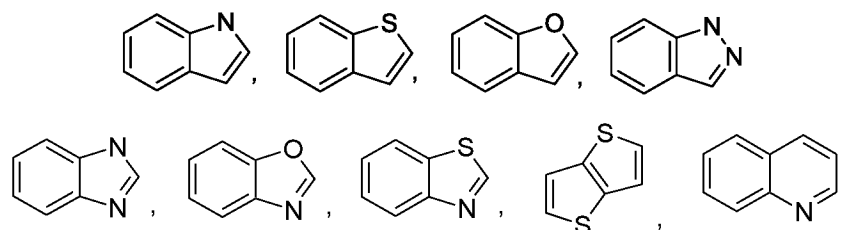
такие как пирилий. Соответствующие 5-членные гетероарильные кольца (в виде моноциклического гетероарила или в виде части полициклического гетероарила) содержат один атом кислорода, серы или азота в кольце или один атом азота с одним

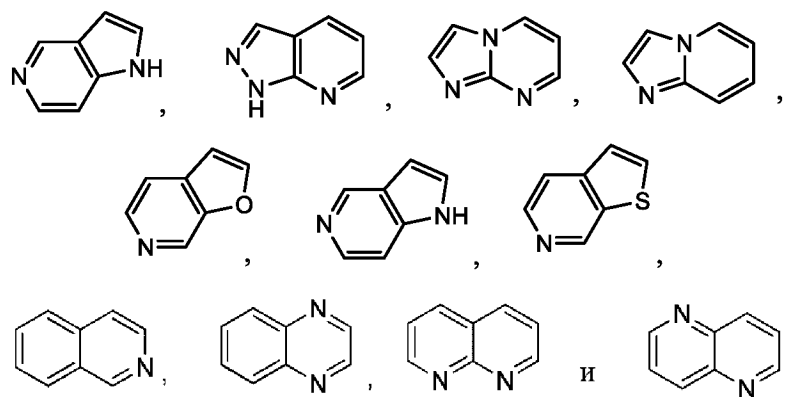
5 членные гетероарильные кольца (в виде моноциклического гетероарила или в виде части полициклического гетероарила) содержат 1, 2 или 3 атома азота в кольце.

Примеры гетероарильных групп включают без ограничения пиридинил, имидазолил, имидазопиридинил, пиримидинил, пиразолил, триазолил, пиразинил, тетразолил, фурил, тиенил, изоксазолил, тиазолил, оксазолил, изотиазолил, пирролил, хинолинил, 10 изохинолинил, индолил, бензимидазолил, бензофуранил, циннолинил, индазолил, индолизинил, фталазинил, пиридазинил, триазинил, изоиндолил, птеридинил, пуринил, оксадиазолил, триазолил, тиадиазолил, фуразанил, бензофуразанил, бензотиофенил, бензотиазолил, бензоксазолил, хиназолинил, хиноксалинил, нафтиридинил и фуропиридинил.

15 Термин “бициклический гетероарил” относится к гетероарилу, как определено выше, содержащему два составляющих ароматических кольца, где два кольца сочленены друг с другом, и по меньшей мере одно из колец представляет собой гетероарил, как определено выше. Бициклические гетероарилы включают бициклические гетероарильные группы, содержащие 1, 2, 3 или 4 атома в кольце, 20 являющихся гетероатомами, выбранными из O, N или S. В некоторых вариантах осуществления, где гетероатом представляет собой N, он может быть представлен N-оксидом. Бициклические гетероарилы также включают 8-, 9- или 10-членные бициклические гетероарильные группы. Бициклические гетероарилы также включают 8-, 9- или 10-членные бициклические гетероарильные группы, которые содержат 1, 2, 3 25 или 4 атома в кольце, являющихся гетероатомами, выбранными из O, N или S.

Иллюстративные примеры бициклических гетероариллов включают без ограничения





Специалисту в данной области техники будет понятно, что виды соединений, представляющих собой гетероарильные, циклоалкильные и гетероциклоалкильные группы, перечисленные или проиллюстрированные выше, не являются исчерпывающими, и что также могут быть выбраны дополнительные виды соединений в пределах объема этих определенных терминов.

Применяемый в данном документе термин “замещенный” означает, что указанная группа или фрагмент содержит один или несколько подходящих заместителей. Применяемый в данном документе термин “незамещенный” означает, что указанная группа не содержит заместителей. Применяемый в данном документе термин “необязательно замещенный” означает, что указанная группа является незамещенной или замещена указанным числом заместителей. Когда термин “замещенный” применяют для описания структурной системы, подразумевается, что замещение происходит в любом разрешенном по валентности положении в системе.

Применяемое в данном документе выражение “один или несколько заместителей” означает от одного до максимально возможного числа замещений, которые могут происходить в любом разрешенном по валентности положении в системе. В определенном варианте осуществления один или несколько заместителей означает 1, 2, 3, 4 или 5 заместителей. В другом варианте осуществления один или несколько заместителей означает 1, 2 или 3 заместителя.

Предполагается, что любой атом, представленный в данном документе с ненасыщенной валентностью, характеризуется достаточным количеством атомов водорода для насыщения валентности атома.

В случае если любая переменная (например, алкил или  $R^a$ ) представлена более чем в одном местоположении в любой формуле или описании, представленных в данном документе, определение такой переменной в каждом случае является независимым от ее определения во всех остальных случаях.

Предполагается, что числовые диапазоны, применяемые в данном документе, включают последовательные целые числа. Например, диапазон, выраженный как “от 0 до 4” или “0-4”, включает 0, 1, 2, 3 и 4.

В случае если показан многофункциональный фрагмент, точка присоединения к остальной части формулы может находиться в любой точке многофункционального фрагмента. В некоторых вариантах осуществления точка присоединения обозначена линией или дефисом. Например, арилокси- относится к фрагменту, в котором атом кислорода является точкой присоединения к ядру молекулы, при этом арил присоединен к атому кислорода.

#### Дополнительные определения

Применяемый в данном документе “протонный ядерный магнитный резонанс” или <sup>1</sup>H ЯМР представляет собой применение ядерного магнитного резонанса в ЯМР-спектроскопии по отношению к ядрам водорода-1 в молекулах вещества с целью определения структуры его молекул.

Применяемый в данном документе термин “субъект” охватывает млекопитающих и немлекопитающих. Примеры млекопитающих включают без ограничения любых представителей класса млекопитающих: людей; отличных от человека приматов, таких как шимпанзе и другие виды человекообразных обезьян и нечеловекообразных обезьян; сельскохозяйственных животных, таких как крупный рогатый скот, лошади, овцы, козы, свиньи; домашних животных, таких как кролики, собаки и кошки; и лабораторных животных, включая грызунов, таких как крысы, мыши и морские свинки, и т. п. Примеры немлекопитающих включают без ограничения птиц, рыб и т. п. В одном варианте осуществления настоящего изобретения млекопитающим является человек.

“Пациент” включает как человека, так и животных.

Термин “ингибитор” относится к молекуле, такой как соединение, лекарственное средство, активатор фермента или гормон, которая блокирует определенную биологическую активность или иным образом препятствует ей.

Термин “модулятор” относится к молекуле, такой как соединение по настоящему изобретению, которая увеличивает или уменьшает или иным образом влияет на активность данного фермента или белка.

Термины “эффективное количество” или “терапевтически эффективное количество” относятся к достаточному количеству средства для получения желаемого

биологического результата. Этим результатом может являться уменьшение и/или снижение выраженности признаков, симптомов или причин заболевания или медицинского состояния или любое другое требуемое изменение биологической системы. Например, “эффективное количество” для терапевтического применения представляет собой количество соединения или композиции, содержащей соединение, которое требуется для обеспечения клинически значимого изменения в отношении статуса заболевания, симптома или медицинского состояния. Соответствующее “эффективное” количество в каждом отдельном случае может определить специалист в данной области техники с применением рутинных экспериментов. Таким образом, выражение “эффективное количество” в общем относится к количеству, при котором активное вещество оказывает требуемый терапевтически эффект.

Применяемые в данном документе термины “лечить” или “лечение” охватывают как “профилактическое” и “направленное на излечение” лечение. “Профилактическое” лечение предназначено для обозначения отсрочки развития заболевания, симптома заболевания или медицинского состояния, подавления симптомов, которые могут возникнуть, или снижения риска развития или рецидива заболевания или симптома. “Направленное на излечение” лечение включает снижение тяжести или подавление ухудшения существующего заболевания, симптома или состояния. Таким образом, лечение включает уменьшение интенсивности или предупреждение ухудшения существующих симптомов заболевания, предупреждение появления дополнительных симптомов, уменьшение интенсивности или предупреждение проявлений основных метаболических причин симптомов, подавление нарушения или заболевания, например остановку развития нарушения или заболевания, облегчение нарушения или заболевания, обуславливание регрессии нарушения или заболевания, облегчение состояния, вызванного заболеванием или нарушением, или купирование симптомов заболевания или нарушения.

#### Дополнительные химические описания

Любая формула, приведенная в данном документе, предназначена для представления соединений, которые характеризуются структурами, представленными структурной формулой, а также некоторых их вариантов или форм. Например, соединения любой формулы, приведенной в данном документе, могут иметь асимметричные или хиральные центры и, следовательно, существовать в разных стереоизомерных формах. Все стереоизомеры, включая оптические изомеры,

энантиомеры и диастереомеры, соединений общей формулы и их смеси считаются попадающими в пределы объема формулы. Кроме того, некоторые структуры могут существовать в виде геометрических изомеров (т. е. *цис*- и *транс*-изомеров), в виде таутомеров или в виде атропоизомеров. Все такие изомерные формы и их смеси рассматриваются в данном документе как часть настоящего изобретения. Таким образом, любая формула, приведенная в данном документе, предназначена для представления рацемата, одной или нескольких энантиомерных форм, одной или нескольких диастереомерных форм, одной или нескольких таутомерных или атропоизомерных форм и их смесей.

Диастереомерные смеси можно разделять на их отдельные диастереомеры на основе их физико-химических отличий посредством способов, широко известных специалистам в данной области техники, таких как, например, хроматография и/или фракционная кристаллизация. Энантиомеры можно разделять посредством превращения энантиомерной смеси в диастереомерную смесь посредством реакции с подходящим оптически активным соединением (например, хиральное вспомогательное вещество, такое как хиральный спирт или хлорангидрид Мошера, или образование смеси диастереомерных солей), разделения диастереомеров и превращения (например, гидролиз или обессоливание) отдельных диастереомеров с получением соответствующих чистых энантиомеров. Энантиомеры также можно разделять с применением колонки для хиральной HPLC. Хиральные центры соединений по настоящему изобретению могут быть обозначены как “R” или “S”, как определено в рекомендациях IUPAC 1974 г.

Соединения по настоящему изобретению могут образовывать фармацевтически приемлемые соли, которые также находятся в пределах объема данного изобретения.

“Фармацевтически приемлемая соль” относится к соли свободной кислоты или основания соединения формулы I, II или III, которая является нетоксичной, является физиологически приемлемой, является совместимой с фармацевтической композицией, в которую ее составляют, и иным образом подходит для составления и/или введения субъекту. Подразумевается, что ссылка на соединение, представленное в данном документе, включает ссылку на фармацевтически приемлемую соль указанного соединения, если не указано иное.

Соли соединения включают кислые соли, образованные с неорганическими и/или органическими кислотами, а также основные соли, образованные с неорганическими и/или органическими основаниями. В дополнение, если данное

соединение содержит как основной фрагмент, такой как без ограничения пиридин или имидазол, так и кислотный фрагмент, такой как без ограничения карбоновая кислота, то специалисту в данной области техники будет понятно, что соединение может существовать в виде цвиттер-иона (“внутренняя соль”); такие соли включены в термин

5 “соль”, применяемый в данном документе. Соли соединений по настоящему изобретению можно получать, например, посредством осуществления реакции соединения с некоторым количеством подходящей кислоты или основания, таким как эквивалентное количество, в среде, такой как среда, в которой соль осаждается, или в водной среде с последующей лиофилизацией.

10 Иллюстративные соли включают без ограничения сульфатные, цитратные, ацетатные, оксалатные, хлоридные, бромидные, йодидные, нитратные, бисульфатные, фосфатные, ортофосфорнокислые, изоникотинатные, лактатные, салицилатные, лимоннокислые, тартратные, олеатные, таннатные, пантотенатные, битартратные, аскорбатные, сукцинатные, малеатные, гентизинатные, fumarатные, глюконатные, 15 глюкуронатные, сахаратные, формиатные, бензоатные, глутаматные, метансульфонатные (“мезилатные”), этансульфонатные, бензолсульфонатные, *n*-толуолсульфонатные и памоатные (т. е. 1,1'-метилден-бис(2-гидрокси-3-нафтоат)) соли. Фармацевтически приемлемая соль может предусматривать присоединение другой молекулы, как например ацетат-иона, сукцинат-иона или другого противоиона.

20 Противоион может представлять собой любой органический или неорганический фрагмент, который стабилизирует заряд исходного соединения. Кроме того, фармацевтически приемлемая соль может иметь в своей структуре более одного заряженного атома. В случаях, когда несколько заряженных атомов являются частью фармацевтически приемлемой соли, может иметься несколько противоионов.

25 Следовательно, фармацевтически приемлемая соль может содержать один или несколько заряженных атомов и/или один или несколько противоионов.

Иллюстративные соли присоединения кислоты включают ацетаты, аскорбаты, бензоаты, бензолсульфонаты, бисульфаты, бораты, бутираты, цитраты, камфораты, камфорсульфонаты, fumarаты, гидрохлориды, гидробромиды, гидройодиды, лактаты, 30 малеаты, метансульфонаты, нафталинсульфонаты, нитраты, оксалаты, фосфаты, пропионаты, салицилаты, сукцинаты, сульфаты, тартраты, тиоцианаты, толуолсульфонаты (также известные как тозилаты) и т. п.

Иллюстративные основные соли включают соли аммония, соли щелочных металлов, такие как соли натрия, лития и калия, соли щелочноземельных металлов,

такие как соли кальция и магния, соли с органическими основаниями (например, органическими аминами), такими как дициклогексиламины, трет-бутиламины, и соли с аминокислотами, такими как аргинин, лизин и т. д. Основные азотсодержащие группы можно кватернизировать с помощью таких средств, как низшие алкилгалогениды (например, метил-, этил- и бутил- хлориды, бромиды и йодиды), диалкилсульфаты (например, диметил-, диэтил- и дибутилсульфаты), галогениды с длинной цепью (например, децил-, лаурил- и стеарил- хлориды, бромиды и йодиды), аралкилгалогениды (например, бензил- и фенэтилбромиды) и другие.

В дополнение, кислоты и основания, которые обычно считаются подходящими для образования фармацевтически применимых солей из фармацевтических соединений, рассматриваются, 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.*, *J. Pharm. Sci.* (1977) 66(1) 1-19; P. Gould, *Int. J. Pharm.* (1986) 33 201-217; Anderson *et al.*, *The Practice of Medicinal Chemistry* (1996), Academic Press, New York; а также в The Orange Book (Food & Drug Administration, MD, доступно от FDA). Эти раскрытия включены в данный документ посредством ссылки на них.

В дополнение, подразумевается, что любое соединение, описанное в данном документе, также относится к любой несольватированной форме или гидрату, сольвату или полиморфу такого соединения и их смесям, даже если такие формы не указаны явным образом. “Сольват” означает физическую ассоциацию соединения по настоящему изобретению с одной или несколькими молекулами растворителя. Данная физическая ассоциация включает различные степени ионной и ковалентной связи, включая водородную связь. В некоторых случаях будет иметься возможность выделения сольвата, например, когда одна или несколько молекул растворителя включены в кристаллическую решетку кристаллического твердого вещества. “Сольват” охватывает как жидкофазные сольваты, так и поддающиеся выделению сольваты. Подходящие сольваты включают сольваты, образованные с фармацевтически приемлемыми растворителями, такими как вода, этанол и т. п. В некоторых вариантах осуществления растворитель представляет собой воду, а сольваты представляют собой гидраты.

Одно или несколько соединений по настоящему изобретению необязательно можно превращать в сольваты. Способы получения сольватов являются общеизвестными. Так, например, в M. Caira *et al.*, *J. Pharm. Sci.*, 93(3), 601-611 (2004) описано получение сольватов противогрибкового средства флуконазола в этилацетате,

а также с водой. Аналогичные препараты сольватов, гемисольватов, гидратов и т. п. описаны в E. C. van Tonder *et al.*, AAPS PharmSciTech., 5(1), article 12 (2004); а также A. L. Bingham *et al.*, Chem. Commun., 603-604 (2001). Стандартный неограничивающий способ предусматривает растворение соединения согласно настоящему изобретению в 5 подходящих количествах растворителя (органического растворителя или воды или их смеси) при температуре выше температуры окружающей среды и охлаждение раствора со скоростью, достаточной для образования кристаллов, которые затем выделяют стандартными способами. Аналитические методики, такие как, например, инфракрасная спектроскопия, показывают присутствие растворителя (или воды) в 10 кристаллах в виде сольвата (или гидрата).

Настоящее изобретение также относится к фармацевтически приемлемым пролекарствам на основе соединений формулы I, II или III и к способам лечения с использованием таких фармацевтически приемлемых пролекарств. Термин

“пролекарство” означает предшественник указанного соединения, после введения

15 субъекту которого образуется соединение *in vivo* посредством химического или физиологического процесса, такого как сольволиз или ферментативное расщепление, или в физиологических условиях (например, пролекарство при доведении pH до его физиологического уровня превращается в соединение формулы I, II или III).

“Фармацевтически приемлемое пролекарство” представляет собой пролекарство,

20 которое является нетоксичным, биологически переносимым и в других отношениях подходящим для составления и/или введения субъекту. Иллюстративные процедуры выбора и получения подходящих производных пролекарств описаны, например, в “Design of Prodrugs”, ed. H. Bundgaard, Elsevier, 1985.

Примеры пролекарств включают фармацевтически приемлемые сложные эфиры 25 соединений по настоящему изобретению, которые также рассматриваются как являющиеся частью настоящего изобретения. Фармацевтически приемлемые сложные эфиры соединений по настоящему изобретению включают следующие группы: (1) сложные эфиры карбоновых кислот, полученные путем эстерификации гидроксильных групп, в которых некарбонильный фрагмент относящейся к карбоновой кислоте части 30 сложноэфирной группировки выбран из алкила с прямой или разветвленной цепью (например, ацетила, н-пропила, т-бутила или н-бутила), алкоксиалкила (например, метоксиметила), аралкила (например, бензила), арилоксиалкила (например, феноксиметила), арила (например, фенила, необязательно замещенного, например, галогеном, C<sub>1</sub>-4алкилом, C<sub>1</sub>-4алкокси или амино); (2) сложные эфиры сульфокислот,

такие как алкил- или аралкилсульфонил (например, метансульфонил); (3) сложные эфиры аминокислот (например, L-валил или L-изолейцил); (4) сложные эфиры фосфоновых кислот и (5) сложные моно-, ди- или трифосфатные эфиры. Сложные фосфатные эфиры можно дополнительно подвергать эстерификации с помощью, например, C<sub>1-20</sub>спирта или его реакционноспособного производного или с помощью 2,3-ди(C<sub>6-24</sub>)ацилглицерина. Дополнительное обсуждение пролекарств представлено в T. Higuchi and V. Stella, Pro-drugs as Novel Delivery Systems (1987) 14 of the A.C.S. Symposium Series, а также в Bioreversible Carriers in Drug Design, (1987) Edward B. Roche, ed., American Pharmaceutical Association and Pergamon Press.

Например, если соединение формулы I, II или III содержит функциональную группу карбоновой кислоты, пролекарство может предусматривать сложный эфир, образованный путем замены атома водорода кислотной группы на группу, такую как, например, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)алкил, (C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub>)алканоилоксиметил, 1-(алканоилокси)этил, содержащий от 4 до 9 атомов углерода, 1-метил-1-(алканоилокси)-этил, содержащий от 5 до 10 атомов углерода, алкоксикарбонилоксиметил, содержащий от 3 до 6 атомов углерода, 1-(алкоксикарбонилокси)этил, содержащий от 4 до 7 атомов углерода, 1-метил-1-(алкоксикарбонилокси)этил, содержащий от 5 до 8 атомов углерода, N-(алкоксикарбонил)аминометил, содержащий от 3 до 9 атомов углерода, 1-(N-(алкоксикарбонил)амино)этил, содержащий от 4 до 10 атомов углерода, 3-фталидил, 4-критонолактонил, гамма-бутиролактон-4-ил, ди-N,N-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)алкиламино(C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>)алкил (такой как β-диметиламиноэтил), карбамоил-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)алкил, N,N-ди(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)алкилкарбамоил-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)алкил и пиперидино-, пирролидино- или морфолин(C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>)алкил и т. п.

Аналогично, если соединение формулы I, II или III содержит спиртовую функциональную группу, пролекарство может быть образовано путем замены атома водорода спиртовой группы на группу, такую как, например, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алканоилоксиметил, 1-((C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алканоилокси)этил, 1-метил-1-((C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алканоилокси)этил, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкоксикарбонилоксиметил, N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкоксикарбониламинометил, сукциноил, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алканоил, α-амино(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алканил, арилацил и α-аминоацил или α-аминоацил-α-аминоацил, где каждая α-аминоацильная группа независимо выбрана из встречающихся в природе L-аминокислот, P(O)(OH)<sub>2</sub>, -P(O)(O(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкила)<sub>2</sub> или гликозила (радикал, образующийся в результате удаления гидроксильной группы полуацетальной формы углевода) и т. п.

Если соединение формулы I, II или III содержит функциональную аминогруппу, пролекарство может быть образовано путем замены атома водорода в аминогруппе на группу, такую как, например, R''-карбонил, R''O-карбонил, NR''R'-карбонил, где каждый из R'' и R' независимо представляет собой (C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)алкил, (C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)циклоалкил, бензил, или R''-карбонил представляет собой природный α-аминоацил или природный α-аминоацил, -C(OH)C(O)OY<sup>1</sup>, где Y<sup>1</sup> представляет собой H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкил или бензил, -C(OY<sup>2</sup>)Y<sup>3</sup>, где Y<sup>2</sup> представляет собой (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкил, а Y<sup>3</sup> представляет собой (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкил, карбокси(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкил, амино(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкил или моно-N- или ди-N,N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкиламиноалкил, -C(Y<sup>4</sup>)Y<sup>5</sup>, где Y<sup>4</sup> представляет собой H или метил, а Y<sup>5</sup> представляет собой моно-N- или ди-N,N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкиламиноморфолино, пиперидин-1-ил или пирролидин-1-ил и т. п.

Настоящее изобретение также относится к фармацевтически активным метаболитам соединений формулы I, II или III и к вариантам применения таких метаболитов в способах по настоящему изобретению. “Фармацевтически активный метаболит” означает фармакологически активный продукт метаболизма соединения формулы I, II или III или его соли в организме. Пролекарства на основе соединения и его активные метаболиты можно определять с применением рутинных методик, известных или доступных в уровне техники. См., например, Bertolini *et al.*, *J. Med. Chem.* 1997, 40, 2011-2016; Shan *et al.*, *J. Pharm. Sci.* 1997, 86 (7), 765-767; Bagshawe, *Drug Dev. Res.* 1995, 34, 220-230; Bodor, *Adv. Drug Res.* 1984, 13, 255-331; Bundgaard, *Design of Prodrugs* (Elsevier Press, 1985); а также Larsen, *Design and Application of Prodrugs, Drug Design and Development* (Krogsgaard-Larsen *et al.*, eds., Harwood Academic Publishers, 1991).

Любая формула, приведенная в данном документе, также предназначена для представления немеченых форм, а также меченных изотопами форм соединений. Соединения, меченные изотопами, характеризуются структурами, представленными приведенными в данном документе формулами, за исключением того, что один или несколько атомов заменены атомом, имеющим выбранную атомную массу или массовое число. Примеры изотопов, которые могут быть включены в соединения по настоящему изобретению, включают изотопы водорода, углерода, азота, кислорода, фосфора, фтора, хлора и йода, такие как <sup>2</sup>H, <sup>3</sup>H, <sup>11</sup>C, <sup>13</sup>C, <sup>14</sup>C, <sup>15</sup>N, <sup>18</sup>O, <sup>17</sup>O, <sup>31</sup>P, <sup>32</sup>P, <sup>35</sup>S, <sup>18</sup>F, <sup>36</sup>Cl и <sup>125</sup>I соответственно. Такие изотопно-меченые соединений применимы в исследованиях метаболизма (например, с использованием <sup>14</sup>C), исследованиях кинетики реакций (с использованием, например, <sup>2</sup>H или <sup>3</sup>H), методиках обнаружения

или визуализации [таких как позитронно-эмиссионная томография (PET) или  
 однофотонная эмиссионная компьютерная томография (SPECT)], включая анализы  
 распределения лекарственного средства или субстрата в тканях, или в лечении  
 пациентов посредством радиотерапии. В частности, соединение, меченное  $^{18}\text{F}$  или  $^{11}\text{C}$ ,  
 5 может быть особенно подходящим для PET- или SPECT-исследований. Кроме того,  
 замещение более тяжелыми изотопами, такими как дейтерий (т. е.  $^2\text{H}$ ), может  
 предоставить определенные терапевтические преимущества, обеспечиваемые в  
 результате большей метаболической стабильности, например увеличение периода  
 полувыведения *in vivo* или снижение требований к дозировке. Меченные изотопами  
 10 соединения согласно данному изобретения и пролекарства на их основе, как правило,  
 можно получать путем проведения процедур, описанных на схемах или в примерах и  
 процедурах получения, описанных ниже, посредством замены легкодоступного  
 меченного изотопом реагента на немеченный изотоп реагент.

Применение терминов “соль”, “сольват”, “полиморф”, “пролекарство” и т. п. в  
 15 отношении соединений, описанных в данном документе, предназначено для  
 применения в равной степени к энантиомерам, стереоизомерам, ротамерам,  
 таутомерам, атропоизомерам и рацематам соединений по настоящему изобретению,  
 представленным в формах соли, сольвата, полиморфа и пролекарства.

Настоящее изобретение может также представлять собой соединение,  
 20 выбранное из группы, состоящей из  
 5-[(3-цианофенил)метил]-2-фтор-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-  
 карбоновой кислоты, 5-[(6-цианопиридин-2-ил)метил]-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-  
 циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 5-[(6-карбамоилпиридин-2-ил)метил]-7-  
 гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 6-({4-  
 25 карбокси-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-5-ил}метил)пиридин-2-  
 карбоновой кислоты, 5-[(3-циано-2-фторфенил)метил]-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-  
 циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 5-[(1,3-бензоксазол-6-ил)метил]-7-гексил-  
 5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 5-[(1,3-бензоксазол-  
 5-ил)метил]-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты,  
 30 5-[(6-фторпиридин-2-ил)метил]-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-  
 карбоновой кислоты, 5-[(2-фторпиридин-4-ил)метил]-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-  
 циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 7-гексил-5-{[6-(трифторметил)пиридин-2-  
 ил]метил}-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 7-гексил-  
 5-{[2-(трифторметил)пиридин-4-ил]метил}-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-

- 4-карбоновой кислоты, 5-[(5-цианопиридин-3-ил)метил]-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 5-[(5-цианотиофен-2-ил)метил]-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 5-[(4-цианотиофен-2-ил)метил]-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 5-[(5-цианофуран-2-ил)метил]-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 5-[(3,5-диметил-1,2-оксазол-4-ил)метил]-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 5-(3-цианобензоил)-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 5-[(1,3-бензоксазол-7-ил)метил]-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 5-[(5-цианотиофен-3-ил)метил]-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 7-гексил-5-[(1Н-индол-4-ил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 5-[(3-карбамоилфенил)метил]-7-пропил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 7-бутил-5-[(3-карбамоилфенил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 7-бутил-5-[(3-цианофенил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 7-бутил-5-[(пиридин-3-ил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 7-бутил-5-[(3-метилфенил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 7-бутил-5-[(3-метоксифенил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 7-бутил-5-[(3-хлорфенил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 7-бутил-5-[(3-гидроксифенил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 7-бутил-5-[(2-метоксипиридин-4-ил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 7-бутил-5-[(4-карбамоилфенил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 7-бутил-5-[(2-карбамоилфенил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 7-бутил-5-[(4-метилфенил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 7-бутил-5-[(2-цианофенил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 7-бутил-5-[(2-метилфенил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 7-бутил-5-[(2-фторфенил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 5-[(3-карбамоилфенил)метил]-7-пентил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 5-[(3-цианофенил)метил]-7-пентил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 5-[(3-карбамоилфенил)метил]-7-(2-

- фенилэтил)-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[б]индол-4-карбоновой кислоты, 5-[(3-цианофенил)метил]-7-(2-фенилэтил)-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[б]индол-4-карбоновой кислоты, 5-[(3-карбамоилфенил)метил]-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[б]индол-4-карбоновой кислоты, 5-[(3-цианофенил)метил]-7-гексил-
- 5 5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[б]индол-4-карбоновой кислоты, 5-[(3-карбамоилфенил)метил]-7-октил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[б]индол-4-карбоновой кислоты, 5-[(3-цианофенил)метил]-7-октил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[б]индол-4-карбоновой кислоты, 5-[(3-фторфенил)метил]-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[б]индол-4-карбоновой кислоты, 7-гексил-5-
- 10 [(пиридин-3-ил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[б]индол-4-карбоновой кислоты, 7-гексил-5-[(3-метилфенил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[б]индол-4-карбоновой кислоты, 7-гексил-5-[(3-метоксифенил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[б]индол-4-карбоновой кислоты, 5-[(3-хлорфенил)метил]-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[б]индол-4-карбоновой кислоты, 7-гексил-5-[(2-
- 15 метоксипиридин-4-ил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[б]индол-4-карбоновой кислоты, 5-[(3-карбоксифенил)метил]-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[б]индол-4-карбоновой кислоты, 5-[(4-карбамоилфенил)метил]-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[б]индол-4-карбоновой кислоты, 5-[(2-
- 20 карбамоилфенил)метил]-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[б]индол-4-карбоновой кислоты, 7-гексил-5-[(4-метилфенил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[б]индол-4-карбоновой кислоты, 5-[(4-цианофенил)метил]-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[б]индол-4-карбоновой кислоты, 5-[(2-
- 25 цианофенил)метил]-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[б]индол-4-карбоновой кислоты, 7-гексил-5-[(2-метилфенил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[б]индол-4-карбоновой кислоты, 5-[(2-фторфенил)метил]-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[б]индол-4-карбоновой кислоты, 5-[(4-фторфенил)метил]-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[б]индол-4-карбоновой кислоты, 9-[(3-
- 30 карбамоилфенил)метил]-2-гексил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой кислоты, 9-[(3-цианофенил)метил]-2-гексил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой кислоты, 9-[(3-карбоксифенил)метил]-2-гексил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой кислоты, 9-[(3-фторфенил)метил]-2-гексил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой кислоты, 2-гексил-9-[(пиридин-3-ил)метил]-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой кислоты, 2-гексил-9-[(3-метилфенил)метил]-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой кислоты, 2-гексил-9-[(3-

- метоксифенил)метил]-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой кислоты, 9-[(3-хлорфенил)метил]-2-гексил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой кислоты, 2-гексил-9-[(3-гидроксифенил)метил]-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой кислоты, 2-гексил-9-[(2-метоксипиридин-4-ил)метил]-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой кислоты, 9-[(3-карбоксифенил)метил]-2-гексил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой кислоты, 9-[(4-карбамоилфенил)метил]-2-гексил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой кислоты, 9-[(2-карбамоилфенил)метил]-2-гексил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой кислоты, 2-гексил-9-[(4-метилфенил)метил]-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой кислоты, 9-[(4-цианофенил)метил]-2-гексил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой кислоты, 9-[(2-цианофенил)метил]-2-гексил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой кислоты, 2-гексил-9-[(2-метилфенил)метил]-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой кислоты, 9-[(2-фторфенил)метил]-2-гексил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой кислоты, 9-[(3-карбамоилфенил)метил]-2-(2-фенилэтил)-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой кислоты, 9-[(3-цианофенил)метил]-2-(2-фенилэтил)-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой кислоты, 9-[(3-карбамоилфенил)метил]-4-(2-фенилэтил)-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой кислоты, 9-[(3-цианофенил)метил]-4-(2-фенилэтил)-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой кислоты, 9-[(3-карбамоилфенил)метил]-2-пропил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой кислоты, 9-[(3-цианофенил)метил]-2-пропил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой кислоты, 2-бутил-9-[(3-карбамоилфенил)метил]-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой кислоты, 9-[(3-карбамоилфенил)метил]-2-пентил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой кислоты, 9-[(3-цианофенил)метил]-2-пентил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой кислоты, 1-бутил-9-[(3-карбамоилфенил)метил]-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой кислоты, 9-[(3-карбамоилфенил)метил]-1-(пентилокси)-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой кислоты, 9-[(3-цианофенил)метил]-1-(пентилокси)-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой кислоты, 1-бутил-9-[(3-цианофенил)метил]-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой кислоты, 6-бутил-5-[(3-карбамоилфенил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[б]индол-4-карбоновой кислоты, 6-бутил-5-[(3-цианофенил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[б]индол-4-карбоновой кислоты, 9-[(3-карбамоилфенил)метил]-1-этил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой кислоты, 9-[(3-цианофенил)метил]-1-этил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой кислоты, 9-[(3-карбоксифенил)метил]-1-этил-2,3,4,9-

- тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой кислоты, 9-[(3-карбамоилфенил)метил]-1-пропокси-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой кислоты, 9-[(3-карбамоилфенил)метил]-4-этил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой кислоты, 4-[(3-карбамоилфенил)метил]-3-этил-1Н,2Н,3Н,4Н-циклопента[b]индол-5-карбоновой
- 5 кислоты, 4-[(3-цианофенил)метил]-3-этил-1Н,2Н,3Н,4Н-циклопента[b]индол-5-карбоновой кислоты, 3-бутил-4-[(3-карбамоилфенил)метил]-1Н,2Н,3Н,4Н-циклопента[b]индол-5-карбоновой кислоты, 3-бутил-4-[(3-цианофенил)метил]-1Н,2Н,3Н,4Н-циклопента[b]индол-5-карбоновой кислоты, 2-бутил-4-[(3-карбамоилфенил)метил]-1Н,2Н,3Н,4Н-циклопента[b]индол-5-карбоновой кислоты, 2-
- 10 бутил-4-[(3-цианофенил)метил]-1Н,2Н,3Н,4Н-циклопента[b]индол-5-карбоновой кислоты, 5-[(3-карбамоилфенил)метил]-10-этил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 5-[(3-цианофенил)метил]-10-этил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 5-[(3-карбамоилфенил)метил]-10-пропил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-
- 15 карбоновой кислоты, 5-[(3-цианофенил)метил]-10-пропил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 9-[(3-карбоксифенил)метил]-4-этил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой кислоты, 9-[(3-карбамоилфенил)метил]-3-этил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой кислоты, 10-бутил-5-[(3-карбамоилфенил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой
- 20 кислоты, 10-бутил-5-[(3-цианофенил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 5-[(3-карбамоилфенил)метил]-10-пентил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 5-[(3-цианофенил)метил]-10-пентил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 4-[(3-карбамоилфенил)метил]-2-пентил-1Н,2Н,3Н,4Н-циклопента[b]индол-5-
- 25 карбоновой кислоты, 4-[(3-цианофенил)метил]-2-пентил-1Н,2Н,3Н,4Н-циклопента[b]индол-5-карбоновой кислоты, 9-[(3-карбамоилфенил)метил]-2-этил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой кислоты, 9-[(3-карбоксифенил)метил]-2-этил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой кислоты, 5-[(3-карбамоилфенил)метил]-7-этил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-
- 30 карбоновой кислоты, 5-[(3-цианофенил)метил]-7-этил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 9-[(3-цианофенил)метил]-3-этил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой кислоты, 9-[(3-карбамоилфенил)метил]-4-пропил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой кислоты, 9-[(3-карбамоилфенил)метил]-3-пропил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой

кислоты, 9-[(3-цианофенил)метил]-3-пропил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой кислоты, 4-бутил-9-[(3-карбамоилфенил)метил]-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой кислоты, 4-бутил-9-[(3-цианофенил)метил]-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой кислоты, 3-бутил-9-[(3-карбамоилфенил)метил]-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой кислоты, 3-бутил-9-[(3-цианофенил)метил]-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой кислоты, 9-[(3-карбамоилфенил)метил]-4-пентил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой кислоты, 9-[(3-цианофенил)метил]-4-пентил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой кислоты, 9-[(3-карбамоилфенил)метил]-3-пентил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой кислоты, 9-[(3-цианофенил)метил]-3-пентил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой кислоты, 4-[(3-карбамоилфенил)метил]-3-пропил-1Н,2Н,3Н,4Н-циклопента[b]индол-5-карбоновой кислоты, 4-[(3-цианофенил)метил]-3-пропил-1Н,2Н,3Н,4Н-циклопента[b]индол-5-карбоновой кислоты, 2-(7-бутил-5-[(3-карбамоилфенил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-ил}формамидо)уксусной кислоты, 2-(7-бутил-5-[(3-цианофенил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-ил}формамидо)уксусной кислоты, 7-бутил-5-[(3-карбамоилфенил)метил]-N-(2-гидроксиэтил)-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоксамида, 7-бутил-5-[(3-цианофенил)метил]-N-(2-гидроксиэтил)-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоксамида, 7-бутил-5-[(3-фторфенил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты и 7-бутил-5-[(3-карбоксифенил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты или их фармацевтически приемлемых солей или стереоизомеров.

Еще один вариант осуществления представляет собой способ введения соединения по настоящему изобретению субъекту (например, человеку), нуждающемуся в этом, посредством введения субъекту фармацевтического состава по настоящему изобретению.

Еще один вариант осуществления представляет собой способ получения фармацевтического состава по настоящему изобретению посредством смешивания по меньшей мере одного фармацевтически приемлемого соединения и необязательно одной или нескольких фармацевтически приемлемых добавок или вспомогательных веществ.

Для получения фармацевтических композиций из соединений, описанных в данном изобретении, инертные, фармацевтически приемлемые носители могут быть

либо твердыми, либо жидкими. Препараты в твердой форме включают порошки, таблетки, диспергируемые гранулы, капсулы, крахмальные капсулы и суппозитории. Порошки и таблетки могут состоять из активного ингредиента на от приблизительно 5 до приблизительно 95 процентов. Подходящие твердые носители известны в уровне техники, например, карбонат магния, стеарат магния, тальк, сахар или лактоза. Таблетки, порошки, крахмальные капсулы и капсулы могут использоваться в качестве твердых лекарственных форм, подходящих для перорального введения. Примеры фармацевтически приемлемых носителей и способов изготовления различных композиций можно найти в A. Gennaro (ed.), Remington's Pharmaceutical Sciences, 18th Edition, (1990), Mack Publishing Co., Easton, Pa.

Композиции и составы по настоящему изобретению можно вводить в виде стерильных композиций и стерильных составов. Стерильные фармацевтические составы составляют или изготавливают в соответствии с фармацевтическими стандартами стерилизации (например, статьи 797, 1072 и 1211 Фармакопеи Соединенных Штатов Америки; раздел 4127.7 Делового и профессионального кодекса штата Калифорния; раздел 16, параграф 1751 Административного кодекса штата Калифорния, раздел 21 Свода федеральных нормативных актов, 21, или бывшие аналоги таких нормативных актов в США), известными специалистам в данной области техники.

Препараты в жидкой форме включают растворы, суспензии и эмульсии. В качестве примера могут быть упомянуты водные или водно-пропиленгликолевые растворы для парентерального введения или добавление подсластителей и замутнителей для пероральных растворов, суспензий и эмульсий. Препараты в жидкой форме могут также включать растворы для интраназального введения.

Аэрозольные препараты, подходящие для ингаляции, могут включать растворы и твердые вещества в форме порошка, которые могут быть представлены в комбинации с фармацевтически приемлемым носителем, таким как инертный сжатый газ, например азот.

Также включены препараты в твердой форме, которые предназначены для преобразования незадолго до применения в препараты в жидкой форме для либо перорального, либо парентерального введения. Такие жидкие формы включают растворы, суспензии и эмульсии.

Соединения по настоящему изобретению также могут быть доставлены трансдермально. Трансдермальные композиции могут быть представлены в форме

кремов, лосьонов, аэрозолей и/или эмульсий и могут быть включены в трансдермальные пластыри матричного или резервуарного типа, как это принято применительно к данной цели в уровне техники.

Соединения согласно данному изобретению можно также доставлять подкожно.

5 Соединение можно вводить перорально или внутривенно.

Фармацевтический препарат может быть представлен в стандартной лекарственной форме. В такой форме препарат дополнительно разделен на стандартные дозы подходящего размера, содержащие требуемые количества активного компонента, например, эффективное количество для достижения требуемой цели.

10 Количество активного соединения в стандартной дозе препарата может варьироваться или регулироваться в диапазоне от приблизительно 1 мг до приблизительно 1000 мг, например от приблизительно 1 мг до приблизительно 500 мг, в частности от приблизительно 1 мг до приблизительно 250 мг или от приблизительно 1 мг до приблизительно 25 мг, в зависимости от конкретной области применения.

15 Фактическая используемая доза может варьироваться в зависимости от требований для пациента и тяжести состояния, подлежащего лечению. Определение надлежащего режима введения дозы для конкретной ситуации находится в пределах компетенции специалиста в данной области техники. Для удобства общую суточную дозу можно разделять и вводить частями в течение дня в соответствии с требованиями.

20 Количество и частота введения соединений по настоящему изобретению и/или их фармацевтически приемлемых солей будут регулироваться в соответствии с решением лечащего врача с учетом таких факторов, как возраст, состояние и размер тела пациента, а также тяжести симптомов подлежащих лечению. Типичный рекомендуемый суточный режим введения дозы в случае перорального введения  
25 может предусматривать количество, находящееся в диапазоне от приблизительно 1 мг/день до приблизительно 500 мг/день, предпочтительно от 1 мг/день до 200 мг/день, вводимое в виде дробных доз, количество которых составляет от двух до четырех.

### Схемы и примеры

30 Иллюстративные неограничивающие химические соединения и способы, применимые при получении соединений по настоящему изобретению, будут описаны далее со ссылкой на иллюстративные схемы синтеза для их общего получения, как описано ниже, и конкретные примеры, которые указаны далее. Специалистам в данной области техники будет очевидно, что для синтеза соединений в соответствии с

настоящим изобретением можно использовать другие пути синтеза. Несмотря на то, что в данном документе изображены и рассмотрены конкретные исходные материалы и реагенты, их можно легко заменить на другие исходные материалы и реагенты для обеспечения ряда различных производных и/или условий реакций. В дополнение, множество иллюстративных соединений, полученных посредством описанных способов, можно дополнительно модифицировать в свете данного раскрытия с применением стандартных химических реакций, широко известных специалистам в данной области техники.

Специалистам в данной области техники будет понятно, что для получения различных соединений, предусматриваемых в данном документе, исходные материалы можно соответствующим образом выбирать таким образом, чтобы необходимые в итоге заместители переносились через реакционную схему с использованием для них защитных групп или без их использования, при необходимости, с получением необходимого продукта. В качестве альтернативы вместо конечного требуемого заместителя может оказаться необходимым или потребоваться использовать подходящую группу, которую можно перенести по реакционной схеме и заменить, при необходимости, требуемым заместителем. Каждую из реакций, изображенных на схемах реакций, предпочтительно проводят при температуре от приблизительно 0°C до температуры образования флегмы используемого растворителя. Если не указано иное, переменные, показанные на схемах ниже, определены выше со ссылкой на формулу (I).

Соединения в соответствии с настоящим изобретением можно синтезировать посредством синтетических путей, которые включают процедуры, аналогичные тем, которые хорошо известны в областях техники, связанных химией, в частности в свете описания, содержащегося в данном документе, а также тем, которые используются в случае других гетероциклов, описанных в Comprehensive Heterocyclic Chemistry II, Editors Katritzky and Rees, Elsevier, 1997, e.g. Volume 3; Liebigs Annalen der Chemie, (9):1910-16, (1985); Helvetica Chimica Acta, 41:1052-60, (1958); Arzneimittel-Forschung, 40(12):1328-31, (1990), каждый из которых конкретно включен посредством ссылки. Исходные материалы, как правило, доступны из коммерческих источников, таких как Sigma-Aldrich Chemicals (Милуоки, Висконсин), или могут быть легко получены с использованием способов, хорошо известных специалистам в данной области техники (например, получены способами, в целом описанными в Louis F. Fieser and Mary Fieser, Reagents for Organic Synthesis, v. 1-23, Wiley, N.Y. (1967-2006 ed.) или Beilsteins

Handbuch der organischen Chemie, 4, Aufl. ed. Spkolycoer-Verlag, Berlin, включая вспомогательные средства (также доступны через онлайн-базу данных Beilstein).

Синтетические химические превращения и методологии использования защитных групп (введение защитной группы и удаление защитной группы),

- 5 применимые при синтезе соединений в соответствии с настоящим изобретением, и необходимые реагенты и промежуточные соединения известны в уровне техники и включают, например, описанные в R. Larock, Comprehensive Organic Transformations, VCH Publishers (1989); T. W. Greene and P. G. M. Wuts, Protective Groups in Organic Synthesis, 3rd Ed., John Wiley and Sons (1999); и L. Paquette, ed., Encyclopedia of
- 10 Reagents for Organic Synthesis, John Wiley and Sons (1995), а также в их последующих изданиях. Необходимость в такой защите будет варьироваться в зависимости от характера отдаленной функциональности и условий способов получения. Подходящие amino-защитные группы включают ацетил, трифторацетил, трет-бутоксикарбонил (BOC), бензилоксикарбонил (CBz) и 9-флуоренилметиленоксикарбонил (Fmoc).
- 15 Необходимость такой защиты легко определяется специалистом в данной области техники.

- Дополнительные конкретно применимые реакции при получении соединений по настоящему изобретению включают реакции алкилирования, восстановительного аминирования, окисления, восстановления и гидролиза. Такие превращения вполне
- 20 находятся в пределах компетенции специалиста в данной области техники.

- Соединения в соответствии с настоящим изобретением можно получать по отдельности или в виде библиотек соединений, содержащих, например, по меньшей мере два, или от 5 до 1000 соединений, или от 10 до 100 соединений. Библиотеки соединений формулы I, II или III можно получать комбинаторным подходом
- 25 “разделение и смешивание” или посредством нескольких параллельных реакций синтеза с применением либо жидкофазной, либо твердофазной химии посредством процедур, известных специалистам в данной области техники. Таким образом, в соответствии с дополнительным аспектом настоящего изобретения представлена библиотека соединений, содержащая по меньшей мере два соединения формулы I, II
- 30 или III или их фармацевтически приемлемые соли.

В способах получения соединений в соответствии с настоящим изобретением может быть преимущественным отделять продукты реакции друг от друга и/или от исходных материалов. Необходимые продукты каждой стадии или серий стадий отделяют и/или очищают до требуемой степени гомогенности посредством методик

общепринятых в уровне техники. Как правило, такие процедуры разделения предусматривают многофазную экстракцию, кристаллизацию из растворителя или смеси растворителей, дистилляцию, сублимацию или хроматографию. Хроматография может предусматривать любое количество способов, включая, например, способы

5 обращенно-фазовой и нормально-фазовой; эксклюзионной; ионообменной; жидкостной хроматографии высокого, среднего и низкого давления и прибор для их осуществления; мелкомасштабную аналитическую; предусматривающую псевдодвижущийся слой (SMB) и препаративную тонко- и толстослойную хроматографию, а также методики мелкомасштабной тонкослойной и флэш-

10 хроматографии.

Другой класс способов разделения предусматривает обработку смеси реагентом, выбранным для обеспечения связывания необходимого продукта, непрореагировавшего исходного материала, побочного продукта реакции или т. п. или придания им способности быть разделенными иным образом. Такие средства

15 включают адсорбенты или абсорбенты, такие как активированный уголь, молекулярные сита, ионообменные среды или т. п. В качестве альтернативы, средства могут являться кислотами в случае основного материала, основаниями в случае кислого материала, связывающими реактивами, такими как антитела, связывающие белки, селективными хелаторами, такими как краун-эфиры, реактивами для

20 жидкостно-жидкостной ионной экстракции (LIX) или т. п. Выбор подходящих способов разделения зависит от свойств рассматриваемых материалов, как например точка кипения и молекулярная масса при дистилляции и сублимации, наличие или отсутствие полярных функциональных групп при хроматографии, стабильность материалов в кислых и щелочных средах при многофазной экстракции и т. п.

Отдельный стереоизомер, например энантиомер, по сути не содержащий своего стереоизомера, можно получать посредством разделения рацемической смеси с применением способа, такого как образование диастереомеров с применением оптически активных разделяющих средств (Eliel, E. and Wilen, S. "Stereochemistry of Organic Compounds," John Wiley & Sons, Inc., New York, 1994; Lochmuller, C. H., (1975)

30 J. Chromatogr., 113(3):283-302). Рацемические смеси хиральных соединений по настоящему изобретению можно разделять и выделять любым подходящим способом, включая (1) образование ионных диастереомерных солей с хиральными соединениями и разделение посредством фракционной кристаллизации или других способов, (2) образование диастереомерных соединений с хиральными дериватизирующими

реагентами, разделение диастереомеров и превращение в чистые стереоизомеры и (3) разделение по сути чистых или обогащенных стереоизомеров непосредственно в хиральных условиях. См. "Drug Stereochemistry, Analytical Methods and Pharmacology," Irving W. Wainer, Ed., Marcel Dekker, Inc., New York (1993).

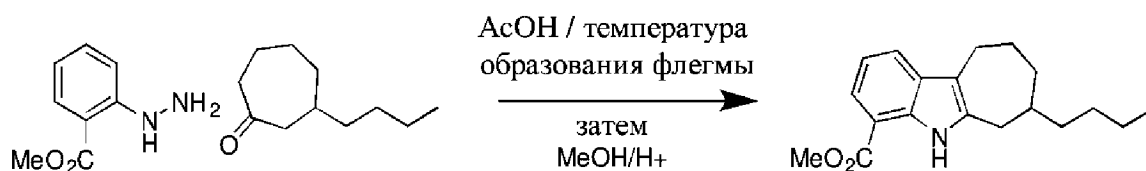
- 5 Согласно способу (1) диастереомерные соли могут быть образованы посредством реакции энантиомерно чистых хиральных оснований, таких как бруцин, хинин, эфедрин, стрихнин,  $\alpha$ -метил- $\beta$ -фенилэтиламин (амфетамин) и т. п., с асимметрическими соединениями, несущими кислотную функциональную группу, такими как карбоновая кислота и сульфоновая кислота. Разделение диастереомерных
- 10 солей можно индуцировать путем фракционной кристаллизации или ионной хроматографии. Для разделения оптических изомеров аминосоединений добавление хиральных карбоновых или сульфоновых кислот, таких как камфорсульфоновая кислота, винная кислота, миндальная кислота или молочная кислота, может приводить к образованию диастереомерных солей.
- 15 В качестве альтернативы, согласно способу (2) субстрат, подлежащий разделению, вводят в реакцию с одним энантиомером хирального соединения с образованием диастереомерной пары (E. and Wilen, S. "Stereochemistry of Organic Compounds", John Wiley & Sons, Inc., 1994, p. 322). Диастереомерные соединения могут быть образованы посредством введения в реакцию асимметричных соединений с
- 20 энантиомерно чистыми хиральными дериватизирующими реагентами, такими как ментильные производные, с последующим разделением диастереомеров и гидролизом с получением чистого или обогащенного энантиомера. Способ определения оптической чистоты предусматривает получение хиральных сложных эфиров, таких как сложный ментильный эфир, например (-)-ментилхлорформиат, в присутствии
- 25 основания, или сложный эфир Мошера,  $\alpha$ -метокси- $\alpha$ -(трифторметил)фенилацетат, рацемической смеси и анализа  $^1\text{H}$  ЯМР-спектра на присутствие двух атропоизомерных энантиомеров или диастереомеров (Jacob III. J. Org. Chem. (1982) 47:4165). Стабильные диастереомеры атропоизомерных соединений можно разделять и выделять посредством нормально- и обращенно-фазовой хроматографии, следуя способам
- 30 разделения атропоизомерных нафтилизохинолинов (WO 96/15111). Согласно способу (3) рацемическую смесь двух энантиомеров можно разделять посредством хроматографии с применением хиральной неподвижной фазы ("Chiral Liquid Chromatography" (1989) W. J. Lough, Ed., Chapman and Hall, New York; Okamoto, J. Chromatogr., (1990) 513:375-378). Обогащенные или очищенные энантиомеры можно

различать посредством способов, применяемых для различения других хиральных молекул с асимметричными атомами углерода, как например вращение плоскости поляризации света и круговой дихроизм.

## 5 ПОДРОБНОЕ ОПИСАНИЕ ЭКСПЕРИМЕНТОВ

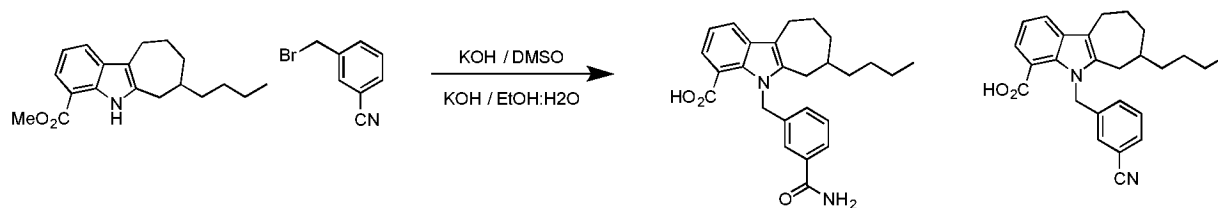
Способ синтеза А Посредством синтеза индола по Фишеру с применением бета-замещенного циклического кетона и 2-карбоксилатфенилгидразина с последующей эстерификацией получали индольное промежуточное соединение. Посредством алкилирования атома азота индола требуемым алкилбромидом с последующим гидролизом обеспечивали образование необходимого продукта после очистки.

Иллюстративный пример: 7-бутил-5-[(3-карбамоилфенил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[б]индол-4-карбоновая кислота



**Стадия 1.1.** Гидразин (1,12 г) и кетон (3 г) смешивали в AcOH и перемешивали при 130°C, затем через 3 ч отгоняли AcOH. Затем реакционную смесь нейтрализовали насыщенным раствором бикарбоната натрия и экстрагировали с помощью EtOAc (300 мл x 3), полученное высушивали и концентрировали посредством ротационного выпаривания. Очистка посредством колоночной хроматографии (30% EtOAc:птр. эфир) обеспечивала получение 1 г требуемого индольного продукта.

**Стадия 1.2.** 1 г индола растворяли в 15 мл MeOH. Добавляли 1 мл H<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> и нагревали при 80°C. Через 16 ч из реакционной смеси отгоняли MeOH, ее нейтрализовали насыщенным раствором бикарбоната натрия и экстрагировали с помощью EtOAc (300 мл x 3), полученное высушивали и концентрировали посредством ротационного выпаривания. Очистка посредством колоночной хроматографии (20% EtOAc:птр. эфир) обеспечивала получение 900 мг требуемого индольного сложноэфирного продукта



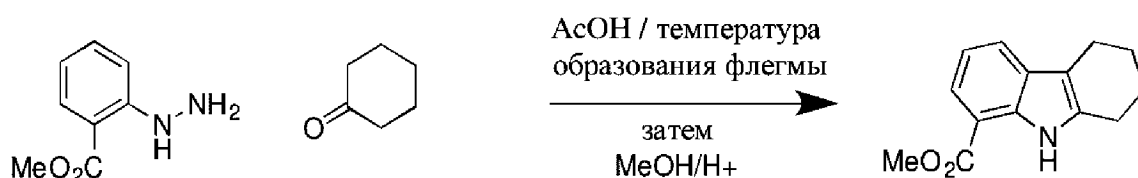
**Стадия 2.1.** Индольный сложный эфир (900 мг) и 3-цианобензилбромид (1,18 г)

растворяли в DMSO (10 мл), а затем добавляли KOH (842 мг) при комнатной температуре и перемешивали. Через 2 ч реакционную смесь разбавляли водой и экстрагировали с помощью EtOAc (300 мл x 3), полученное высушивали и концентрировали посредством ротационного выпаривания. Очистка посредством колоночной хроматографии (15% EtOAc:петр. эфир) обеспечивала получение 700 мг требуемого индольного сложноэфирного продукта

- 10 **Стадия 2.2.** Бензилиндол растворяли в смеси EtOH:H<sub>2</sub>O (30:6 мл), а затем добавляли KOH (473 мг) при комнатной температуре и нагревали до 70°C. Через 15 мин реакционную смесь охлаждали до к. т., нейтрализовали с помощью 1 н. раствора HCl и экстрагировали с помощью EtOAc (300 мл x 3). Затем собранный органический экстракт высушивали и концентрировали посредством ротационного выпаривания.
- 15 Очистка посредством MS-контролируемой очистки обеспечивала получение 110 мг 7-бутил-5-[(3-цианопенил)метил]-5H,6H,7H,8H,9H,10H-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты и 105 мг 7-бутил-5-[(3-карбамоилфенил)метил]-5H,6H,7H,8H,9H,10H-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты.

- 20 Способ синтеза В Посредством синтеза индола по Фишеру с применением незамещенного циклического кетона и 2-карбоксилатфенилгидразина с последующей эстерификацией получали индольное промежуточное соединение. Посредством протокола TFAA-DMSO-алкилирования (Masanori Tayu *et al.*, *Org. Biomol. Chem.* (2013) **11** 496) с участием требуемого нуклеофила с последующим гидролизом
- 25 сложного эфира обеспечивали получение необходимого продукта после очистки.

Иллюстративный пример: 9-[(3-карбамоилфенил)метил]-2-пентил-2,3,4,9-тетрагидро-1H-карбазол-8-карбоновая кислота

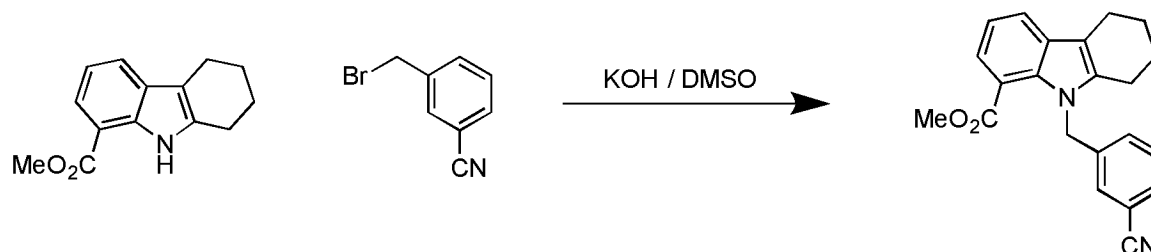


**Стадия 1.1.** Гидразин (6,0 г) и кетон (6,2 г) смешивали в AcOH (100 мл) и перемешивали при 130°C, затем через 3 ч отгоняли AcOH. Затем реакционную смесь нейтрализовали насыщенным раствором бикарбоната натрия и экстрагировали с

5 помощью EtOAc (300 мл x 3), полученное высушивали и концентрировали посредством ротационного выпаривания. Очистка посредством колоночной хроматографии (30% EtOAc:пстр. эфир) обеспечивала получение 5 г требуемого индольного продукта.

10 **Стадия 1.2.** 5 г индола растворяли в 100 мл MeOH. Добавляли 7 мл концентрированной H<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> и нагревали при 80°C. Через 16 часов из реакционной смеси отгоняли MeOH, ее нейтрализовали насыщенным раствором бикарбоната натрия и экстрагировали с помощью EtOAc (300 мл x 3), полученное высушивали и концентрировали посредством ротационного выпаривания. Очистка посредством

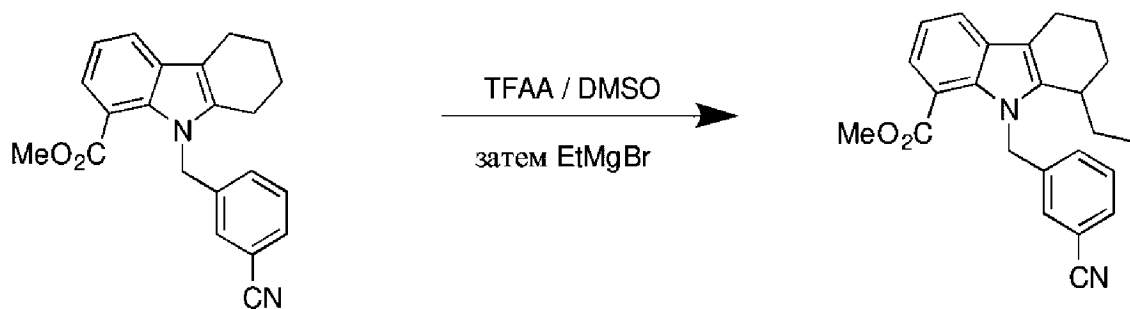
15 колоночной хроматографии (20% EtOAc:пстр. эфир) обеспечивала получение 4,2 г требуемого индольного сложноэфирного продукта.



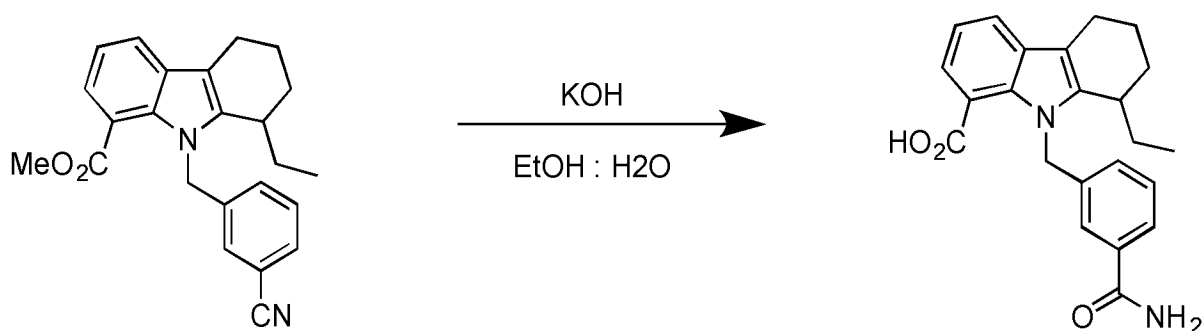
**Стадия 2.** Индольный сложный эфир (3 г) растворяли в DMSO (50 мл), а затем добавляли KOH (3,675 г) при комнатной температуре. Затем частями добавляли 3-

20 цианобензилбромид (5,13 г) и перемешивали. Через 2 ч реакционную смесь медленно выливали в 1 н. HCl в колбе на ледяной бане, а затем органические слои экстрагировали с помощью EtOAc (300 мл x 3), полученное высушивали и концентрировали посредством ротационного выпаривания. Очистка посредством колоночной хроматографии (20% EtOAc:пстр. эфир) обеспечивала получение 3,5 г

25 требуемого индольного сложноэфирного продукта.



**Стадия 3.** В раствор индольного сложного эфира (500 мг) в дихлорметане (7 мл) при -40°C добавляли DMSO (0,315 мл). В данную смесь добавляли по каплям трифторуксусный ангидрид (0,617 мл) и перемешивали при -40°C. Через 1 ч в данную смесь по каплям добавляли бромид этилмагния (17,647 мл, 1 М). Через 2 ч реакционную смесь медленно выливали в раствор, содержащий 10 мл насыщенного раствора  $\text{NaHCO}_3$  + 20 мл  $\text{H}_2\text{O}$  + 30 мл  $\text{EtOAc}$ . Органический слой отделяли и высушивали и полученное концентрировали под вакуумом. Очистка посредством колоночной хроматографии (20%  $\text{EtOAc}$ :петр. эфир) обеспечивала получение 300 мг



**Стадия 4.** Бензилиндол (150 мг) растворяли в смеси  $\text{EtOH}:\text{H}_2\text{O}$  (5:2 мл), а затем добавляли  $\text{KOH}$  (156 мг) при комнатной температуре и перемешивали. Через 16 ч реакционную смесь нейтрализовали 1 н. раствором  $\text{HCl}$  и твердое вещество фильтровали с получением продукта в виде 9-[(3-карбамоилфенил)метил]-2-пентил-2,3,4,9-тетрагидро-1H-карбазол-8-карбоновой кислоты (30 мг).

Технические результаты вышеуказанного отражены в таблице 1, приведенной ниже.

| Название<br>согласно<br>IUPAC                                                                                                         | <sup>1</sup> H ЯМР                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                               | Точная<br>масса<br>(г) | Наблюдае<br>мое<br>[M+H]/Z                             | Способ синтеза                                                                                                                                                                                                     |
|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|------------------------|--------------------------------------------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 5-[(3-<br>цианофенил)м<br>етил]-2-фтор-<br>7-гексил-<br>5Н,6Н,7Н,8Н,<br>9Н,10Н-<br>циклогепта[b]<br>индол-4-<br>карбоновая<br>кислота | <sup>1</sup> H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d <sub>6</sub> ): _<br>13,1 (brs, 1H), 7,68-7,66 (m, 1H),<br>7,52-7,49 (m, 1H), 7,45 (t, J = 7,6 Гц,<br>1H), 7,30 (s, 1H), 7,18-7,15 (m, 1H),<br>6,97 (d, J = 8,0 Гц, 1H), 5,79-5,74 (m,<br>1H), 5,61-5,56 (m, 1H), 2,90-2,80 (m,<br>2H), 2,51-2,50 (m, 2H), 1,91-1,84 (m,<br>2H), 1,54-1,49 (m, 2H), 1,36 (brs, 1H),<br>1,23-0,91 (m, 10H), 0,83 (t, J = 7,2 Гц,<br>3H),                                      | 446,24                 | MS (ESI)<br>масса/заряд<br>: 446<br>[M+H] <sup>+</sup> | Соединение<br>синтезировали<br>посредством<br>способа А с<br>применением 3-<br>гексил-1-<br>циклогептанона и<br>2-циано-1-<br>бензилбромиды в<br>качестве<br>соответствующих<br>структурных<br>элементов           |
| 5-[(6-<br>цианопиридин<br>-2-ил)метил]-<br>7-гексил-<br>5Н,6Н,7Н,8Н,<br>9Н,10Н-<br>циклогепта[b]<br>индол-4-<br>карбоновая<br>кислота | <sup>1</sup> H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d <sub>6</sub> ): _<br>12,8 (s, 1H), 7,94-7,88 (m, 2H), 7,69<br>(d, J = 8,00 Гц, 1H), 7,43 (d, J = 3,27<br>Гц, 1H), 7,07 (t, J = 7,60 Гц, 1H),<br>6,81-6,79 (m, 1H), 5,85 (d, J = 18,00<br>Гц, 1H), 5,63 (d, J = 18,40 Гц, 1H),<br>2,94-2,89 (m, 1H), 2,87-2,67 (m, 2H),<br>1,93-1,87 (m, 2H), 1,53-1,50 (m, 2H),<br>1,41-1,24 (m, 1H), 1,19-1,09 (m, 9H),<br>1,01-0,99 (m, 2H), 0,831 (t, J = 7,2<br>Гц, 3H), | 429,24                 | MS (ESI)<br>масса/заряд<br>: 430<br>(M+H) <sup>+</sup> | Соединение<br>синтезировали<br>посредством<br>способа А с<br>применением 3-<br>гексил-1-<br>циклогептанона и<br>2-(бромметил)-6-<br>изоцианопиридин<br>а в качестве<br>соответствующих<br>структурных<br>элементов |

|                                                                                                        |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                        |        |                                                     |                                                                                                                                                                   |
|--------------------------------------------------------------------------------------------------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------|-----------------------------------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 5-[(6-карбамоилпиридин-2-ил)метил]-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновая кислота | <sup>1</sup> H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d <sub>6</sub> ): _<br>12,5 (s, 1H), 7,83 (d, J = 4,40 Гц, 2H), 7,69-7,62 (m, 3H), 7,43 (d, J = 0,80 Гц, 1H), 7,06 (t, J = 7,60 Гц, 1H), 6,84 (t, J = 4,40 Гц, 1H), 5,90 (d, J = 17,60 Гц, 1H), 5,68 (d, J = 17,60 Гц, 1H), 2,92-2,86 (m, 2H), 2,71-2,65 (m, 1H), 1,92-1,84 (m, 2H), 1,55-1,49 (m, 2H), 1,24-0,94 (m, 12H), 0,81 (t, J = 7,20 Гц, 3H)                                | 447,25 | MS (ESI)<br>масса/заряд : 448<br>(M+H) <sup>+</sup> | Соединение синтезировали посредством способа А с применением 3-гексил-1-циклогептанона и 2-циано-1-бензилбромиды в качестве соответствующих структурных элементов |
| 6-({4-карбокси-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-5-ил}метил)пиридин-2-карбоновая кислота  | <sup>1</sup> H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d <sub>6</sub> ): _<br>7,67-7,27 (m, 2H), 7,41 (d, J = 7,60 Гц, 1H), 7,15 (d, J = 7,20 Гц, 1H), 6,93 (t, J = 7,60 Гц, 2H), 5,81 (d, J = 16,00 Гц, 1H), 5,64 (d, J = 16,40 Гц, 1H), 2,89 (d, J = 42,40 Гц, 1H), 2,82-2,67 (m, 1H), 2,65-2,56 (m, 2H), 1,91 (t, J = 4,40 Гц, 1H), 1,81 (d, J = 8,80 Гц, 1H), 1,52 (t, J = 7,60 Гц, 3H), 1,23-1,15 (m, 10H), 0,84 (t, J = 6,80 Гц, 3H), | 448,24 | MS (ESI)<br>масса/заряд : 447 (M-H) <sup>-</sup>    | Соединение синтезировали посредством способа А с применением 3-гексил-1-циклогептанона и 2-циано-1-бензилбромиды в качестве соответствующих структурных элементов |
| 5-[(3-циано-2-фторфенил)метил]-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновая кислота     | <sup>1</sup> H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d <sub>6</sub> ): _<br>12,86 (s, 1H), 7,79-7,76 (m, 1H), 7,69 (d, J = 7,60 Гц, 1H), 7,41 (d, J = 7,20 Гц, 1H), 7,23-7,19 (m, 1H), 7,08-7,04 (m, 1H), 6,53-6,50 (m, 1H), 5,86-5,65 (m, 2H), 2,94-2,89 (m, 1H), 2,81-2,72 (m, 1H), 2,72-2,67 (m, 1H), 1,93-1,87 (m, 2H), 1,55-1,43 (m, 4H), 1,15-1,00 (m, 10H), 0,82 (t, J = 7,20 Гц, 3H),                                             | 446,24 | MS (ESI)<br>масса/заряд : 447<br>[M+H] <sup>+</sup> | Соединение синтезировали посредством способа А с применением 3-гексил-1-циклогептанона и 1-циано-2-фтор-3-бензилбромиды в качестве                                |

|                                                                                                     |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                              |        |                                                          |                                                                                                                                                                         |
|-----------------------------------------------------------------------------------------------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------|----------------------------------------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
|                                                                                                     |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                              |        |                                                          | соответствующих<br>структурных<br>элементов                                                                                                                             |
| 5-[(1,3-бензоксазол-6-ил)метил]-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновая кислота | <sup>1</sup> H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d <sub>6</sub> ): _ 12,90 (s, 1H), 8,66 (s, 1H), 7,64-7,70 (m, 2H), 7,38-7,40 (m, 1H), 7,04-7,08 (m, 2H), 6,79-6,82 (m, 1H), 5,90 (d, J = 18,00 Гц, 1H), 5,71 (d, J = 17,60 Гц, 1H), 2,84-2,93 (m, 2H), 2,67-2,73 (m, 1H), 1,85-1,91 (m, 2H), 1,37-1,56 (m, 3H), 1,06-1,10 (m, 5H), 0,75-0,96 (m, 9H),                                     | 444,24 | MS (ESI)<br>масса/заряд<br>: 444,9<br>[M+H] <sup>+</sup> | Соединение синтезировали посредством способа А с применением 3-гексил-1-циклогептанона и 6-(бромметил)бензо[d]оксазола в качестве соответствующих структурных элементов |
| 5-[(1,3-бензоксазол-5-ил)метил]-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновая кислота | <sup>1</sup> H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d <sub>6</sub> ): _ 12,90 (s, 1H), 8,68 (s, 1H), 7,60-7,69 (m, 2H), 7,38 (d, J = 6,80 Гц, 1H), 7,01-7,07 (m, 2H), 6,87-6,89 (m, 1H), 5,89 (d, J = 17,20 Гц, 1H), 5,70 (d, J = 17,60 Гц, 1H), 2,85-2,89 (m, 2H), 2,67-2,68 (m, 1H), 1,88-1,91 (m, 2H), 1,49-1,54 (m, 2H), 1,24-1,45 (m, 2H), 0,95-1,10 (m, 13H), 0,77 (t, J = 7,60 Гц, 3H); | 444,24 | MS (ESI)<br>масса/заряд<br>: 445<br>[M+H] <sup>+</sup>   | Соединение синтезировали посредством способа А с применением 3-гексил-1-циклогептанона и 5-(бромметил)бензо[d]оксазола в качестве соответствующих структурных элементов |

|                                                                                                   |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                |        |                                                  |                                                                                                                                                                          |
|---------------------------------------------------------------------------------------------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------|--------------------------------------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 5-[(6-фторпиридин-2-ил)метил]-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновая кислота | <sup>1</sup> H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d <sub>6</sub> ): _<br>12,86 (s, 1H), 7,85-7,78 (m, 1H), 7,68 (d, J = 7,2 Гц, 1H), 7,41 (d, J = 7,20 Гц, 1H), 7,08-7,04 (m, 1H), 6,98 (d, J = 7,60 Гц, 1H), 6,35 (d, J = 6,80 Гц, 1H), 5,81-5,76 (m, 1H), 5,58-5,53 (m, 1H), 2,94-2,89 (m, 1H), 2,82-2,78 (m, 1H), 2,72-2,66 (m, 2H), 1,93-1,87 (m, 2H), 1,57-1,45 (m, 3H), 1,19-0,98 (m, 1H), 0,82 (t, J = 6,80 Гц, 3H)     | 422,24 | масса/заряд : 423 [M+H] <sup>+</sup>             | Соединение синтезировали посредством способа А с применением 3-гексил-1-циклогептанона и 6-фтор-пиридин-2-бензилбромиды в качестве соответствующих структурных элементов |
| 5-[(2-фторпиридин-4-ил)метил]-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновая кислота | <sup>1</sup> H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d <sub>6</sub> ): _1<br>2,8 (s, 1H), 7,83 (d, J = 4,40 Гц, 1H), 8,09 (d, J = 5,20 Гц, 1H), 7,44 (d, J = 6,40 Гц, 1H), 7,08 (t, J = 7,60 Гц, 1H), 7,08 (d, J = 7,60 Гц, 1H), 6,52 (s, 1H), 5,83 (d, J = 18,80 Гц, 1H), 5,65 (d, J = 18,40 Гц, 1H), 2,90-2,88 (m, 1H), 2,76-2,66 (m, 2H), 1,93-1,86 (m, 2H), 1,57-1,178 (m, 3H), 1,20-1,03 (m, 1H), 0,83(t, , J = 7,2 Гц, 3H); | 422,24 | MS (ESI)<br>масса/заряд : 421 [M-H] <sup>-</sup> | Соединение синтезировали посредством способа А с применением 3-гексил-1-циклогептанона и 6-фтор-пиридин-4-бензилбромиды в качестве соответствующих структурных элементов |
| 7-гексил-5-{[6-(трифторметил)пиридин-2-ил]метил}-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-         | <sup>1</sup> H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d <sub>6</sub> ): _<br>12,92 (brs, 1H), 7,94 (t, J = 8,0 Гц, 1H), 7,75-7,69 (m, 2H), 7,45 (dd, J = 1,2, 7,2 Гц, 1H), 7,08 (t, J = 7,6 Гц, 1H), 6,72 (d, J = 8,0 Гц, 1H), 5,89-5,85 (m, 1H), 5,67-5,62 (m, 1H), 2,96-2,91 (m, 1H), 2,76-2,64 (m, 1H), 2,50-2,49 (m, 1H), 1,92-1,89 (m, 2H), 1,55-1,48 (m, 2H), 1,38 (brs, 1H), 1,16-                                          | 472,23 | MS (ESI)<br>масса/заряд : 473[M+H] <sup>+</sup>  | Соединение синтезировали посредством способа А с применением 3-гексил-1-циклогептанона и 2-(бромметил)-6-(трифторметил)пиридина в качестве                               |

|                                                                                                             |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                |        |                                                       |                                                                                                                                                                                 |
|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------|-------------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| карбоновая кислота                                                                                          | 1,00 (m, 9H), 0,93-0,89 (m, 2H), 0,80 (t, J = 7,2 Гц, 3H),                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                     |        |                                                       | соответствующих структурных элементов                                                                                                                                           |
| 7-гексил-5-{[2-(трифторметил)пиридин-4-ил]метил}-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновая кислота | <sup>1</sup> H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d <sub>6</sub> ):<br>_12,89 (brs, 1H), 8,62 (d, J = 4,8 Гц, 1H), 7,72 (d, J = 8,0 Гц, 1H), 7,47-7,43 (m, 2H), 7,09 (t, J = 7,6 Гц, 1H), 6,99-6,98 (m, 1H), 5,89-5,84 (m, 1H), 5,69-5,65 (m, 1H), 2,95-2,90 (m, 1H), 2,72-2,68 (m, 2H), 1,93-1,87 (m, 2H), 1,55-1,50 (m, 2H), 1,36 (brs, 1H), 1,16-1,11 (m, 2H), 1,09-0,89 (m, 7H), 0,80 (t, J = 7,2 Гц, 3H), | 472,23 | MS (ESI)<br>масса/заряд : 472,9<br>[M+H] <sup>+</sup> | Соединение синтезировали посредством способа А с применением 3-гексил-1-циклогептанона и 2-трифторметил-пиридин-4-бензилбромид в качестве соответствующих структурных элементов |
| 5-[(5-цианопиридин-3-ил)метил]-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновая кислота          | <sup>1</sup> H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d <sub>6</sub> ):<br>_12,90 (s, 1H), 8,88 (d, J = 1,60 Гц, 1H), 8,23 (d, J = 2,00 Гц, 1H), 7,70-7,74 (m, 2H), 7,44 (d, J = 6,80 Гц, 1H), 7,08 (m, 1H), 5,77 (d, J = 18,40 Гц, 1H), 5,62 (d, J = 18,00 Гц, 1H), 2,67-2,93 (m, 3H), 1,85-1,93 (m, 2H), 1,41-1,57 (m, 3H), 0,83-1,24 (m, 14H),                                                                  | 429,24 | MS (ESI)<br>масса/заряд : 430<br>[M+H] <sup>+</sup>   | Соединение синтезировали посредством способа А с применением 3-гексил-1-циклогептанона и 5-(бромметил)никотинонитрила в качестве соответствующих структурных элементов          |

|                                                                                                                                      |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                          |        |                                               |                                                                                                                                                                                                                         |
|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------|-----------------------------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 5-[(5-<br>цианотиофен-<br>2-ил)метил]-7-<br>гексил-<br>5Н,6Н,7Н,8Н,<br>9Н,10Н-<br>циклогепта[b]<br>индол-4-<br>карбоновая<br>кислота | <sup>1</sup> H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d <sub>6</sub> ): _<br>13,04 (s, 1H), 7,75 (d, J = 3,60 Гц,<br>1H), 7,69 (d, J = 7,20 Гц, 1H), 7,50 (d,<br>J = 7,20 Гц, 1H), 7,08 (t, J = 7,60 Гц,<br>1H), 6,78 (d, J = 4,00 Гц, 1H), 6,01 (d,<br>J = 18,00 Гц, 1H), 5,86 (d, J = 18,00<br>Гц, 1H), 2,85-2,94 (m, 2H), 2,51-2,70<br>(m, 3H), 1,84-1,97 (m, 2H), 1,52-1,54<br>(m, 3H), 1,16-1,23 (m, 9H), 0,85 (t, J =<br>7,20 Гц, 3H), | 434,20 | MS (ESI)<br>масса/заряд<br>: 433,3 [M-<br>H]- | Соединение<br>синтезировали<br>посредством<br>способа А с<br>применением 3-<br>гексил-1-<br>циклогептанона и<br>5-<br>(бромметил)тиофе<br>н-2-карбонитрила<br>в качестве<br>соответствующих<br>структурных<br>элементов |
| 5-[(4-<br>цианотиофен-<br>2-ил)метил]-7-<br>гексил-<br>5Н,6Н,7Н,8Н,<br>9Н,10Н-<br>циклогепта[b]<br>индол-4-<br>карбоновая<br>кислота | <sup>1</sup> H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d <sub>6</sub> ): _<br>13,0(s, 1H), 8,31 (s, J=1,2Hz, 1H),<br>7,66 (d, J=6,8 Гц, 1H) ,7,49-7,47 (m,<br>1H), 7,08-7,04 (m, 2H), 5,94 (d, J=18<br>,1H ), 5,80 (d, J=17,2 Гц, 1H), 2,96<br>(d, J=15,6Hz ,1H), 2,89-2,84 (m , 1H),<br>2,62-2,58 (m, 2H), 1,96-1,84 (m , 2H),<br>1,55-1,50 (m ,3H), 1,23-1,18 (m, 10H),<br>0,85 (t , J=6,4 ,3H);                                            | 434,20 | MS (ESI)<br>масса/заряд<br>: 433 [M-<br>H]-   | Соединение<br>синтезировали<br>посредством<br>способа А с<br>применением 3-<br>гексил-1-<br>циклогептанона и<br>5-<br>(бромметил)тиофе<br>н-3-карбонитрила<br>в качестве<br>соответствующих<br>структурных<br>элементов |
| 5-[(5-<br>цианофуран-2-<br>ил)метил]-7-<br>гексил-<br>5Н,6Н,7Н,8Н,<br>9Н,10Н-<br>циклогепта[b]<br>индол-4-                           | <sup>1</sup> H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d <sub>6</sub> ): _<br>13,10 (s, 1H), 7,66 (d, J = 7,20 Гц,<br>1H), 7,46 (t, J = 3,60 Гц, 2H), 7,06 (t, J<br>= 7,60 Гц, 1H), 6,12 (d, J = 3,60 Гц,<br>1H), 5,87 (d, J = 18,00 Гц, 1H), 5,71<br>(d, J = 18,00 Гц, 1H), 2,84-3,03 (m,<br>2H), 2,60-2,70 (m, 1H), 1,85-1,97 (m,                                                                                                           | 418,23 | MS (ESI)<br>масса/заряд<br>: 417 [M-<br>H]-   | Соединение<br>синтезировали<br>посредством<br>способа А с<br>применением 3-<br>гексил-1-<br>циклогептанона и<br>5-                                                                                                      |

|                                                                                                             |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                      |        |                                                     |                                                                                                                                                                               |
|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------|-----------------------------------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| карбоновая кислота                                                                                          | 2H), 1,55-1,57 (m, 3H), 1,23-1,27 (m, 1H), 0,85 (t, J = 6,80 Гц, 3H);                                                                                                                                                                                                                                                                                |        |                                                     | (бромметил)фуран-2-карбонитрила в качестве соответствующих структурных элементов                                                                                              |
| 5-[(3,5-диметил-1,2-оксазол-4-ил)метил]-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновая кислота | <sup>1</sup> H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d <sub>6</sub> ): _ 12,79 (s, 1H), 7,66-7,68 (m, 1H), 7,38-7,40 (m, 1H), 7,04 (t, J = 7,60 Гц, 1H), 5,38 (d, J = 17,20 Гц, 1H), 5,30 (d, J = 17,20 Гц, 1H), 2,86-2,90 (m, 2H), 2,67-2,68 (m, 1H), 1,85-1,97 (m, 2H), 1,77 (s, 3H), 1,63 (s, 3H), 1,51-1,53 (m, 3H), 1,22-1,30 (m, 11H), 0,85 (t, J = 7,20 Гц, 3H), | 422,26 | MS (ESI)<br>масса/заряд : 423<br>[M+H] <sup>+</sup> | Соединение синтезировали посредством способа А с применением 3-гексил-1-циклогептанона и 4-(бромметил)-3,5-диметилизоксазола в качестве соответствующих структурных элементов |
| 5-(3-цианобензоил)-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновая кислота                      | <sup>1</sup> H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d <sub>6</sub> ): _ 12,90 (s, 1H), 8,10-8,12 (m, 1H), 7,92 (s, 1H), 7,82-7,84 (m, 1H), 7,67 (t, J = 7,60 Гц, 1H), 7,53-7,57 (m, 2H), 7,26 (t, J = 7,60 Гц, 1H), 2,57-2,88 (m, 4H), 1,84-1,93 (m, 2H), 1,57-1,63 (m, 3H), 1,24-1,25 (m, 1H), 0,80-1,15 (m, 12H),                                                    | 442,23 | MS (ESI)<br>масса/заряд : 441 [M-H] <sup>-</sup>    | Соединение синтезировали посредством способа А с применением 3-гексил-1-циклогептанона и 2-циано-1-бензилбромиды в качестве соответствующих структурных элементов             |

|                                                                                                     |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                              |        |                                                       |                                                                                                                                                                                      |
|-----------------------------------------------------------------------------------------------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------|-------------------------------------------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 5-[(1,3-бензоксазол-7-ил)метил]-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновая кислота | <sup>1</sup> H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d <sub>6</sub> ): _ 12,90 (s, 1H), 8,78 (s, 1H), 7,70 (d, J = 7,60 Гц, 1H), 7,61 (d, J = 7,60 Гц, 1H), 7,40 (d, J = 7,60 Гц, 1H), 7,17 (t, J = 8,00 Гц, 1H), 7,06 (t, J = 7,60 Гц, 1H), 6,27 (d, J = 7,60 Гц, 1H), 6,09 (d, J = 18,40 Гц, 1H), 5,90 (d, J = 18,40 Гц, 1H), 2,83-2,95 (m, 2H), 2,67-2,73 (m, 1H), 1,89-1,91 (m, 2H), 1,40-1,57 (m, 3H), 1,24-1,26 (m, 1H), 1,08-1,13 (m, 4H), 0,86-1,01 (m, 6H), 0,79 (t, J = 7,20 Гц, 3H). | 444,24 | MS (ESI)<br>масса/заряд : 445<br>[M+H] <sup>+</sup>   | Соединение синтезировали посредством способа А с применением 3-гексил-1-циклогептанона и 7-(бромметил)бензо[d]оксазола в качестве соответствующих структурных элементов              |
| 5-[(5-цианотиофен-3-ил)метил]-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновая кислота   | <sup>1</sup> H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d <sub>6</sub> ): _ 12,95 (s, 1H), 7,69-7,61 (m, 1H), 7,51 (s, 1H), 7,42-7,40 (m, 1H), 7,18 (s, 1H), 7,07-7,03 (m, 1H), 5,73-5,69 (m, 1H), 5,57-5,53 (m, 1H), 2,90-2,83 (m, 1H), 2,73-2,65 (m, 2H), 2,57-2,54 (m, 1H), 1,93-1,84 (m, 2H), 1,54-1,45 (m, 3H), 1,24-1,14 (m, 10H), 0,85 (t, J = 7,20 Гц, 3H) .                                                                                                                               | 434,20 | MS (ESI)<br>масса/заряд : 435,0<br>[M+H] <sup>+</sup> | Соединение синтезировали посредством способа А с применением 3-гексил-1-циклогептанона и метил-5-((5-цианотиофен-3-ил)метил)бромида в качестве соответствующих структурных элементов |
| 7-гексил-5-[(1Н-индол-4-ил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-                          | <sup>1</sup> H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d <sub>6</sub> ): _ 12,75 (bs, 1H), 11,11 (bs, 1H), 7,68 (d, J = 7,20 Гц, 1H), 7,37 (d, J = 6,80 Гц, 1H), 7,30 (t, J = 2,80 Гц, 1H), 7,19 (d, J = 8,00 Гц, 1H), 7,04 (t, J = 7,60 Гц, 1H), 6,80 (t, J = 8,00 Гц, 1H), 6,35 (s, 1H), 6,02 (d, J = 18,00 Гц, 1H), 5,85 (s, 1H), 5,81 (d, J = 6,80 Гц, 1H),                                                                                                                                   | 442,26 | MS (ESI)<br>масса/заряд : 443,3<br>[M+H] <sup>+</sup> | Соединение синтезировали посредством способа А с применением 3-гексил-1-циклогептанона и метил-5-((1-(трет-                                                                          |

|                                                                                                                                    |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                         |        |       |                                                                                                                                                                                                         |
|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------|-------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| карбоновая<br>кислота                                                                                                              | 2,93-2,89 (m, 1H), 2,81-2,77 (m, 1H),<br>2,71-2,67 (m, 1H), 2,42-2,36 (m, 1H),<br>1,88-1,86 (m, 2H), 1,54-1,44 (m, 2H),<br>1,31-1,20 (m, 2H), 1,15-1,09 (m, 1H),<br>1,02-0,92 (m, 6H), 0,89-0,78 (m, 5H).                                                                                                                                                                                                                                               |        |       | бутоксикарбонил)<br>-1H-индол-4-<br>ил)бромид в<br>качестве<br>соответствующих<br>структурных<br>элементов                                                                                              |
| 5-[(3-<br>карбамоилфен<br>ил)метил]-7-<br>пропил-<br>5H,6H,7H,8H,<br>9H,10H-<br>циклогепта[b]<br>индол-4-<br>карбоновая<br>кислота | 400MHz-DMSO d6 : 12,84(br s, 1H),<br>7,87 (br s, 1H), 7,67 (d, J =8Hz, 2H),<br>7,52 ( s, 1H), 7,38 (d, J = 7,2Hz, 1H),<br>7,29(br s, 1H), 7,26 ( t, J= 8Hz, 1H),<br>7,04 ( t, J=8Hz, 1H), 6,72(d, J=8Hz,<br>1H), 5,79 ( d, J= 18Hz, 1H), 5,60( d,<br>J= 18Hz, 1H), 2,93-2,81 ( m, 2H),<br>2,72-2,66(m, 1H), 2,46 (m, 1H), 1,92-<br>1,85 (m, 2H), 1,55-1,47(m, 3H), 1,11-<br>1,02(m, 4H), 0,71-0,70 (m, 3H)                                              | 404,21 | 405,1 | Соединение<br>синтезировали<br>посредством<br>способа А с<br>применением 3-<br>пропил-1-<br>циклогептанона и<br>3-циано-1-<br>бензилбромид в<br>качестве<br>соответствующих<br>структурных<br>элементов |
| 7-бутил-5-[(3-<br>карбамоилфен<br>ил)метил]-<br>5H,6H,7H,8H,<br>9H,10H-<br>циклогепта[b]<br>индол-4-<br>карбоновая<br>кислота      | 400MHz-DMSO d6 : 12,85(br s, 1H),<br>7,88 (br s, 1H), 7,68 (d, J =8Hz, 2H),<br>7,53 ( s, 1H), 7,38 (d, J = 7,2Hz, 1H),<br>7,31 (br s, 1H), 7,26 ( t, J= 8Hz, 1H),<br>7,05 ( t, J=8Hz, 1H), 6,71(d, J=8Hz,<br>1H), 5,80 ( d, J= 17Hz, 1H), 5,60( d,<br>J= 17Hz, 1H), 2,93-2,88 (m, 1H), 2,82(<br>d, J=16Hz, 1H), 2,72-2,66(m, 1H),<br>2,46 (m, 1H), 1,92-1,85 (m, 2H), 1,55-<br>1,47(m, 2H),1,45-1,36(m, 1H), 1,11-<br>0,95(m, 6H), 0,74 (t, J =7Hz, 3H) | 418,23 | 419,1 | Соединение<br>синтезировали<br>посредством<br>способа А с<br>применением 3-<br>бутил-1-<br>циклогептанона и<br>3-циано-1-<br>бензилбромид в<br>качестве<br>соответствующих<br>структурных<br>элементов  |

|                                                                                                                           |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                             |        |        |                                                                                                                                                                                                         |
|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------|--------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 7-бутил-5-[(3-<br>цианофенил)м<br>етил]-<br>5Н,6Н,7Н,8Н,<br>9Н,10Н-<br>циклогепта[b]<br>индол-4-<br>карбоновая<br>кислота | 400MHz-DMSO d6 : 12,87(br s, 1H),<br>7,69 (t, J=8Hz,2H), 7,45 ( t, J=8Hz,<br>1H), 7,41(d, J=8Hz, 1), 7,29 (br s, 1H),<br>7,07 ( t, J= 8Hz, 1H), 6,99 (d, J=8Hz,<br>1H), 5,78 ( d, J= 18Hz, 1H), 5,60( d,<br>J= 18Hz, 1H), 2,93-2,88 (m, 1H), 2,78(<br>d, J=16Hz, 1H), 2,72-2,67(m, 1H),<br>2,46 (m, 1H), 1,92-1,86 (m, 2H), 1,55-<br>1,37(m, 2H),1,4-1,30(m, 1H), 1,11-<br>0,95(m, 6H), 0,76 (t, J=7Hz, 3H) | 400,22 | 401,1  | Соединение<br>синтезировали<br>посредством<br>способа А с<br>применением 3-<br>пропил-1-<br>циклогептанона и<br>3-циано-1-<br>бензилбромид в<br>качестве<br>соответствующих<br>структурных<br>элементов |
| 7-бутил-5-<br>[(пиридин-3-<br>ил)метил]-<br>5Н,6Н,7Н,8Н,<br>9Н,10Н-<br>циклогепта[b]<br>индол-4-<br>карбоновая<br>кислота | 400MHz-DMSO d6 : 12,84(br s, 1H),<br>8,38(s, 1H), 8,07(s, 1H), 7,69 (dd, J<br>=8,0, 0,8Hz, 1H), 7,41 (dd, J =8,0,<br>0,8Hz, 1H), 7,26-7,23 (m, 1H), 7,08-<br>7,04 (m, 2H), 5,76 ( d, J= 17,6Hz,<br>1H), 5,62( d, J= 17,6Hz, 1H), 2,93-<br>2,84 (m, 2H), 2,73-2,66(m, 1H), 2,57-<br>2,53 (m, 1H), 1,94-1,84 (m, 2H), 1,58-<br>1,44(m, 3H), 1,25-1,02 (m, 6H), 0,77<br>(t, J =6,8Hz, 3H)                      | 376,22 | 377,23 | Соединение<br>синтезировали<br>посредством<br>способа А с<br>применением 3-<br>бутил-1-<br>циклогептанона и<br>3-<br>бензилбромпирид<br>ина в качестве<br>соответствующих<br>структурных<br>элементов   |
| 7-бутил-5-[(3-<br>метилфенил)м<br>етил]-<br>5Н,6Н,7Н,8Н,<br>9Н,10Н-<br>циклогепта[b]<br>индол-4-<br>карбоновая<br>кислота | 400MHz-DMSO d6 : 12,85(br s, 1H),<br>7,66(d, J =8Hz, 1H), 7,37 (d, J =8Hz,<br>1H), 7,05 (m, 2H), 6,96 (d, J=8Hz,<br>1H), 6,70 (s, 1H), 6,44(d, J = 7,2 Гц,<br>1H), 5,72 (d, J= 17,6Hz, 1H), 5,52 ( d,<br>J= 17,6Hz, 1H), 2,93-2,85 (m, 2H),<br>2,71-2,65 (m, 1H), 2,50 (m, 1H), 2,185<br>(s, 3H), 1,94-1,84 (m, 2H), 1,58-1,47<br>(m, 2H), 1,45-1,36 (m, 1H), 1,18-<br>0,95(m, 6H), 0,77 (t, J =6,8Hz, 3H)  | 389,24 | 390,1  | Соединение<br>синтезировали<br>посредством<br>способа А с<br>применением 3-<br>бутил-1-<br>циклогептанона и<br>3-метил-1-<br>бензилбромид в<br>качестве                                                 |

|                                                                                              |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                        |        |       |                                                                                                                                                                    |
|----------------------------------------------------------------------------------------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------|-------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
|                                                                                              |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                        |        |       | соответствующих<br>структурных<br>элементов                                                                                                                        |
| 7-бутил-5-[(3-метоксифенил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновая кислота | 400MHz-DMSO d6 : 12,85(br s, 1H), 7,66(d, J=8Hz, 1H), 7,37 (d, J=8Hz, 1H), 7,11 (t, J=8Hz, 1H), 7,04 (t, J=8Hz, 1H), 6,71 (m, 1H), 6,31-6,26 (m, 2H), 5,73 (d, J= 17,6Hz, 1H), 5,54 (d, J= 17,6Hz, 1H), 3,62 (s, 3H), 2,93-2,85 (m, 2H), 2,71-2,65 (m, 1H), 2,50 (m, 1H), 1,94-1,84 (m, 2H), 1,58-1,47 (m, 2H), 1,45-1,36 (m, 1H), 1,18-0,95(m, 6H), 0,77 (t, J=6,8Hz, 3H)             | 405,23 | 406,1 | Соединение синтезировали посредством способа А с применением 3-бутил-1-циклогептанона и 3-метокси-1-бензилбромада в качестве соответствующих структурных элементов |
| 7-бутил-5-[(3-хлорфенил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновая кислота    | 400MHz-DMSO d6 : 12,86(br s, 1H), 7,68 (d, J=7,2Hz, 1H), 7,40 (d, J=7,2Hz, 1H), 7,27-7,21 (m, 2H), 7,04(t, J=8Hz, 1H), 6,84 (s, 1H), 6,67 (d, J= 6,4Hz, 1H), 5,77 (d, J= 17,6Hz, 1H), 5,57( d, J= 17,6Hz, 1H), 2,93-2,87 (m, 1H), 2,83( d, J=16Hz, 1H), 2,68-2,66(m, 1H), 2,47 (m, 1H), 1,93-1,87 (m, 2H), 1,58-1,48(m, 2H), 1,44-1,33(m, 1H), 1,21-0,95(m, 6H), 0,77 (t, J=6,8Hz, 3H) | 409,18 | 410,1 | Соединение синтезировали посредством способа А с применением 3-бутил-1-циклогептанона и 3-хлор-1-бензилбромада в качестве соответствующих структурных элементов    |

|                                                                                                     |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                         |        |        |                                                                                                                                                                           |
|-----------------------------------------------------------------------------------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------|--------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 7-бутил-5-[(3-гидроксифенил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновая кислота       | 400MHz-DMSO d6 : 12,85(br s, 1H), 9,19(s, 1H), 7,65(d, J =7,6Hz, 1H), 7,37 (d, J =7,6Hz, 1H), 7,05-6,97(m, 2H), 6,52 (d, J=6,4Hz, 1H), 6,22 (d, J=7,6Hz, 1H), 6,10(s, 1H), 5,68 (d, J=17,6Hz, 1H), 5,50 (d, J= 17,6Hz, 1H), 2,97-2,83 (m, 3H), 2,71-2,65 (m, 1H), 1,94-1,84 (m, 2H), 1,58-1,47 (m, 3H), 1,25-1,20 (m, 2H), 1,18-1,00(m, 6H), 0,78 (t, J =6,8Hz, 3H)     | 391,21 | 392,46 | Соединение синтезировали посредством способа А с применением 3-бутил-1-циклогептанона и 3-гидроксил-1-бензилбромид в качестве соответствующих структурных элементов       |
| 7-бутил-5-[(2-метоксипиридин-4-ил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновая кислота | 400MHz-DMSO d6 : 12,85(br s, 1H), 8,00(d, J =5,2Hz, 1H), 7,69 (d, J =7,2Hz, 1H), 7,42 (d, J =6,8Hz, 1H), 7,06 (t, J=7,2Hz, 1H), 6,41 (d, J =4,4Hz, 1H), 6,00 (s, 1H), 5,75 (d, J=17,6Hz, 1H), 5,57 (d, J= 17,6Hz, 1H), 3,74 (s, 3H), 2,93-2,86 (m, 1H), 2,79-2,65 (m, 2H), 2,50 (m, 1H), 1,94-1,84 (m, 2H), 1,58-1,47 (m, 3H), 1,18-0,99(m, 6H), 0,75 (t, J =6,8Hz, 3H) | 406,23 | 407    | Соединение синтезировали посредством способа А с применением 3-бутил-1-циклогептанона и 2-метокси-4-бензилбромидпиридина в качестве соответствующих структурных элементов |
| 7-бутил-5-[(4-карбамоилфенил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновая кислота      | 400MHz-DMSO d6 : 12,85 (br s, 1H), 7,83 (s, 1H), 7,72-7,67(m, 3H), 7,39 (d, J = 10,8 Гц, 1H), 7,26 (s, 1H), 7,05 (t, J=8Hz, 1H), 6,79 (d, J=7,6Hz, 2H), 5,80 (d, J= 18,4 Гц, 1H), 5,62( d, J=18,4Hz, 1H), 2,90 (dd, J = 16, 7,2 Гц, 1H), 2,82( d, J=15,6Hz, 1H), 2,69 (dd, J = 16, 7,2 Гц, 1H), 2,47 (m, 1H), 1,93-1,87 (m, 2H), 1,56-1,48 (m,                          | 418,23 | 419,1  | Соединение синтезировали посредством способа А с применением 3-бутил-1-циклогептанона и 4-амид-1-бензилбромид в качестве                                                  |

|                                                                                                |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                       |        |       |                                                                                                                                                                  |
|------------------------------------------------------------------------------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------|-------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
|                                                                                                | 2H), 1,42-1,35 (m, 1H), 1,15-0,98(m, 6H), 0,74 (t, J =6,8Hz, 3H)                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                      |        |       | соответствующих структурных элементов                                                                                                                            |
| 7-бутил-5-[(2-карбамоилфенил)метил]-5H,6H,7H,8H,9H,10H-циклогепта[b]индол-4-карбоновая кислота | 400MHz-DMSO d6 : 12,85 (br s, 1H), 7,86 (s, 1H), 7,68 (d, J=7,6Hz, 1H), 7,54 (dd, J=8,0, 1,6Hz, 1H), 7,47 (s, 1H), 7,37 (d, J = 7,6 Гц, 1H), 7,24-7,05 (m, 2H), 7,05(t, J=7,6Hz, 1H), 6,79 (d, J=7,6Hz, 2H), 5,94-5,88( m, 3H), 2,90 (dd, J = 16, 7,2 Гц, 1H), 2,74-2,66(m, 2H), 2,42-2,33 (m, 1H), 1,93-1,85 (m, 2H), 1,56-1,48 (m, 2H), 1,42-1,35 (m, 1H), 1,15-0,95(m, 6H), 0,74 (t, J =6,8Hz, 3H) | 418,23 | 419,1 | Соединение синтезировали посредством способа А с применением 3-бутил-1-циклогептанона и 2-амид-1-бензилбромида в качестве соответствующих структурных элементов  |
| 7-бутил-5-[(4-метилфенил)метил]-5H,6H,7H,8H,9H,10H-циклогепта[b]индол-4-карбоновая кислота     | 400MHz-DMSO d6 : 12,85(br s, 1H), 7,65(d, J =7,2Hz, 1H), 7,36 (d, J =6,8Hz, 1H), 7,04-6,99 (m, 3H), 6,64 (d, J= 7,6Hz, 2H), 5,70( d, J= 17,6Hz, 1H), 5,53 (d, J= 17,6Hz, 1H), 2,91-2,84 (m, 2H), 2,71-2,65 (m, 1H), 2,47 (m, 1H), 2,20(s, 3H), 1,93-1,84 (m, 2H), 1,58-1,42(m, 3H), 1,15-1,02(m, 6H), 0,77 (t, J =6,8Hz, 3H)                                                                          | 389,24 | 390,1 | Соединение синтезировали посредством способа А с применением 3-бутил-1-циклогептанона и 4-метил-1-бензилбромида в качестве соответствующих структурных элементов |

|                                                                                                                           |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                      |        |       |                                                                                                                                                                                                         |
|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------|-------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 7-бутил-5-[(2-<br>цианофенил)м<br>етил]-<br>5Н,6Н,7Н,8Н,<br>9Н,10Н-<br>циклогепта[b]<br>индол-4-<br>карбоновая<br>кислота | 400MHz-DMSO d6 : 12,85(br s, 1H),<br>7,85(d, J =8Hz, 1H), 7,71 (d, J =8Hz,<br>1H), 7,49-7,37 (m, 3H), 7,05 (t,<br>J=7,6Hz, 1H), 6,96 (d, J=7,6Hz, 1H),<br>6,18 (d, J= 17,6Hz, 1H), 6,01 (d, J =<br>10,8Hz, 1H), 5,79( d, J= 17,6Hz, 1H),<br>2,92 (dd, J = 14,8, 6 Гц, 1H), 2,78-<br>2,69 (m, 2H), 2,47 (m, 1H), 1,97-1,86<br>(m, 2H), 1,58-1,42(m, 2H), 1,20-<br>0,94(m, 6H), 0,74 (t, J =6,8Hz, 3H) | 400,22 | 401,2 | Соединение<br>синтезировали<br>посредством<br>способа А с<br>применением 3-<br>бутил-1-<br>циклогептанона и<br>2-циано-1-<br>бензилбромиды в<br>качестве<br>соответствующих<br>структурных<br>элементов |
| 7-бутил-5-[(2-<br>метилфенил)м<br>етил]-<br>5Н,6Н,7Н,8Н,<br>9Н,10Н-<br>циклогепта[b]<br>индол-4-<br>карбоновая<br>кислота | 400MHz-DMSO d6 : 12,85(br s, 1H),<br>7,68(d, J =7,2Hz, 1H), 7,35 (d, J<br>=6,8Hz, 1H), 7,14(d, J =8Hz, 1H),<br>7,04 (t, J=8Hz, 2H), 6,88 (d, J=7,2Hz,<br>1H), 5,76-5,72(m, 2H), 5,55( d, J =<br>9,6Hz, 1H), 2,91 (dd, J = 14,8, 6 Гц,<br>1H), 2,78-2,69 (m, 2H), 2,47 (m,<br>1H), 2,34 (s, 3H), 1,93-1,86 (m, 2H),<br>1,62-1,43(m, 2H), 1,16-0,94(m, 6H),<br>0,73 (t, J =6,8Hz, 3H)                  | 389,24 | 390,1 | Соединение<br>синтезировали<br>посредством<br>способа А с<br>применением 3-<br>бутил-1-<br>циклогептанона и<br>2-метил-1-<br>бензилбромиды в<br>качестве<br>соответствующих<br>структурных<br>элементов |
| 7-бутил-5-[(2-<br>фторфенил)ме<br>тил]-<br>5Н,6Н,7Н,8Н,<br>9Н,10Н-<br>циклогепта[b]<br>индол-4-<br>карбоновая<br>кислота  | 400MHz-DMSO d6 : 12,85(br s, 1H),<br>7,68 (d, J =7,6Hz, 1H), 7,40 (d, J<br>=6,8Hz, 1H), 7,26-7,14 (m, 2H),<br>7,05(t, J = 8,0Hz, 1H), 6,96(t, J =<br>8,0Hxz, 1H), 6,15 (t, J= 7,2Hz, 1H),<br>5,82 ( d, J= 18,4 Гц, 1H), 5,64 (d, J=<br>18,4Hz, 1H), 2,91 (dd,J=16,0, 6,8Hz,<br>1H), 2,81(d, J= 16,0Hz, 1H), 2,73-<br>2,67(m, 1H), 2,47 (m, 1H), 2,20(s,<br>3H), 1,93-1,87 (m, 2H), 1,58-1,42(m,      | 393,21 | 394   | Соединение<br>синтезировали<br>посредством<br>способа А с<br>применением 3-<br>бутил-1-<br>циклогептанона и<br>2-фтор-1-<br>бензилбромиды в<br>качестве                                                 |

|                                                                                                 |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                   |        |       |                                                                                                                                                                    |
|-------------------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------|-------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
|                                                                                                 | 3H), 1,18-1,02(m, 6H), 0,75 (t, J =6,8Hz, 3H)                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                     |        |       | соответствующих структурных элементов                                                                                                                              |
| 5-[(3-карбамоилфенил)метил]-7-пентил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновая кислота | 400MHz-DMSO d6 : 12,80(br s, 1H), 7,86 (br s, 1H), 7,67 (d, J =8Hz, 2H), 7,52 ( s, 1H), 7,38 (d, J = 7,2Hz, 1H), 7,28 (br s, 1H), 7,26 ( t, J= 8Hz, 1H), 7,05 ( t, J=8Hz, 1H), 6,71(d, J=8Hz, 1H), 5,80 ( d, J= 17Hz, 1H), 5,64( d, J= 17Hz, 1H) 2,93-2,88 (m, 1H), 2,82( d, J=16Hz, 1H), 2,72-2,66(m, 1H), 2,46 (m, 1H), 1,92-1,85 (m, 2H), 1,56-1,41(m, 3H),1,11-0,95(m, 8H), 0,78 (t, J =7Hz, 3H)                              | 432,24 | 433,1 | Соединение синтезировали посредством способа А с применением 3-пентил-1-циклогептанона и 3-циано-1-бензилбромаида в качестве соответствующих структурных элементов |
| 5-[(3-цианофенил)метил]-7-пентил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновая кислота     | 400MHz-DMSO d6 : 12,83(br s, 1H), 7,67 (d, J=8Hz,1H), 7,50 ( d, J=8Hz, 1H), 7,43(t, J=8Hz, 1H), 7,40 (dd, J=7,2, 1,2 Гц, 1H), 7,26 (br s, 1H), 7,05 ( t, J= 8Hz, 1H), 6,80 (d, J=8Hz, 1H), 5,77( d, J= 18Hz, 1H), 5,58( d, J= 18Hz, 1H), 2,80 (dd, J = 12,0, 8,0 Гц , 1H), 2,77( d, J=15,6Hz, 1H), 2,72-2,67(m, 1H), 2,48 (m, 1H), 1,91-1,84 (m, 2H), 1,53-1,46(m, 2H), 1,40-1,30 (m, 1H), 1,16-0,94(m, 8H), 0,77 (t, J =8Hz, 3H) | 414,23 | 415,1 | Соединение синтезировали посредством способа А с применением 3-пропил-1-циклогептанона и 3-циано-1-бензилбромаида в качестве соответствующих структурных элементов |

|                                                                                                        |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                   |        |       |                                                                                                                                                                      |
|--------------------------------------------------------------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------|-------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 5-[(3-карбамоилфенил)метил]-7-(2-фенилэтил)-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновая кислота | 400MHz-DMSO d6 : 12,80(br s, 1H), 7,89 (br s, 1H), 7,66 (d, J =8Hz, 2H), 7,56 ( s, 1H), 7,37 (d, J = 7,2Hz, 1H), 7,30 (br s, 1H), 7,27-7,19 ( m, 3H), 7,12 ( t, J=8Hz, 1H), 7,06-7,02(m, 3H), 6,74(d, J=8Hz, 1H), 5,82 ( d, J= 17Hz, 1H), 5,64( d, J= 17Hz, 1H), 2,94-2,86 (m, 2H), 2,74-2,68(m, 1H), 2,58-2,54(m, 1H) 2,45-2,33 (m, 2H), 2,00-1,96 (m, 1H), 1,90-1,85 (m, 1H), 1,60-1,41(m, 5H)  | 466,23 | 467,1 | Соединение синтезировали посредством способа А с применением 3-(фенэтил)-1-циклогептанона и 3-циано-1-бензилбромиды в качестве соответствующих структурных элементов |
| 5-[(3-цианофенил)метил]-7-(2-фенилэтил)-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновая кислота     | 400MHz-DMSO d6 : 12,83(br s, 1H), 7,67 (t, J=8Hz,2H), 7,44-7,38 (m, 2H), 7,24 (br s, 1H), 7,22 ( t, J= 7,2Hz, 2H), 7,13 ( t, J= 7,2Hz, 2H), 7,06-7,04(m, 4H), 7,00(d, J=8Hz, 1H), 5,81( d, J= 17,6Hz, 1H), 5,66 ( d, J= 17,6Hz, 1H), 2,88 (d, J = 15,6Hz , 2H), 2,75-2,67( m, 1H), 2,62-2,55(m, 1H), 2,44-2,33 (m, 2H), 2,01-1,97 (m, 1H), 1,94-1,86 (m, 1H), 1,53-1,46(m, 2H), 1,62-1,40 (m, 5H) | 448,22 | 449,1 | Соединение синтезировали посредством способа А с применением 3-(фенэтил)-1-циклогептанона и 3-циано-1-бензилбромиды в качестве соответствующих структурных элементов |
| 5-[(3-карбамоилфенил)метил]-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновая кислота        | 400MHz-DMSO d6 : 12,80(br s, 1H), 7,86 (br s, 1H), 7,67 (d, J =8Hz, 2H), 7,52 ( s, 1H), 7,38 (d, J = 7,2Hz, 1H), 7,28 (br s, 1H), 7,25 ( t, J= 8Hz, 1H), 7,04 ( t, J=8Hz, 1H), 6,71(d, J=8Hz, 1H), 5,80 ( d, J= 17Hz, 1H), 5,60( d, J= 17Hz, 1H) 2,93-2,88 (m, 1H), 2,82( d, J=16Hz, 1H), 2,72-2,66(m, 1H), 2,46 (m, 1H), 1,92-1,85 (m, 2H), 1,56-                                                | 446,26 | 447,1 | Соединение синтезировали посредством способа А с применением 3-гексил-1-циклогептанона и 3-циано-1-бензилбромиды в качестве                                          |

|                                                                                                                                   |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  |        |       |                                                                                                                                                                                                          |
|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------|-------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
|                                                                                                                                   | 1,41(m, 3H),1,23-0,97(m, 10H), 0,82 (t, J =7Hz, 3H)                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                              |        |       | соответствующих структурных элементов                                                                                                                                                                    |
| 5-[(3-<br>цианофенил)м<br>етил]-7-<br>гексил-<br>5Н,6Н,7Н,8Н,<br>9Н,10Н-<br>циклогепта[b]<br>индол-4-<br>карбоновая<br>кислота    | 400MHz-DMSO d6 : 12,9(br s, 1H),<br>7,68 (d, J=8Hz,1H), 7,66 ( d, J=8Hz,<br>1H), 7,44(t, J=8Hz, 1H), 7,40 (dd,<br>J=7,2, 1,2 Гц, 1H), 7,29 (br s, 1H),<br>7,06 ( t, J= 8Hz, 1H), 6,98 (d, J=8Hz,<br>1H), 5,79( d, J= 18Hz, 1H), 5,60( d, J=<br>18Hz, 1H), 2,90 (dd, J = 12,0, 8,0 Гц ,<br>1H), 2,78( d, J=15,6Hz, 1H), 2,69(m,<br>dd, J = 12,0, 8,0 Гц , 1H), 2,48 (m,<br>1H), 1,92-1,85 (m, 2H), 1,55-1,50 (m,<br>2H), 1,40-1,30 (m, 1H), 1,23-0,95(m,<br>10H), 0,77 (t, J =7,2 Гц, 3H)         | 428,25 | 429,1 | Соединение<br>синтезировали<br>посредством<br>способа А с<br>применением 3-<br>гексил-1-<br>циклогептанона и<br>3-циано-1-<br>бензилбромада в<br>качестве<br>соответствующих<br>структурных<br>элементов |
| 5-[(3-<br>карбамоилфен<br>ил)метил]-7-<br>октил-<br>5Н,6Н,7Н,8Н,<br>9Н,10Н-<br>циклогепта[b]<br>индол-4-<br>карбоновая<br>кислота | 400MHz-DMSO d6 : 12,9(br s, 1H),<br>7,92(s, 1H), 7,74(s, 1H), 7,69 (d, J=6,8<br>Гц,1H), 7,59 ( d, J=7,2 Гц, 1H),<br>7,52(dd, J=6,0, 1,2Hz, 1H), 7,27-7,23<br>(m, 1H), 7,29 (br s, 1H), 7,09 ( t, J=<br>7,6Hz, 1H), 6,71 (d, J=8,0 Гц,<br>1H),6,46(s, 1H), 5,67( d, J= 18Hz,<br>1H), 5,59( d, J= 18Hz, 1H), 2,98-2,92<br>(m, 2H), 2,84-2,80 (m, 1H), 2,67( dd, J<br>= 15,6, 10 Гц , 1H), 2,48 (m, 1H),<br>2,07-1,96 (m, 3H), 1,87-1,60 (m, 5H),<br>1,40- 1,23(m, 20H), 0,87 (t, J =7,2 Гц,<br>3H) | 474,29 | 475,1 | Соединение<br>синтезировали<br>посредством<br>способа А с<br>применением 3-<br>октил-1-<br>циклогептанона и<br>3-циано-1-<br>бензилбромада в<br>качестве<br>соответствующих<br>структурных<br>элементов  |

|                                                                                                                            |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                            |        |       |                                                                                                                                                                                                         |
|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------|-------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 5-[(3-<br>цианофенил)м<br>етил]-7-октил-<br>5Н,6Н,7Н,8Н,<br>9Н,10Н-<br>циклогепта[b]<br>индол-4-<br>карбоновая<br>кислота  | 400MHz-DMSO d6 : 12,9(br s, 1H),<br>7,74 (t, J=8Hz,2H), 7,47( d, J=8,0Hz,<br>1H), 7,32(t, J=8,0Hz, 1H), 7,15-7,00<br>(m ,3H), 5,75( d, J= 18Hz, 1H), 5,57(<br>d, J= 18Hz, 1H), 2,98-2,92 (m, 1H),<br>2,78-2,72 (m, 2H), 2,50-2,44( m , 1H),<br>2,48 (m, 1H), 2,01-1,93 (m, 3H), 1,87-<br>1,60 (m, 4H), 1,40- 1,23(m, 17H), 0,87<br>(t, J =7,2 Гц, 3H)                                                      | 456,28 | 457,1 | Соединение<br>синтезировали<br>посредством<br>способа А с<br>применением 3-<br>октил-1-<br>циклогептанона и<br>3-циано-1-<br>бензилбромиды в<br>качестве<br>соответствующих<br>структурных<br>элементов |
| 5-[(3-<br>фторфенил)ме<br>тил]-7-гексил-<br>5Н,6Н,7Н,8Н,<br>9Н,10Н-<br>циклогепта[b]<br>индол-4-<br>карбоновая<br>кислота  | 400MHz-DMSO d6 : 12,90 (br s, 1H),<br>7,65 (d, J =6Hz, 1H), 7,37 (d, J =6Hz,<br>1H), 7,25 (dd, J=14,4, 8Hz, 1H), 7,06-<br>6,96 (m, 2H), 6,57-6,64 (m, 2H), 5,81 ( d,<br>J= 18Hz, 1H), 5,60( d, J= 18Hz, 1H)<br>2,93-2,80 (m, 2H), 2,71-2,66( m, 1H),<br>2,62-2,46(m, 1H), 1,92-1,85 (m, 2H),<br>1,56-1,41(m, 2H), 1,45-1,35(m,1H),<br>1,23-0,97(m, 10H), 0,83 (t, J =6,8Hz,<br>3H)                         | 421,24 | 422,1 | Соединение<br>синтезировали<br>посредством<br>способа А с<br>применением 3-<br>гексил-1-<br>циклогептанона и<br>3-фтор-1-<br>бензилбромиды в<br>качестве<br>соответствующих<br>структурных<br>элементов |
| 7-гексил-5-<br>[(пиридин-3-<br>ил)метил]-<br>5Н,6Н,7Н,8Н,<br>9Н,10Н-<br>циклогепта[b]<br>индол-4-<br>карбоновая<br>кислота | 400MHz-DMSO d6 : 12,6 (br s, 1H),<br>8,37(d, J = 3,2Hz, 1H), 8,06(d, J =<br>1,6Hz, 1H), 7,68(dd, J = 8,0, 1,2Hz,<br>1H), 7,40 (dd, J =7,2, 0,8Hz, 1H),<br>7,25-7,22 (m, 1H), 7,06-7,01 (m, 2H),<br>5,76 ( d, J= 17,6Hz, 1H), 5,61( d, J=<br>17,6Hz, 1H) 2,93-2,84 (m, 2H), 2,72-<br>2,66( m, 1H), 2,56-2,52(m, 1H), 1,93-<br>1,85 (m, 2H), 1,56-1,43(m, 3H), 1,23-<br>1,10(m, 10H), 0,83 (t, J =7,2Hz, 3H) | 404,25 | 405,1 | Соединение<br>синтезировали<br>посредством<br>способа А с<br>применением 3-<br>гексил-1-<br>циклогептанона и<br>пиридил-3-<br>бензилбромиды в<br>качестве                                               |

|                                                                                               |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                            |        |       | соответствующих<br>структурных<br>элементов                                                                                                                        |
|-----------------------------------------------------------------------------------------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------|-------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 7-гексил-5-[(3-метилфенил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновая кислота   | 400MHz-DMSO d6 : 12,82 (br s, 1H), 7,66 (d, J =6,8Hz, 1H), 7,37 (d, J =6,8Hz, 1H), 7,06-7,01 (m, 2H), 6,96 (d, J=7,6Hz, 1H), 6,70 (s, 1H), 6,43 (d, J= 6Hz, 1H), 5,72 (d, J= 17,6Hz, 1H), 5,52 (d, J= 17,6Hz, 1H) 2,93-2,80 (m, 2H), 2,71-2,66 (m, 1H), 2,62-2,46 (m, 1H), 2,22 (s, 3H), 1,96-1,82 (m, 2H), 1,56-1,45 (m, 2H), 1,43-1,35 (m, 1H), 1,23-0,97 (m, 10H), 0,83 (t, J =7,2Hz, 3H)                               | 417,27 | 416,5 | Соединение синтезировали посредством способа А с применением 3-гексил-1-циклогептанона и 3-метил-1-бензилбромид в качестве соответствующих структурных элементов   |
| 7-гексил-5-[(3-метоксифенил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновая кислота | 400MHz-DMSO d6 : 12,90 (br s, 1H), 7,66 (d, J =7,2Hz, 1H), 7,38 (d, J =7,2Hz, 1H), 7,11 (t, J=7,6Hz, 1H), 7,04 (t, J=7,6Hz, 1H), 6,71 (d, J=6,8Hz, 1H), 6,31 (s, 1H), 6,27 (d, J= 6,8Hz, 1H), 5,74 (d, J= 17,6Hz, 1H), 5,54 (d, J= 17,6Hz, 1H), 3,62 (s, 3H), 2,91-2,82 (m, 2H), 2,71-2,66 (m, 1H), 2,62-2,46 (m, 1H), 1,96-1,82 (m, 2H), 1,56-1,45 (m, 2H), 1,43-1,35 (m, 1H), 1,23-0,97 (m, 10H), 0,83 (t, J =7,2Hz, 3H) | 433,26 | 434,1 | Соединение синтезировали посредством способа А с применением 3-гексил-1-циклогептанона и 3-метокси-1-бензилбромид в качестве соответствующих структурных элементов |
| 5-[(3-хлорфенил)метил]-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-                                           | 400MHz-DMSO d6 : 12,90 (br s, 1H), 7,65 (d, J =7,6Hz, 1H), 7,38 (d, J =7,6Hz, 1H), 7,27-7,20 (m, 2H), 7,04 (t, J=7,2Hz, 1H), 6,84 (s, 1H), 6,67 (d, J=7,2Hz, 1H), 5,74 (d, J=                                                                                                                                                                                                                                              | 437,21 | 438,1 | Соединение синтезировали посредством способа А с применением 3-                                                                                                    |

|                                                                                                                                         |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                            |        |        |                                                                                                                                                                                                                        |
|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------|--------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| циклогепта[b]<br>индол-4-<br>карбоновая<br>кислота                                                                                      | 17,6Hz, 1H), 5,54 (d, J= 17,6Hz, 1H),<br>2,88 (dd, J =15,6, 7,2 Гц, 1H), 2,81(d,<br>J=15,6, 1H), 2,71-2,66(m, 1H), 2,62-<br>2,46(m, 1H), 1,96-1,82 (m, 2H), 1,56-<br>1,45(m, 2H), 1,43-1,35(m,1H), 1,23-<br>0,97(m, 10H), 0,83 (t, J =7,2Hz, 3H)                                                                                                                                                                                                           |        |        | гексил-1-<br>циклогептанона и<br>3-хлор-1-<br>бензилбромада в<br>качестве<br>соответствующих<br>структурных<br>элементов                                                                                               |
| 7-гексил-5-[(2-<br>метоксипирид<br>ин-4-<br>ил)метил]-<br>5Н,6Н,7Н,8Н,<br>9Н,10Н-<br>циклогепта[b]<br>индол-4-<br>карбоновая<br>кислота | 500MHz-DMSO d6 : 12,8 (br s, 1H),<br>8,00 (d, J =5,0Hz, 1H), 7,70 (d, J<br>=8,0Hz, 1H), 7,41 (d, J =7,5Hz, 1H),<br>7,07 (t, J =7,5 Гц, 1H), 6,41 (d, J<br>=5,0Hz, 1H), 6,00 (s, 1H), 5,76 (d, J=<br>17,5Hz, 1H), 5,56 (d, J= 17,5Hz, 1H),<br>3,74(s, 3H), 2,91-2,88 (m, 1H), 2,79-<br>2,72 (m, 2H), 2,71-2,64(m, 1H), 1,93-<br>1,85 (m, 2H), 1,56-1,43(m, 3H), 1,24-<br>1,08(m, 12H), 0,82 (t, J =7,2Hz, 3H)                                               | 434,26 | 433,35 | Соединение<br>синтезировали<br>посредством<br>способа А с<br>применением 3-<br>гексил-1-<br>циклогептанона и<br>пиридил-2-<br>метокси-3-<br>бензилбромада в<br>качестве<br>соответствующих<br>структурных<br>элементов |
| 5-[(3-<br>карбоксифени<br>л)метил]-7-<br>гексил-<br>5Н,6Н,7Н,8Н,<br>9Н,10Н-<br>циклогепта[b]<br>индол-4-<br>карбоновая<br>кислота       | 500MHz-DMSO d6 : 12,8 (br s, 1H),<br>7,74 (d, J =7,5Hz, 1H), 7,68 (d, J<br>=7,5Hz, 1H), 7,46(s, 1H), 7,39 (d, J<br>=9,0Hz, 1H), 7,35 (t, J =7,5 Гц, 1H),<br>7,05 (t, J =7,5 Гц, 1H), 6,96 (d, J<br>=7,0Hz, 1H), 6,00 (s, 1H), 5,81 (d, J=<br>17,5Hz, 1H), 5,61 (d, J= 17,5Hz, 1H),<br>3,74(s, 3H), 2,91-2,89 (m, 1H), 2,81<br>(d, J = 15Hz, 1H), 2,71-2,64(m, 1H),<br>1,92-1,87 (m, 2H), 1,56-1,43(m, 3H),<br>1,24-1,08(m, 12H), 0,82 (t, J =7,2Hz,<br>3H) | 447,24 | 446,48 | Соединение<br>синтезировали<br>посредством<br>способа А с<br>применением 3-<br>гексил-1-<br>циклогептанона и<br>3-карбоксил-1-<br>бензилбромада в<br>качестве<br>соответствующих<br>структурных<br>элементов           |

|                                                                                                 |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                            |        |              |                                                                                                                                                                          |
|-------------------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------|--------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 5-[(4-карбамоилфенил)метил]-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновая кислота | 400MHz-DMSO d6 : 12,8 (br s, 1H), 7,83(s, 1H), 7,71 (d, J =7,6Hz, 2H), 7,67 (d, J =7,6Hz, 2H), 7,39 (d, J =7,5Hz, 1H), 7,26 (s, 1H), 7,04 (t, J =8,0 Гц, 1H), 6,79(d, J =8,0Hz, 2H), 6,00 (s, 1H), 5,81 (d, J= 17,6Hz, 1H), 5,63 (d, J= 17,6Hz, 1H), 2,93-2,81 (m, 2H), 2,72-2,67(m, 1H), 2,60-2,50(m, 2H), 1,93-1,85 (m, 2H), 1,56-1,43(m, 3H), 1,24-1,06(m, 10H), 0,81 (t, J =7,2Hz, 3H) | 446,26 | 447,1        | Соединение синтезировали посредством способа А с применением 3-гексил-1-циклогептанона и 1-карбоксиламид-3-бензилбромид в качестве соответствующих структурных элементов |
| 5-[(2-карбамоилфенил)метил]-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновая кислота | 400MHz-DMSO d6 : 12,8 (br s, 1H), 7,85(s, 1H), 7,69 (d, J =7,2Hz, 1H), 7,54 (d, J =6,4Hz, 2H), 7,47 (s, 1H), 7,38 (d, J =6,4Hz, 1H), 7,23-7,14 (m, 2H), 7,05 (t, J =8,0Hz, 2H), 5,92-5,88(m, 3H), 2,93-2,88 (m, 1H), 2,74-2,65 (m, 2H), 2,45-2,33(m, 1H), 1,93-1,85 (m, 2H), 1,56-1,43(m, 2H), 1,43-1,40(m, 1H), 1,24-1,06(m, 10H), 0,82 (t, J =7,2Hz, 3H)                                 | 446,26 | 447,1        | Соединение синтезировали посредством способа А с применением 3-гексил-1-циклогептанона и 1-карбоксиламид-2-бензилбромид в качестве соответствующих структурных элементов |
| 7-гексил-5-[(4-метилфенил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновая кислота     | 400MHz-DMSO d6 : 12,82 (br s, 1H), 7,65(d, J =7,6Hz, 1H), 7,36 (d, J =7,6Hz, 1H), 7,05-6,99(m, 3H), 6,63 (d, J=8Hz, 1H), 5,70 (d, J= 17,6Hz, 1H), 5,52 (d, J= 17,6Hz, 1H), 2,92-2,83 (m 2H), 2,71-2,65 (m, 1H), 2,52-2,46(m, 1H), 2,20 (s, 3H), 1,96-1,82 (m, 2H), 1,56-1,45(m, 2H), 1,43-1,35 (m,1H), 1,23-0,98(m, 10H), 0,83 (t, J =7,2Hz, 3H)                                           | 417,27 | 416,57 [МН]- | Соединение синтезировали посредством способа А с применением 3-гексил-1-циклогептанона и 4-метил-1-бензилбромид в качестве                                               |

|                                                                                                                                |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                           |        |        |                                                                                                                                                                                                          |
|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------|--------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
|                                                                                                                                |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                           |        |        | соответствующих<br>структурных<br>элементов                                                                                                                                                              |
| 5-[(4-<br>цианофенил)м<br>етил]-7-<br>гексил-<br>5Н,6Н,7Н,8Н,<br>9Н,10Н-<br>циклогепта[b]<br>индол-4-<br>карбоновая<br>кислота | 400MHz-DMSO d6 : 12,82 (br s, 1H),<br>7,70(m, 3H), 7,41 (d, J =7,6Hz, 1H),<br>7,06(t, J=7,2Hz, 1H), 6,93 (d, J=8,4Hz,<br>2H), 5,85 (d, J= 17,6Hz, 1H), 5,65 (d,<br>J= 17,6Hz, 1H), 2,93-2,86 (m, 1H),<br>2,76-2,65 (m, 2H), 2,48-2,44(m, 1H),<br>1,94-1,84 (m, 2H), 1,56-1,45(m, 2H),<br>1,43-1,35 (m, 1H), 1,23-0,98(m, 10H),<br>0,85 (t, J =7,2Hz, 3H)                  | 428,25 | 429,24 | Соединение<br>синтезировали<br>посредством<br>способа А с<br>применением 3-<br>гексил-1-<br>циклогептанона и<br>4-циано-1-<br>бензилбромида в<br>качестве<br>соответствующих<br>структурных<br>элементов |
| 5-[(2-<br>цианофенил)м<br>етил]-7-<br>гексил-<br>5Н,6Н,7Н,8Н,<br>9Н,10Н-<br>циклогепта[b]<br>индол-4-<br>карбоновая<br>кислота | 400MHz-DMSO d6 : 12,8 (br s, 1H),<br>7,85 (d, J =6,4Hz, 1H), 7,71 (d, J<br>=7,2Hz, 1H), 7,48-7,38 (m, 3H), 7,07<br>(t, J =8,0 Гц, 1H), 6,17 (d, J =8,0Hz,<br>1H), 6,00 (d, J= 17,5Hz, 1H), 5,80 (d,<br>J= 17,5Hz, 1H), 2,96-2,89 (m, 1H),<br>2,77-2,65 (m, 2H), 2,55-2,49 (m, 1H)<br>1,92-1,87 (m, 2H), 1,58-1,43(m, 3H),<br>1,24-1,08(m, 10H), 0,82 (t, J =7,2Hz,<br>3H) | 428,25 | 429,17 | Соединение<br>синтезировали<br>посредством<br>способа А с<br>применением 3-<br>гексил-1-<br>циклогептанона и<br>1-циано-2-<br>бензилбромида в<br>качестве<br>соответствующих<br>структурных<br>элементов |

|                                                                                             |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                      |        |        |                                                                                                                                                                  |
|---------------------------------------------------------------------------------------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------|--------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 7-гексил-5-[(2-метилфенил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновая кислота | 400MHz-DMSO d6 : 12,8 (br s, 1H), 7,68(d, J =7,2Hz, 1H), 7,35 (d, J =7,2Hz, 1H), 7,14 (d, J =7,6Hz, 1H), 7,04 (t, J =8Hz, 1H), 6,88 (t, J =8Hz, 1H), 5,77-5,73 (m, 2H), 5,54 (d, J =18,4Hz, 1H), 2,93 (dd, J = 14,8Hz, 6Hz, 1H), 2,77-2,67 (m, 2H), 2,50-2,44(m, 1H), 2,34 (s, 3H), 1,94-1,82 (m, 2H), 1,59-1,43(m, 3H), 1,26-0,98(m, 10H), 0,82 (t, J =7,2Hz, 3H)                                   | 417,27 | 418,1  | Соединение синтезировали посредством способа А с применением 3-гексил-1-циклогептанона и 2-метил-1-бензилбромид в качестве соответствующих структурных элементов |
| 5-[(2-фторфенил)метил]-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновая кислота  | 400MHz-DMSO d6 : 12,8 (br s, 1H), 7,69(d, J =7,2Hz, 1H), 7,41 (d, J =7,2Hz, 1H), 7,23-7,14 (m, 2H), 7,06 (t, J =8Hz, 1H), 6,96 (t, J =8Hz, 1H), 6,14 (t, J =8Hz, 1H), 5,81 (d, J =18,0Hz, 1H), 5,64 (d, J =18,0Hz, 1H), 2,91 (dd, J = 14,8Hz, 6Hz, 1H), 2,81 (d, J = 16,0Hz, 1H), 2,72-2,67(m, 1H), 2,50-2,44(m, 1H), 1,94-1,86 (m, 2H), 1,57-1,43(m, 3H), 1,23-1,02(m, 10H), 0,82 (t, J =7,2Hz, 3H) | 421,24 | 422,29 | Соединение синтезировали посредством способа А с применением 3-гексил-1-циклогептанона и 2-фтор-1-бензилбромид в качестве соответствующих структурных элементов  |
| 5-[(4-фторфенил)метил]-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновая кислота  | 400MHz-DMSO d6 : 12,8 (br s, 1H), 7,68(d, J =7,2Hz, 1H), 7,35 (d, J =7,2Hz, 1H), 7,14 (d, J =7,6Hz, 1H), 7,04 (t, J =8Hz, 1H), 6,88 (t, J =8Hz, 1H), 5,77-5,73 (m, 2H), 5,54 (d, J =18,4Hz, 1H), 2,93-2,81 (m, 2H), 2,71-2,65 (m, 1H), 2,50-2,44(m, 1H), 2,34 (s, 3H), 1,94-1,82 (m, 2H), 1,59-1,43(m, 3H), 1,24-0,96(m, 10H), 0,83 (t, J =7,2Hz, 3H)                                                | 421,24 | 420,46 | Соединение синтезировали посредством способа А с применением 3-гексил-1-циклогептанона и 4-фтор-1-бензилбромид в качестве                                        |

|                                                                                          |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                 |        |       | соответствующих<br>структурных<br>элементов                                                                                                                       |
|------------------------------------------------------------------------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------|-------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 9-[(3-карбамоилфенил)метил]-2-гексил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновая кислота | 400MHz-DMSO d6 : 12,80(br s, 1H), 7,87 (br s, 1H), 7,65 (d, J=8Hz, 1H), 7,51 (d, J=8Hz, 1H), 7,49 (s, 1H), 7,39 (d, J=7,2Hz, 1H), 7,30 (br s, 1H), 7,24 (t, J=8Hz, 1H), 7,04 (t, J=8Hz, 1H), 6,64 (d, J=8Hz, 1H), 5,68 (d, J=17Hz, 1H), 5,62 (d, J=17Hz, 1H) 2,84-2,77 (m, 2H), 2,67-2,63 (m, 1H), 2,27-2,21 (m, 1H), 1,98-1,94 (m, 1H), 1,83 (br s, 1H), 1,46-1,24(m, 1H), 0,85 (t, J=7Hz, 3H) | 432,24 | 433,1 | Соединение синтезировали посредством способа А с применением 3-гексил-1-циклогексанона и 3-циано-1-бензилбромида в качестве соответствующих структурных элементов |
| 9-[(3-цианофенил)метил]-2-гексил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновая кислота     | 400MHz-DMSO d6 : 12,81(br s, 1H), 7,64 (t, J=8Hz, 2H), 7,42 (t, J=8Hz, 2H), 7,23 (br s, 1H), 7,06 (t, J=8Hz, 1H), 6,93 (d, J=8Hz, 1H), 5,68 (d, J=18Hz, 1H), 5,60 (d, J=18Hz, 1H), 2,83-2,77 (m, 2H), 2,66-2,60 (m, 1H), 2,23 (dd, J=16,8, 8,8 Гц, 1H), 1,98-1,90 (m, 1H), 1,90-1,80 (m, 1H), 1,48-1,25(m, 1H), 0,85 (t, J=6,4 Гц, 3H)                                                          | 414,23 | 415,1 | Соединение синтезировали посредством способа А с применением 3-гексил-1-циклогексанона и 3-циано-1-бензилбромида в качестве соответствующих структурных элементов |

|                                                                                         |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                    |        |        |                                                                                                                                                                  |
|-----------------------------------------------------------------------------------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------|--------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 9-[(3-карбоксифенил)метил]-2-гексил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновая кислота | 400MHz-DMSO d6 : 12,80(br s, 1H), 8,30 (br s, 1H), 7,70 (d, J =7,6Hz, 1H), 7,52-7,49 (m, 2H), 7,31 (d, J = 7,2Hz, 1H), 7,27 ( t, J= 8Hz, 1H), 6,98 ( t, J=8Hz, 1H), 6,86 (d, J=7,2Hz, 1H), 5,76 ( d, J= 17,2Hz, 1H), 5,66( d, J= 17,2Hz, 1H) 2,81-2,74 (m, 2H), 2,67-2,63 (m, 1H), 2,23-2,17 (m, 1H), 1,98-1,93 (m, 1H), 1,81 (br s, 1H), 1,46-1,23(m, 1H), 0,84 (t, J =6,4Hz, 3H) | 433,23 | 434,1  | Соединение синтезировали посредством способа А с применением 3-гексил-1-циклогексанона и 3-циано-1-бензилбромид в качестве соответствующих структурных элементов |
| 9-[(3-фторфенил)метил]-2-гексил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновая кислота     | 1H-ЯМР (400MHz-DMSO d6) : 12,80(br s, 1H), 7,62 (d, J =7,6Hz, 1H), 7,41 (d, J = 7,6Hz, 1H), 7,25-7,22 (m, 1H), 7,27-6,96 ( m, 2H), 6,52-6,49(m, 2H), 5,65 ( d, J= 17,2Hz, 1H), 5,58 ( d, J= 17,2Hz, 1H) 2,84-2,76 (m, 2H), 2,67-2,60 (m, 1H), 2,27-2,21 (m, 1H), 1,98-1,95 (m, 1H), 1,84 (br s, 1H), 1,46-1,23(m, 1H), 0,85 (t, J =6,4Hz, 3H)                                      | 407,23 | 408,1  | Соединение синтезировали посредством способа А с применением 3-гексил-1-циклогексанона и 3-фтор-1-бензилбромид в качестве соответствующих структурных элементов  |
| 2-гексил-9-[(пиридин-3-ил)метил]-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновая кислота    | 1H-ЯМР (400MHz-DMSO d6) : 8,35-8,33 (m, 1H), 8,12(s, 1H), 7,62 (d, J =7,6Hz, 1H), 7,41 (d, J = 7,6Hz, 1H), 7,25-7,22 (m, 1H), 7,27-6,96 ( m, 2H), 6,52-6,49(m, 2H), 5,65 ( d, J= 17,2Hz, 1H), 5,58 ( d, J= 17,2Hz, 1H) 2,84-2,76 (m, 2H), 2,67-2,60 (m, 1H), 2,27-2,21 (m, 1H), 1,98-1,95 (m, 1H), 1,84 (br s, 1H), 1,46-1,23(m, 1H), 0,85 (t, J =6,4Hz, 3H)                       | 390,23 | 391,25 | Соединение синтезировали посредством способа А с применением 3-гексил-1-циклогексанона и пиридил-3-бензилбромид в качестве                                       |

|                                                                                        |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                    |        |       |                                                                                                                                                                    |
|----------------------------------------------------------------------------------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------|-------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
|                                                                                        |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                    |        |       | соответствующих<br>структурных<br>элементов                                                                                                                        |
| 2-гексил-9-[(3-метилфенил)метил]-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновая кислота   | <sup>1</sup> H-ЯМР (400MHz-DMSO d <sub>6</sub> ):<br>12,80(br s, 1H), 7,60 (d, J =6,8Hz, 1H), 7,40 (d, J = 6,8Hz, 1H), 7,07-7,00 (m, 2H), 6,96-6,95 (m, 1H), 6,70(s, 1H), 6,38(d, J = 6,8Hz, 1H), 5,59 ( d, J= 17,2Hz, 1H), 5,52 ( d, J= 17,2Hz, 1H) 2,86-2,76 (m, 2H), 2,67-2,63 (m, 1H), 2,29-2,22 (m, 1H), 2,18(s, 3H), 1,98-1,95 (m, 1H), 1,83 (br s, 1H), 1,46-1,25(m, 11H), 0,85 (t, J =6,4Hz, 3H)                                           | 403,25 | 404,1 | Соединение синтезировали посредством способа А с применением 3-гексил-1-циклогексанона и 3-метил-1-бензилбромид в качестве соответствующих структурных элементов   |
| 2-гексил-9-[(3-метоксифенил)метил]-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновая кислота | <sup>1</sup> H-ЯМР (400MHz-DMSO d <sub>6</sub> ):<br>12,80(br s, 1H), 7,62 (dd, J =7,6, 0,8Hz, 1H), 7,41 (dd, J = 7,6, 0,8Hz, 1H), 7,10(t, J = 6,0Hz, 1H), 7,03(t, J= 6,0Hz, 1H), 6,72-6,70(m, 2H), 6,26(s, 1H), 6,25( d, J = 7,6Hz, 1h), 5,60 ( d, J= 17,2Hz, 1H), 5,54 ( d, J= 17,2Hz, 1H) , 3,62(s, 3H), 2,85-2,76 (m, 2H), 2,64-2,60 (m, 1H), 2,28-2,22 (m, 1H), 1,98-1,95 (m, 1H), 1,83 (br s, 1H), 1,45-1,25(m, 11H), 0,87 (t, J =6,4Hz, 3H) | 419,25 | 420,1 | Соединение синтезировали посредством способа А с применением 3-гексил-1-циклогексанона и 3-метокси-1-бензилбромид в качестве соответствующих структурных элементов |

|                                                                                               |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                        |        |       |                                                                                                                                                                      |
|-----------------------------------------------------------------------------------------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------|-------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 9-[(3-хлорфенил)метил]-2-гексил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновая кислота           | <sup>1</sup> H-ЯМР (400 МГц, DMSO-d <sub>6</sub> ): $\delta$ 12,90 (s, 1H), 7,72-7,69 (m, 2H), 7,14-7,065 (m, 3H), 6,86 (s, 1H), 6,57 (d, J = 7,20 Гц, 1H), 5,63 (d, J = 17,2 Гц, 1H), 2,87-2,84 (m, 1H), 2,78-2,71 (m, 2H), 2,28-2,21 (m, 1H), 2,06-2,01 (m, 1H), 1,89 (br s, 1H), 1,58-1,26 (m, 1H), 1,08-1,13 (m, 11H), 0,88 (t, J = 7,20 Гц, 3H).                  | 423,20 | 424,1 | Соединение синтезировали посредством способа А с применением 3-гексил-1-циклогексанона и 3-хлор-1-бензилбромида в качестве соответствующих структурных элементов     |
| 2-гексил-9-[(3-гидроксифенил)метил]-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновая кислота       |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                        | 405,23 |       | Соединение синтезировали посредством способа А с применением 3-гексил-1-циклогексанона и 3-гидрокси-1-бензилбромида в качестве соответствующих структурных элементов |
| 2-гексил-9-[(2-метоксипиридин-4-ил)метил]-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновая кислота | 400MHz-DMSO d <sub>6</sub> : 12,8 (br s, 1H), 7,96(d, J =4,8Hz, 1H), 7,41 (d, J =8,0Hz, 1H), 7,27 (d, J =8,0Hz, 1H), 6,95 (t, J =8Hz, 1H), 6,44 (d, J =4,4Hz, 1H), 5,95 (s, 1H), 5,84 (d, J = 17,6Hz, 1H), 5,70 (d, J = 17,6Hz, 1H), 3,73 (s, 3H), 2,76-2,64 (m, 3H), 2,17-2,10 (m, 1H), 1,96-1,92 (m, 1H), 1,78 (br s, 1H), 1,44-1,24(m, 11H), 0,85 (t, J =7,2Hz, 3H) | 420,24 | 421,1 | Соединение синтезировали посредством способа А с применением 3-гексил-1-циклогексанона и 2-метокси-4-бензилпиридина в качестве                                       |

|                                                                                                                     |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                             |        |       | соответствующих<br>структурных<br>элементов                                                                                                                                                                    |
|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------|-------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 9-[(3-<br>карбоксифени<br>л)метил]-2-<br>гексил-2,3,4,9-<br>тетрагидро-<br>1Н-карбазол-<br>8-карбоновая<br>кислота  | 400MHz-DMSO d6 : 12,8 (br s, 1H),<br>7,73(d, J =7,2Hz, 1H), 7,62 (d, J<br>=7,2Hz, 1H), 7,44 (s, 1H), 7,40 (d, J<br>=7,2Hz, 1H), 7,33 (t, J =8,0Hz, 1H),<br>7,04 (t, J =8Hz, 1H), 6,88 (d, J<br>=7,2Hz, 1H), 5,70 (d, J = 17,6Hz,<br>1H), 5,63 (d, J = 17,6Hz, 1H), 2,83-<br>2,77 (m, 2H), 2,68-2,64 (m, 1H), 2,26-<br>2,22(m, 1H), 1,98-1,95 (m, 1H), 1,90-<br>1,85 (m, 1H), 1,49-1,33(m, 5H), 1,30-<br>1,20(m, 6H), 0,84 (t, J =7,2Hz, 3H) | 433,23 | 434   | Соединение<br>синтезировали<br>посредством<br>способа А с<br>применением 3-<br>гексил-1-<br>циклогексанона и<br>3-карбокси-1-<br>бензилбромида в<br>качестве<br>соответствующих<br>структурных<br>элементов    |
| 9-[(4-<br>карбамоилфен<br>ил)метил]-2-<br>гексил-2,3,4,9-<br>тетрагидро-<br>1Н-карбазол-<br>8-карбоновая<br>кислота | 400MHz-DMSO d6 : 12,81(br s, 1H),<br>7,83 (s, 1H), 7,68 (t, J=8Hz,2H), 7,62<br>(t, J=8Hz,2H), 7,42 (d, J=6,0Hz, 2H),<br>7,26 (br s, 1H), 7,04 ( t, J= 8Hz, 1H),<br>6,93 (d, J=8Hz, 1H), 5,68( d, J= 18Hz,<br>1H), 5,60 (d, J= 18Hz, 1H), 2,84-2,78<br>(m, 2H), 2,67-2,62 (m, 1H), 2,23 ( dd,<br>J = 16,0, 8,8 Гц,1H), 1,98-1,94 (m,<br>1H), 1,83 (br s, 1H), 1,47-1,25(m,<br>1H), 0,85 (t, J =6,4 Гц, 3H)                                   | 432,24 | 433,1 | Соединение<br>синтезировали<br>посредством<br>способа А с<br>применением 3-<br>гексил-1-<br>циклогексанона и<br>4-карбоксамид-1-<br>бензилбромида в<br>качестве<br>соответствующих<br>структурных<br>элементов |

|                                                                                          |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                         |        |       |                                                                                                                                                                          |
|------------------------------------------------------------------------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------|-------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 9-[(2-карбамоилфенил)метил]-2-гексил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновая кислота | 400MHz-DMSO d6 : 12,7(br s, 1H), 7,84 (s, 1H), 7,63(d, J = 7,2Hz, 1H), 7,52 (d, J = 7,2Hz, 1H), 7,46 (s, 1H), 7,41 (d, J=7,2Hz, 2H), 7,20 (t, J = 7,2Hz, 1H), 7,12 (t, J= 6,8Hz, 1H), 7,05 (t, J= 6,8Hz, 1H), 5,88-5,77 (m, 2H), 2,81-2,75 (m, 1H), 2,68-2,62 (m, 2H), 2,14-2,08 (m, 1H), 1,98-1,94 (m, 1H), 1,78 (br s, 1H), 1,50-1,22(m, 1H), 0,84 (t, J =6,4 Гц, 3H) | 432,24 | 433,1 | Соединение синтезировали посредством способа А с применением 3-гексил-1-циклогексанона и 2-карбоксиламид-1-бензилбромид в качестве соответствующих структурных элементов |
| 2-гексил-9-[(4-метилфенил)метил]-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновая кислота     | 400MHz-DMSO d6 : 12,8 (br s, 1H), 7,60 (d, J =8,0Hz, 1H), 7,39 (d, J =8,0Hz, 1H), 7,04-6,98 (m, 3H), 6,60 (d, J =8,0Hz, 1H), 5,58 (d, J = 17,6Hz, 1H), 5,51 (d, J = 17,6Hz, 1H), 2,83-2,77 (m, 2H), 2,68-2,64 (m, 1H), 2,28-2,19(m, 4H), 1,98-1,95 (m, 1H), 1,81 (br s, 1H), 1,46-1,25(m, 1H), 0,85 (t, J =7,2Hz, 3H)                                                   | 403,25 | 404,1 | Соединение синтезировали посредством способа А с применением 3-гексил-1-циклогексанона и 4-метил-1-бензилбромид в качестве соответствующих структурных элементов         |
| 9-[(4-цианофенил)метил]-2-гексил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновая кислота     | 400MHz-CDCl3 : 12,8 (br s, 1H), 7,73 (dd, J =8,0, 1,2Hz, 1H), 7,39 (d, J =8,0Hz, 1H), 7,13 (t, J = 8,0Hz, 1H), 6,86 (d, J =8,0Hz, 1H), 5,72 (d, J = 18,4Hz, 1H), 5,64 (d, J = 18,4Hz, 1H), 2,88-2,80 (m, 1H), 2,74-2,67 (m, 2H), 2,24-2,18(m, 1H), 2,06-2,03(m, 1H), 1,89 (br s, 1H), 1,46-1,25(m, 1H), 0,88 (t, J =7,2Hz, 3H)                                          | 414,23 | 415,1 | Соединение синтезировали посредством способа А с применением 3-гексил-1-циклогексанона и 4-циано-1-бензилбромид в качестве                                               |

|                                                                                                                 |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                 |        |       | соответствующих<br>структурных<br>элементов                                                                                                                      |
|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------|-------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 9-[(2-<br>цианофенил)м<br>етил]-2-<br>гексил-2,3,4,9-<br>тетрагидро-<br>1Н-карбазол-<br>8-карбоновая<br>кислота | 400MHz-CDCl <sub>3</sub> : 12,8 (br s, 1H), 7,74 (t, J=7,6Hz, 2H), 7,66-7,64 (m, 1H), 7,34-7,26(m, 2H), 7,13 (t, J = 8,0Hz, 1H), 6,36 (d, J=8,0Hz, 1H), 5,88 (d, J = 17,6Hz, 1H), 5,82 (d, J = 17,6Hz, 1H), 2,88-2,82 (m, 1H), 2,74-2,67 (m, 2H), 2,22-2,16(m, 1H), 2,06-2,00(m, 1H), 1,89 (br s, 1H), 1,46-1,27 (m, 1H), 0,88 (t, J=7,2Hz, 3H) | 414,23 | 415,1 | Соединение синтезировали посредством способа А с применением 3-гексил-1-циклогексанона и 2-циано-1-бензилбромид в качестве соответствующих структурных элементов |
| 2-гексил-9-[(2-<br>метилфенил)м<br>етил]-2,3,4,9-<br>тетрагидро-<br>1Н-карбазол-<br>8-карбоновая<br>кислота     | 400MHz-CDCl <sub>3</sub> : 12,8 (br s, 1H), 7,73 (d, J=8,0, 1H), 7,65 (d, J=8,0Hz, 1H), 7,13-7,04 (m, 3H), 6,88 (t, J = 8,0Hz, 1H), 5,89 (d, J=8,0Hz, 1H), 5,58-5,55 (m, 2H), 2,89-2,83 (m, 1H), 2,75-2,67 (m, 2H), 2,36(s, 3H), 2,25-2,19(m, 1H), 2,06-2,00(m, 1H), 1,88 (br s, 1H), 1,54-1,27(m, 1H), 0,88 (t, J=7,2Hz, 3H)                   | 403,25 | 404,1 | Соединение синтезировали посредством способа А с применением 3-гексил-1-циклогексанона и 2-метил-1-бензилбромид в качестве соответствующих структурных элементов |
| 9-[(2-<br>фторфенил)ме<br>тил]-2-гексил-<br>2,3,4,9-<br>тетрагидро-<br>1Н-карбазол-                             | 400MHz-CDCl <sub>3</sub> : 12,8 (br s, 1H), 7,71 (dd, J=8,0, 2,4Hz, 2H), 7,16-7,08 (m, 2H), 7,00(t, J = 8,8Hz, 1H), 6,86 (t, J = 8,8Hz, 1H), 6,25 (t, J = 8,0Hz, 1H), 5,71 (d, J=17,6Hz, 1H), 5,65 (d, J =17,6Hz, 1H), 2,88-2,67 (m, 3H), 2,27-2,19(m, 1H), 2,05-2,00(m, 1H),                                                                   | 407,23 | 408,1 | Соединение синтезировали посредством способа А с применением 3-гексил-1-циклогексанона и                                                                         |

|                                                                                                 |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                      |        |       |                                                                                                                                                                 |
|-------------------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------|-------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 8-карбоновая кислота                                                                            | 1,88 (br s, 1H), 1,54-1,27(m, 11H), 0,88 (t, J =7,2Hz, 3H)                                                                                                                                                                                                                                                                                                                           |        |       | 2-фтор-1-бензилбромида в качестве соответствующих структурных элементов                                                                                         |
| 9-[(3-карбамоилфенил)метил]-2-(2-фенилэтил)-2,3,4,9-тетрагидро-1H-карбазол-8-карбоновая кислота | 400MHz-DMSO d6 : 12,80(br s, 1H), 7,88 (br s, 1H), 7,66 (d, J =8Hz, 1H), 7,61 (d, J =8Hz, 1H), 7,52 (br s, 1H), 7,41 (d, J = 7,2Hz, 1H), 7,31 (br s, 1H), 7,27-7,22 (m,3H), 7,18-7,14 (m,3H), 7,04 ( t, J=8Hz, 1H), 6,66 (d, J=8Hz, 1H), 5,66( s, 2H), 2,91-2,86(m, 1H), 2,82-2,72 (m, 1H), 2,66-2,63(m, 3H) 2,35-2,30 (m, 1H), 1,82 (br s, 1H), 1,76-1,63 (m, 2H), 1,55-1,48(m, 1H) | 452,21 | 453,1 | Соединение синтезировали посредством способа А с применением 3-этил-1-циклогексанона и 3-циано-1-бензилбромида в качестве соответствующих структурных элементов |
| 9-[(3-цианофенил)метил]-2-(2-фенилэтил)-2,3,4,9-тетрагидро-1H-карбазол-8-карбоновая кислота     | 400MHz-DMSO d6 : 12,87(br s, 1H), 7,67 (d, J=7,6Hz, 1H), 7,62 (d, J=7,6Hz, 1H), 7,45-7,40 (m, 2H), 7,27-7,23 ( m, 3H), 7,18-7,13 (m, 3H), 7,05 ( t, J= 8Hz, 1H), 6,94 (d, J=8Hz, 1H), 5,66( s, 2H), 2,90-2,78 (m, 2H), 2,72-2,62 (m, 3H), 2,35-2,30 (m, 1H), 2,03-2,00 (m, 1H), 1,83(br s, 1H), 1,78-1,64 (m, 2H), 1,56-1,48 (m, 1H)                                                 | 434,20 | 435,1 | Соединение синтезировали посредством способа А с применением 3-этил-1-циклогексанона и 3-циано-1-бензилбромида в качестве соответствующих структурных элементов |
| 9-[(3-карбамоилфенил)метил]-4-(2-                                                               | 400MHz-DMSO d6 : 12,80(br s, 1H), 7,88 (br s, 1H), 7,63 (d, J =8Hz, 2H), 7,55 (d, J = 7,2Hz, 1H), 7,50 (br s, 1H), 7,34-7,16 (m, 8H), 7,00 ( t,                                                                                                                                                                                                                                      | 452,21 | 453,1 | Соединение синтезировали посредством способа А с                                                                                                                |

|                                                                                                                            |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  |        |       |                                                                                                                                                                                                          |
|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------|-------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| фенилэтил)-<br>2,3,4,9-<br>тетрагидро-<br>1Н-карбазол-<br>8-карбоновая<br>кислота                                          | J=8Hz, 1H), 6,67 (d, J=8Hz, 1H), 5,67<br>(d, J= 17Hz, 1H), 5,57( d, J= 17Hz,<br>1H), 3,04-3,00(m, 1H), 2,78-2,67(m,<br>3H), 2,59-2,54(m, 1H) 2,15-2,02 (m,<br>1H), 1,90-1,85 (m, 4H)                                                                                                                                                                                                                                             |        |       | применением 3-<br>этил-1-<br>циклогексанона и<br>3-циано-1-<br>бензилбромада в<br>качестве<br>соответствующих<br>структурных<br>элементов                                                                |
| 9-[(3-<br>цианофенил)м<br>етил]-4-(2-<br>фенилэтил)-<br>2,3,4,9-<br>тетрагидро-<br>1Н-карбазол-<br>8-карбоновая<br>кислота | 400MHz-DMSO d6 : 12,81(br s, 1H),<br>7,64 (d, J=8Hz,1H), 7,55 (d,<br>J=8Hz,1H), 7,41 (t, J=8Hz, 1H), 7,36-<br>7,24 ( m, 6H), 7,18 ( m, 1H), 7,01 ( t,<br>J= 8Hz, 1H), 6,94 (d, J=8Hz, 1H),<br>5,68( d, J= 18Hz, 1H), 5,60 (d, J=<br>18Hz, 1H), 3,03-2,90 (m, 1H), 2,81-<br>2,74 ( m, 1H), 2,72-2,63 (m, 2H), 2,57-<br>2,55 (m ,1H), 2,13-2,05 (m, 1H),1,93-<br>1,80 (m, 5H)                                                      | 434,20 | 435,1 | Соединение<br>синтезировали<br>посредством<br>способа А с<br>применением 3-<br>этил-1-<br>циклогексанона и<br>3-циано-1-<br>бензилбромада в<br>качестве<br>соответствующих<br>структурных<br>элементов   |
| 9-[(3-<br>карбамоилфен<br>ил)метил]-2-<br>пропил-<br>2,3,4,9-<br>тетрагидро-<br>1Н-карбазол-<br>8-карбоновая<br>кислота    | 400MHz-DMSO d6 : 12,80(br s, 1H),<br>7,87 (br s, 1H), 7,64 (d, J =8Hz, 1H),<br>7,62 (d, J =8Hz, 1H), 7,49 ( s, 1H),<br>7,39 (d, J = 7,2Hz, 1H), 7,30 (br s,<br>1H), 7,24 ( t, J= 8Hz, 1H), 7,03 ( t,<br>J=8Hz, 1H), 6,65 (d, J=8Hz, 1H), 5,68<br>( d, J= 17Hz, 1H), 5,62( d, J= 17Hz,<br>1H) 2,84-2,77 (m, 2H), 2,70-2,60(m,<br>1H), 2,27-2,21 (m, 1H), 1,98-1,94 (m,<br>1H), 1,83 (br s, 1H), 1,46-1,24(m, 5H),<br>0,85 (m, 3H) | 390,19 | 391,1 | Соединение<br>синтезировали<br>посредством<br>способа А с<br>применением 3-<br>пропил-1-<br>циклогексанона и<br>3-циано-1-<br>бензилбромада в<br>качестве<br>соответствующих<br>структурных<br>элементов |

|                                                                                                                         |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                           |        |       |                                                                                                                                                                                                          |
|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------|-------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 9-[(3-<br>цианофенил)м<br>етил]-2-<br>пропил-<br>2,3,4,9-<br>тетрагидро-<br>1Н-карбазол-<br>8-карбоновая<br>кислота     | 400MHz-DMSO d6 : 12,81(br s, 1H),<br>7,65 (t, J=8Hz,2H), 7,42 (t, J=8Hz,<br>2H), 7,23 (br s, 1H), 7,06 ( t, J= 8Hz,<br>1H), 6,92 (d, J=8Hz, 1H), 5,67( d, J=<br>13Hz, 1H), 5,60 (d, J= 13Hz, 1H),<br>2,83-2,77 (m, 2H), 2,66-2,60 (m, 1H),<br>2,27-2,21 ( m, 1H), 1,98-1,95 (m, 1H),<br>1,90-1,80 (m, 1H), 1,48-1,34(m, 5H),<br>0,85 (m, 3H)                                                                                              | 372,18 | 373,1 | Соединение<br>синтезировали<br>посредством<br>способа А с<br>применением 3-<br>пропил-1-<br>циклогексанона и<br>3-циано-1-<br>бензилбромиды в<br>качестве<br>соответствующих<br>структурных<br>элементов |
| 2-бутил-9-[(3-<br>карбамоилфен<br>ил)метил]-<br>2,3,4,9-<br>тетрагидро-<br>1Н-карбазол-<br>8-карбоновая<br>кислота      | 400MHz-DMSO d6 : 12,80(br s, 1H),<br>7,87 (br s, 1H), 7,64 (d, J =8Hz, 1H),<br>7,62 (d, J =8Hz, 1H), 7,49 ( s, 1H),<br>7,39 (d, J = 7,2Hz, 1H), 7,30 (br s,<br>1H), 7,25 ( t, J= 8Hz, 1H), 7,04 ( t,<br>J=8Hz, 1H), 6,64 (d, J=8Hz, 1H), 5,68<br>( d, J= 17Hz, 1H), 5,62( d, J= 17Hz,<br>1H) 2,84-2,77 (m, 2H), 2,70-2,60(m,<br>1H), 2,27-2,21 (m, 1H), 1,98-1,94 (m,<br>1H), 1,83 (br s, 1H), 1,46-1,24(m, 7H),<br>0,85 (t, J=7,2Hz, 3H) | 404,21 | 405,1 | Соединение<br>синтезировали<br>посредством<br>способа А с<br>применением 3-<br>бутил-1-<br>циклогексанона и<br>3-циано-1-<br>бензилбромиды в<br>качестве<br>соответствующих<br>структурных<br>элементов  |
| 9-[(3-<br>карбамоилфен<br>ил)метил]-2-<br>пентил-<br>2,3,4,9-<br>тетрагидро-<br>1Н-карбазол-<br>8-карбоновая<br>кислота | 400MHz-DMSO d6 : 12,80(br s, 1H),<br>7,87 (br s, 1H), 7,66-7,61 (m, 2H),<br>7,48 ( s, 1H), 7,40 (d, J = 7,2Hz, 1H),<br>7,30 (br s, 1H), 7,24 ( t, J= 8Hz, 1H),<br>7,04 ( t, J=8Hz, 1H), 6,64 (d, J=8Hz,<br>1H), 5,68 ( d, J= 17Hz, 1H), 5,62( d,<br>J= 17Hz, 1H) 2,84-2,77 (m, 2H),<br>2,70-2,60(m, 1H), 2,27-2,21 (m, 1H),<br>2,00-1,90 (m, 1H), 1,84 (br s, 1H),                                                                        | 418,23 | 419,1 | Соединение<br>синтезировали<br>посредством<br>способа А с<br>применением 3-<br>пентил-1-<br>циклогексанона и<br>3-циано-1-<br>бензилбромиды в<br>качестве                                                |

|                                                                                                                     |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                              |        |       |                                                                                                                                                                                                                                                                  |
|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------|-------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
|                                                                                                                     | 1,42-1,20(m, 9H), 0,85 (t, J=7,2Hz, 3H)                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                      |        |       | соответствующих структурных элементов                                                                                                                                                                                                                            |
| 9-[(3-<br>цианофенил)м<br>етил]-2-<br>пентил-<br>2,3,4,9-<br>тетрагидро-<br>1Н-карбазол-<br>8-карбоновая<br>кислота | 400MHz-DMSO d6 : 12,81(br s, 1H),<br>7,65 (t, J=8Hz,2H), 7,42 (t, J=8Hz,<br>2H), 7,23 (br s, 1H), 7,06 ( t, J= 8Hz,<br>1H), 6,93 (d, J=8Hz, 1H), 5,67( d, J=<br>16Hz, 1H), 5,60 (d, J= 16Hz, 1H),<br>2,83-2,73 (m, 2H), 2,66-2,60 (m, 1H),<br>2,27-2,21 (m, 1H), 2,05-1,95 (m, 1H),<br>1,90-1,80 (m, 1H), 1,48-1,34(m, 9H),<br>0,85 (t, J=6,8Hz, 3H)                                         | 400,22 | 401,1 | Соединение<br>синтезировали<br>посредством<br>способа А с<br>применением 3-<br>пентил-1-<br>циклогексанона и<br>3-циано-1-<br>бензилбромаида в<br>качестве<br>соответствующих<br>структурных<br>элементов                                                        |
| 1-бутил-9-[(3-<br>карбамоилфен<br>ил)метил]-<br>2,3,4,9-<br>тетрагидро-<br>1Н-карбазол-<br>8-карбоновая<br>кислота  | 400MHz-DMSO d6 : 12,80(br s, 1H),<br>7,84 (br s, 1H), 7,66-7,61 (m, 2H),<br>7,44 (s, 1H), 7,38 (d, J = 7,2Hz, 1H),<br>7,29 (br s, 1H), 7,20 ( t, J= 8Hz, 1H),<br>7,03 ( t, J=8Hz, 1H), 6,51 (d, J=8Hz,<br>1H), 5,78 ( d, J= 16Hz, 1H), 5,47( d,<br>J= 16Hz, 1H) 2,84-2,77 (m, 2H),<br>2,65-2,55 (m, 1H), 2,00-1,90 (m, 1H),<br>1,90-1,70 (m, 3H), 1,55-1,15(m, 6H),<br>0,81 (t, J=7,2Hz, 3H) | 404,21 | 405,1 | Соединение<br>синтезировали<br>посредством<br>способа В с<br>применением<br>бромаида<br>бутилмагния в<br>качестве<br>соответствующих<br>структурных<br>элементов и 3-<br>циано-1-<br>бензилбромаида в<br>качестве<br>соответствующих<br>структурных<br>элементов |

|                                                                                                |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                              |        |              |                                                                                                                                                    |
|------------------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------|--------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 9-[(3-карбамоилфенил)метил]-1-(пентилокси)-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновая кислота | 400MHz-DMSO d6 : 12,80(br s, 1H), 7,91 (br s, 1H), 7,66-7,55 (m, 3H), 7,40-7,35 (m, 1H), 7,26 (br s, 1H), 7,20 (t, J= 8Hz, 1H), 7,02 (t, J=8Hz, 1H), 6,70 (m, 1H), 5,81(m, 1H), 5,59(d, J= 16Hz, 1H), 4,5 (br s, 1H), 3,62-3,55 (m, 1H), 3,41-3,35(m, 1H), 2,84-2,77 (m, 1H), 2,65-2,55 (m, 1H), 2,25-2,15 (m, 1H), 1,90-1,81.(m,2H), 1,80-1,65 (m, 1H), 1,40-1,30(m, 2H), 1,35-1,10(m, 4H), 0,78 (t, J=6,4Hz, 3H)                                           | 434,22 | 433,2 [M-H]- | Соединение синтезировали посредством способа В с применением 1-гексанола и 3-циано-1-бензилбромид в качестве соответствующих структурных элементов |
| 9-[(3-цианофенил)метил]-1-(пентилокси)-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновая кислота     | 400MHz-DMSO d6 : 12,80(br s, 1H), 7,72 (d, J=8Hz, 1H), 7,62 (d, J=8Hz, 1H), 7,49 (s, 1H), 7,43 (d, J= 7,2Hz, 1H), 7,39 (t, J= 8Hz, 1H), 7,24 (br s, 1H), 7,07 (t, J=8Hz, 1H), 6,98 (d, J=8Hz, 1H), 5,71 (d, J= 17Hz, 1H), 5,60(d, J= 17Hz, 1H), 4,5 (br s, 1H), 3,62-3,55 (m, 1H), 3,41-3,35(m, 1H), 2,87-2,80 (m, 1H), 2,62-2,55 (m, 1H), 2,25-2,20 (m, 1H), 1,90-1,81.(m,2H), 1,80-1,70 (m, 1H), 1,26-1,20(m, 2H), 1,18-1,00(m, 4H), 0,74 (t, J=6,4Hz, 3H) | 416,21 | 415,1 [M-H]- | Соединение синтезировали посредством способа В с применением 1-гексанола и 3-циано-1-бензилбромид в качестве соответствующих структурных элементов |
| 1-бутил-9-[(3-цианофенил)метил]-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновая кислота            | 400MHz-DMSO d6 : 12,81(br s, 1H), 7,64 (d, J=8Hz, 2H), 7,40-7,36 (m, 2H), 7,19 (br s, 1H), 7,05 (t, J= 8Hz, 1H), 6,78 (d, J=8Hz, 1H), 5,74(d, J= 16Hz, 1H), 5,50 (d, J= 16Hz, 1H), 2,84-2,77 (m, 2H), 2,65-2,55 (m, 1H), 2,00-1,90 (m, 1H), 1,90-1,70 (m, 3H), 1,55-1,15(m, 6H), 0,81 (t, J=7,2Hz, 3H)                                                                                                                                                       | 386,20 | 387,1        | Соединение синтезировали посредством способа В с применением бромид бутилмагния и 3-циано-1-бензилбромид в качестве соответствующих                |

|                                                                                                |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                |        |       |                                                                                                                                                                                                                            |
|------------------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------|-------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
|                                                                                                |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                |        |       | структурных<br>элементов                                                                                                                                                                                                   |
| 6-бутил-5-[(3-карбамоилфенил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновая кислота | 400MHz-DMSO d6 : 12,81(br s, 1H), 7,84 (br s, 1H), 7,66 (t, J =8Hz, 2H), 7,50 ( s, 1H), 7,35 (d, J = 7,2Hz, 1H), 7,27 (br s, 1H), 7,23 ( t, J= 8Hz, 1H), 7,02 ( t, J=8Hz, 1H), 6,67 (d, J=8Hz, 1H), 5,81 ( d, J= 18Hz, 1H), 5,55( d, J= 18Hz, 1H), 3,05-2,95 ( m, 2H), 2,62-2,55(m, 1H), 1,92-1,65 (m, 4H), 1,62-1,55(m, 1H), 1,50-1,40(m, 1H), 1,40-1,20 (m, 3H), 1,17-1,08(m, 2H), 1,08-0,98 (m, 1H), 0,74 (t, J=7,2 Гц, 3H) | 418,23 | 419,1 | Соединение синтезировали посредством способа В с применением 5-[(3-карбамоилфенил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты и бромида бутилмагния в качестве соответствующих структурных элементов |

|                                                                                                                           |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                             |        |       |                                                                                                                                                                                                                                                                                    |
|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------|-------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 6-бутил-5-[(3-<br>цианофенил)м<br>етил]-<br>5Н,6Н,7Н,8Н,<br>9Н,10Н-<br>циклогепта[b]<br>индол-4-<br>карбоновая<br>кислота | 400MHz-CDCl <sub>3</sub> : 12,81(br s, 1H),<br>7,76 (d, J =7,6Hz, 1H), 7,71 (d, J<br>=7,6Hz, 1H), 7,47 ( d, J=8,0Hz, 1H),<br>7,30 (t, J = 8,0Hz, 1H), 7,15-7,10 (m,<br>2H), 7,02 ( d, J= 8Hz, 1H), 5,90 ( d, J=<br>17,6Hz, 1H), 5,48( d, J= 17,6Hz, 1H),<br>3,09-3,05 ( m, 1H), 2,95-2,85(m, 1H),<br>2,73-2,65 (m, 1H), 2,05-1,86 (m, 4H),<br>1,77-1,46(m, 5H), , 1,40--1,08(m, 4H),<br>0,82 (t, J=7,2 Гц, 3H)                              | 400,22 | 401,1 | Соединение<br>синтезировали<br>посредством<br>способа В с<br>применением 5-<br>[(3-<br>цианофенил)мети<br>л]-<br>5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,1<br>0Н-<br>циклогепта[b]инд<br>ол-4-карбоновой<br>кислоты и<br>бромид<br>бутилмагния в<br>качестве<br>соответствующих<br>структурных<br>элементов |
| 9-[(3-<br>карбамоилфен<br>ил)метил]-1-<br>этил-2,3,4,9-<br>тетрагидро-<br>1Н-карбазол-<br>8-карбоновая<br>кислота         | 400MHz-DMSO d <sub>6</sub> : 12,68(br s, 1H),<br>7,83 (br s, 1H), 7,60 (d, J =8Hz, 1H),<br>7,41 (s, 1H), 7,35 (d, J = 6,8Hz, 1H),<br>7,27 (br s, 1H), 7,18 ( t, J= 8Hz, 1H),<br>7,02 (t, J=8Hz, 1H), 6,47 (d, J=8Hz,<br>1H), 5,77 ( d, J= 17,2Hz, 1H), 5,43( d,<br>J= 17,2Hz, 1H), 2,79-2,70 ( m, 2H),<br>2,65-2,53(m, 1H), 1,98 (br d, J=16Hz,<br>1H), 1,82-1,69(m, 3H), 1,63-1,57(m,<br>1H), 1,50-1,42 (m, 1H), 0,94 (t, J=7,2<br>Гц, 3H) | 376,18 | 377,1 | Соединение<br>синтезировали<br>посредством<br>способа В с<br>применением 9-<br>[(3-<br>карбамоилфенил)<br>метил]-2,3,4,9-<br>тетрагидро-1Н-<br>карбазол-8-<br>карбоновой<br>кислоты и<br>бромид<br>этилмагния в<br>качестве<br>соответствующих                                     |

|                                                                                                                  |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                     |        |       |                                                                                                                                                                                                                                                                        |
|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------|-------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
|                                                                                                                  |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                     |        |       | структурных<br>элементов                                                                                                                                                                                                                                               |
| 9-[(3-<br>цианофенил)м<br>етил]-1-этил-<br>2,3,4,9-<br>тетрагидро-<br>1Н-карбазол-<br>8-карбоновая<br>кислота    | 400MHz-DMSO d6 : 12,80(br s, 1H),<br>7,69 (d, J=8,0Hz, 1H), 7,60 (dd, J<br>=8,0, 1,2Hz, 1H), 7,36-7,30(m, 2H),<br>7,26(t, J = 8,0Hz, 1H), 7,01(t, J =<br>8,0Hz, 1H), 6,71 (d, J=8Hz, 1H), 5,78<br>( d, J= 17,2Hz, 1H), 5,46( d, J=<br>17,2Hz, 1H) 2,80-2,70 (m, 2H), 2,65-<br>2,56 (m, 1H), 2,00-1,96 (m, 1H), 1,78-<br>1,61(m, 3H), 1,59-1,50(m, 1H), 1,46-<br>1,24(m, 1H), 0,94 (t, J =7,2Hz, 3H) | 358,17 |       | Соединение<br>синтезировали<br>посредством<br>способа В с<br>применением 9-<br>[(3-<br>цианофенил)мети<br>л]-2,3,4,9-<br>тетрагидро-1Н-<br>карбазол-8-<br>карбоновой<br>кислоты и<br>бромид<br>этилмагния в<br>качестве<br>соответствующих<br>структурных<br>элементов |
| 9-[(3-<br>карбоксифени<br>л)метил]-1-<br>этил-2,3,4,9-<br>тетрагидро-<br>1Н-карбазол-<br>8-карбоновая<br>кислота | 400MHz-DMSO d6 : 12,75(br s, 2H),<br>7,68 (d, J=8,0Hz, 1H), 7,60 (dd, J<br>=8,0, 1,2Hz, 1H), 7,36-7,32(m, 2H),<br>7,26(t, J = 8,0Hz, 1H), 7,01(t, J =<br>8,0Hz, 1H), 6,71 (d, J=8Hz, 1H), 5,78<br>( d, J= 17,2Hz, 1H), 5,46( d, J=<br>17,2Hz, 1H) 2,80-2,70 (m, 2H), 2,65-<br>2,56 (m, 1H), 2,05-1,96 (m, 1H), 1,82-                                                                                | 377,16 | 378,1 | Соединение<br>синтезировали<br>посредством<br>способа В с<br>применением 9-<br>[(3-<br>карбоксилфенил)<br>метил]-2,3,4,9-                                                                                                                                              |

|                                                                                            |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                    |        |              |                                                                                                                                                                 |
|--------------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------|--------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
|                                                                                            | 1,61(m, 3H), 1,62-1,52 (m, 1H), 1,50-1,42(m, 1H), 0,94 (t, J =7,2Hz, 3H)                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                           |        |              | тетрагидро-1H-карбазол-8-карбоновой кислоты и бромида этилмагния в качестве соответствующих структурных элементов                                               |
| 9-[(3-карбамоилфенил)метил]-1-пропокси-2,3,4,9-тетрагидро-1H-карбазол-8-карбоновая кислота | 400MHz-DMSO d6 : 12,8(br s, 1H), 7,98 (br s, 1H), 7,63-7,59(m, 3H), 7,65 (d, J =8,1Hz, 1H), 7,33 (br s, 1H), 7,25 (br s, 1H), 7,19 ( t, J= 8Hz, 1H), 6,99(br s, 1H), 6,78(br s, 1H), 5,89 ( m, 1H), 5,56( d, J= 16,0Hz, 1H), 4,53(s, 1H), 3,59-3,53(m, 1H), 3,41-3,39(m, 1H), 2,80(d, J = 16,0Hz, 1H), 2,60-2,55(m, 1H), 2,21(d, J = 15,2Hz, 1H), 1,90-1,65(m, 3H), 1,41(q, J = 6,4Hz, 1H), 0,80 (t, J=7,2 Гц, 3H) | 406,19 | 405,1 [M-H]- | Соединение синтезировали посредством способа В с применением циклогексанона и 1-пропанола                                                                       |
| 9-[(3-карбамоилфенил)метил]-4-этил-2,3,4,9-тетрагидро-1H-карбазол-8-карбоновая кислота     | 300MHz-DMSO d6 : 12,8(br s, 1H), 7,90 (br s, 1H), 7,70 (d, J =6,9Hz, 1H), 7,65 (d, J =8,1Hz, 1H), 7,48 (s, 1H), 7,37 (d, J = 6,8Hz, 1H), 7,33 (br s, 1H), 7,24 ( t, J= 8Hz, 1H), 7,03 (t, J=8Hz, 1H), 6,65 (d, J=7,8Hz, 1H), 5,69 ( d, J= 17,1Hz, 1H), 5,56( d, J= 17,1Hz, 1H), 2,95-2,85 (m, aH), 2,75-2,65(m, 2H), 1,88-1,69(m, 4H), 1,60-1,48(m, 1H), 0,98 (t, J=7,2 Гц, 3H)                                    | 376,18 | 377,1        | Соединение синтезировали посредством способа А с применением 3-этил-1-циклогексанона и 3-циано-1-бензилбромида в качестве соответствующих структурных элементов |

|                                                                                         |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                           |        |       |                                                                                                                                                   |
|-----------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------|-------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 4-[(3-карбамоилфенил)метил]-3-этил-1Н,2Н,3Н,4Н-циклопента[б]индол-5-карбоновая кислота  | 500MHz-DMSO d6 : 12,76 (br s, 1H), 7,87 (br s, 1H), 7,65 (d, J=7,5 Гц, 2H), 7,57 (d, J=7,5Hz, 1H), 7,48 (s, 1H), 7,35 (d, J = 7,2Hz, 1H), 7,31 (br s, 1H), 7,24 (t, J= 8Hz, 1H), 7,03 (t, J=8Hz, 1H), 6,69 (d, J=8Hz, 1H), 5,73 (d, J= 17Hz, 1H), 5,50 (d, J= 17Hz, 1H) 2,84-2,77 (m, 2H), 2,67-2,64 (m, 1H), 2,22-2,18 (m, 1H), 1,69-1,66 (m, 1H), 1,47-1,42 (m, 1H), 0,84 (t, J=7,2Hz, 3H)                                                              | 362,16 | 363,1 | Соединение синтезировали посредством способа В с применением цикlopентанона и бромида этилмагни в качестве соответствующих структурных элементов  |
| 4-[(3-цианофенил)метил]-3-этил-1Н,2Н,3Н,4Н-циклопента[б]индол-5-карбоновая кислота      | 400MHz-DMSO d6 : 12,80(br s, 1H), 7,66 (d, J=8Hz, 1H), 7,59 (d, J=8Hz, 1H), 7,41 (t, J= 8Hz, 1H), 7,36 (d, J=8Hz, 1H), 7,25(s, 1H), 7,05 (t, J= 8Hz, 1H), 6,92 (d, J=8Hz, 1H), 5,72 (d, J= 16Hz, 1H), 5,52 (d, J= 16Hz, 1H), 3,25-3,15 (m, 1H), 2,86-2,65 (m, 3H), 2,23-2,15 (m, 1H), 2,00-1,90 (m, 1H), 1,90-1,70 (m, 3H), 1,55-1,15 (m, 6H), 0,84 (t, J=7,2Hz, 3H)                                                                                      | 344,15 | 345,1 | Соединение синтезировали посредством способа В с применением цикlopентанона и бромида этилмагни в качестве соответствующих структурных элементов  |
| 3-бутил-4-[(3-карбамоилфенил)метил]-1Н,2Н,3Н,4Н-циклопента[б]индол-5-карбоновая кислота | 500MHz-DMSO d6 : 12,76 (br s, 1H), 7,86 (br s, 1H), 7,65 (d, J=7,5 Гц, 2H), 7,57 (d, J=7,5Hz, 1H), 7,49 (s, 1H), 7,36 (d, J = 7,2Hz, 1H), 7,33 (br s, 1H), 7,24 (t, J= 8Hz, 1H), 7,04 (t, J=7,5Hz, 1H), 6,71 (d, J=8Hz, 1H), 5,71 (d, J= 17,0Hz, 1H), 5,52 (d, J= 17,0Hz, 1H) 3,21 (br s, 1H), 2,83-2,80 (m, 1H), 2,79-2,75 (m, 1H), 2,67-2,63 (m, 1H), 2,22-2,18 (m, 1H), 1,69-1,66 (m, 1H), 1,39-1,32 (m, 1H), 1,25-1,12 (m, 1H), 0,77 (t, J=7,2Hz, 3H) | 390,19 | 391,1 | Соединение синтезировали посредством способа В с применением цикlopентанона и бромида бутилмагни в качестве соответствующих структурных элементов |

|                                                                                                                    |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                |        |       |                                                                                                                                                                                                             |
|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------|-------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 3-бутил-4-[(3-<br>цианофенил)м<br>етил]-<br>1Н,2Н,3Н,4Н-<br>циклопента[б]<br>индол-5-<br>карбоновая<br>кислота     | 400MHz-DMSO d6 : 12,80(br s, 1H),<br>7,88(br s, 1H), 7,68-7,63(m, 2H), 7,49<br>(br s, 1H), 7,41( t, J= 8Hz, 1H), 7,36<br>(d, J=8Hz, 1H), 7,31(s, 1H), 7,24 ( t,<br>J= 8Hz, 1H), 7,03 ( t, J= 8Hz, 1H),<br>6,67 (d, J=8Hz, 1H), 5,68 (d, J=<br>17,0Hz, 1H), 5,56 (d, J= 17,0 Гц, 1H),<br>3,05-2,95 (m, 1H), 1,90-1,85 (m, 1H),<br>1,82-1,70 (m, 4H), 1,55-1,40(m, 3H),<br>0,84 (t, J=7,2Hz, 3H) | 372,18 | 373,1 | Соединение<br>синтезировали<br>посредством<br>способа В с<br>применением<br>циклопентанона и<br>бромид<br>бутилмагния в<br>качестве<br>соответствующих<br>структурных<br>элементов                          |
| 2-бутил-4-[(3-<br>карбамоилфен<br>ил)метил]-<br>1Н,2Н,3Н,4Н-<br>циклопента[б]<br>индол-5-<br>карбоновая<br>кислота | 400MHz-DMSO d6 : 12,81 (br s, 1H),<br>7,88 (br s, 1H), 7,66 (d, J=8,0 Гц, 2H),<br>7,55-7,52 (m, 2H), 7,37-7,24 (m, 3H),<br>7,02 ( t, J=7,5Hz, 1H), 6,80 (d,<br>J=7,2Hz, 1H), , 5,58( s, 2H) 3,05-2,88<br>(m, 4H), 1,58-1,52 (m, 2H), 1,34-1,31<br>(m, 4H), 0,89 (t, J=7,2Hz, 3H)                                                                                                               | 390,19 | 391,1 | Соединение<br>синтезировали<br>посредством<br>способа А с<br>применением 3-<br>бутил-1-<br>циклопентанона и<br>3-циано-1-<br>бензилбромид<br>а в<br>качестве<br>соответствующих<br>структурных<br>элементов |
| 2-бутил-4-[(3-<br>цианофенил)м<br>етил]-<br>1Н,2Н,3Н,4Н-<br>циклопента[б]<br>индол-5-<br>карбоновая<br>кислота     | 400MHz-DMSO d6 : 12,80(br s, 1H),<br>7,67 (d, J=8Hz, 1H), 7,57 (d, J=8Hz,<br>1H), 7,44( t, J= 8Hz, 1H), 7,36 (d,<br>J=8Hz, 1H), 7,30 (s, 1H), 7,04 ( t, J=<br>8Hz, 1H), 6,92 (d, J=8Hz, 1H), 5,58( s,<br>2H), 3,05-2,91 (m, 3H), 2,51-2,46 (m,<br>1H), 1,60-1,52(m, 2H), 1,36-1,28 (m,<br>4H), 0,89 (t, J=7,2Hz, 3H)                                                                           | 372,18 | 373,1 | Соединение<br>синтезировали<br>посредством<br>способа А с<br>применением 3-<br>бутил-1-<br>циклопентанона и<br>3-циано-1-<br>бензилбромид<br>а в<br>качестве<br>соответствующих                             |

|                                                                                                |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                          |        |       |                                                                                                                                                                 |
|------------------------------------------------------------------------------------------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------|-------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
|                                                                                                |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                          |        |       | структурных<br>элементов                                                                                                                                        |
| 5-[(3-карбамоилфенил)метил]-10-этил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновая кислота | 400MHz-DMSO d6 : 12,85(br s, 1H), 7,88 (br s, 1H), 7,66-7,63 (m, 2H), 7,47 (s, 1H), 7,34(d, J = 7,6Hz, 1H), 7,28 (br s, 1H), 7,24 (t, J=7,6Hz, 1H), 7,02(t, J=7,2Hz, 1H), 6,70 (d, J=8,0Hz, 1H), 5,74(d, J = 18,0Hz, 1H), 5,65 (d, J = 18,0Hz, 1H), 3,13(m, 1H) 2,93-2,88 (m, 1H), 2,69-2,61 (m, 1H), 2,05-2,00 (m, 1H), 1,88-1,80 (m, 3H), 1,67-1,55 (m, 3H), 1,33-1,24(m, 1H), 0,84 (t, J = 7,2Hz, 3H) | 390,19 | 391,1 | Соединение синтезировали посредством способа А с применением 3-этил-1-циклогептанона и 3-циано-1-бензилбромиды в качестве соответствующих структурных элементов |
| 5-[(3-цианофенил)метил]-10-этил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновая кислота     | 400MHz-DMSO d6 : 12,90(br s, 1H), 7,70 (d, J=8,0Hz, 1H), 7,65 (d, J=8,0Hz, 1H), 7,44 (t, J = 8,0Hz, 1H), 7,39(d, J = 6,8Hz, 1H), 7,13 (br s, 1H), 7,06 (t, J=7,2Hz, 1H), 6,97 (d, J=8,0Hz, 1H), 5,68 (m, 2H), 3,16-3,13(m, 1H) 2,89-2,84 (m, 1H), 2,69-2,61 (m, 1H), 2,09-2,03 (m, 1H), 1,84-1,80 (m, 3H), 1,67-1,57 (m, 3H), 1,28-1,24(m, 1H), 0,84 (t, J = 7,2Hz, 3H)                                  | 372,18 | 373,1 | Соединение синтезировали посредством способа А с применением 3-этил-1-циклогептанона и 3-циано-1-бензилбромиды в качестве соответствующих структурных элементов |
| 5-[(3-карбамоилфенил)метил]-10-пропил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-                                      | 500MHz-DMSO d6 : 12,85(br s, 1H), 7,86 (br s, 1H), 7,68-7,64 (m, 2H), 7,45 (s, 1H), 7,37(d, J = 7,5Hz, 1H), 7,29 (br s, 1H), 7,24 (t, J=7,5Hz, 1H), 7,04 (t, J=7,2Hz, 1H), 6,65 (d, J=8,0Hz, 1H), 5,72 (d, J = 17,5Hz,                                                                                                                                                                                   | 404,21 | 405,1 | Соединение синтезировали посредством способа А с применением 3-пропил-1-                                                                                        |

|                                                                                                                                 |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                 |        |       |                                                                                                                                                                  |
|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------|-------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| циклогепта[b]<br>индол-4-<br>карбоновая<br>кислота                                                                              | 1H), 5,63 (d, J = 17,5Hz, 1H), 3,24(m, 1H) 2,93-2,88 (m, 1H), 2,65-2,63 (m, 1H), 2,05-2,00 (m, 1H), 1,88-1,82 (m, 3H), 1,62-1,55 (m, 3H), 1,33-1,24(m, 3H), 0,87 (t, J = 7,0Hz, 3H)                                                                                                                                                             |        |       | циклогептанона и 3-циано-1-бензилбромид в качестве соответствующих структурных элементов                                                                         |
| 5-[(3-<br>цианофенил)м<br>етил]-10-<br>пропил-<br>5Н,6Н,7Н,8Н,<br>9Н,10Н-<br>циклогепта[b]<br>индол-4-<br>карбоновая<br>кислота | 400MHz-DMSO d6 : 12,90(br s, 1H), 7,63(d, J=7,2Hz, 1H), 7,58 (d, J=7,2Hz, 1H), 7,43 (t, J = 8,0Hz, 1H), 7,29(d, J = 6,8Hz, 1H), 7,03-6,99 (m, 2H), 5,74 (m, 2H), 3,16-3,13(m, 1H) 2,89-2,84 (m, 1H), 2,69-2,61 (m, 1H), 2,09-1,95 (m, 1H), 1,87-1,80 (m, 3H), 1,65-1,53 (m, 3H), 1,35-1,11(m, 3H), 0,86 (t, J = 7,2Hz, 3H)                      | 386,20 | 387,1 | Соединение синтезировали посредством способа А с применением 3-пропил-1-циклогептанона и 3-циано-1-бензилбромид в качестве соответствующих структурных элементов |
| 9-[(3-<br>карбоксифени<br>л)метил]-4-<br>этил-2,3,4,9-<br>тетрагидро-<br>1Н-карбазол-<br>8-карбоновая<br>кислота                | 300MHz-DMSO d6 : 12,85(br s, 1H), 7,72 (t, J = 7,2Hz, 1H), 7,43(s, 1H), 7,38(d, J = 6,6Hz, 1H), 7,33(t, J=7,5Hz, 1H), 7,04(t, J=7,8Hz, 1H), 6,88 ( d, J=7,0Hz, 1H), 5,67-5,59 (m, 2H) 2,90-2,86 (m, 1H), 2,76-2,73 (m, 1H), 2,64-2,58 (m, 2H), 2,30-2,25 (m, 1H), 2,07-2,00 (m, 1H), 1,66 (br s, 1H), 1,52-1,42(m, 3H), 0,98 (t, J = 6,0Hz, 3H) | 377,16 | 378   | Соединение синтезировали посредством способа А с применением 3-этил-1-циклогексанона и 3-циано-1-бензилбромид в качестве соответствующих структурных элементов   |

|                                                                                                 |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                 |        |       |                                                                                                                                                                 |
|-------------------------------------------------------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------|-------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 9-[(3-карбамоилфенил)метил]-3-этил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновая кислота          | 500MHz-DMSO d6 : 12,8(br s, 1H), 7,88 (br s, 1H), 7,65-7,63(m, 2H), 7,48(s, 1H), 7,41(dd, J = 7,0, 1,0Hz, 1H), 7,31(s, 1H), 7,24(t, J=7,0Hz, 1H), 7,04(t, J=7,0Hz, 1H), 6,67 (d, J=7,0Hz, 1H), 5,67-5,59 (m, 2H) 2,90-2,86 (m, 1H), 2,76-2,73 (m, 1H), 2,64-2,58 (m, 2H), 2,30-2,25 (m, 1H), 2,07-2,00 (m, 1H), 1,66 (br s, 1H), 1,52-1,42(m, 3H), 0,98 (t, J = 6,0Hz, 3H)                                                      | 376,18 | 377,1 | Соединение синтезировали посредством способа А с применением 4-этил-1-циклогексанона и 3-циано-1-бензилбромид в качестве соответствующих структурных элементов  |
| 10-бутил-5-[(3-карбамоилфенил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновая кислота | 400MHz-DMSO d6 : 12,85(br s, 1H), 7,85 (br s, 1H), 7,65 (t, J=7,6Hz, 2H), 7,46(s, 1H), 7,37(d, J = 6,8Hz, 1H), 7,28 (s, 1H), 7,24(t, J=6,8Hz, 1H), 7,04(t, J=7,2Hz, 1H), 6,64 (d, J=6,8Hz, 1H), 5,72(d, J = 17,6Hz, 1H), 5,65 (d, J = 17,6Hz, 1H), 3,26-3,22(m, 1H) 2,93-2,88 (m, 1H), 2,69-2,61 (m, 1H), 2,02-1,95 (m, 1H), 1,88-1,82 (m, 3H), 1,66-1,53 (m, 3H), 1,33-1,24(m, 5H), 1,16-1,10 (m, 1H), 0,82 (t, J = 7,2Hz, 3H) | 418,23 | 419,1 | Соединение синтезировали посредством способа А с применением 3-бутил-1-циклогептанона и 3-циано-1-бензилбромид в качестве соответствующих структурных элементов |
| 10-бутил-5-[(3-цианофенил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновая кислота     | 400MHz-DMSO d6 : 12,89(br s, 1H), 7,69 (d, J = 7,2Hz, 1H), 7,65 (d, J = 7,2Hz, 1H), 7,44 (t, J=7,6Hz, 2H), 7,39 (d, J = 7,2Hz, 1H), 7,10-7,05(m, 2H), 6,97 (d, J=7,6Hz, 1H), 5,68 (s, 2H), 3,26-3,22(m, 1H) 3,26-3,23 (m, 1H), 2,90-2,86 (m, 1H), 2,67-2,60(m, 1H), 2,03-1,98 (m, 1H), 1,88-1,83 (m, 3H), 1,66-1,53 (m, 3H), 1,36-1,24(m, 4H),                                                                                  | 400,22 | 401,1 | Соединение синтезировали посредством способа А с применением 3-бутил-1-циклогептанона и 3-циано-1-бензилбромид в качестве                                       |

|                                                                                                  |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                               |        |       |                                                                                                                                                                   |
|--------------------------------------------------------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------|-------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
|                                                                                                  | 1,12-1,07 (m, 1H), 0,82 (t, J = 6,8Hz, 3H)                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                    |        |       | соответствующих структурных элементов                                                                                                                             |
| 5-[(3-карбамоилфенил)метил]-10-пентил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновая кислота | 400MHz-DMSO d6 : 12,85(br s, 1H), 7,85 (br s, 1H), 7,65 (t, J=7,2Hz, 2H), 7,38 (s, 1H), 7,36(d, J = 7,6Hz, 1H), 7,28 (s, 1H), 7,23(t, J=8,0Hz, 1H), 7,04(t, J=7,6Hz, 1H), 6,63 (d, J=7,6Hz, 1H), 5,72(d, J = 18,0Hz, 1H), 5,64 (d, J = 18,0Hz, 1H), 3,31-3,20(m, 1H) 2,92-2,87 (m, 1H), 2,69-2,61 (m, 1H), 2,02-1,95 (m, 1H), 1,88-1,82 (m, 3H), 1,66-1,53 (m, 3H), 1,33-1,14(m, 7H), 0,81 (t, J = 7,2Hz, 3H) | 432,24 | 433,1 | Соединение синтезировали посредством способа А с применением 3-пентил-1-циклогептанона и 3-циано-1-бензилбромиды в качестве соответствующих структурных элементов |
| 5-[(3-цианофенил)метил]-10-пентил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновая кислота     | 400MHz-DMSO d6 : 12,89(br s, 1H), 7,69 (d, J = 7,2Hz, 1H), 7,65 (d, J = 7,2Hz, 1H), 7,43 (t, J=7,6Hz, 1H), 7,39 (d, J = 7,2Hz, 1H), 7,11-7,05(m, 2H), 6,98 (d, J=7,6Hz, 1H), 5,68 (s, 2H), 3,26-3,22(m, 1H) 2,90-2,86 (m, 1H), 2,67-2,60(m, 1H), 2,03-1,98 (m, 1H), 1,88-1,83 (m, 3H), 1,66-1,53 (m, 3H), 1,36-1,07 (m, 7H), 0,81 (t, J = 6,8Hz, 3H)                                                          | 414,23 | 415,1 | Соединение синтезировали посредством способа А с применением 3-пентил-1-циклогептанона и 3-циано-1-бензилбромиды в качестве соответствующих структурных элементов |

|                                                                                          |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  |        |       |                                                                                                                                                                  |
|------------------------------------------------------------------------------------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------|-------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 4-[(3-карбамоилфенил)метил]-2-пентил-1Н,2Н,3Н,4Н-циклопента[b]индол-5-карбоновая кислота | 500MHz-DMSO d6 : 12,81 (br s, 1H), 7,87 (br s, 1H), 7,66 (d, J=7,2 Гц, 2H), 7,55 (d, J=7,2Hz, 1H), 7,51 (s, 1H), 7,37 (d, J = 7,2Hz, 1H), 7,31 (br s, 1H), 7,26 (t, J= 8Hz, 1H), 7,03 (t, J=8Hz, 1H), 6,69 (d, J=8Hz, 1H), 5,60 (s, 2H), 3,05-2,77 (m, 4H), 2,67-2,64 (m, 1H), 1,60-1,50 (m, 1H), 1,37-1,20 (m, 7H), 0,87 (t, J=7,2Hz, 3H)                       | 404,21 | 405,1 | Соединение синтезировали посредством способа А с применением 3-пентил-1-циклопентанона и 3-циано-1-бензилбромид в качестве соответствующих структурных элементов |
| 4-[(3-цианофенил)метил]-2-пентил-1Н,2Н,3Н,4Н-циклопента[b]индол-5-карбоновая кислота     | 500MHz-DMSO d6 : 12,81 (br s, 1H), 7,57 (dd, J = 7,5, 1,0 Гц, 1H), 7,52 (d, J=7,5 Гц, 1H), 7,46 (d, J=7,5Hz, 1H), 7,36 (t, J = 8,0Hz, 1H), 7,19 (s, 1H), 7,06-7,03 (m, 2H), 5,61 (s, 2H), 3,10-2,98 (m, 3H), 2,55-2,48 (m, 2H), 1,64-1,62 (m, 2H), 1,44-1,42 (m, 2H), 1,37-1,30 (m, 4H), 0,92 (t, J=7,5Hz, 3H)                                                   | 386,20 | 387,1 | Соединение синтезировали посредством способа А с применением 3-пентил-1-циклопентанона и 3-циано-1-бензилбромид в качестве соответствующих структурных элементов |
| 9-[(3-карбамоилфенил)метил]-2-этил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновая кислота   | 300MHz-DMSO d6 : 8,14(br s, 1H), 7,90 (br s, 1H), 7,64(t, J = 6,9Hz, 1H), 7,48(s, 1H), 7,40 (d, J =7,2Hz, 1H), 7,33 (s, 1H), 7,24 (t, J = 7,5Hz, 1H), 7,04(t, J = 7,2Hz, 1H), 6,64 (d, J=7,8Hz, 1H), 5,65( q, J= 1Hz, 1H) 2,80-2,70 (m, 2H), 2,65-2,55 (m, 1H), 2,25-2,15 (m, 1H), 1,98-1,94 (m, 1H), 1,67 (br s, 1H), 1,50-1,24(m, 8H), 0,89 (t, J = 6,4Hz, 3H) | 376,18 | 377,1 | Соединение синтезировали посредством способа А с применением 3-этил-1-циклогексанона и 3-циано-1-бензилбромид в качестве                                         |

|                                                                                                                                  |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                            |        |       |                                                                                                                                                                                                        |
|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------|-------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
|                                                                                                                                  |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                            |        |       | соответствующих<br>структурных<br>элементов                                                                                                                                                            |
| 9-[(3-<br>карбоксифени<br>л)метил]-2-<br>этил-2,3,4,9-<br>тетрагидро-<br>1Н-карбазол-<br>8-карбоновая<br>кислота                 | 300MHz-DMSO d6 : 12,85(br s, 2H),<br>7,73(d, J=7,8Hz, 1H), 7,64(d,<br>J=7,8Hz, 1H), 7,45(s, 1H), 7,41 (d, J<br>=7,2Hz, 1H), 7,33 (t, J = 7,5Hz, 1H),<br>7,04(t, J = 7,2Hz, 1H), 6,87 ( d,<br>J=7,8Hz, 1H), 5,66( m, 2H) 2,87-2,73<br>(m, 2H), 2,68-2,57 (m, 1H), 2,28-2,20<br>(m, 1H), 2,04-1,98 (m, 1H), 1,76(br s,<br>1H), 1,50-1,34(m, 3H), 0,93 (t, J =<br>6,4Hz, 3H)                                                  | 377,16 | 378,1 | Соединение<br>синтезировали<br>посредством<br>способа А с<br>применением 3-<br>этил-1-<br>циклогексанона и<br>3-циано-1-<br>бензилбромида в<br>качестве<br>соответствующих<br>структурных<br>элементов |
| 5-[(3-<br>карбамоилфен<br>ил)метил]-7-<br>этил-<br>5Н,6Н,7Н,8Н,<br>9Н,10Н-<br>циклогепта[b]<br>индол-4-<br>карбоновая<br>кислота | 400MHz-DMSO d6 : 12,85(br s, 1H),<br>7,87(br s, 1H), 7,67(t, J = 7,2Hz, 1H),<br>7,50(s, 1H), 7,38 (d, J =7,2Hz, 1H),<br>7,29 (s, 1H), 7,26 (t, J = 7,2Hz, 1H),<br>7,04(t, J = 7,2Hz, 1H), 6,73 ( d,<br>J=7,8Hz, 1H), 5,78( d, J= 17,6Hz,<br>1H), 5,61( d, J= 17,6Hz, 1H) 2,93-2,82<br>(m, 2H), 2,72-2,66 (m, 1H), 1,94-1,85<br>(m, 1H), 1,57-1,46 (m, 2H), 1,36(br s,<br>1H), 1,22-1,14(m, 2H), 0,68 (t, J =<br>7,6Hz, 3H) | 390,19 | 391,1 | Соединение<br>синтезировали<br>посредством<br>способа А с<br>применением 3-<br>этил-1-<br>циклогептанона и<br>3-циано-1-<br>бензилбромида в<br>качестве<br>соответствующих<br>структурных<br>элементов |

|                                                                                                                          |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                |        |       |                                                                                                                                                                                                        |
|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------|-------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 5-[(3-<br>цианофенил)м<br>етил]-7-этил-<br>5Н,6Н,7Н,8Н,<br>9Н,10Н-<br>циклогепта[b]<br>индол-4-<br>карбоновая<br>кислота | 400MHz-DMSO d6 : 12,87(br s, 1H),<br>7,68 (t, J=8Hz,2H), 7,44 ( t, J=8Hz,<br>1H), 7,41(d, J=8Hz, 1), 7,27 (br s, 1H),<br>7,06 ( t, J= 8Hz, 1H), 6,99 (d, J=8Hz,<br>1H), 5,78 ( d, J= 18Hz, 1H), 5,62( d,<br>J= 18Hz, 1H), 2,92 (dd, J=15,6, 7,2Hz,<br>1H), 2,81( d, J=16Hz, 1H), 2,72-<br>2,67(m, 1H), 2,51 (m, 1H), 1,95-1,89<br>(m, 2H), 1,56-1,53(m, 2H), 1,32(m,<br>1H), 1,22(m, 2H), 0,68 (t, J =7Hz, 3H) | 372,18 | 373,1 | Соединение<br>синтезировали<br>посредством<br>способа А с<br>применением 3-<br>этил-1-<br>циклогептанона и<br>3-циано-1-<br>бензилбромиды в<br>качестве<br>соответствующих<br>структурных<br>элементов |
| 9-[(3-<br>цианофенил)м<br>етил]-3-этил-<br>2,3,4,9-<br>тетрагидро-<br>1Н-карбазол-<br>8-карбоновая<br>кислота            | 500MHz-DMSO d6 : 12,82 (br s, 1H),<br>7,66 (t, J=8Hz,2H), 7,45-7,41 (m, 2H),<br>7,25 (s, 1H), 7,06 (t, J= 8,0Hz, 1H),<br>6,93 (d, J=8,0Hz, 1H), 5,66-5,58(m,<br>2H), 2,88(dd, J = 16, 4Hz, 1H), 2,75-<br>2,70 (m, 1H), 2,65-2,60 (m, 1H), 2,54-<br>2,48 (m, 2H), 2,30-2,25 (m, 1H), 2,03-<br>2,00 (m, 1H), 1,67 (m, 1H), 1,53-<br>1,42(m, 3H), 0,99 (t, J=7,5Hz, 3H)                                           | 358,17 | 359,1 | Соединение<br>синтезировали<br>посредством<br>способа А с<br>применением 4-<br>этил-1-<br>циклогексанона и<br>3-циано-1-<br>бензилбромиды в<br>качестве<br>соответствующих<br>структурных<br>элементов |
| 9-[(3-<br>карбамоилфен<br>ил)метил]-4-<br>пропил-<br>2,3,4,9-<br>тетрагидро-<br>1Н-карбазол-<br>8-карбоновая<br>кислота  | 500MHz-DMSO d6 : 12,8(br s, 1H),<br>7,86 (br s, 1H), 7,69 (d, J =7,5Hz,<br>1H), 7,64 (d, J =7,5Hz, 1H), 7,48 (s,<br>1H), 7,38 (d, J = 7,5Hz, 1H), 7,30 (br<br>s, 1H), 7,24 ( t, J= 7,5Hz, 1H), 7,04 (t,<br>J=7,5Hz, 1H), 6,66 (d, J=7,5Hz, 1H),<br>5,68 ( d, J= 17,0Hz, 1H), 5,56( d, J=<br>17,0Hz, 1H), 3,02-2,99 (m, 1H), 2,70-<br>2,64(m, 1H), 2,51-2,49(m, 1H), 1,89-                                      | 390,19 | 391,1 | Соединение<br>синтезировали<br>посредством<br>способа А с<br>применением 3-<br>пропил-1-<br>циклогексанона и<br>3-циано-1-<br>бензилбромиды в<br>качестве                                              |

|                                                                                          |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                     |        |       |                                                                                                                                                                   |
|------------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------|-------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
|                                                                                          | 1,88(m, 1H), 1,82-1,75(m, 4H), 1,53-1,40(m, 3H), 0,95 (t, J=7,2 Гц, 3H)                                                                                                                                                                                                                                                                             |        |       | соответствующих структурных элементов                                                                                                                             |
| 9-[(3-карбамоилфенил)метил]-3-пропил-2,3,4,9-тетрагидро-1H-карбазол-8-карбоновая кислота | 400MHz-DMSO d6 : 12,8(br s, 1H), 7,87 (br s, 1H), 7,64 (m, 2H), 7,48 (s, 1H), 7,40(d, J = 7,6Hz, 1H), 7,30(s, 1H), 7,24 (t, J - 8,0Hz, 1H), 7,04(t, J - 8,0Hz, 1H), 6,68 (d, J=7,6Hz, 1H), 5,66- 5,56(m, 2H) 2,90-2,85 (m, 1H), 2,72-2,62 (m, 2H), 2,33-2,25 (m, 1H), 2,02-1,98 (m, 1H), 1,76 (br s, 1H), 1,52-1,36(m, 5H), 0,92 (t, J = 7,0Hz, 3H) | 390,19 | 391,1 | Соединение синтезировали посредством способа А с применением 4-пропил-1-циклогексанона и 3-циано-1-бензилбромида в качестве соответствующих структурных элементов |
| 9-[(3-цианофенил)метил]-3-пропил-2,3,4,9-тетрагидро-1H-карбазол-8-карбоновая кислота     | 400MHz-DMSO d6 : 12,82 (br s, 1H), 7,66-7,63 (m, 2H), 7,44-7,40 (m, 2H), 7,24 (s, 1H), 7,06 (t, J= 8Hz, 1H), 6,94 (d, J=8Hz, 1H), 5,62 (s, 2H), 2,87(dd, J = 16, 4Hz, 1H), 2,70-2,55 (m, 2H), 2,31-2,45 (m, 1H), 2,05-1,95 (m, 1H), 1,78 (br s, 1H), 1,52-1,41(m, 5H), 0,93 (t, J=8Hz, 3H)                                                          | 372,18 | 373,1 | Соединение синтезировали посредством способа А с применением 4-пропил-1-циклогексанона и 3-циано-1-бензилбромида в качестве соответствующих структурных элементов |

|                                                                                         |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                       |        |       |                                                                                                                                                                 |
|-----------------------------------------------------------------------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------|-------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 4-бутил-9-[(3-карбамоилфенил)метил]-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновая кислота | 500MHz-DMSO d6 : 12,8(br s, 1H), 7,86 (br s, 1H), 7,68-7,64 (m, 2H), 7,48 (s, 1H), 7,37 (d, J = 7,0Hz, 1H), 7,31 (br s, 1H), 7,24 (t, J= 7,5Hz, 1H), 7,04 (t, J=7,5Hz, 1H), 6,65 (d, J=7,5Hz, 1H), 5,68 (d, J= 17,0Hz, 1H), 5,56 (d, J= 17,0Hz, 1H), 3,01-2,98 (m, 1H), 2,70-2,64(m, 2H), 1,89-1,76 (m, 5H), 1,52-1,31(m, 5H), 0,90 (t, J=7,0 Гц, 3H) | 404,21 | 405,1 | Соединение синтезировали посредством способа А с применением 3-бутил-1-циклогексанона и 3-циано-1-бензилбромид в качестве соответствующих структурных элементов |
| 4-бутил-9-[(3-цианофенил)метил]-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновая кислота     | 500MHz-DMSO d6 : 12,8(br s, 1H), 7,709-7,65 (m, 2H), 7,44-7,38 (m, 2H), 7,22 (br s, 1H), 7,06 (t, J=8,0Hz, 1H), 6,93 (d, J=8,0Hz, 1H), 5,64 (d, J= 17,5Hz, 1H), 5,56 (d, J= 17,5Hz, 1H), 3,01-2,98 (m, 1H), 2,65-2,62(m, 1H), 2,56-2,50(m, 1H), 1,89-1,76 (m, 5H), 1,54-1,50(m, 1H), 1,42-1,31(m, 4H), 0,90 (t, J=7,0 Гц, 3H)                         | 386,20 | 387,1 | Соединение синтезировали посредством способа А с применением 3-бутил-1-циклогексанона и 3-циано-1-бензилбромид в качестве соответствующих структурных элементов |
| 3-бутил-9-[(3-карбамоилфенил)метил]-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновая кислота | 400MHz-DMSO d6 : 8,14(br s, 1H), 7,86 (br s, 1H), 7,57 (d, J =9Hz, 1H), 7,30-7,16 (m, 3H), 7,10-6,95 (m, 2H), 6,82 (t, J=7,2Hz, 1H), 5,85 (d, J= 16Hz, 1H), 5,71 (d, J= 16Hz, 1H) 2,80-2,70 (m, 2H), 2,65-2,55 (m, 1H), 2,25-2,15 (m, 1H), 1,98-1,94 (m, 1H), 1,67 (br s, 1H), 1,50-1,24(m, 8H), 0,89 (t, J = 6,4Hz, 3H)                              | 404,21 | 405,1 | Соединение синтезировали посредством способа А с применением 3-пентил-1-циклогексанона и 3-циано-1-бензилбромид в качестве                                      |

|                                                                                                                         |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                 |        |       | соответствующих<br>структурных<br>элементов                                                                                                                                                              |
|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------|-------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 3-бутил-9-[(3-<br>цианофенил)м<br>етил]-2,3,4,9-<br>тетрагидро-<br>1Н-карбазол-<br>8-карбоновая<br>кислота              | 400MHz-DMSO d6 : 12,82 (br s, 1H),<br>7,65 (t, J=8Hz,2H), 7,42 (t, J=8Hz,<br>2H), 7,23 (s, 1H), 7,05 (t, J= 8Hz, 1H),<br>6,93 (d, J=8Hz, 1H), 5,62(s, 2H),<br>2,86(dd, J = 16, 4Hz, 1H), 2,75-2,65<br>(m, 1H), 2,65-2,55 (m, 1H), 2,28 (dd, J<br>=15, 5Hz, 1H), 2,05-1,95 (m, 1H), 1,75<br>(m, 1H), 1,55-1,45(m, 1H), 1,45-<br>1,30(m, 6H), 0,90 (t, J=8Hz, 3H)                                                 | 386,20 | 387,4 | Соединение<br>синтезировали<br>посредством<br>способа А с<br>применением 4-<br>бутил-1-<br>циклогексанона и<br>3-циано-1-<br>бензилбромада в<br>качестве<br>соответствующих<br>структурных<br>элементов  |
| 9-[(3-<br>карбамоилфен<br>ил)метил]-4-<br>пентил-<br>2,3,4,9-<br>тетрагидро-<br>1Н-карбазол-<br>8-карбоновая<br>кислота | 400MHz-DMSO d6 : 12,8(br s, 1H),<br>7,87 (br s, 1H), 7,66 (t, J = 8,4Hz, 2H),<br>7,49 (s, 1H), 7,38 (d, J = 7,2Hz, 1H),<br>7,30 (br s, 1H), 7,24 ( t, J= 7,6Hz, 1H),<br>7,04 (t, J=7,6Hz, 1H), 6,65 (d,<br>J=8,0Hz, 1H), 5,67 ( d, J= 17,6Hz,<br>1H), 5,55 (d, J= 17,6Hz, 1H), 3,01-<br>2,98 (m, 1H), 2,71-2,64(m, 1H), 2,55-<br>2,48(m, 1H), 1,89-1,76 (m, 5H),<br>1,55-1,33(m, 7H), 0,88 (t, J=6,8 Гц,<br>3H) | 418,23 | 419,1 | Соединение<br>синтезировали<br>посредством<br>способа А с<br>применением 3-<br>пентил-1-<br>циклогексанона и<br>3-циано-1-<br>бензилбромада в<br>качестве<br>соответствующих<br>структурных<br>элементов |
| 9-[(3-<br>цианофенил)м<br>етил]-4-<br>пентил-<br>2,3,4,9-                                                               | 500MHz-DMSO d6 : 12,8(br s, 1H),<br>7,70-7,65 (m, 2H), 7,44-7,38 (m, 2H),<br>7,22 (br s, 1H), 7,06 (t, J=8,0Hz, 1H),<br>6,93 (d, J=8,0Hz, 1H), 5,64 ( d, J=<br>17,6Hz, 1H), 5,56 (d, J= 17,6Hz, 1H),                                                                                                                                                                                                            | 400,22 | 401,1 | Соединение<br>синтезировали<br>посредством<br>способа А с<br>применением 3-                                                                                                                              |

|                                                                                          |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                      |        |       |                                                                                                                                                                  |
|------------------------------------------------------------------------------------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------|-------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновая кислота                                              | 3,01-2,98 (m, 1H), 2,68-2,63(m, 1H), 2,56-2,50(m, 1H), 1,89-1,76 (m, 5H), 1,57-1,31(m, 7H), 0,88 (t, J=7,2 Гц, 3H)                                                                                                                                                                                                                                                   |        |       | пентил-1-циклогексанона и 3-циано-1-бензилбромид в качестве соответствующих структурных элементов                                                                |
| 9-[(3-карбамоилфенил)метил]-3-пентил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновая кислота | 400MHz-DMSO d6 : 12,8(br s, 1H), , 7,66 (d, J =7,6Hz, 2H), 7,44-7,40(m, 2H), 7,23(s, 1H), 7,05(t, J = 7,6Hz, 1h), 6,93 ( t, J=7,2Hz, 1H), 5,61 (s, 2H) 2,90-2,85(m, 1H), 2,73-2,60 (m, 2H), 2,32-2,25 (m, 1H), 2,02-1,98 (m, 1H), 1,75 (br s, 1H), 1,55-1,51(m, 1H),1,41(br s, 4H), 1,34-1,23(m, 4H), 0,88 (t, J = 6,8Hz, 3H)                                        | 418,23 | 419,1 | Соединение синтезировали посредством способа А с применением 4-пентил-1-циклогексанона и 3-циано-1-бензилбромид в качестве соответствующих структурных элементов |
| 9-[(3-цианофенил)метил]-3-пентил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновая кислота     | 400MHz-DMSO d6 : 12,8(br s, 1H), 7,87 (br s, 1H), 7,64 (d, J =6,8Hz, 1H), 7,48(s, 1H), 7,40 (d, J = 7,6Hz, 1H) 7,30(s, 1H), 7,24(t, J = 7,6Hz, 1H), 7,03(t, J = 7,6Hz, 1h), 6,67 ( t, J=7,2Hz, 1H), 5,64 ( s, 2H) 2,87(dd, J = 12,0, 4,8Hz, 1H), 2,71-2,50 (m, 2H), 2,32-2,25 (m, 1H), 2,02-1,98 (m, 1H), 1,74 (br s, 1H), 1,51-1,24(m, 9H), 0,88 (t, J = 6,8Hz, 3H) | 400,22 | 401,1 | Соединение синтезировали посредством способа А с применением 4-гексил-1-циклогексанона и 3-циано-1-бензилбромид в качестве соответствующих структурных элементов |

|                                                                                                              |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                              |        |       |                                                                                                                                                     |
|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------|-------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 4-[(3-карбамоилфенил)метил]-3-пропил-1Н,2Н,3Н,4Н-циклопента[b]индол-5-карбоновая кислота                     | 400MHz-DMSO d6 : 12,76 (br s, 1H), 7,86 (br s, 1H), 7,65 (d, J =7,6Hz, 1H), 7,56 (d, J = 8,0Hz, 1H) 7,49 (s, 1H), 7,36 (d, J =7,6Hz, 1H), 7,30 (s, 1H), 7,24(t, J = 7,6Hz, 1H), 7,04(t, J = 7,6Hz, 1h), 6,71 ( d, J=7,6Hz, 1H), 5,72 ( d, J = 16,4Hz, 1H) 5,50 ( d, J = 16,4Hz, 1H), 3,28-3,24(m, 1H), 2,87-2,64 (m, 3H), 2,22-2,17 (m, 1H), 1,58-1,52(m, 1H), 1,42-1,23(m, 3H), 0,79 (t, J =6,8Hz, 3H)                                                      | 376,18 | 377,1 | Соединение синтезировали посредством способа В с применением цикlopентанона и бромида пропилмагния в качестве соответствующих структурных элементов |
| 4-[(3-цианофенил)метил]-3-пропил-1Н,2Н,3Н,4Н-циклопента[b]индол-5-карбоновая кислота                         | 400MHz-DMSO d6 : 12,81(br s, 1H), 7,66 (d, J =7,2Hz, 1H), 7,59 (d, J =8,0Hz, 1H), 7,42(t, J = 8,0Hz, 1H), 7,37(d, J = 7,2Hz, 1H), 7,26 (s, 1H), 7,05 (t, J = 8,0Hz, 1H), 5,70 ( d, J= 17,2Hz, 1H), 5,53 (d, J= 17,2Hz, 1H), 3,28-3,24(m, 1H), 2,87-2,64 (m, 3H), 2,22-2,17 (m, 1H), 1,58-1,52(m, 1H), 1,42-1,25(m, 3H), 0,79 (t, J =6,8Hz, 3H)                                                                                                               | 358,17 | 359,1 | Соединение синтезировали посредством способа В с применением цикlopентанона и бромида бутилмагния в качестве соответствующих структурных элементов  |
| 2-(7-бутил-5-[(3-карбамоилфенил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклопента[b]индол-4-ил}формамидо)уксусная кислота | 400MHz-DMSO d6 : 12,85(br s, 1H), 8,01 (br s, 1H), 7,62 (d, J =8Hz, 2H), 7,54 (d, J = 7,2Hz, 1H), 7,51 ( s, 1H), 7,25-7,21 (m, 2H), 7,06 ( d, J= 6,0Hz, 1H), 7,00 ( t, J=8Hz, 1H), 6,71(d, J=7,6Hz, 1H), 5,66 ( d, J= 17,6Hz, 1H), 5,47 ( d, J= 17,6Hz, 1H), 3,44-3,32 (m, 1H), 2,93-2,88 (m, 1H), 2,80(d, J=15,2Hz, 1H), 2,70-2,66(m, 1H), 2,51-2,42 (m, 2H), 1,92-1,85 (m, 2H), 1,55-1,47(m, 2H), 1,45-1,39(m, 1H), 1,12-0,95(m, 6H), 0,75 (t, J =7Hz, 3H) | 475,25 | 476,1 | Соединение синтезировали посредством способа С с применением 7-бутил-5-[(3-карбамоилфенил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклопента[b]индол-4-карбоновой |

|                                                                                                                                                    |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  |        |       |                                                                                                                                                                                                                           |
|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------|-------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
|                                                                                                                                                    |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  |        |       | кислоты и<br>аланина                                                                                                                                                                                                      |
| 2-({7-бутил-5-<br>[(3-<br>цианофенил)м<br>етил]-<br>5Н,6Н,7Н,8Н,<br>9Н,10Н-<br>циклогепта[b]<br>индол-4-<br>ил}формаимид<br>о)уксусная<br>кислота  | 400MHz-DMSO d6 : 12,60(br s, 1H),<br>8,71 (m, 1H), 7,64 (d, J=8Hz, 2H),<br>7,59 (d, J = 7,2Hz, 1H), 7,43 ( t,<br>J=8Hz, 1H), 7,21 ( s, 1H), 7,11-7,03<br>(m, 3H), 5,68 ( d, J= 18,4Hz, 1H),<br>5,49 ( d, J= 18,4Hz, 1H), 3,78-3,71 (m,<br>2H), 2,94-2,88 (m, 1H), 2,80-2,66(m,<br>2H), 2,47-2,42 (m, 2H), 1,92-1,85 (m,<br>2H), 1,53-1,47(m, 2H), 1,35-1,29(m,<br>1H), 1,13-0,95(m, 6H), 0,76 (t, J<br>=7,6Hz, 3H)                                                                                                                               | 457,24 | 458,1 | Соединение<br>синтезировали<br>посредством<br>способа С с<br>применением 7-<br>бутил-5-[(3-<br>цианофенил)мети<br>л]-<br>5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,1<br>0Н-<br>циклогепта[b]инд<br>ол-4-карбоновой<br>кислоты и<br>аланина           |
| 7-бутил-5-[(3-<br>карбамоилфен<br>ил)метил]-N-<br>(2-<br>гидроксиэтил)<br>-<br>5Н,6Н,7Н,8Н,<br>9Н,10Н-<br>циклогепта[b]<br>индол-4-<br>карбоксамид | 400MHz-DMSO d6 : 12,85(br s, 1H),<br>8,22(t, J = 5,2Hz, 1H), 7,87 (br s, 1H),<br>7,68 (d, J =8,0Hz, 2H), 7,54 (dd, J =<br>6,0, 2,8 Гц, 1H), 7,51 ( s, 1H), 7,30-<br>7,25 (m, 2H), 7,03-6,98 ( m, 2H),<br>6,82(d, J=8,0Hz, 1H), 5,63 ( d, J=<br>17,6Hz, 1H), 5,47 ( d, J= 17,6Hz, 1H),<br>4,57(t, J = 6,0Hz, 1H), 3,26-3,23 (m,<br>2H), 3,12(m, 2H), 2,93-2,88 (m, 1H),<br>2,78 (d, J=15,2Hz, 1H), 2,70-2,66(m,<br>1H), 2,51-2,42 (m, 2H), 1,92-1,85 (m,<br>2H), 1,53-1,47(m, 2H), 1,43-1,33(m,<br>1H), 1,12-0,95(m, 6H), 0,75 (t, J =7Hz,<br>3H) | 461,27 | 462,2 | Соединение<br>синтезировали<br>посредством<br>способа С с<br>применением 7-<br>бутил-5-[(3-<br>карбамоилфенил)<br>метил]-<br>5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,1<br>0Н-<br>циклогепта[b]инд<br>ол-4-карбоновой<br>кислоты и 2-амин-<br>1-ола |

|                                                                                                                                            |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                        |        |       |                                                                                                                                                                                                                           |
|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------|-------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 7-бутил-5-[(3-<br>цианофенил)м<br>етил]-N-(2-<br>гидроксиэтил)<br>-<br>5Н,6Н,7Н,8Н,<br>9Н,10Н-<br>циклогепта[b]<br>индол-4-<br>карбоксамид | 400MHz-DMSO d6 : 8,31-8,27(m,<br>1H), 7,67 (d, J =7,2Hz, 2H), 7,60-7,56<br>(m, 1H), 7,45 ( t, J = 8.p0Hz, 1H),<br>7,17-7,07 (m, 2H), 7,05-7,02 ( m, 2H),<br>5,63 ( d, J= 18,0Hz, 1H), 5,50 ( d, J=<br>18,0Hz, 1H), 4,57(t, J = 6,0Hz, 1H),<br>3,26-3,20 (m, 2H), 3,14-3,06 (m, 2H),<br>2,92-2,86 (m, 1H), 2,77-2,69 (m, 2H),<br>2,47-2,42 (m, 2H), 1,93-1,85 (m, 2H),<br>1,53-1,47(m, 2H), 1,35-1,23(m, 1H),<br>1,12-0,95(m, 6H), 0,74 (t, J =7Hz, 3H) | 443,26 | 444,1 | Соединение<br>синтезировали<br>посредством<br>способа С с<br>применением 7-<br>бутил-5-[(3-<br>цианомоилфенил)<br>метил]-<br>5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,1<br>0Н-<br>циклогепта[b]инд<br>ол-4-карбоновой<br>кислоты и 2-амин-<br>1-ола |
| 7-бутил-5-[(3-<br>фторфенил)ме<br>тил]-<br>5Н,6Н,7Н,8Н,<br>9Н,10Н-<br>циклогепта[b]<br>индол-4-<br>карбоновая<br>кислота                   | 400MHz-DMSO d6 : 12,85(br s, 1H),<br>7,65 (d, J =8Hz, 1H), 7,38 (d, J =8Hz,<br>1H), 7,25 (m, 1H), 7,04-6,96 (m, 2H),<br>6,58-6,64(m, 2H), 5,80 ( d, J= 16,8Hz,<br>1H), 5,60( d, J= 17Hz, 1H), 2,93-2,87<br>(m, 1H), 2,83( d, J=16Hz, 1H), 2,72-<br>2,66(m, 1H), 2,47 (m, 1H), 1,92-1,84<br>(m, 2H), 1,58-1,48(m, 2H),1,45-<br>1,36(m, 1H), 1,11-0,95(m, 6H), 0,77 (t,<br>J =6,8Hz, 3H)                                                                 | 393,21 | 394,1 | Соединение<br>синтезировали<br>посредством<br>способа А с<br>применением 3-<br>бутил-1-<br>циклогептанона и<br>3-метил-1-<br>бензилбромада в<br>качестве<br>соответствующих<br>структурных<br>элементов                   |
| 7-бутил-5-[(3-<br>карбоксифени<br>л)метил]-<br>5Н,6Н,7Н,8Н,<br>9Н,10Н-<br>циклогепта[b]<br>индол-4-<br>карбоновая<br>кислота               | 400MHz-DMSO d6 : 12,85(br s, 1H),<br>7,75 (d, J =8Hz, 1H), 7,65 (d, J =8Hz,<br>1H), 7,47(s, 1H), 7,40-7,33O(m, 2H),<br>7,05(t, J = 7,2Hz, 1H), 6,97(d,<br>J=7,2Hz, 1H), 5,82 ( d, J= 16,8Hz,<br>1H), 5,61 ( d, J= 17Hz, 1H), 2,93-2,88<br>(m, 1H), 2,81( d, J=16Hz, 1H), 2,72-<br>2,66(m, 1H), 2,47 (m, 1H), 1,92-1,84<br>(m, 2H), 1,52-1,46(m, 2H), 1,36(br s,                                                                                        | 419,21 | 420,1 | Соединение<br>синтезировали<br>посредством<br>способа А с<br>применением 3-<br>бутил-1-<br>циклогептанона и<br>3-циано-1-<br>бензилбромада в                                                                              |

|  |                                                  |  |  |                                                         |
|--|--------------------------------------------------|--|--|---------------------------------------------------------|
|  | 1H), 1,12-0,93(m, 6H), 0,72 (t, J<br>=6,8Hz, 3H) |  |  | качестве<br>соответствующих<br>структурных<br>элементов |
|--|--------------------------------------------------|--|--|---------------------------------------------------------|

Таблица 1

Иллюстративные способы HPLC, которые могут применяться, включают

5 следующее:

#### СПОСОБ А

Колонка: Kinetex EVO C18 (50 мм x 4,6 мм, 5 мкм).

Подвижная фаза: В1: 0,1% FA в воде, А1: 0,1% FA в ACN.

10 Градиент: время (мин) / % А1: 0/2, 0,4/2, 2,7/98, 3,40/98, 3,41/2, 3,5/2.

Скорость потока в колонке: 2,0 мл/мин.

Температура колонки: 45°C.

#### СПОСОБ В

15 Колонка: ACQUITY UPLC BEH C18 (50 мм x 2,1 мм, 1,7 мкм).

Подвижная фаза: В1: 0,1% FA в воде, А1: 0,1% FA в ACN.

Градиент: время (мин) / % А1: 0/2, 0,4/2, 2,8/98, 3,4/98, 3,41/2, 3,5/2.

Скорость потока в колонке: 0,6 мл/мин.

Температура колонки: 60°C.

20

#### СПОСОБ С

Колонка: ACQUITY UPLC BEH C18 (50 мм x 2,1 мм, 1,7 мкм).

Подвижная фаза: В1: 0,1% FA в воде, А1: 0,1% FA в ACN.

Градиент: время (мин) / % А1: 0/2, 0,3/2, 2,3/98, 2,8/98, 2,81/2, 3,0/2.

25 Скорость потока в колонке: 0,8 мл/мин.

Температура колонки: 60°C.

## СПОСОБ D

Колонка: X-BRIDGE C18 (4,6 x 150 мм), 5 мкм.<sup>[SEP]</sup>

Подвижная фаза: А: 10 мМ ацетат аммония (aq), В: ацетонитрил.

Градиент: время относительно % В: разбавитель, 0/10, 1/10, 12/95, 15/98, 20/98,

5 20,01/10.

Температура колонки, скорость потока: температура окружающей среды<sup>[SEP]</sup>: 1 мл/мин  
: (ACN : вода).

## СПОСОБ E

10 Колонка: ACQUITY UPLC BEH C18 (50 мм x 2,1 мм, 1,7 мкм).

Подвижная фаза: В1: 0,1% FA в воде, А1: 0,1% FA в ACN/ACN.

Градиент: время (мин) / % А1: 0/2, 0,2/2, 5,0/98, 5,8/98, 5,81/2,0, 6,00/2,0.

Скорость потока в колонке: 0,8 мл/мин.

Температура колонки: 60°C.

15

## СПОСОБ F

Подвижная фаза А: 0,1% FA в воде.

Подвижная фаза В: 0,1% FA в ACN.

Градиент % В:

20 0/5, 0,3/5, 1,5/60, 2/98, 4/98, 5/5.

Поток: 0,6 мл/мин.

Колонка: BEH C18, 2,1\*50 мм, 1,7 мкм.

В таблице 2, приведенной ниже, соотнесены применяемые способы HPLC с

25 названием согласно IUPAC.

| Название согласно IUPAC                                                                                   | Мол. масса | Способ HPLC/rt  |
|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------|------------|-----------------|
| 7-бутил-5-[(3-цианофенил)метил]-N-(2-гидроксиэтил)-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоксамид    | 443,59     | Способ В / 2,51 |
| 2-({7-бутил-5-[(3-цианофенил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-ил}формамидо)уксусная кислота | 457,57     | Способ В / 2,54 |

|                                                                                                               |        |                  |
|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------|------------------|
| 2-({7-бутил-5-[(3-карбамоилфенил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-ил}формамидо)уксусная кислота | 475,59 | Способ В / 2,296 |
| 4-[(3-цианофенил)метил]-3-пропил-1Н,2Н,3Н,4Н-циклопента[b]индол-5-карбоновая кислота                          | 358,44 | Способ В / 2,454 |
| 4-[(3-карбамоилфенил)метил]-3-пропил-1Н,2Н,3Н,4Н-циклопента[b]индол-5-карбоновая кислота                      | 376,46 | Способ В / 2,220 |
| 9-[(3-цианофенил)метил]-3-пентил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновая кислота                          | 400,52 | Способ В / 2,755 |
| 9-[(3-карбамоилфенил)метил]-3-пентил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновая кислота                      | 418,54 | Способ В / 2,54  |
| 9-[(3-цианофенил)метил]-4-пентил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновая кислота                          | 400,52 | Способ В / 2,878 |
| 9-[(3-карбамоилфенил)метил]-4-пентил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновая кислота                      | 418,54 | Способ В / 2,64  |
| 3-бутил-9-[(3-цианофенил)метил]-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновая кислота                           | 386,50 | Способ В / 2,83  |
| 3-бутил-9-[(3-карбамоилфенил)метил]-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновая кислота                       | 404,51 | Способ В / 2,65  |
| 4-бутил-9-[(3-цианофенил)метил]-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновая кислота                           | 386,50 | Способ С / 2,79  |
| 4-бутил-9-[(3-карбамоилфенил)метил]-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновая кислота                       | 404,51 | Способ С / 2,53  |
| 9-[(3-цианофенил)метил]-3-пропил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновая кислота                          | 372,47 | Способ С / 2,27  |
| 9-[(3-карбамоилфенил)метил]-3-пропил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновая кислота                      | 390,48 | Способ В / 2,35  |
| 9-[(3-карбамоилфенил)метил]-4-пропил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновая кислота                      | 390,48 | Способ В / 2,29  |
| 9-[(3-цианофенил)метил]-3-этил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновая кислота                            | 358,44 | Способ В / 2,47  |
| 5-[(3-цианофенил)метил]-7-этил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновая кислота                     | 372,47 | Способ В / 2,66  |

|                                                                                                          |        |                  |
|----------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------|------------------|
| 5-[(3-карбамоилфенил)метил]-7-этил-<br>5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-<br>карбоновая кислота    | 390,48 | Способ В / 2,37  |
| 9-[(3-карбоксифенил)метил]-2-этил-2,3,4,9-<br>тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновая кислота                | 377,44 | Способ В / 2,496 |
| 9-[(3-карбамоилфенил)метил]-2-этил-2,3,4,9-<br>тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновая кислота               | 376,46 | Способ В / 2,38  |
| 4-[(3-цианофенил)метил]-2-пентил-<br>1Н,2Н,3Н,4Н-циклопента[b]индол-5-карбоновая<br>кислота              | 386,50 | Способ В / 2,69  |
| 4-[(3-карбамоилфенил)метил]-2-пентил-<br>1Н,2Н,3Н,4Н-циклопента[b]индол-5-карбоновая<br>кислота          | 404,51 | Способ В / 2,48  |
| 5-[(3-цианофенил)метил]-10-пентил-<br>5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-<br>карбоновая кислота     | 414,55 | Способ В / 2,746 |
| 5-[(3-карбамоилфенил)метил]-10-пентил-<br>5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-<br>карбоновая кислота | 432,56 | Способ В / 2,54  |
| 10-бутил-5-[(3-цианофенил)метил]-<br>5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-<br>карбоновая кислота      | 400,52 | Способ В / 2,663 |
| 10-бутил-5-[(3-карбамоилфенил)метил]-<br>5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-<br>карбоновая кислота  | 418,54 | Способ В / 2,441 |
| 9-[(3-карбамоилфенил)метил]-3-этил-2,3,4,9-<br>тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновая кислота               | 376,46 | Способ В / 2,23  |
| 5-[(3-цианофенил)метил]-10-пропил-<br>5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-<br>карбоновая кислота     | 386,50 | Способ В / 2,58  |
| 5-[(3-карбамоилфенил)метил]-10-пропил-<br>5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-<br>карбоновая кислота | 404,51 | Способ В / 2,34  |
| 5-[(3-цианофенил)метил]-10-этил-<br>5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-<br>карбоновая кислота       | 372,47 | Способ В / 2,64  |

|                                                                                                |        |                 |
|------------------------------------------------------------------------------------------------|--------|-----------------|
| 5-[(3-карбамоилфенил)метил]-10-этил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновая кислота | 390,48 | Способ В / 2,35 |
| 2-бутил-4-[(3-цианофенил)метил]-1Н,2Н,3Н,4Н-циклопента[b]индол-5-карбоновая кислота            | 372,47 | Способ В / 2,77 |
| 2-бутил-4-[(3-карбамоилфенил)метил]-1Н,2Н,3Н,4Н-циклопента[b]индол-5-карбоновая кислота        | 390,48 | Способ В / 2,51 |
| 3-бутил-4-[(3-цианофенил)метил]-1Н,2Н,3Н,4Н-циклопента[b]индол-5-карбоновая кислота            | 372,47 | Способ В / 2,54 |
| 3-бутил-4-[(3-карбамоилфенил)метил]-1Н,2Н,3Н,4Н-циклопента[b]индол-5-карбоновая кислота        | 390,48 | Способ В / 2,31 |
| 9-[(3-карбамоилфенил)метил]-4-этил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновая кислота         | 376,46 | Способ А / 2,30 |
| 9-[(3-карбамоилфенил)метил]-1-пропокси-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновая кислота     | 406,48 | Способ В / 2,18 |
| 9-[(3-карбоксифенил)метил]-1-этил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновая кислота          | 377,44 | Способ В / 2,34 |
| 9-[(3-карбамоилфенил)метил]-1-этил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновая кислота         | 376,46 | Способ В / 2,24 |
| 6-бутил-5-[(3-карбамоилфенил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновая кислота | 418,54 | Способ В / 2,50 |
| 1-бутил-9-[(3-цианофенил)метил]-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновая кислота            | 386,50 | Способ В / 2,63 |
| 9-[(3-цианофенил)метил]-1-(пентилокси)-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновая кислота     | 416,52 | Способ В / 2,64 |
| 9-[(3-карбамоилфенил)метил]-1-(пентилокси)-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновая кислота | 434,54 | Способ В / 2,33 |
| 1-бутил-9-[(3-карбамоилфенил)метил]-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновая кислота        | 404,51 | Способ В / 2,40 |
| 9-[(3-цианофенил)метил]-2-пентил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновая кислота           | 400,52 | Способ А / 2,69 |

|                                                                                             |        |                  |
|---------------------------------------------------------------------------------------------|--------|------------------|
| 9-[(3-карбамоилфенил)метил]-2-пентил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновая кислота    | 418,54 | Способ А / 2,42  |
| 2-бутил-9-[(3-карбамоилфенил)метил]-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновая кислота     | 404,51 | Способ D / 9,11  |
| 9-[(3-цианофенил)метил]-2-пропил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновая кислота        | 372,47 | Способ А / 2,50  |
| 9-[(3-карбамоилфенил)метил]-2-пропил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновая кислота    | 390,48 | Способ А / 2,20  |
| 9-[(2-фторфенил)метил]-2-гексил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновая кислота         | 407,53 | Способ Е / 3,343 |
| 2-гексил-9-[(2-метилфенил)метил]-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновая кислота        | 403,57 | Способ Е / 3,513 |
| 9-[(2-цианофенил)метил]-2-гексил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновая кислота        | 414,55 | Способ Е / 3,133 |
| 9-[(4-цианофенил)метил]-2-гексил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновая кислота        | 414,55 | Способ В / 3,066 |
| 2-гексил-9-[(4-метилфенил)метил]-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновая кислота        | 403,57 | Способ Е / 3,441 |
| 9-[(3-карбоксифенил)метил]-2-гексил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновая кислота     | 433,55 | Способ В / 2,908 |
| 9-[(3-карбоксифенил)метил]-2-гексил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновая кислота     | 433,55 | Способ В / 2,77  |
| 9-[(3-цианофенил)метил]-2-гексил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновая кислота        | 414,55 | Способ В / 2,91  |
| 9-[(3-карбамоилфенил)метил]-2-гексил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновая кислота    | 432,56 | Способ В / 2,70  |
| 5-[(4-фторфенил)метил]-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновая кислота  | 421,56 | Способ F / 3,82  |
| 5-[(2-фторфенил)метил]-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновая кислота  | 421,56 | Способ F / 3,86  |
| 7-гексил-5-[(2-метилфенил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновая кислота | 417,59 | Способ В / 3,685 |

|                                                                                                        |        |                  |
|--------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------|------------------|
| 5-[(4-цианофенил)метил]-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновая кислота            | 428,58 | Способ F / 3,70  |
| 7-гексил-5-[(4-метилфенил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновая кислота            | 417,59 | Способ F / 3,93  |
| 5-[(3-хлорфенил)метил]-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновая кислота             | 438,01 | Способ В / 3,669 |
| 7-гексил-5-[(3-метоксифенил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновая кислота          | 433,59 | Способ В / 3,359 |
| 7-гексил-5-[(3-метилфенил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновая кислота            | 417,59 | Способ F / 3,92  |
| 5-[(3-фторфенил)метил]-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновая кислота             | 421,56 | Способ В / 3,448 |
| 5-[(3-цианофенил)метил]-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновая кислота            | 428,58 | Способ В / 2,83  |
| 5-[(3-карбамоилфенил)метил]-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновая кислота        | 446,59 | Способ В / 2,72  |
| 9-[(3-цианофенил)метил]-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой кислоты                            | 330,39 | Способ С / 1,87  |
| 9-[(3-карбамоилфенил)метил]-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой кислоты                        | 348,40 | Способ С / 1,65  |
| 5-[(3-цианофенил)метил]-7-(2-фенилэтил)-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновая кислота     | 448,57 | Способ С / 2,16  |
| 5-[(3-карбамоилфенил)метил]-7-(2-фенилэтил)-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновая кислота | 466,58 | Способ С / 1,98  |

|                                                                                                     |        |                  |
|-----------------------------------------------------------------------------------------------------|--------|------------------|
| 5-[(3-цианофенил)метил]-7-пентил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновая кислота         | 414,55 | Способ В / 2,60  |
| 5-[(3-карбамоилфенил)метил]-7-пентил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновая кислота     | 432,56 | Способ В / 2,42  |
| 7-бутил-5-[(2-фторфенил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновая кислота           | 393,50 | Способ В / 3,010 |
| 7-бутил-5-[(2-метилфенил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновая кислота          | 389,54 | Способ В / 3,049 |
| 7-бутил-5-[(2-цианофенил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновая кислота          | 400,52 | Способ F / 3,55  |
| 7-бутил-5-[(4-метилфенил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновая кислота          | 389,54 | Способ В / 3,058 |
| 7-бутил-5-[(2-карбамоилфенил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновая кислота      | 418,54 | Способ В / 2,729 |
| 7-бутил-5-[(4-карбамоилфенил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновая кислота      | 418,54 | Способ В / 2,594 |
| 7-бутил-5-[(3-карбоксифенил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновая кислота       | 419,52 | Способ В / 2,726 |
| 7-бутил-5-[(2-метоксипиридин-4-ил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновая кислота | 406,53 | Способ В / 2,8   |
| 7-бутил-5-[(3-гидроксифенил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновая кислота       | 391,51 | Способ В / 3,38  |
| 7-бутил-5-[(3-хлорфенил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновая кислота           | 409,95 | Способ В / 3,037 |

|                                                                                                         |        |                  |
|---------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------|------------------|
| 7-бутил-5-[(3-метоксифенил)метил]-<br>5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[б]индол-4-<br>карбоновая кислота    | 405,54 | Способ В / 2,967 |
| 7-бутил-5-[(3-метилфенил)метил]-<br>5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[б]индол-4-<br>карбоновая кислота      | 389,54 | Способ В / 3,057 |
| 7-бутил-5-[(пиридин-3-ил)метил]-<br>5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[б]индол-4-<br>карбоновая кислота      | 376,50 | Способ В / 3,16  |
| 7-бутил-5-[(3-фторфенил)метил]-<br>5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[б]индол-4-<br>карбоновая кислота       | 393,50 | Способ Е / 2,723 |
| 7-бутил-5-[(3-циановфенил)метил]-<br>5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[б]индол-4-<br>карбоновая кислота     | 400,52 | Способ В / 2,68  |
| 7-бутил-5-[(3-карбамоилфенил)метил]-<br>5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[б]индол-4-<br>карбоновая кислота  | 418,54 | Способ В / 2,45  |
| 5-[(3-карбамоилфенил)метил]-7-пропил-<br>5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[б]индол-4-<br>карбоновая кислота | 404,51 | Способ А / 2,23  |

Таблица 2

- Активность соединений в отношении потребления глюкозы адипоцитами
- 5 тестировали на мышинных адипоцитах, представляющих собой дифференцированные клетки 3Т3-L1. Преадипоциты 3Т3-L1 (АТСС) рутинно культивировали в среде для роста, состоящей из DMEM с высоким содержанием глюкозы (Sigma), 10% FBS (Gibco), пенициллина в количестве 10 ЕД/мл и стрептомицина в количестве 10 мкг/мл (P/S; Gibco). Для индуцирования адипогенной дифференцировки конфлюэнтный слой
- 10 клеток 3Т3-L1 инкубировали со средой для роста, содержащей 2 мкМ росиглитазона, 1 мкМ дексаметазона, 500 мкМ IBMX и инсулин в количестве 1 мкг/мл (Sigma). Через сорок восемь (48) часов (в день 2) и в дни 4 и 6 среду клеток заменяли свежей средой, содержащей инсулин в количестве 1 мкг/мл. В дни 8 и 10 среду обновляли стандартной средой для роста, а добавление инсулина не проводили. В день 11 или 12

среду клеток заменяли свежей средой, содержащей либо указанные соединения (10 мкМ), либо среду-носитель, в которой были растворены соединения (DMSO).

Конечная концентрация DMSO составляла 0,1% (об./об.). Среду для роста, содержащую 0,1% DMSO, инкубировали в лунках для культивирования, не

- 5 содержащих клеток, и ее использовали в качестве контроля. Через период продолжительностью от двадцати двух до 24 часов среду собирали и подвергали центрифугированию при 10000 g в течение 5 мин. Концентрацию глюкозы в супернатантах определяли с применением колориметрического анализа. (Glucose Assay Kit I, Eton Biosciences). Потребление глюкозы клетками, обработанными соединением
- 10 и средой-носителем, измеряли как снижение уровня глюкозы в культуральной среде и представляли как среднее кратное изменение (соединение/DMSO)  $\pm$  стандартное отклонение (SD).

- Профиль активности соединений по отношению к FABP4 определяли с применением анализа времяразрешенного флуоресцентного переноса энергии (TR-FRET) на основе тербия (Tb). В ходе анализа измеряли опосредованное соединением
- 15 вытеснение флуоресцентной жирной кислоты BODIPY FL C12 (Thermo Fisher; номер по каталогу D3822) из рекомбинантного человеческого FABP4, меченного His6 (His6-FABP4; Cayman Chemicals, номер по каталогу 10009549), что осуществляли посредством регистрации переноса энергии от молекулы-донора ТВ на антителе к
- 20 His6-метке к акцепторному фрагменту BODIPY. Вкратце, соединения получали в концентрациях 0,362 мМ и 0,0362 мМ и BODIPY FL C12 получали в концентрации 4,2 мкМ в DMSO. Добавляли по 1,2 мкл каждого соединения или DMSO (среда-носитель) и 1,2 мкл BODIPY FL C12 в лунки 384-луночного черного полипропиленового планшета. His6-FABP4 и Tb-антитело к His6 получали в буфере для анализа (25 мМ
- 25 Tris/HCl, pH 7,4, 0,4 мг/мл  $\gamma$ -глобулинов, 0,010% NP-40, 1 мМ DTT) в концентрациях 83 нМ и 49,6 нМ соответственно. Затем растворы белка и антитела смешивали в соотношении 34:7 (об./об.) и инкубировали на льду в течение 30 минут. Анализ начинали посредством добавления 41 мкл полученного в результате раствора белок/антитело в лунки, содержащие соединения и BODIPY FL C12. Планшет
- 30 центрифугировали и инкубировали при комнатной температуре в течение 10 мин. Сигналы TR-FRET записывали с применением планшет-ридера EnVision Multilabel (PerkinElmer; длина волны возбуждения для ТВ составляет 320 нм, длина волны излучения для BODIPY FL C12 составляет 520 нм; длина волны излучения для ТВ составляет 615 нм). Относительный коэффициент флуоресценции (520 нм \* 10000/615

нм) применяли для расчета опосредованного соединением подавления связывания жирной кислоты BODIPY C12 FL с FABP4. Соединения тестировали в трех повторностях и результаты отображали как средний процент ингибирования (соединение \* 100/DMSO)  $\pm$  стандартное отклонение (SD). Потребление глюкозы и

5 ингибирование FABP4 показано ниже в таблице 3, приведенной ниже.

|                                                                                                    | Потребление глюкозы<br>(кратное изменение) |                        | Ингибирование FABP4<br>(%) при 10 мкМ |                        | Ингибирование FABP4<br>(%) при 1 мкМ |                        |
|----------------------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------------------------|------------------------|---------------------------------------|------------------------|--------------------------------------|------------------------|
| Название согласно IUPAC                                                                            | Среднее значение                           | Стандартное отклонение | Среднее значение                      | Стандартное отклонение | Среднее значение                     | Стандартное отклонение |
| 5-[(3-цианофенил)метил]-2-фтор-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновая кислота | 1,33                                       | 0,16                   | 93,93                                 | 5,33                   | 87,33                                | 2,21                   |
| 5-[(6-цианопиридин-2-ил)метил]-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-                   | 1,28                                       | 0,05                   | 88,08                                 | 2,75                   | 93,45                                | 3,71                   |

|                                                                                                                                               |      |      |       |      |       |      |
|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|------|------|-------|------|-------|------|
| карбоновая<br>кислота                                                                                                                         |      |      |       |      |       |      |
| 5-[(6-<br>карбамоилп<br>иридин-2-<br>ил)метил]-7-<br>гексил-<br>5Н,6Н,7Н,8<br>Н,9Н,10Н-<br>циклогепта[<br>b]индол-4-<br>карбоновая<br>кислота | 1,23 | 0,07 | 95,20 | 1,10 | 93,97 | 0,72 |
| 6-({4-<br>карбокси-7-<br>гексил-<br>5Н,6Н,7Н,8<br>Н,9Н,10Н-<br>циклогепта[<br>b]индол-5-<br>ил}метил)пи<br>ридин-2-<br>карбоновая<br>кислота  | 0,96 | 0,06 | 96,52 | 4,41 | 91,60 | 2,01 |
| 5-[(3-циано-<br>2-<br>фторфенил)<br>метил]-7-<br>гексил-<br>5Н,6Н,7Н,8<br>Н,9Н,10Н-<br>циклогепта[<br>b]индол-4-<br>карбоновая<br>кислота     | 1,36 | 0,11 | 95,46 | 2,28 | 87,86 | 2,41 |

|                                                                                                     |       |      |       |      |        |      |
|-----------------------------------------------------------------------------------------------------|-------|------|-------|------|--------|------|
| 5-[(1,3-бензоксазол-6-ил)метил]-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[б]индол-4-карбоновая кислота | 1,17  | 0,00 | 94,89 | 6,25 | 101,45 | 5,49 |
| 5-[(1,3-бензоксазол-5-ил)метил]-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[б]индол-4-карбоновая кислота | 0,87  | 0,05 | 88,48 | 3,59 | 88,05  | 4,24 |
| 5-[(6-фторпиридин-2-ил)метил]-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[б]индол-4-карбоновая кислота   | 1,25  | 0,07 | 91,85 | 6,14 | 86,45  | 3,56 |
| 5-[(2-фторпиридин-4-ил)метил]-7-гексил-                                                             | н. д. |      | 90,36 | 6,43 | 92,85  | 2,17 |

|                                                                                                                                                        |       |      |       |      |       |      |
|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-------|------|-------|------|-------|------|
| 5Н,6Н,7Н,8<br>Н,9Н,10Н-<br>циклогепта[<br>b]индол-4-<br>карбоновая<br>кислота                                                                          |       |      |       |      |       |      |
| 7-гексил-5-<br>{[6-<br>(трифтормет<br>ил)пиридин-<br>2-<br>ил]метил}-<br>5Н,6Н,7Н,8<br>Н,9Н,10Н-<br>циклогепта[<br>b]индол-4-<br>карбоновая<br>кислота | н. д. |      | 79,79 | 5,72 | 79,67 | 6,79 |
| 7-гексил-5-<br>{[2-<br>(трифтормет<br>ил)пиридин-<br>4-<br>ил]метил}-<br>5Н,6Н,7Н,8<br>Н,9Н,10Н-<br>циклогепта[<br>b]индол-4-<br>карбоновая<br>кислота | н. д. |      | 94,69 | 4,08 | 87,58 | 3,36 |
| 5-[(5-<br>цианопирид<br>ин-3-<br>ил)метил]-7-<br>гексил-<br>5Н,6Н,7Н,8                                                                                 | 1,06  | 0,04 | 91,85 | 5,52 | 90,51 | 1,79 |

|                                                                                                                                          |       |      |       |      |       |      |
|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-------|------|-------|------|-------|------|
| Н,9Н,10Н-<br>циклогепта[<br>b]индол-4-<br>карбоновая<br>кислота                                                                          |       |      |       |      |       |      |
| 5-[(5-<br>цианотиофе<br>н-2-<br>ил)метил]-7-<br>гексил-<br>5Н,6Н,7Н,8<br>Н,9Н,10Н-<br>циклогепта[<br>b]индол-4-<br>карбоновая<br>кислота | 1,05  | 0,03 | 87,32 | 3,51 | 86,60 | 1,60 |
| 5-[(4-<br>цианотиофе<br>н-2-<br>ил)метил]-7-<br>гексил-<br>5Н,6Н,7Н,8<br>Н,9Н,10Н-<br>циклогепта[<br>b]индол-4-<br>карбоновая<br>кислота | н. д. |      | 89,42 | 3,25 | 83,31 | 4,04 |
| 5-[(5-<br>цианофуран-<br>2-ил)метил]-<br>7-гексил-<br>5Н,6Н,7Н,8<br>Н,9Н,10Н-<br>циклогепта[<br>b]индол-4-                               | 1,29  | 0,10 | 90,01 | 4,54 | 81,35 | 3,96 |

|                                                                                                                                                    |       |      |       |      |       |      |
|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-------|------|-------|------|-------|------|
| карбоновая<br>кислота                                                                                                                              |       |      |       |      |       |      |
| 5-[(3,5-<br>диметил-1,2-<br>оксазол-4-<br>ил)метил]-7-<br>гексил-<br>5Н,6Н,7Н,8<br>Н,9Н,10Н-<br>циклогепта[<br>b]индол-4-<br>карбоновая<br>кислота | 0,95  | 0,00 | 95,64 | 4,70 | 79,75 | 2,98 |
| 5-(3-<br>цианобензoi<br>л)-7-гексил-<br>5Н,6Н,7Н,8<br>Н,9Н,10Н-<br>циклогепта[<br>b]индол-4-<br>карбоновая<br>кислота                              | н. д. |      | 88,54 | 2,91 | 87,12 | 3,59 |
| 5-[(1,3-<br>бензоксазол-<br>7-ил)метил]-<br>7-гексил-<br>5Н,6Н,7Н,8<br>Н,9Н,10Н-<br>циклогепта[<br>b]индол-4-<br>карбоновая<br>кислота             | н. д. |      | 95,32 | 4,32 | 92,05 | 8,03 |
| 5-[(5-<br>цианотиофе<br>н-3-<br>ил)метил]-7-                                                                                                       | 1,20  | 0,00 | н. д. |      | н. д. |      |

|                                                                                                                                       |      |      |        |       |       |      |
|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|------|------|--------|-------|-------|------|
| гексил-<br>5Н,6Н,7Н,8<br>Н,9Н,10Н-<br>циклогепта[<br>b]индол-4-<br>карбоновая<br>кислота                                              |      |      |        |       |       |      |
| 5-[(3-<br>карбамоилф<br>енил)метил]<br>-7-пропил-<br>5Н,6Н,7Н,8<br>Н,9Н,10Н-<br>циклогепта[<br>b]индол-4-<br>карбоновая<br>кислота    | 1,06 | 0,05 | 91,42  | 3,55  | 85,14 | 1,91 |
| 7-бутил-5-<br>[(3-<br>карбамоилф<br>енил)метил]<br>-<br>5Н,6Н,7Н,8<br>Н,9Н,10Н-<br>циклогепта[<br>b]индол-4-<br>карбоновая<br>кислота | 1,12 | 0,08 | 116,71 | 37,23 | 89,41 | 2,63 |
| 7-бутил-5-<br>[(3-<br>цианофенил<br>)метил]-<br>5Н,6Н,7Н,8<br>Н,9Н,10Н-<br>циклогепта[<br>b]индол-4-                                  | 1,29 | 0,02 | 112,30 | 41,26 | 73,46 | 6,37 |

|                                                                                                                                 |      |      |       |      |       |      |
|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|------|------|-------|------|-------|------|
| карбоновая<br>кислота                                                                                                           |      |      |       |      |       |      |
| 7-бутил-5-<br>[(пиридин-3-<br>ил)метил]-<br>5Н,6Н,7Н,8<br>Н,9Н,10Н-<br>циклогепта[<br>b]индол-4-<br>карбоновая<br>кислота       | 1,21 | 0,00 | 83,81 | 1,55 | 71,63 | 5,54 |
| 7-бутил-5-<br>[(3-<br>метилфенил<br>)метил]-<br>5Н,6Н,7Н,8<br>Н,9Н,10Н-<br>циклогепта[<br>b]индол-4-<br>карбоновая<br>кислота   | 1,32 | 0,05 | 91,05 | 1,76 | 94,75 | 7,89 |
| 7-бутил-5-<br>[(3-<br>метоксифен<br>ил)метил]-<br>5Н,6Н,7Н,8<br>Н,9Н,10Н-<br>циклогепта[<br>b]индол-4-<br>карбоновая<br>кислота | 1,23 | 0,02 | 86,49 | 3,46 | 91,65 | 4,14 |
| 7-бутил-5-<br>[(3-<br>хлорфенил)<br>метил]-<br>5Н,6Н,7Н,8                                                                       | 1,18 | 0,04 | 83,05 | 5,99 | 84,25 | 4,37 |

|                                                                                                                                            |       |      |       |      |       |      |
|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-------|------|-------|------|-------|------|
| Н,9Н,10Н-<br>циклогепта[<br>b]индол-4-<br>карбоновая<br>кислота                                                                            |       |      |       |      |       |      |
| 7-бутил-5-<br>[(3-<br>гидроксифе<br>нил)метил]-<br>5Н,6Н,7Н,8<br>Н,9Н,10Н-<br>циклогепта[<br>b]индол-4-<br>карбоновая<br>кислота           | 1,14  | 0,08 | 96,10 | 6,35 | 98,73 | 1,50 |
| 7-бутил-5-<br>[(2-<br>метоксипир<br>идин-4-<br>ил)метил]-<br>5Н,6Н,7Н,8<br>Н,9Н,10Н-<br>циклогепта[<br>b]индол-4-<br>карбоновая<br>кислота | н. д. |      | 88,17 | 2,64 | 83,40 | 3,63 |
| 7-бутил-5-<br>[(4-<br>карбамоилф<br>енил)метил]<br>-<br>5Н,6Н,7Н,8<br>Н,9Н,10Н-<br>циклогепта[<br>b]индол-4-                               | 1,13  | 0,09 | 95,47 | 2,56 | 92,59 | 3,07 |

|                                                                                                                                       |      |      |       |      |        |      |
|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|------|------|-------|------|--------|------|
| карбоновая<br>кислота                                                                                                                 |      |      |       |      |        |      |
| 7-бутил-5-<br>[(2-<br>карбамоилф<br>енил)метил]<br>-<br>5Н,6Н,7Н,8<br>Н,9Н,10Н-<br>циклогепта[<br>b]индол-4-<br>карбоновая<br>кислота | 1,11 | 0,07 | 94,50 | 4,71 | 71,33  | 6,27 |
| 7-бутил-5-<br>[(4-<br>метилфенил<br>)метил]-<br>5Н,6Н,7Н,8<br>Н,9Н,10Н-<br>циклогепта[<br>b]индол-4-<br>карбоновая<br>кислота         | 1,27 | 0,02 | 92,42 | 2,91 | 106,31 | 4,76 |
| 7-бутил-5-<br>[(2-<br>цианофенил<br>)метил]-<br>5Н,6Н,7Н,8<br>Н,9Н,10Н-<br>циклогепта[<br>b]индол-4-<br>карбоновая<br>кислота         | 1,10 | 0,03 | 87,30 | 0,72 | 91,50  | 7,07 |
| 7-бутил-5-<br>[(2-<br>метилфенил                                                                                                      | 1,12 | 0,03 | 95,31 | 3,47 | 100,87 | 3,68 |

|                                                                                                                                    |      |      |       |      |        |      |
|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|------|------|-------|------|--------|------|
| )метил]-<br>5Н,6Н,7Н,8<br>Н,9Н,10Н-<br>циклогепта[<br>b]индол-4-<br>карбоновая<br>кислота                                          |      |      |       |      |        |      |
| 7-бутил-5-<br>[(2-<br>фторфенил)<br>метил]-<br>5Н,6Н,7Н,8<br>Н,9Н,10Н-<br>циклогепта[<br>b]индол-4-<br>карбоновая<br>кислота       | 1,11 | 0,09 | 88,10 | 5,30 | 92,06  | 4,48 |
| 5-[(3-<br>карбамоилф<br>енил)метил]<br>-7-пентил-<br>5Н,6Н,7Н,8<br>Н,9Н,10Н-<br>циклогепта[<br>b]индол-4-<br>карбоновая<br>кислота | 1,27 | 0,01 | 93,32 | 2,47 | 91,21  | 3,77 |
| 5-[(3-<br>цианофенил<br>)метил]-7-<br>пентил-<br>5Н,6Н,7Н,8<br>Н,9Н,10Н-<br>циклогепта[<br>b]индол-4-                              | 1,35 | 0,00 | 96,09 | 3,74 | 100,38 | 6,94 |

|                                                                                                                                               |       |      |       |      |        |      |
|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-------|------|-------|------|--------|------|
| карбоновая<br>кислота                                                                                                                         |       |      |       |      |        |      |
| 5-[(3-<br>карбамоилф<br>енил)метил]<br>-7-(2-<br>фенилэтил)-<br>5Н,6Н,7Н,8<br>Н,9Н,10Н-<br>циклогепта[<br>b]индол-4-<br>карбоновая<br>кислота | н. д. |      | 98,04 | 2,98 | 99,08  | 2,15 |
| 5-[(3-<br>цианофенил<br>)метил]-7-<br>(2-<br>фенилэтил)-<br>5Н,6Н,7Н,8<br>Н,9Н,10Н-<br>циклогепта[<br>b]индол-4-<br>карбоновая<br>кислота     | 1,02  | 0,10 | 94,55 | 1,81 | 93,10  | 2,67 |
| 5-[(3-<br>карбамоилф<br>енил)метил]<br>-7-гексил-<br>5Н,6Н,7Н,8<br>Н,9Н,10Н-<br>циклогепта[<br>b]индол-4-<br>карбоновая<br>кислота            | 1,26  | 0,03 | 94,16 | 3,93 | 101,55 | 6,09 |
| 5-[(3-<br>цианофенил                                                                                                                          | 1,26  | 0,01 | 88,70 | 1,75 | 94,10  | 5,70 |

|                                                                                                |      |      |       |      |       |       |
|------------------------------------------------------------------------------------------------|------|------|-------|------|-------|-------|
| )метил]-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[б]индол-4-карбоновая кислота                    |      |      |       |      |       |       |
| 5-[(3-карбамоилфенил)метил]-7-октил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[б]индол-4-карбоновая кислота | 1,13 | 0,03 | 93,61 | 5,74 | 98,10 | 12,50 |
| 5-[(3-цианофенил)метил]-7-октил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[б]индол-4-карбоновая кислота     | 1,12 | 0,04 | 93,03 | 3,55 | 94,55 | 2,06  |
| 5-[(3-фторфенил)метил]-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[б]индол-4-                       | 1,14 | 0,07 | 92,94 | 2,30 | 93,56 | 6,10  |

|                                                                                                                                  |      |      |       |       |        |      |
|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|------|------|-------|-------|--------|------|
| карбоновая<br>кислота                                                                                                            |      |      |       |       |        |      |
| 7-гексил-5-<br>[(пиридин-3-<br>ил)метил]-<br>5Н,6Н,7Н,8<br>Н,9Н,10Н-<br>циклогепта[<br>b]индол-4-<br>карбоновая<br>кислота       | 1,14 | 0,05 | 97,30 | 1,45  | 105,24 | 9,00 |
| 7-гексил-5-<br>[(3-<br>метилфенил<br>)метил]-<br>5Н,6Н,7Н,8<br>Н,9Н,10Н-<br>циклогепта[<br>b]индол-4-<br>карбоновая<br>кислота   | 1,13 | 0,03 | 94,68 | 4,27  | 98,63  | 3,46 |
| 7-гексил-5-<br>[(3-<br>метоксифен<br>ил)метил]-<br>5Н,6Н,7Н,8<br>Н,9Н,10Н-<br>циклогепта[<br>b]индол-4-<br>карбоновая<br>кислота | 1,13 | 0,00 | 93,59 | 5,69  | 93,23  | 4,03 |
| 5-[(3-<br>хлорфенил)<br>метил]-7-<br>гексил-<br>5Н,6Н,7Н,8                                                                       | 1,18 | 0,00 | 45,91 | 42,86 | 102,84 | 4,45 |

|                                                                                                                                             |      |      |       |      |       |      |
|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|------|------|-------|------|-------|------|
| Н,9Н,10Н-<br>циклогепта[<br>b]индол-4-<br>карбоновая<br>кислота                                                                             |      |      |       |      |       |      |
| 7-гексил-5-<br>[(2-<br>метоксипир<br>идин-4-<br>ил)метил]-<br>5Н,6Н,7Н,8<br>Н,9Н,10Н-<br>циклогепта[<br>b]индол-4-<br>карбоновая<br>кислота | 1,12 | 0,03 | 82,81 | 1,77 | 78,13 | 5,92 |
| 5-[(3-<br>карбоксибен<br>зил)метил]-7-<br>гексил-<br>5Н,6Н,7Н,8<br>Н,9Н,10Н-<br>циклогепта[<br>b]индол-4-<br>карбоновая<br>кислота          | 1,15 | 0,00 | 89,21 | 1,85 | 89,78 | 3,93 |
| 5-[(4-<br>карбамоилф<br>енил)метил]<br>-7-гексил-<br>5Н,6Н,7Н,8<br>Н,9Н,10Н-<br>циклогепта[<br>b]индол-4-<br>карбоновая<br>кислота          | 1,05 | 0,00 | 83,82 | 1,05 | 77,65 | 2,37 |

|                                                                                                 |      |      |       |       |       |      |
|-------------------------------------------------------------------------------------------------|------|------|-------|-------|-------|------|
| 5-[(2-карбамоилфенил)метил]-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[б]индол-4-карбоновая кислота | 0,97 | 0,05 | 82,04 | 2,38  | 79,18 | 6,48 |
| 7-гексил-5-[(4-метилфенил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[б]индол-4-карбоновая кислота     | 1,05 | 0,02 | 91,67 | 11,79 | 95,59 | 4,31 |
| 5-[(4-цианофенил)метил]-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[б]индол-4-карбоновая кислота     | 0,94 | 0,03 | 84,65 | 4,88  | 81,28 | 2,79 |
| 5-[(2-цианофенил)метил]-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-                                            | 0,91 | 0,00 | 88,61 | 0,70  | 88,51 | 3,49 |

|                                                                                                                                |      |      |       |      |       |      |
|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|------|------|-------|------|-------|------|
| циклогепта[<br>b]индол-4-<br>карбоновая<br>кислота                                                                             |      |      |       |      |       |      |
| 7-гексил-5-<br>[(2-<br>метилфенил<br>)метил]-<br>5Н,6Н,7Н,8<br>Н,9Н,10Н-<br>циклогепта[<br>b]индол-4-<br>карбоновая<br>кислота | 1,00 | 0,03 | 84,23 | 3,88 | 92,71 | 1,33 |
| 5-[(2-<br>фторфенил)<br>метил]-7-<br>гексил-<br>5Н,6Н,7Н,8<br>Н,9Н,10Н-<br>циклогепта[<br>b]индол-4-<br>карбоновая<br>кислота  | 1,17 | 0,04 | 87,30 | 6,15 | 77,54 | 5,88 |
| 5-[(4-<br>фторфенил)<br>метил]-7-<br>гексил-<br>5Н,6Н,7Н,8<br>Н,9Н,10Н-<br>циклогепта[<br>b]индол-4-<br>карбоновая<br>кислота  | 1,17 | 0,10 | 77,60 | 2,50 | 74,41 | 4,82 |
| 9-[(3-<br>карбамоилф                                                                                                           | 1,13 | 0,03 | 90,45 | 0,43 | 92,76 | 4,16 |

|                                                                                                                            |      |      |       |      |       |       |
|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|------|------|-------|------|-------|-------|
| енил)метил]<br>-2-гексил-<br>2,3,4,9-<br>тетрагидро-<br>1Н-<br>карбазол-8-<br>карбоновая<br>кислота                        |      |      |       |      |       |       |
| 9-[(3-<br>цианофенил<br>)метил]-2-<br>гексил-<br>2,3,4,9-<br>тетрагидро-<br>1Н-<br>карбазол-8-<br>карбоновая<br>кислота    | 1,16 | 0,03 | 83,38 | 8,29 | 63,63 | 1,64  |
| 9-[(3-<br>карбоксифен<br>ил)метил]-2-<br>гексил-<br>2,3,4,9-<br>тетрагидро-<br>1Н-<br>карбазол-8-<br>карбоновая<br>кислота | 1,01 | 0,11 | 72,96 | 5,81 | 23,88 | 14,24 |
| 2-гексил-9-<br>[(пиридин-3-<br>ил)метил]-<br>2,3,4,9-<br>тетрагидро-<br>1Н-<br>карбазол-8-                                 | 1,21 | 0,07 | н. д. |      | н. д. |       |

|                                                                                                                                      |       |      |       |      |       |      |
|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-------|------|-------|------|-------|------|
| карбоновая<br>кислота                                                                                                                |       |      |       |      |       |      |
| 2-гексил-9-<br>[(3-<br>гидроксифе<br>нил)метил]-<br>2,3,4,9-<br>тетрагидро-<br>1Н-<br>карбазол-8-<br>карбоновая<br>кислота           | 1,11  | 0,00 | 93,09 | 4,30 | 77,86 | 5,25 |
| 2-гексил-9-<br>[(2-<br>метоксипир<br>идин-4-<br>ил)метил]-<br>2,3,4,9-<br>тетрагидро-<br>1Н-<br>карбазол-8-<br>карбоновая<br>кислота | 1,19  | 0,04 | 77,82 | 4,70 | 44,22 | 7,18 |
| 9-[(3-<br>карбоксифен<br>ил)метил]-2-<br>гексил-<br>2,3,4,9-<br>тетрагидро-<br>1Н-<br>карбазол-8-<br>карбоновая<br>кислота           | н. д. |      | 80,24 | 4,24 | 42,40 | 4,80 |
| 9-[(4-<br>карбамоилф<br>енил)метил]                                                                                                  | н. д. |      | 89,27 | 7,22 | 87,30 | 5,09 |

|                                                                                                                             |       |  |       |      |       |      |
|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-------|--|-------|------|-------|------|
| -2-гексил-<br>2,3,4,9-<br>тетрагидро-<br>1Н-<br>карбазол-8-<br>карбоновая<br>кислота                                        |       |  |       |      |       |      |
| 9-[(2-<br>карбамоилф<br>енил)метил]<br>-2-гексил-<br>2,3,4,9-<br>тетрагидро-<br>1Н-<br>карбазол-8-<br>карбоновая<br>кислота | н. д. |  | 80,74 | 5,59 | 31,12 | 6,48 |
| 2-гексил-9-<br>[(4-<br>метилфенил<br>)метил]-<br>2,3,4,9-<br>тетрагидро-<br>1Н-<br>карбазол-8-<br>карбоновая<br>кислота     | н. д. |  | 88,47 | 4,23 | 74,28 | 6,79 |
| 9-[(4-<br>цианофенил<br>)метил]-2-<br>гексил-<br>2,3,4,9-<br>тетрагидро-<br>1Н-<br>карбазол-8-                              | н. д. |  | 78,90 | 4,26 | 39,74 | 4,51 |

|                                                                                                                         |       |      |       |      |       |      |
|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-------|------|-------|------|-------|------|
| карбоновая<br>кислота                                                                                                   |       |      |       |      |       |      |
| 9-[(2-<br>цианофенил<br>)метил]-2-<br>гексил-<br>2,3,4,9-<br>тетрагидро-<br>1Н-<br>карбазол-8-<br>карбоновая<br>кислота | 1,13  | 0,03 | 92,72 | 3,52 | 87,33 | 7,02 |
| 2-гексил-9-<br>[(2-<br>метилфенил<br>)метил]-<br>2,3,4,9-<br>тетрагидро-<br>1Н-<br>карбазол-8-<br>карбоновая<br>кислота | 1,23  | 0,01 | 83,16 | 6,50 | 87,40 | 2,66 |
| 9-[(2-<br>фторфенил)<br>метил]-2-<br>гексил-<br>2,3,4,9-<br>тетрагидро-<br>1Н-<br>карбазол-8-<br>карбоновая<br>кислота  | 1,24  | 0,02 | 84,93 | 4,93 | 81,82 | 9,38 |
| 9-[(3-<br>карбамоилф<br>енил)метил]<br>-2-(2-                                                                           | н. д. |      | 94,12 | 6,56 | 98,44 | 3,55 |

|                                                                                                                                        |       |      |       |      |       |      |
|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-------|------|-------|------|-------|------|
| фенилэтил)-<br>2,3,4,9-<br>тетрагидро-<br>1Н-<br>карбазол-8-<br>карбоновая<br>кислота                                                  |       |      |       |      |       |      |
| 9-[(3-<br>цианофенил<br>)метил]-2-<br>(2-<br>фенилэтил)-<br>2,3,4,9-<br>тетрагидро-<br>1Н-<br>карбазол-8-<br>карбоновая<br>кислота     | н. д. |      | 92,33 | 5,58 | 92,65 | 2,83 |
| 9-[(3-<br>карбамоилф<br>енил)метил]<br>-4-(2-<br>фенилэтил)-<br>2,3,4,9-<br>тетрагидро-<br>1Н-<br>карбазол-8-<br>карбоновая<br>кислота | н. д. |      | 77,91 | 0,56 | 44,14 | 3,62 |
| 9-[(3-<br>цианофенил<br>)метил]-4-<br>(2-<br>фенилэтил)-<br>2,3,4,9-<br>тетрагидро-                                                    | 1,10  | 0,01 | 53,44 | 4,98 | 31,03 | 7,46 |

|                                                                                          |      |      |       |       |       |      |
|------------------------------------------------------------------------------------------|------|------|-------|-------|-------|------|
| 1Н-карбазол-8-карбоновая кислота                                                         |      |      |       |       |       |      |
| 9-[(3-карбамоилфенил)метил]-2-пропил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновая кислота | 1,09 | 0,02 | 88,00 | 6,66  | 83,59 | 3,12 |
| 9-[(3-цианофенил)метил]-2-пропил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновая кислота     | 1,21 | 0,00 | 81,41 | 4,67  | 55,57 | 7,71 |
| 2-бутил-9-[(3-карбамоилфенил)метил]-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновая кислота  | 1,10 | 0,08 | 95,49 | 0,69  | 88,54 | 9,35 |
| 9-[(3-карбамоилф                                                                         | 1,13 | 0,04 | 67,03 | 28,39 | 75,03 | 5,11 |

|                                                                                                                            |      |      |        |      |       |      |
|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|------|------|--------|------|-------|------|
| енил)метил]<br>-2-пентил-<br>2,3,4,9-<br>тетрагидро-<br>1Н-<br>карбазол-8-<br>карбоновая<br>кислота                        |      |      |        |      |       |      |
| 9-[(3-<br>цианофенил<br>)метил]-2-<br>пентил-<br>2,3,4,9-<br>тетрагидро-<br>1Н-<br>карбазол-8-<br>карбоновая<br>кислота    | 1,34 | 0,03 | 77,06  | 3,04 | 60,75 | 9,35 |
| 1-бутил-9-<br>[(3-<br>карбамоилф<br>енил)метил]<br>-2,3,4,9-<br>тетрагидро-<br>1Н-<br>карбазол-8-<br>карбоновая<br>кислота | 1,02 | 0,02 | 86,24  | 6,94 | 83,05 | 5,37 |
| 9-[(3-<br>карбамоилф<br>енил)метил]<br>-1-<br>(пентилокси<br>)-2,3,4,9-<br>тетрагидро-<br>1Н-                              | 1,09 | 0,02 | 100,36 | 4,05 | 81,93 | 2,72 |

|                                                                                                                                       |      |      |       |      |       |      |
|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|------|------|-------|------|-------|------|
| карбазол-8-<br>карбоновая<br>кислота                                                                                                  |      |      |       |      |       |      |
| 9-[(3-<br>цианофенил<br>)метил]-1-<br>(пентилокси<br>)-2,3,4,9-<br>тетрагидро-<br>1Н-<br>карбазол-8-<br>карбоновая<br>кислота         | 1,19 | 0,04 | 63,30 | 5,49 | 7,56  | 7,21 |
| 1-бутил-9-<br>[(3-<br>цианофенил<br>)метил]-<br>2,3,4,9-<br>тетрагидро-<br>1Н-<br>карбазол-8-<br>карбоновая<br>кислота                | 1,14 | 0,00 | 93,67 | 1,80 | 57,97 | 3,09 |
| 6-бутил-5-<br>[(3-<br>карбамоилф<br>енил)метил]<br>-<br>5Н,6Н,7Н,8<br>Н,9Н,10Н-<br>циклогепта[<br>b]индол-4-<br>карбоновая<br>кислота | 1,03 | 0,02 | 95,15 | 2,57 | 91,41 | 4,19 |
| 6-бутил-5-<br>[(3-                                                                                                                    | 1,16 | 0,04 | 85,67 | 7,45 | 71,34 | 3,30 |

|                                                                                                                           |      |      |       |      |       |      |
|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|------|------|-------|------|-------|------|
| цианофенил<br>)метил]-<br>5Н,6Н,7Н,8<br>Н,9Н,10Н-<br>циклогепта[<br>b]индол-4-<br>карбоновая<br>кислота                   |      |      |       |      |       |      |
| 9-[(3-<br>карбамоилф<br>енил)метил]<br>-1-этил-<br>2,3,4,9-<br>тетрагидро-<br>1Н-<br>карбазол-8-<br>карбоновая<br>кислота | 0,94 | 0,00 | 95,91 | 0,97 | 90,27 | 2,15 |
| 9-[(3-<br>цианофенил<br>)метил]-1-<br>этил-2,3,4,9-<br>тетрагидро-<br>1Н-<br>карбазол-8-<br>карбоновая<br>кислота         | 1,11 | 0,01 | 87,60 | 4,09 | 44,21 | 6,98 |
| 9-[(3-<br>карбоксифен<br>ил)метил]-1-<br>этил-2,3,4,9-<br>тетрагидро-<br>1Н-<br>карбазол-8-<br>карбоновая<br>кислота      | 1,09 | 0,01 | 78,55 | 4,96 | 39,62 | 3,73 |

|                                                                                            |      |      |        |      |       |      |
|--------------------------------------------------------------------------------------------|------|------|--------|------|-------|------|
| 9-[(3-карбамоилфенил)метил]-1-пропокси-2,3,4,9-тетрагидро-1H-карбазол-8-карбоновая кислота | 1,03 | 0,01 | 91,95  | 3,37 | 57,57 | 5,01 |
| 9-[(3-карбамоилфенил)метил]-4-этил-2,3,4,9-тетрагидро-1H-карбазол-8-карбоновая кислота     | 1,21 | 0,07 | 102,19 | 3,54 | 87,03 | 3,76 |
| 4-[(3-карбамоилфенил)метил]-3-этил-1H,2H,3H,4H-циклопента[b]индол-5-карбоновая кислота     | 1,02 | 0,05 | 101,60 | 8,01 | 87,35 | 2,64 |
| 4-[(3-цианофенил)метил]-3-этил-1H,2H,3H,4H-                                                | 1,12 | 0,06 | 86,15  | 3,77 | 54,79 | 9,38 |

|                                                                                                                                |      |      |       |      |       |      |
|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|------|------|-------|------|-------|------|
| циклопента[<br>b]индол-5-<br>карбоновая<br>кислота                                                                             |      |      |       |      |       |      |
| 3-бутил-4-<br>[(3-<br>карбамоилф<br>енил)метил]<br>-<br>1Н,2Н,3Н,4<br>Н-<br>циклопента[<br>b]индол-5-<br>карбоновая<br>кислота | 1,15 | 0,04 | 98,53 | 7,00 | 96,85 | 4,65 |
| 3-бутил-4-<br>[(3-<br>цианофенил<br>)метил]-<br>1Н,2Н,3Н,4<br>Н-<br>циклопента[<br>b]индол-5-<br>карбоновая<br>кислота         | 1,21 | 0,06 | 98,54 | 5,39 | 85,13 | 2,82 |
| 2-бутил-4-<br>[(3-<br>карбамоилф<br>енил)метил]<br>-<br>1Н,2Н,3Н,4<br>Н-<br>циклопента[<br>b]индол-5-<br>карбоновая<br>кислота | 1,14 | 0,04 | 95,21 | 1,97 | 87,15 | 1,08 |

|                                                                                                                                   |      |      |       |      |       |      |
|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|------|------|-------|------|-------|------|
| 2-бутил-4-<br>[(3-<br>цианофенил<br>)метил]-<br>1Н,2Н,3Н,4<br>Н-<br>циклопента[<br>b]индол-5-<br>карбоновая<br>кислота            | 1,28 | 0,02 | 85,14 | 9,63 | 62,12 | 5,33 |
| 5-[(3-<br>карбамоилф<br>енил)метил]<br>-10-этил-<br>5Н,6Н,7Н,8<br>Н,9Н,10Н-<br>циклопента[<br>b]индол-4-<br>карбоновая<br>кислота | 0,99 | 0,03 | 98,00 | 1,95 | 86,38 | 4,41 |
| 5-[(3-<br>цианофенил<br>)метил]-10-<br>этил-<br>5Н,6Н,7Н,8<br>Н,9Н,10Н-<br>циклопента[<br>b]индол-4-<br>карбоновая<br>кислота     | 1,15 | 0,00 | 98,24 | 4,40 | 92,43 | 5,77 |
| 5-[(3-<br>карбамоилф<br>енил)метил]<br>-10-пропил-<br>5Н,6Н,7Н,8<br>Н,9Н,10Н-                                                     | 1,02 | 0,04 | 91,62 | 2,09 | 38,78 | 7,53 |

|                                                                                                                                 |      |      |        |      |       |      |
|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|------|------|--------|------|-------|------|
| циклогепта[<br>b]индол-4-<br>карбоновая<br>кислота                                                                              |      |      |        |      |       |      |
| 5-[(3-<br>цианофенил<br>)метил]-10-<br>пропил-<br>5Н,6Н,7Н,8<br>Н,9Н,10Н-<br>циклогепта[<br>b]индол-4-<br>карбоновая<br>кислота | 1,18 | 0,01 | 97,55  | 4,36 | 73,32 | 4,30 |
| 9-[(3-<br>карбоксифен<br>ил)метил]-4-<br>этил-2,3,4,9-<br>тетрагидро-<br>1Н-<br>карбазол-8-<br>карбоновая<br>кислота            | 1,06 | 0,01 | 85,38  | 3,02 | 52,11 | 3,11 |
| 9-[(3-<br>карбамоилф<br>енил)метил]<br>-3-этил-<br>2,3,4,9-<br>тетрагидро-<br>1Н-<br>карбазол-8-<br>карбоновая<br>кислота       | 1,10 | 0,02 | 103,25 | 3,15 | 98,24 | 1,74 |
| 10-бутил-5-<br>[(3-<br>карбамоилф                                                                                               | 1,14 | 0,00 | 87,88  | 6,31 | 63,30 | 6,49 |

|                                                                                                                                     |      |      |       |      |       |      |
|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|------|------|-------|------|-------|------|
| енил)метил]<br>-<br>5Н,6Н,7Н,8<br>Н,9Н,10Н-<br>циклогепта[<br>b]индол-4-<br>карбоновая<br>кислота                                   |      |      |       |      |       |      |
| 10-бутил-5-<br>[(3-<br>цианофенил<br>)метил]-<br>5Н,6Н,7Н,8<br>Н,9Н,10Н-<br>циклогепта[<br>b]индол-4-<br>карбоновая<br>кислота      | 1,24 | 0,05 | 73,63 | 1,45 | 30,87 | 9,67 |
| 5-[(3-<br>карбамоилф<br>енил)метил]<br>-10-пентил-<br>5Н,6Н,7Н,8<br>Н,9Н,10Н-<br>циклогепта[<br>b]индол-4-<br>карбоновая<br>кислота | 1,27 | 0,05 | 96,14 | 5,04 | 81,14 | 2,85 |
| 5-[(3-<br>цианофенил<br>)метил]-10-<br>пентил-<br>5Н,6Н,7Н,8<br>Н,9Н,10Н-<br>циклогепта[<br>b]индол-4-                              | 1,20 | 0,03 | 76,96 | 3,53 | 44,31 | 1,32 |

|                                                                                                                             |      |      |        |       |       |      |
|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|------|------|--------|-------|-------|------|
| карбоновая<br>кислота                                                                                                       |      |      |        |       |       |      |
| 4-[(3-<br>карбамоилф<br>енил)метил]<br>-2-пентил-<br>1Н,2Н,3Н,4<br>Н-<br>циклопента[<br>b]индол-5-<br>карбоновая<br>кислота | 0,68 | 0,00 | 93,08  | 1,08  | 86,88 | 3,08 |
| 4-[(3-<br>цианофенил<br>)метил]-2-<br>пентил-<br>1Н,2Н,3Н,4<br>Н-<br>циклопента[<br>b]индол-5-<br>карбоновая<br>кислота     | 1,18 | 0,08 | 78,31  | 10,06 | 39,48 | 8,52 |
| 9-[(3-<br>карбамоилф<br>енил)метил]<br>-2-этил-<br>2,3,4,9-<br>тетрагидро-<br>1Н-<br>карбазол-8-<br>карбоновая<br>кислота   | 1,06 | 0,06 | 100,70 | 1,67  | 85,46 | 2,84 |
| 9-[(3-<br>карбоксифен<br>ил)метил]-2-<br>этил-2,3,4,9-                                                                      | 1,11 | 0,06 | 69,18  | 8,93  | 23,47 | 0,85 |

|                                                                                                                                  |      |      |        |      |       |      |
|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|------|------|--------|------|-------|------|
| тетрагидро-<br>1Н-<br>карбазол-8-<br>карбоновая<br>кислота                                                                       |      |      |        |      |       |      |
| 5-[(3-<br>карбамоилф<br>енил)метил]<br>-7-этил-<br>5Н,6Н,7Н,8<br>Н,9Н,10Н-<br>циклогепта[<br>b]индол-4-<br>карбоновая<br>кислота | 0,96 | 0,14 | 100,11 | 0,22 | 91,82 | 5,87 |
| 5-[(3-<br>цианофенил<br>)метил]-7-<br>этил-<br>5Н,6Н,7Н,8<br>Н,9Н,10Н-<br>циклогепта[<br>b]индол-4-<br>карбоновая<br>кислота     | 1,16 | 0,03 | 97,05  | 4,07 | 90,00 | 4,80 |
| 9-[(3-<br>цианофенил<br>)метил]-3-<br>этил-2,3,4,9-<br>тетрагидро-<br>1Н-<br>карбазол-8-<br>карбоновая<br>кислота                | 1,08 | 0,02 | 90,34  | 3,77 | 45,83 | 4,50 |
| 9-[(3-<br>карбамоилф                                                                                                             | 1,04 | 0,05 | 89,99  | 2,36 | 53,85 | 6,44 |

|                                                                                                                             |      |      |       |      |       |      |
|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|------|------|-------|------|-------|------|
| енил)метил]<br>-4-пропил-<br>2,3,4,9-<br>тетрагидро-<br>1Н-<br>карбазол-8-<br>карбоновая<br>кислота                         |      |      |       |      |       |      |
| 9-[(3-<br>карбамоилф<br>енил)метил]<br>-3-пропил-<br>2,3,4,9-<br>тетрагидро-<br>1Н-<br>карбазол-8-<br>карбоновая<br>кислота | 1,10 | 0,01 | 99,18 | 1,85 | 87,33 | 5,21 |
| 9-[(3-<br>цианофенил<br>)метил]-3-<br>пропил-<br>2,3,4,9-<br>тетрагидро-<br>1Н-<br>карбазол-8-<br>карбоновая<br>кислота     | 1,20 | 0,04 | 85,39 | 2,92 | 46,78 | 4,58 |
| 4-бутил-9-<br>[(3-<br>карбамоилф<br>енил)метил]<br>-2,3,4,9-<br>тетрагидро-<br>1Н-<br>карбазол-8-                           | 1,35 | 0,02 | 83,41 | 3,07 | 43,27 | 0,87 |

|                                                                                                                            |      |      |       |      |       |       |
|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|------|------|-------|------|-------|-------|
| карбоновая<br>кислота                                                                                                      |      |      |       |      |       |       |
| 4-бутил-9-<br>[(3-<br>цианофенил<br>)метил]-<br>2,3,4,9-<br>тетрагидро-<br>1Н-<br>карбазол-8-<br>карбоновая<br>кислота     | 1,28 | 0,02 | 65,48 | 5,25 | 25,30 | 11,15 |
| 3-бутил-9-<br>[(3-<br>карбамоилф<br>енил)метил]<br>-2,3,4,9-<br>тетрагидро-<br>1Н-<br>карбазол-8-<br>карбоновая<br>кислота | 1,09 | 0,04 | 97,21 | 3,11 | 92,39 | 3,47  |
| 3-бутил-9-<br>[(3-<br>цианофенил<br>)метил]-<br>2,3,4,9-<br>тетрагидро-<br>1Н-<br>карбазол-8-<br>карбоновая<br>кислота     | 1,14 | 0,07 | 81,09 | 3,73 | 35,80 | 1,49  |
| 9-[(3-<br>карбамоилф<br>енил)метил]<br>-4-пентил-                                                                          | 1,12 | 0,02 | 84,44 | 2,27 | 42,64 | 4,86  |

|                                                                                          |      |      |       |      |       |      |
|------------------------------------------------------------------------------------------|------|------|-------|------|-------|------|
| 2,3,4,9-тетрагидро-1H-карбазол-8-карбоновая кислота                                      |      |      |       |      |       |      |
| 9-[(3-цианофенил)метил]-4-пентил-2,3,4,9-тетрагидро-1H-карбазол-8-карбоновая кислота     | 1,13 | 0,04 | 73,70 | 3,05 | 26,27 | 6,63 |
| 9-[(3-карбамоилфенил)метил]-3-пентил-2,3,4,9-тетрагидро-1H-карбазол-8-карбоновая кислота | 1,08 | 0,05 | 98,44 | 3,02 | 90,93 | 5,66 |
| 9-[(3-цианофенил)метил]-3-пентил-2,3,4,9-тетрагидро-1H-карбазол-8-карбоновая кислота     | 1,17 | 0,00 | 83,34 | 6,35 | 57,36 | 2,64 |

|                                                                                                               |      |      |       |      |       |       |
|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------|------|------|-------|------|-------|-------|
| 4-[(3-карбамоилфенил)метил]-3-пропил-1Н,2Н,3Н,4Н-циклопента[b]индол-5-карбоновая кислота                      | 1,18 | 0,00 | 95,27 | 2,16 | 89,06 | 3,85  |
| 4-[(3-цианофенил)метил]-3-пропил-1Н,2Н,3Н,4Н-циклопента[b]индол-5-карбоновая кислота                          | 1,38 | 0,08 | 97,64 | 5,64 | 67,85 | 5,18  |
| 2-({7-бутил-5-[(3-карбамоилфенил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-ил}формамидо)уксусная кислота | 0,90 | 0,05 | 90,18 | 3,23 | 59,02 | 7,71  |
| 2-({7-бутил-5-[(3-цианофенил)метил]-                                                                          | 1,20 | 0,05 | 40,99 | 9,54 | 8,61  | 10,28 |

|                                                                                                                                                        |      |      |       |      |       |      |
|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|------|------|-------|------|-------|------|
| 5Н,6Н,7Н,8<br>Н,9Н,10Н-<br>циклогепта[<br>b]индол-4-<br>ил}формами<br>до)уксусная<br>кислота                                                           |      |      |       |      |       |      |
| 7-бутил-5-<br>[(3-<br>карбамоилф<br>енил)метил]<br>-N-(2-<br>гидроксиэти<br>л)-<br>5Н,6Н,7Н,8<br>Н,9Н,10Н-<br>циклогепта[<br>b]индол-4-<br>карбоксамид | 0,98 | 0,02 | н. д. |      | 10,23 | 4,72 |
| 7-бутил-5-<br>[(3-<br>цианофенил<br>)метил]-N-<br>(2-<br>гидроксиэти<br>л)-<br>5Н,6Н,7Н,8<br>Н,9Н,10Н-<br>циклогепта[<br>b]индол-4-<br>карбоксамид     | 1,08 | 0,01 | 42,68 | 2,54 | 6,65  | 6,50 |
| 7-бутил-5-<br>[(3-<br>фторфенил)<br>метил]-<br>5Н,6Н,7Н,8                                                                                              | 1,12 | 0,03 | 90,57 | 5,37 | 96,96 | 1,18 |

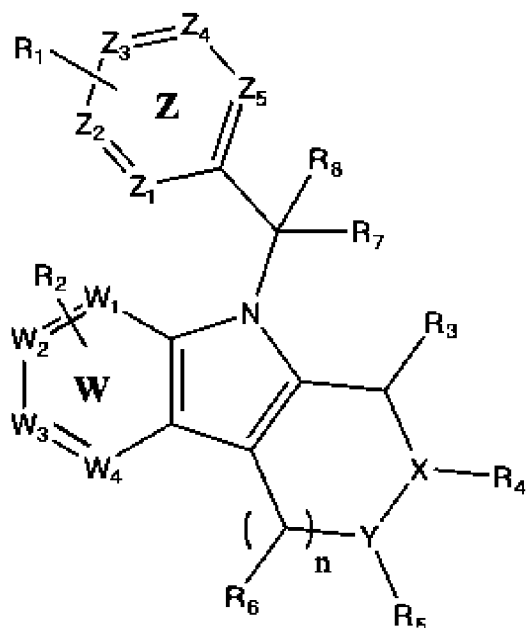
|                                                                                                                                  |      |      |        |      |       |      |
|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|------|------|--------|------|-------|------|
| Н,9Н,10Н-<br>циклогепта[<br>b]индол-4-<br>карбоновая<br>кислота                                                                  |      |      |        |      |       |      |
| 7-бутил-5-<br>[(3-<br>карбоксифен<br>ил)метил]-<br>5Н,6Н,7Н,8<br>Н,9Н,10Н-<br>циклогепта[<br>b]индол-4-<br>карбоновая<br>кислота | 0,95 | 0,02 | 100,35 | 7,59 | 91,80 | 7,00 |

Таблица 3

Хотя данное изобретение было описано с определенной степенью конкретности, следует понимать, что настоящее раскрытие было сделано только в качестве иллюстрации и что можно прибегнуть к многочисленным изменениям в деталях конструкции и расположении частей без отступления от сущности и объема настоящего изобретения.

### Формула изобретения

1. Соединение формулы I, предусматривающей:



формула (I),

5 где  
каждый из  $W_{1-4}$  и  $Z_1 - Z_5$  независимо представляет собой -C, -CH,  $CH_2$ , O, S или  
N;

Х независимо представляет собой  $\text{CH}_2$ , N или  $\text{CHR}_4$ ;

Y независимо представляет собой  $\text{CH}_2$  или  $\text{CHR}_5$ ;

10            n представляет собой число от 0 до 3;

один или несколько  $R_1$  в кольце  $Z$  независимо выбраны из группы, состоящей из  $CN$ ,  $OH$ ,  $COOH$ ,  $OCH_3$ ,  $CF_3$ ,  $CONH_2$ ,  $B(OH)_2$ ,  $B(OR)_2$ , изомера кислоты, замещенного амина, простых эфиров и галогена, замещенного или незамещенного алкила, замещенного или незамещенного циклического или гетероциклического радикала, замещенного или незамещенного циклоарила или циклогетероарила, где замещенный циклоарил или циклогетероарил может быть замещен водородом,  $CN$ ,  $OH$ ,  $COOH$ ,  $OCH_3$ ,  $CF_3$ ,  $CONH_2$ ,  $B(OH)_2$ ,  $B(OR)_2$ , изомером кислоты, замещенным амином, простыми эфирами и галогеном, замещенным или незамещенным алкилом, замещенным или незамещенным циклическим или гетероциклическим радикалом, замещенным или незамещенным циклоариллом или циклогетероариллом и  $SO_2NH_2$ ;

один или несколько  $R_2$  в кольце W независимо выбраны из группы, состоящей из CN, OH, CHF<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>F, CF<sub>3</sub>, COOH, CONH<sub>2</sub>, B(OH)<sub>2</sub>, B(OR)<sub>2</sub>, изоостера кислоты, галогена и бициклического гетероарила;

$R_7$  представляет собой водород или CN, COOH, CONH<sub>2</sub>, B(OH)<sub>2</sub>, B(OR)<sub>2</sub> или  
5 изоостер кислоты;

R представляет собой алкил;

каждый из  $R_3$ ,  $R_4$ ,  $R_5$ , или  $R_8$ , или  $R_6$ , когда n не равняется нулю, независимо  
выбран из

(1) водорода;

10 (2) замещенного или незамещенного алкила или простого эфира,  
содержащего от 1 до 12 атомов углерода,

(3) замещенного амина или

(4)  $-(CH_2)_mG$ , где m равняется от 1 до 12, и G независимо выбран из

(a) циклоалкила, содержащего от 3 до 6 атомов углерода,

15 (b) арила или гетероарила,

(c) CF<sub>3</sub>, CF<sub>2</sub>H или CFH<sub>2</sub> или

(d) гетероцикла,

при условии, что  $R_3$ ,  $R_4$ ,  $R_5$ ,  $R_8$  или  $R_6$  одновременно не представляют  
собой водород;

20 или его фармацевтически приемлемые соли или стереоизомеры.

2. Соединение по п. 1, где одновременно присутствуют  $R_1$  и  $R_2$ , и каждый из них  
независимо представляет собой CN, COOH или CONH<sub>2</sub>.

25 3. Соединение по п. 1, где формула I предусматривает несколько  $R_1$  и  $R_2$ .

4. Соединение по п. 1, где каждый из  $R_3$ ,  $R_4$ ,  $R_5$ ,  $R_8$  или  $R_6$ , когда n не равняется нулю,  
независимо представляет собой алкил, содержащий 4 атома углерода.

30 5. Соединение по п. 1, где каждый из  $R_3$ ,  $R_4$ ,  $R_5$ ,  $R_8$  или  $R_6$ , когда n не равняется нулю,  
независимо представляет собой алкил, содержащий 5 атомов углерода.

6. Соединение по п. 1, где каждый из  $R_3$ ,  $R_4$ ,  $R_5$ ,  $R_8$  или  $R_6$ , когда n не равняется нулю,  
независимо представляет собой алкил, содержащий 6 атомов углерода.

7. Соединение по п. 1, где кольцо  $Z$  содержит  $Z_1 - Z_4$ .

8. Соединение по п. 1, где кольцо  $Z$  содержит  $Z_1 - Z_5$ .

5

9. Соединение по п. 1, где один или несколько  $R_1$  в кольце  $Z$  представляют собой галоген.

10. Соединение по п. 1, где один или несколько  $R_1$  в кольце  $Z$  представляют собой CN.

10

11. Соединение по п. 1, где один или несколько  $R_1$  в кольце  $Z$  представляют собой  $CF_3$ .

12. Соединение по п. 1, где один или несколько  $R_2$  в кольце  $W$  представляют собой галоген.

15

13. Соединение по п. 1, где один или несколько  $R_1$  в кольце  $Z$  предусматривают CN и/или галоген.

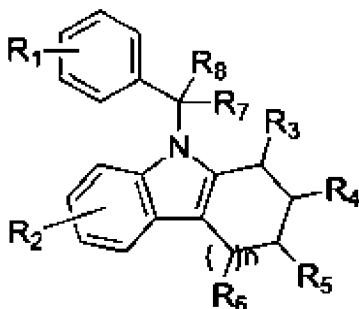
14. Соединение по п. 1, где один или несколько  $R_1$  в кольце  $Z$  предусматривают CN и/или галоген, и где один или несколько  $R_2$  в кольце  $W$  предусматривают другой галоген.

20

15. Соединение по п. 14, где галоген является идентичным другому галогену.

25 16. Соединение по п. 14, где галоген отличается от другого галогена.

17. Соединение формулы II, предусматривающей:



где

$n$  равняется 0, 1 или 2;

$R_1$  выбран из группы, состоящей из CN, COOH, CONH<sub>2</sub>, B(OH)<sub>2</sub>, B(OR)<sub>2</sub>,

5 изостера кислоты и галогена;

$R_2$  выбран из группы, состоящей из CN, COOH, CONH<sub>2</sub>, B(OH)<sub>2</sub>, B(OR)<sub>2</sub>, изостера кислоты, галогена и бициклического соединения;

$R_7$  представляет собой водород или CN, COOH, CONH<sub>2</sub>, B(OH)<sub>2</sub>, B(OR)<sub>2</sub> или изостер кислоты;

10  $R$  представляет собой алкил;

каждый из  $R_3$ ,  $R_4$ ,  $R_5$ , или  $R_8$ , или  $R_6$ , когда  $n$  не равняется нулю, независимо выбран из

(1) водорода;

(2) алкила, содержащего от 1 до 12 атомов углерода, или

15 (3)  $-(CH_2)_mG$ , где  $m$  равняется от 1 до 12, и  $G$  независимо выбран из

(a) циклоалкила, содержащего от 3 до 6 атомов углерода,

(b) арила или гетероарила или

(c) CF<sub>3</sub>, CF<sub>2</sub>H или CFH<sub>2</sub>;

при условии, что  $G$  не представляет собой азот- или

20 кислородсодержащую группу; и

при условии, что  $R_3$ ,  $R_4$ ,  $R_5$ ,  $R_8$  или  $R_6$  одновременно не представляют собой водород;

или его фармацевтически приемлемые соли.

25 18. Соединение по п. 17, где одновременно присутствуют  $R_1$  и  $R_2$ , и каждый из них независимо представляет собой CN, COOH или CONH<sub>2</sub>.

19. Соединение по п. 17, где формула II предусматривает несколько  $R_1$  и  $R_2$ .

20. Соединение по п. 17, где каждый из  $R_3$ ,  $R_4$ ,  $R_5$ ,  $R_8$  или  $R_6$ , когда  $n$  не равняется нулю, независимо представляет собой алкил, содержащий 4 атома углерода.

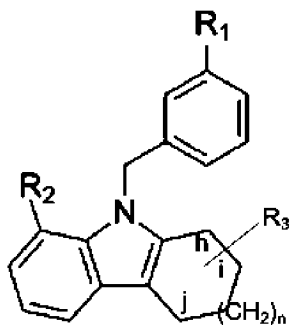
5

21. Соединение по п. 17, где каждый из  $R_3$ ,  $R_4$ ,  $R_5$ ,  $R_8$  или  $R_6$ , когда  $n$  не равняется нулю, независимо представляет собой алкил, содержащий 5 атомов углерода.

10

22. Соединение по п. 17, где каждый из  $R_3$ ,  $R_4$ ,  $R_5$ ,  $R_8$  или  $R_6$ , когда  $n$  не равняется нулю, независимо представляет собой алкил, содержащий 6 атомов углерода.

23. Соединение формулы III, предусматривающей:



где

15

$n$  равняется 0, 1 или 2;

каждый из  $R_1$  и  $R_2$  независимо представляет собой CN, COOH или CONH<sub>2</sub>;

$R_3$  независимо выбран из

(1) алкила, содержащего от 1 до 12 атомов углерода;

(2)  $-(CH_2)_mG$ , где  $m$  равняется от 1 до 12, и  $G$  независимо выбран из

20

(a) циклоалкила, содержащего от 3 до 6 атомов углерода;

(b) фенила; и

при условии, что  $G$  не представляет собой азот- или

кислородсодержащую группу;

или его фармацевтически приемлемые соли.

25

24. Соединение по п. 23, где  $n$  равняется 0, и  $R_3$  присоединен в h-, i- или j-положении.

25. Соединение по п. 23, где n равняется 1, и R<sub>3</sub> присоединен в h-, i- или j-положении.
26. Соединение по п. 23, где n равняется 2, и R<sub>3</sub> присоединен в h-, i- или j-положении.
- 5 27. Соединение по пп. 1, 17 или п. 23, которое представляет собой чистый оптический изомер.
28. Соединение по п. 23, которое представляет собой (+)-изомер.
- 10 29. Соединение по п. 23, которое представляет собой (-)-изомер.
30. Соединение, выбранное из группы, состоящей из 5-[(3-цианофенил)метил]-2-фтор-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 5-[(6-цианопиридин-2-ил)метил]-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 5-[(6-карбамоилпиридин-2-ил)метил]-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 6-({4-карбокси-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-5-ил} метил)пиридин-2-карбоновой кислоты, 5-[(3-циано-2-фторфенил)метил]-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 5-[(1,3-бензоксазол-6-ил)метил]-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 5-[(1,3-бензоксазол-5-ил)метил]-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 5-[(6-фторпиридин-2-ил)метил]-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 5-[(2-фторпиридин-4-ил)метил]-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 7-гексил-5-{[6-(трифторметил)пиридин-2-ил]метил}-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 7-гексил-5-{[2-(трифторметил)пиридин-4-ил]метил}-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 5-[(5-цианопиридин-3-ил)метил]-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 5-[(5-цианотиофен-2-ил)метил]-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 5-[(4-цианотиофен-2-ил)метил]-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 5-[(5-цианофуран-2-ил)метил]-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 5-[(3,5-диметил-1,2-оксазол-4-ил)метил]-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 5-(3-цианобензоил)-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой

- кислоты, 5-[(1,3-бензоксазол-7-ил)метил]-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 5-[(5-цианотиофен-3-ил)метил]-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 7-гексил-5-[(1Н-индол-4-ил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты,
- 5 5-[(3-карбамоилфенил)метил]-7-пропил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 7-бутил-5-[(3-карбамоилфенил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 7-бутил-5-[(3-цианофенил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 7-бутил-5-[(пиридин-3-ил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой
- 10 кислоты, 7-бутил-5-[(3-метилфенил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 7-бутил-5-[(3-метоксифенил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 7-бутил-5-[(3-хлорфенил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты,
- 7-бутил-5-[(3-гидроксифенил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 7-бутил-5-[(2-метоксипиридин-4-ил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 7-бутил-5-[(4-карбамоилфенил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 7-бутил-5-[(2-карбамоилфенил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 7-бутил-5-[(4-метилфенил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 7-бутил-5-[(2-цианофенил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 7-бутил-5-[(2-метилфенил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 7-бутил-5-[(2-фторфенил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 5-[(3-карбамоилфенил)метил]-7-пентил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 5-[(3-цианофенил)метил]-7-пентил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 5-[(3-карбамоилфенил)метил]-7-(2-фенилэтил)-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 5-[(3-цианофенил)метил]-7-(2-фенилэтил)-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 5-[(3-карбамоилфенил)метил]-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 5-[(3-карбамоилфенил)метил]-7-октил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 5-[(3-цианофенил)метил]-7-октил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 5-[(3-фторфенил)метил]-7-гексил-

- 5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 7-гексил-5-  
 [(пиридин-3-ил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой  
 кислоты, 7-гексил-5-[(3-метилфенил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-  
 4-карбоновой кислоты, 7-гексил-5-[(3-метоксифенил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-  
 5 циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 5-[(3-хлорфенил)метил]-7-гексил-  
 5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 7-гексил-5-[(2-  
 метоксипиридин-4-ил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой  
 кислоты, 5-[(3-карбоксифенил)метил]-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-  
 циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 5-[(4-карбамоилфенил)метил]-7-гексил-  
 10 5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 5-[(2-  
 карбамоилфенил)метил]-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-  
 карбоновой кислоты, 7-гексил-5-[(4-метилфенил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-  
 циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 5-[(4-цианофенил)метил]-7-гексил-  
 5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 5-[(2-  
 15 цианофенил)метил]-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой  
 кислоты, 7-гексил-5-[(2-метилфенил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-  
 4-карбоновой кислоты, 5-[(2-фторфенил)метил]-7-гексил-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-  
 циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 5-[(4-фторфенил)метил]-7-гексил-  
 5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты, 9-[(3-  
 20 карбамоилфенил)метил]-2-гексил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой  
 кислоты, 9-[(3-цианофенил)метил]-2-гексил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-  
 карбоновой кислоты, 9-[(3-карбоксифенил)метил]-2-гексил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-  
 карбазол-8-карбоновой кислоты, 9-[(3-фторфенил)метил]-2-гексил-2,3,4,9-тетрагидро-  
 1Н-карбазол-8-карбоновой кислоты, 2-гексил-9-[(пиридин-3-ил)метил]-2,3,4,9-  
 25 тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой кислоты, 2-гексил-9-[(3-метилфенил)метил]-  
 2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой кислоты, 2-гексил-9-[(3-  
 метоксифенил)метил]-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой кислоты, 9-[(3-  
 хлорфенил)метил]-2-гексил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой кислоты, 2-  
 гексил-9-[(3-гидроксифенил)метил]-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой  
 30 кислоты, 2-гексил-9-[(2-метоксипиридин-4-ил)метил]-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-  
 8-карбоновой кислоты, 9-[(3-карбоксифенил)метил]-2-гексил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-  
 карбазол-8-карбоновой кислоты, 9-[(4-карбамоилфенил)метил]-2-гексил-2,3,4,9-  
 тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой кислоты, 9-[(2-карбамоилфенил)метил]-2-  
 гексил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой кислоты, 2-гексил-9-[(4-

- метилфенил)метил]-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой кислоты, 9-[(4-  
 цианофенил)метил]-2-гексил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой кислоты, 9-  
 [(2-цианофенил)метил]-2-гексил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой  
 кислоты, 2-гексил-9-[(2-метилфенил)метил]-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-  
 5 карбоновой кислоты, 9-[(2-фторфенил)метил]-2-гексил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-  
 карбазол-8-карбоновой кислоты, 9-[(3-карбамоилфенил)метил]-2-(2-фенилэтил)-  
 2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой кислоты, 9-[(3-цианофенил)метил]-2-(2-  
 фенилэтил)-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой кислоты, 9-[(3-  
 карбамоилфенил)метил]-4-(2-фенилэтил)-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой  
 10 кислоты, 9-[(3-цианофенил)метил]-4-(2-фенилэтил)-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-  
 карбоновой кислоты, 9-[(3-карбамоилфенил)метил]-2-пропил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-  
 карбазол-8-карбоновой кислоты, 9-[(3-цианофенил)метил]-2-пропил-2,3,4,9-  
 тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой кислоты, 2-бутил-9-[(3-карбамоилфенил)метил]-  
 2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой кислоты, 9-[(3-карбамоилфенил)метил]-  
 15 2-пентил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой кислоты, 9-[(3-  
 цианофенил)метил]-2-пентил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой кислоты,  
 1-бутил-9-[(3-карбамоилфенил)метил]-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой  
 кислоты, 9-[(3-карбамоилфенил)метил]-1-(пентилокси)-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-  
 карбазол-8-карбоновой кислоты, 9-[(3-цианофенил)метил]-1-(пентилокси)-2,3,4,9-  
 20 тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой кислоты, 1-бутил-9-[(3-цианофенил)метил]-  
 2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой кислоты, 6-бутил-5-[(3-  
 карбамоилфенил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклопента[b]индол-4-карбоновой  
 кислоты, 6-бутил-5-[(3-цианофенил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклопента[b]индол-  
 4-карбоновой кислоты, 9-[(3-карбамоилфенил)метил]-1-этил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-  
 25 карбазол-8-карбоновой кислоты, 9-[(3-цианофенил)метил]-1-этил-2,3,4,9-тетрагидро-  
 1Н-карбазол-8-карбоновой кислоты, 9-[(3-карбоксифенил)метил]-1-этил-2,3,4,9-  
 тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой кислоты, 9-[(3-карбамоилфенил)метил]-1-  
 пропокси-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой кислоты, 9-[(3-  
 карбамоилфенил)метил]-4-этил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой кислоты,  
 30 4-[(3-карбамоилфенил)метил]-3-этил-1Н,2Н,3Н,4Н-циклопента[b]индол-5-карбоновой  
 кислоты, 4-[(3-цианофенил)метил]-3-этил-1Н,2Н,3Н,4Н-циклопента[b]индол-5-  
 карбоновой кислоты, 3-бутил-4-[(3-карбамоилфенил)метил]-1Н,2Н,3Н,4Н-  
 циклопента[b]индол-5-карбоновой кислоты, 3-бутил-4-[(3-цианофенил)метил]-  
 1Н,2Н,3Н,4Н-циклопента[b]индол-5-карбоновой кислоты, 2-бутил-4-[(3-



9-[(3-карбамоилфенил)метил]-3-пентил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой кислоты, 9-[(3-цианофенил)метил]-3-пентил-2,3,4,9-тетрагидро-1Н-карбазол-8-карбоновой кислоты, 4-[(3-карбамоилфенил)метил]-3-пропил-1Н,2Н,3Н,4Н-циклопента[b]индол-5-карбоновой кислоты, 4-[(3-цианофенил)метил]-3-пропил-1Н,2Н,3Н,4Н-циклопента[b]индол-5-карбоновой кислоты, 2-({7-бутил-5-[(3-карбамоилфенил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-ил}формамидо)уксусной кислоты, 2-({7-бутил-5-[(3-цианофенил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-ил}формамидо)уксусной кислоты, 7-бутил-5-[(3-карбамоилфенил)метил]-N-(2-гидроксиэтил)-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоксамида, 7-бутил-5-[(3-цианофенил)метил]-N-(2-гидроксиэтил)-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоксамида, 7-бутил-5-[(3-фторфенил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты и 7-бутил-5-[(3-карбоксифенил)метил]-5Н,6Н,7Н,8Н,9Н,10Н-циклогепта[b]индол-4-карбоновой кислоты или их фармацевтически приемлемых солей или стереоизомеров.

31. Соединение по п. 30, которое представляет собой чистый оптический изомер.

32. Способ ингибирования белка, связывающего жирные кислоты, представляющего собой FABP4, у млекопитающего, который включает введение млекопитающему эффективного количества соединения по пп. 1, 17 или п. 23.

33. Способ по п. 32, где субъектом является человек.

34. Соединение по пп. 1, 17 или п. 23 для применения в профилактике или лечении нарушений с воздействием на белок, связывающий жирные кислоты, представляющий собой FABP4.

35. Соединение по п. 34, где нарушения выбраны из диабета 2 типа, гипергликемии, метаболического синдрома, ожирения, атеросклероза, внутричерепной атеросклеротической болезни, неалкогольного стеатогепатита, астмы, сосудистой деменции, рассеянного склероза, болезни Альцгеймера, других хронических воспалительных и аутоиммунных/воспалительных заболеваний, хронической болезни сердца, синдрома поликистозных яичников, преэклампсии и рака.

36. Фармацевтическая композиция, содержащая соединение по пп. 1, 17 или п. 23 в качестве активного ингредиента в комбинации с фармацевтически приемлемым разбавителем или носителем.

5

37. Фармацевтическая композиция для применения в профилактике или лечении нарушений с воздействием на белок, связывающий жирные кислоты, представляющий собой FABP4.

10 38. Фармацевтическая композиция по п. 37, где нарушения выбраны из диабета 2 типа, гипергликемии, метаболического синдрома, ожирения, атеросклероза, внутричерепной атеросклеротической болезни, неалкогольного стеатогепатита, астмы, сосудистой деменции, рассеянного склероза, болезни Альцгеймера, других хронических воспалительных и аутоиммунных/воспалительных заболеваний, хронической болезни  
15 сердца, синдрома поликистозных яичников, преэклампсии и рака.

39. Фармацевтическая композиция по любому из пп. 36-38, дополнительно содержащая дополнительное терапевтически активное средство.

20 40. Способ профилактики или лечения нарушений с воздействием на белок, связывающий жирные кислоты, представляющий собой FABP4, который включает введение субъекту, нуждающемуся в таком лечении, эффективного количества соединения по пп. 1, 17 или п. 23.

25 41. Способ по п. 40, где субъектом является человек.

42. Способ по любому из п. 40 и п. 41, где нарушения выбраны из диабета 2 типа, гипергликемии, метаболического синдрома, ожирения, атеросклероза, внутричерепной атеросклеротической болезни, неалкогольного стеатогепатита, астмы, сосудистой  
30 деменции, рассеянного склероза, болезни Альцгеймера, других хронических воспалительных и аутоиммунных/воспалительных заболеваний, хронической болезни сердца, синдрома поликистозных яичников, преэклампсии и рака.

43. Способ ингибирования FABP4, который включает введение субъекту, нуждающемуся в таком лечении, эффективного количества соединения по пп. 1, 17 или п. 23.

5 44. Способ по п. 43, где субъектом является человек.

45. Применение соединения по пп. 1, 17 или п. 23 для изготовления лекарственного препарата для применения в профилактике или лечении нарушений с воздействием на белок, связывающий жирные кислоты, представляющий собой FABP4.

10

46. Применение по п. 45, где нарушения выбраны из диабета 2 типа, гипергликемии, метаболического синдрома, ожирения, атеросклероза, внутричерепной атеросклеротической болезни, неалкогольного стеатогепатита, астмы, сосудистой деменции, рассеянного склероза, болезни Альцгеймера, других хронических

15 воспалительных и аутоиммунных/воспалительных заболеваний, хронической болезни сердца, синдрома поликистозных яичников, преэклампсии и рака.