

(19)



Евразийское  
патентное  
ведомство

(21) 201301183 (13) A1

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ЕВРАЗИЙСКОЙ ЗАЯВКЕ

(43) Дата публикации заявки  
2014.04.30

(22) Дата подачи заявки  
2012.04.23

(51) Int. Cl. C07D 471/04 (2006.01)  
A61K 31/437 (2006.01)  
A61P 1/00 (2006.01)  
A61P 25/00 (2006.01)  
A61P 35/00 (2006.01)  
A61P 7/00 (2006.01)  
A61P 9/00 (2006.01)  
A61P 11/00 (2006.01)  
A61P 5/00 (2006.01)  
A61P 17/00 (2006.01)  
A61P 27/00 (2006.01)  
A61P 29/00 (2006.01)  
A61P 37/00 (2006.01)

(54) ГЕТЕРОЦИКЛИЧЕСКИЕ СОЕДИНЕНИЯ В КАЧЕСТВЕ ИНГИБИТОРОВ КИНАЗ

(31) 61/517,581

(32) 2011.04.21

(33) US

(86) PCT/EP2012/001736

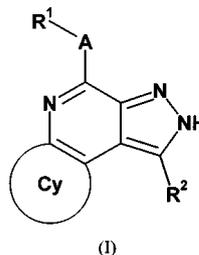
(87) WO 2012/143143 2012.10.26

(71) Заявитель:  
ОРИГЕНИС ГМБХ (DE)

(72) Изобретатель:  
Альмштеттер Михаэль, Торманн  
Михаэль, Тремль Андреас, Кёстлер  
Роланд, Йехия Нассер (DE)

(74) Представитель:  
Веселицкая И.А., Кузенкова Н.В.,  
Веселицкий М.Б., Каксис Р.А.,  
Белоусов Ю.В., Куликов А.В.,  
Кузнецова Е.В. (RU)

(57) Изобретение относится к новым соединениям формулы (I)



которые способны ингибировать одну или несколько киназ, в особенности SYK (селезеночная тирозинкиназа), LRRK2 (богатая лейцином повторная киназа 2) и/или MYLK (киназа легких цепей миозина), или их мутанты. Соединения находят применение при лечении различных заболеваний. Эти заболевания включают аутоиммунные заболевания, воспалительные заболевания, заболевания костей, заболевания обмена веществ, неврологические и нейродегенеративные заболевания, рак, сердечно-сосудистые заболевания, аллергии, астму, болезнь Альцгеймера, болезнь Паркинсона, нарушения кожи, заболевания глаз, инфекционные заболевания и гормонозависимые заболевания.

A1

201301183

201301183

A1

5

10

15

Заявка № 201301183

Заявитель ОРИГЕНИС ГМБХ, DE

## ГЕТЕРОЦИКЛИЧЕСКИЕ СОЕДИНЕНИЯ В КАЧЕСТВЕ ИНГИБИТОРОВ КИНАЗ

20

25

30

Настоящее изобретение относится к новым соединениям, которые способны ингибировать одну или несколько киназ, в особенности, SYK (селезеночная тирозинкиназа), LRRK2 (богатая лейцином повторная киназа 2) и/или MYLK (киназа легких цепей миозина) или их мутанты. Соединения находят применение при лечении различных заболеваний. Эти заболевания включают аутоиммунные заболевания, воспалительные заболевания, заболевания костей, заболевания обмена веществ, неврологические и нейродегенеративные заболевания, рак, сердечно-сосудистые заболевания, аллергии, астму, болезнь Альцгеймера, болезнь Паркинсона, нарушения кожи, заболевания глаз, инфекционные заболевания и гормоносвязанные заболевания.

## ПРЕДПОСЫЛКИ СОЗДАНИЯ ИЗОБРЕТЕНИЯ

Протеинкиназы составляют большое семейство структурно родственных ферментов, которые являются ответственными за контроль ряда процессов передачи сигналов внутри клеток (см., например, Hardie и Hanks, *The Protein Kinase Facts Book*, I and II, Academic Press, Сан-Диего, Калифорния, 1995).

5 Полагают, что протеинкиназы, вследствие сохранения их структуры и каталитической функции, эволюционировали из общего предкового гена. Едва не все киназы содержат подобный 250-300 аминокислотный каталитический домен. Киназы можно сгруппировать в семейства по субстратам, которые они фосфорилируют (например, белок тирозин, белки серин/треонин, липиды, и т.д.).  
10 Были идентифицированы мотивы последовательностей, которые в основном соответствовали каждому из этих семейств (см., например, Hanks & Hunter, (1995), *FASEB J.* 9:576-596; Knighton и др., (1991), *Science* 253:407-414; Hiles и др., (1992), *Cell* 70:419-429; Kunz и др., (1993), *Cell* 73:585-596; Garcia-Bustos и др., (1994), *EMBO J.* 13:2352-2361).

15 Многие заболевания связаны с аномальными клеточными ответами, инициированными протеинкиназа-опосредованными событиями. Эти заболевания включают аутоиммунные заболевания, воспалительные заболевания, заболевания костей, заболевания обмена веществ, неврологические и нейродегенеративные заболевания, рак, сердечно-сосудистые заболевания,  
20 аллергии, астму, болезнь Альцгеймера, болезнь Паркинсона нарушения кожи, инфекционные заболевания и гормоносвязанные заболевания. Вследствие этого, предпринимались значительные усилия в медицинской химии для поиска ингибиторов протеинкиназ для применения в качестве терапевтических средств.

#### SYK - селезеночная тирозинкиназа

25 Syk, как известно, играет важнейшую роль в адаптивном иммунном ответе и передачи сигналов иммунными клетками. Недавние исследования убедительно демонстрируют множество дополнительных биологических функций, как, например, клеточная адгезия, врожденное иммунное распознавание, созревание остеокластов, активация тромбоцитов и развитие сосудов (Moscaï, A. и др., *Nat Rev Immunol*, 10:387 – 402, 2010). Syk ассоциируется с различными рецепторами  
30 иммуноцитов (тучных клеток, В-клеток, макрофагов и нейтрофилов) и неиммуноцитов (остеокластов, клеток рака молочной железы) и контролирует различные клеточные процессы, включая продуцирование цитокинов, резорбцию кости и фагоцитоз. Вследствие взаимодействия с иммунорецепторами и G-

связанными рецепторами Syk не только функционирует в качестве протеинкиназы, но также и в качестве истинного белка - адаптера, и вследствие этого оказалась пригодной для основной модели в передаче сигналов иммунными клетками.

5           Опосредованная иммунорецепторным тирозиновым активирующим мотивом (ITAM) передача сигналов возникает в качестве первичного события в сигнальных путях, ответственных за патологии у человека. ITAM-опосредованная и гем-ITAM-опосредованная передача сигналов является ответственной за ретрансляцию сигналов активирования, инициируемых  
10 классическими иммунорецепторами, такими как Т-клеточные рецепторы, В-клеточные рецепторы, Fc рецепторы в иммунных клетках, и GPVI и FсгаммаRIIa в тромбоцитах, к расположенным ниже внутриклеточным молекулам, таким как Syk и ZAP-70 (Underhill, D. M и Goodridge, H. S., Trends Immunol., 28:66-73, 2007), а также, более того, гем-ITAM-содержащими факторами, как CLEC7A и  
15 другие лектины С-типа.

Связывание лиганда с ITAM-содержащим рецептором запускает события передачи сигналов, которые позволяют рекрутирование белков из семейства нерецепторных тирозинкиназ, называемых Src семейством. Эти киназы фосфорилируют остатки тирозина в ITAM последовательности, области, с  
20 которой взаимодействуют тандемные SH2 домены на или Syk или ZAP-70.

Syk, наряду с Zap-70, является членом Syk семейства протеиновых тирозинкиназ. Взаимодействие Syk или ZAP-70 с дифосфорилированными ITAM последовательностями индуцирует конформационное изменение в киназах, которое позволяет фосфорилирование тирозина самих киназ.  
25 Фосфорилированные члены Syk семейства активируют множество расположенных ниже белков сигнальных путей, которые включают Src гомологичные 2 (SH2) домены. Прямыми партнерами связывания Syk являются члены VAV семейства, фосфолипаза С гамма (PLCгамма, PLCгамма 2), фосфоинозитид 3-киназа (PI3K), члены семейства белков лейкоцитов, содержащих SH2 домен (SLP-76 или SLP-65). Другими сигнальными  
30 медиаторами являются p38, янус-киназа (JNK), семейство RAS гомологов (RHO), Ca<sup>++</sup>, диацилглицерин DAG, семейство TEC, комплекс домен рекрутирования каспазы - В клеточная лимфома 10 - транслокационный белок лимфомы 1 лимфоидной ткани слизистых оболочек (CARD-BCL-10-MALT1),

протеин-тирозин киназа 2 (PYK2), ядерный фактор активированных Т-клеток (NFAT), протеинкиназа С (PKC), RAS гуанил-высвобождающий белок (RASGRP), киназа, регулируемая внеклеточными сигналами (ERK), АКТ, семейство NLR, содержащая 3 пириновых домена (NLRP3) инфламасома, семейство NLR и ядерный фактор каппаВ (NFкаппаВ) и факторы в канонических и неканонических путях передачи сигналов. Они способствуют множеству клеточных ответов, как, например, цитоскелетные изменения, продуцирование ROS, дифференциация, пролиферация, выживание клеток и высвобождение цитокинов.

10 Syk в качестве ключевого медиатора иммунорецепторной и неиммунорецепторной передачи сигналов у хозяина воспалительных клеток идентифицируют в качестве ключевого участника в патогенезе различных заболеваний и нарушений, приписываемых дисфункциональной передаче сигналов, таких как аутоиммунные заболевания, например, ревматоидный артрит, системная волчанка, рассеянный склероз, гемолитическая анемия, иммуно-тромбоцитопеническая пурпура, и гепарин-индуцированная тромбоцитопения, функциональные желудочно-кишечные нарушения, астма, аллергические нарушения, анафилактический шок и артериосклероз (Riccaboni, M. и др., DDT, 15:517 – 529, 2010). Интересно то, что многие из вышеуказанных заболеваний, как полагают, случаются из-за поперечного связывания Fc рецепторов антителами, которые, посредством Syk, активируют каскад передачи сигналов в тучных, базофильных и других иммунных клетках, что приводит к высвобождению клеточных медиаторов, ответственных за воспалительные реакции. Высвобождение медиаторов и продуцирование цитокинов при зависимых от стимулирования IgE аллергических и воспалительных реакциях из тучных клеток и базофилов может контролироваться ингибированием киназной активности Syk (Rossi, A. B. и др., J Allergy Clin Immunol., 118:749-755, 2006). При иммуно-тромбоцитопении, антитело-связанные тромбоциты разрушаются селезенкой посредством Fc рецептор/ITAM/Syk-опосредованного процесса (Crow, A. R. и др., Blood, 106:реферат 2165, 2005). Индуцированная лекарственными средствами тромбоцитопения, вызываемая иммунными комплексами гепарин-тромбоцитарного фактора 4, которые активируют FcгаммаRIIa, также вовлекает Syk передачу сигналов ниже контактирования с рецептором (Reilly, M. P., Blood, 98:2442-2447, 2001).

Также было показано, что Syk опосредствует передачу сигналов классами рецепторов, которые не содержат обычных ITAM мотивов, как, например, интегрины и лектины (Kerrigan, A. M. и др., *Immunol. Rev.*, 234:335-352, 2010). Более того Syk играет важную роль в распознавании патогенов, подобных  
 5 грибам, бактериям и вирусам (Hughes, C. E., и др., *Blood*, 115:2947–2955, 2010; Geijtenbeek, T. B. и др., *Nat Rev Immunol*, 9:465-479, 2009) Механизм Syk активации интегрин-опосредованными агонистами тромбоцитов индуцирует передачу сигналов "изнутри наружу", что приводит к связыванию фибриногена и агрегации тромбоцитов. Это инициирует передачу сигналов "снаружи внутрь",  
 10 которая продуцирует дополнительную стимуляцию тромбоцитов. Syk активируется в течение обеих фаз передачи сигналов посредством интегринов, и ингибирование Syk, как показано, ингибирует адгезию тромбоцитов к иммобилизованным белкам (Law, D. A. и др., *Blood*, 93:2645-2652, 1999). Высвобождение арахидоновой кислоты и серотонина и агрегация тромбоцитов,  
 15 индуцированные коллагеном, заметно ингибируется в тромбоцитах, полученных от Syk дефектных мышей (Poole, A. и др., *EMBO J.*, 16:2333-2341, 1997). Таким образом Syk-ингибиторы также могут обладать антикоагулянтным действием.

Исходя из роли, которую играет Syk в Ig-индуцированной активации тромбоцитов, она представляет интерес при артериосклерозе и рестенозе.  
 20 Артериосклероз является классом заболеваний, характеризующихся уплотнением и отвердеванием артериальных стенок кровеносных сосудов. Хотя все кровеносные сосуды являются восприимчивыми к этому серьезному дегенеративному состоянию, аорта и коронарные артерии, питающие сердце, подвергаются ему чаще. Артериосклероз имеет важное клиническое значение,  
 25 так как он может увеличить риск сердечных приступов, инфарктов миокарда, ударов, и аневризм.

Традиционное лечение артериосклероза включает процедуры васкулярной реканализации в случае менее серьезной закупорки и хирургическое коронарное шунтирование в случае крупной закупорки. Серьезный недостаток  
 30 интраваскулярных процедур заключается в том, что у значительного числа прошедших лечение индивидуумов, некоторые или все из лечившихся сосудов подвергаются рестенозу (то есть, повторно сужаются). Хотя точные гормональные и клеточные процессы, промотирующие рестеноз, не были определены, рестеноз, как полагают, частично обязан механическому

повреждению стенок кровеносных сосудов, вызываемому баллонным катетером или другим внутрисосудистым приспособлением. В ответ на это повреждение, слипающиеся тромбоциты, инфильтрирующие макрофаги, лейкоциты, или клетки гладких мышц сами высвобождают клеточные факторы роста, такие как

5 тромбоцитарный фактор роста (PDGF), с последующей пролиферацией и миграцией медиальных гладкомышечных клеток (SMC) через внутреннюю эластичную ламину в область интимы сосуда. Дальнейшая пролиферация и гиперплазия SMC интимы и, наиболее значительно, продуцирование больших

10 количеств внеклеточного матрикса на протяжении трех - шести месяцев вызывает заполнение и сужение сосудистого пространства, достаточное для значительного затруднения кровотока.

В дополнение к роли, которую Syk играет в Ig-индуцированной активации тромбоцитов, Syk играет очень важную роль в коллаген-опосредованной передаче сигнала. Первичным адгезивным белком, ответственным за адгезию и

15 активация тромбоцитов является коллаген. Коллаген является нитевидным белком, содержащимся в фиброзных колпачках атеросклеротических бляшек, который подвергается воздействию крови во время разрушения бляшек. Коллаген функционирует в первую очередь путем связывания фактора фон Виллебранда, который привязывает тромбоциты благодаря связывающему GPIb

20 на оболочках тромбоцитов. Коллаген функционирует во вторую очередь путем вовлечения двух коллагеновых рецепторов на тромбоцитах, GPVI и интегрин альфа2бета1.

GPVI присутствует в оболочке тромбоцитов в виде комплекса с FcRгамма, взаимодействие необходимо для экспрессии GPVI. Активация FcгаммаRIIa на

25 тромбоцитах вызывает изменение формы тромбоцитов, секрецию и тромбоз. Передача сигналов посредством комплекса GPVI/FcRгамма инициируется фосфорилированием тирозина ITAM домена FCRгамма, и, далее, рекрутированием Syk. Активация GPVI вызывает индукцию разнообразных тромбоцитарных функций, включая: активацию интегринов альфа2бета1 с

30 получением прочной адгезии тромбоцитов, и GP IIb-IIIa, которые опосредствуют агрегацию тромбоцитов и развитие тромбоза; секрецию тромбоцитов, позволяющую доставку воспалительных белков, таких как CD40L, RANTES и TGFбета к стенкам сосудов; и экспрессию P-селектина, который позволяют рекрутирование лейкоцитов. Поэтому полагают, что Syk ингибиторы могут

ингибировать тромботические события, опосредованные адгезией, активацией и агрегацией тромбоцитов.

Было сообщено, что фосфорилирование тирозина внутриклеточного белка (активация), индуцированное стимуляцией рецептора для антитела IgG, FсгаммаR, и фагоцитоз, опосредованный FсгаммаR, значительно ингибируются в макрофагах, полученных от Syk дефектных мышей (Crowley, M. T. и др., J. Exp. Med., 186:1027-1039, 1997). Это предполагает то, что Syk играет довольно важную роль в FсгаммаR-опосредованном фагоцитозе макрофагов.

Также было сообщено, что антисмысловый олигонуклеотид Syk подавляет ингибирование апоптоза эозинофилов, индуцированное GM-CSF (Yousefi, S. и др., J. E. Med., 183:1407-1414, 1996), показывая, что Syk является существенной для сигнала продления жизни эозинофилов, вызываемого GM-CSF и т.п. Так как продление жизни эозинофилов при аллергических нарушениях, таких как астма, тесно связано с переходом заболеваний в хроническую стадию, Syk ингибиторы также могут служить в качестве терапевтических средств для хронического эозинофильного воспаления.

Syk является важной для активации В-клеток посредством В-клеточного антигенного рецептора и вовлечена в метаболизм фосфатидилинозитола и увеличение концентрации внутриклеточного кальция, вызываемого стимуляцией антигенного рецептора (Hutchcroft, J E. и др., J. Biol. Chem., 267:8613-8619, 1992; и Takata, M. и др., EMBO J., 13:1341-1349, 1994). Таким образом, Syk ингибиторы можно использовать для контроля функционирования В-клеток и, следовательно, можно полагать, что они могут служить в качестве терапевтических средств для заболеваний, связанных с антителами.

Syk связывается с Т-клеточным антигенным рецептором, быстро подвергается фосфорилированию тирозина посредством перекрестного связывания рецептора и синергически действует на внутриклеточные сигналы, опосредованные Src тирозинкиназами, такими как Lck (Couture, C. и др., Proc. Natl. Acad. Sci. США, 91:5301-5305, 1994; и Couture, C. и др., Mol. Cell. Biol., 14:5249-5258, 1994). Syk присутствует в популяциях зрелых Т-клеток, таких как внутриэпителиальные гаммадельта Т-клетки и интактные альфабета Т-клетки, и, как сообщалось, является способной фосфорилировать многочисленные компоненты TCR каскада передачи сигналов (Latour, S. и др., Mol Cell Biol., 17:4434-4441, 1997). Вследствие этого, Syk ингибиторы могут служить в

качестве агентов для ингибирования клеточного иммунитета, опосредованного Т-клеточным антигенным рецептором.

В недавних сравнительных исследованиях геномной гибридизации было установлено, что Syk является другим геном, важным в патогенезе лимфомы из клеток мантии (MCL) (Chen, R. и др. *Journal of Clinical Oncology*, 2007 ASCO Annual Meeting Proceedings (издание на основе материалов конференции), т. 25, № 18S (20 июня, дополнение), 2007: 8056). MCL представляет 5-10% от всех неходжкинских лимфом и является трудной для лечения формой лимфомы. Она среди В-клеточных лимфом имеет наихудший прогноз с медианой выживаемости три года. Было сообщено, что Syk сверхэкспрессируется в MCL (Rinaldi, A, и др., *Br. J. Haematol*, 2006; 132:303-316) и что Syk опосредствует сигналы выживаемости mTOR (мишень рапамицина в клетках млекопитающих) в фолликулярных, мантийных клетках, клетках Беркитта, и диффузных больших В-клетках неходжкинских лимфом (Leseux, L., и др., *Blood*, 2006; 108:4156-4162).

Некоторые доказательства говорят о том, что многие В-клеточные лимфомы зависят от сигналов выживаемости, опосредованных В-клеточным рецептором (BCR). BCR передача сигналов индуцирует олигомеризацию рецептора и фосфорилирование Iγальфа и бета иммунорецепторных тирозиновых активирующих мотивов посредством SRC семейства киназ. ИТАМ фосфорилирование вызывает рекрутирование и активацию Syk, которая инициирует расположенные ниже события и усиливает первоначальный сигнал BCR. Показана роль тонической BCR передачи сигналов в нормальных В-клетках и Syk-зависимой выживаемости линий клеток неходжкинской лимфомы *in vitro* (Chen, L., и др., *Blood*, 2006; 108:3428-3433), Syk ингибирование является многообещающей разумной мишенью для лечения определенных В-клеточных лимфом и хронического лимфоцитарного лейкоза (CLL) (Stefania Gobessi, Luca Laurenti, Pablo Longo, Laura Carsetti, Giuseppe Leone, Dimitar G. Efremov, Constitutive activation of the protein tyrosine kinase Syk in Chronic Lymphocytic Leukemia B-cells, *Blood*, 2007, 110, реферат 1123). Недавние данные показывают, что введение мультикиназного ингибитора, который ингибирует Syk, может иметь значительную клиническую активность у CLL пациентов (Friedberg J W и др., *Blood* 2008; 112(11), реферат 3).

Онкогенный потенциал Syk был описан рядом разных параметров. Клинически сообщается о сверхэкспрессии Syk в лимфоме из мантийных клеток (Rinaldi, A, и др., *Br. J. Haematol.*, 2006; 132:303-316) и белке слияния TEL-Syk (Translocated ETS Leukemia (лейкоз с транслокацией ETS)), генерированной хромосомной транслокацией (t(9;12)(q22;p12)), которая приводит к повышенной Syk активности и связана с миелодиспластическим синдромом (Kuno, Y., и др., *Blood*, 2001; 97:1050-1055). Лейкоз индуцируется у мышей посредством адаптивно перенесенных клеток костного мозга, которые экспрессирует человеческая TEL-Syk (Wossning, T., *JEM*, 2006; 203:2829-2840). Более того, в мышинных первичных клетках костного мозга, сверхэкспрессия Syk вызывает IL-7 независимый рост в культуре (Wossning, T., и др., *JEM*, 2006; 203:2829-2840).

Интересно то, что Syk передача сигналов по-видимому необходима для развития и выживаемости В-клеток у человека и мыши. Индуцируемое ослабление В-клеточного рецептора (Lam, K., и др., *Cell*, 1997; 90:1073-1083) или Igальфа (Kraus, M., и др., *Cell*, 2004; 117:787-800) вызывает гибель периферических В-клеток у мышей. Сверхэкспрессия протеиновой тирозинфосфатазы PTP-RO, которая, как известно отрицательно регулирует Syk активность, ингибирует пролиферацию и индуцирует апоптоз у линии клеток, происходящих из неходжкинских лимфом (Chen, L., и др., *Blood*, 2006; 108:3428-3433). Наконец, В-клеточные лимфомы редко демонстрируют потерю BCR экспрессии, и антиидиотипная терапия редко вызывает резистентность (Kuppers, R. *Nat Rev Cancer*, 2005; 5:251-262).

Включение антиген-специфического В-клеточного рецептора (BCR) активирует многочисленные пути передачи сигналов, которые в итоге регулируют статус клеточного активирования, промотируя выживаемость и размножение клона. Передача сигналов через BCR становится возможной путем его ассоциации с двумя другими членами иммуноглобулинового суперсемейства; Igальфа и Igбета, каждый из которых несет иммунотирозиновый активирующий мотив (ITAM) (Jumaa, Hendriks и др. *Annu Rev Immunol* 23: 415-45 (2005). ITAM домен непосредственно фосфорилируется Src семейством киназ в ответ на включение BCR. Syk стыкуется с ITAM и фосфорилирует его, тем самым представляя процесс, который усиливает ее киназную активность, что приводит к Syk аутофосфорилированию и фосфорилированию тирозина многочисленных субстратов, расположенных ниже по ходу сигнала (Rolli,

Gallwitz и др. *Mol Cell* 10(5): 1057-69 (2002). Этот путь передачи сигналов активен в В-клетках, начиная с перехода из про- в пре-В-клеточную стадию развития, когда экспрессируется вновь образованный пре-BCR. В действительности, В-клеточное развитие задерживается на про-В-клеточной 5 стадии в Syk нокаутных мышах (Cheng, Rowley и др. 1995; Turner, Mee и др. *Nature* 378(6554): 303-6 (1995). Индуцируемое ослабление В-клеточного рецептора (Lam, Kuhn и др. *Cell* 90(6): 1073-83 (1997) или Igальфа (Kraus, Alimzhanov и др. *Cell* 117(6): 787-800 (2004) вызывает гибель периферических В-клеток у мышей. Человеческие В-клетки вероятно также требуют Syk для 10 пролиферации и выживания. Сверхэкспрессия протеиновой тирозинфосфатазы PTP-RO, отрицательного регулятора Syk активности, ингибирует пролиферацию и индуцирует апоптоз у линии клеток, происходящих из неходжкинских лимфом (NHL) (Chen, Juszczynski и др. *Blood* 108(10): 3428-33 (2006). Разрушение Syk посредством миРНК в NHL линии SUDHL-4 приводило к блокировке G1/S 15 перехода клеточного цикла (Gururajan, Dasu и др. *J Immunol* 178(1): 111-21 (2007). Вместе, эти данные указывают на то, что Syk передача сигналов является необходимой для развития, пролиферации и даже выживаемости В-клеток человека и мыши.

Наоборот, онкогенный потенциал Syk был описан рядом разных 20 параметров. Клинически сообщается о сверхэкспрессии Syk в лимфоме из мантийных клеток (Rinaldi, Kwee и др. *Br J Haematol* 132(3): 303-16 (2006) и белке слияния TEL-Syk (Translocated ETS Leukemia (лейкоз с транслокацией ETS)), генерированной хромосомной транслокацией (t(9;12)(q22;p12)), которая приводит к повышенной Syk активности и связана с миелодиспластическим 25 синдромом (Kuno, Abe и др. *Blood* 97(4): 1050-5 (2001). Лейкоз индуцируется у мышей посредством адаптивно перенесенных клеток костного мозга, которые экспрессируют человеческий TEL-Syk (Wossning, Herzog и др. *J Exp Med* 203(13): 2829-40 (2006). Более того, в мышинных первичных клетках костного мозга, сверхэкспрессия Syk вызывает IL-7 независимый рост в культуре 30 (Wossning, Herzog и др. 2006). Равным образом, Syk, как сообщено, опосредствует сигналы выживаемости mTOR (мишень рапамицина в клетках млекопитающих) в фолликулярных, мантийных клетках, клетках Беркитта, и диффузных больших В-клетках NHL (Leseux, Hamdi и др. *Blood* 108(13): 4156-62 (2006). Дополнительные недавние исследования также указывают на то, что Syk-

зависимые сигналы выживаемости могут играть роль в злокачественности В-клеток, включая DLBCL, лимфому из клеток мантии и фолликулярную лимфому (Gururajan, Jennings и др. 2006; Irish, Czerwinski и др. *J Immunol* 176(10): 5715-9 (2006)). Показана роль тонической BCR передачи сигналов в нормальных В-клетках и Syk-зависимой выживаемости линии клеток NHL *in vitro*, специфическое ингибирование Syk может оказаться многообещающим для лечения определенных В-клеточных лимфом.

Недавно, R406 (Rigel Pharmaceuticals) был предложен для ингибирования ITAM передачи сигналов в ответ на различные стимулы, включая FcεpsilonR1 и BCR индуцированную Syk активацию (Braselmann, Taylor и др. *J Pharmacol Exp Ther* 319(3): 998-1008 (2006). Интересно то, что этот АТФ-конкурентный ингибитор Syk также являлся активным против Flt3, cKit, и JAK киназ, но не против Src киназы (Braselmann, Taylor и др. 2006). Активирующие мутации Flt3 связывают с AML, и ингибирование этой киназы в настоящее время является объектом клинического исследования (Burnett and Knapper *Hematology Am Soc Hematol Educ Program* 2007: 429-34 (2007). Сверхактивирование тирозинкиназы cKit также связывают с гематологическими злокачественными образованиями, и признают мишенью для терапии рака (Heinrich, Griffith и др. *Blood* 96(3): 925-32 (2000). Подобным образом, JAK3 передача сигналов вовлечена в лейкозы и лимфомы, и в настоящее время ее используют в качестве потенциальной терапевтической мишени (Heinrich, Griffith и др. 2000). Существенно то, что мультикиназная ингибирующая активность R406 ослабляет BCR передачу сигналов в образцах линии клеток лимфомы и первичной лимфомы человека, что приводит к апоптозу первых (Chen, Monti и др. *Blood* 111(4): 2230-7 (2008). Более того, сообщено о благоприятных результатах при проведении II фазы клинического испытания с применением этого соединения при рефрактерной NHL и хроническом лимфоцитарном лейкозе (Friedberg J W и др., *Blood* 2008; 112(11), реферат 3). Несмотря на то, что точный механизм действия R406 неясен, данные свидетельствуют о том, что ингибирование киназ, опосредствующих передачу сигналов выживаемости в лимфоцитах, является клинически полезным.

Дополнительные недавние исследования также указывают на то, что Syk-зависимые сигналы выживаемости могут играть роль в злокачественности В-клеток, включая DLBCL, лимфому из клеток мантии и фолликулярную лимфому (см., например, S. Linfengshen и др. *Blood*, February 2008; 111: 2230-2237; J. M.

Irish и др. *Blood*, 2006; 108: 3135-3142; A. Renaldi и др. *Brit J. Haematology*, 2006; 132: 303-316; M. Gurooajan и др. *J. Immunol*, 2006; 176: 5715-5719; L. Laseux и др. *Blood*, 2006; 108: 4156-4162.

5 В недавней публикации обобщается часто встречающееся обнаружение поражения глаз с ревматоидным артритом и другими аутоиммунными заболеваниями. Склерит, эписклерит и сухой кератоконъюнктивит могут представлять основные клинические проявления этих аутоиммунных заболеваний. Могут быть поражены все компоненты органа зрения. Предподают, что аутоиммунные реакции на основе генетической предрасположенности  
10 пациента имеют значение в патогенезе заболеваний глаз.

Это позволяет признать Syk в качестве значимой терапевтической мишени при глазных болезнях. (Feist, E., Pleyer, U., *Z Rheumatol*, 69: 403 – 410, 2010).

15 Более того SYK также является значимой мишенью при лечении грибковых, вирусных и бактериальных инфекций глаз, например, кератита, вызванного грибковой инфекцией. Дектин-1 опосредованная активация p-Syk, и дальнейших факторов, таких как p-IkB или NFkB, приводит к продуцированию IL-1b и CXCL1/KC, которые имеют важное значение для рекрутирования нейтрофилов и мононуклеарных клеток в строму роговицы. Leal, S. M., Cowden, S., Hsia, Y.-C., Ghannoum, M. A., Momany, M., & Pearlman, E. (2010). Distinct  
20 roles for Dectin-1 and TLR4 in the pathogenesis of *Aspergillus fumigatus* keratitis. *PLoS Pathogens*, 6.

В общем, последние данные показывают, что SYK является важнейшей мишенью для лечения PRR и CLR опосредованного адаптивного иммунного ответа. Kingeter, L. M., & Lin, X. (2012). C-type lectin receptor-induced NF-κB  
25 activation in innate immune and inflammatory responses. *Cellular & molecular immunology*, 9(2), 105–112. Drummond, R. A., Saijo, S., Iwakura, Y., & Brown, G. D. (2011). The role of Syk/CARD9 coupled C-type lectins in antifungal immunity. *European journal of immunology*, 41(2), 276–281. Lee, H.-M., Yuk, J.-M., Kim, K.-H., Jang, J., Kang, G., Park, J. B., Son, J.-W., и др. (2011). *Mycobacterium abscessus*  
30 activates the NLRP3 inflammasome via Dectin-1-Syk and p62/SQSTM1. *Immunology and cell biology*.

В соответствии с одним вариантом осуществления, настоящее изобретение обеспечивает соединения, которые способны ингибировать одну или несколько киназ, более предпочтительно SYK, и их мутанты.

## LRRK2 - Богатая лейцином повторная киназа 2

Большой интерес вызвало открытие, что различные аутосомно-доминантные точковые мутации в пределах гена, кодирующего LRRK2, предрасполагают к развитию у людей болезни Паркинсона с поздним началом (БП), с клинической картиной, неотличимой от идиопатической БП (см. Paisan-Ruiz, C, Jain, S., Evans, E. W., Gilks, W. P., Simon, J., van der Brug, M., Lopez de Munain, A., Aparicio, S., Gill A. M., Khan, N., Johnson, J., Martinez, J. R., Nicholl, D., Carrera, I. M., Pena, A. S., de Silva, R., Lees, A., Marti-Masso, J. F., Perez-Tur, J., Wood, N. W. и Singleton, A. B. (2004) Cloning of the gene containing mutations that cause PARK8-linked Parkinson's disease. *Neuron*. 44, 595-600; Mata, I. F., Wedemeyer, W. J., Farrer, M. J., Taylor, J. P. и Gallo, K. A. (2006) LRRK2 in Parkinson's disease: protein domains and functional insights. *Trends Neurosci*. 29, 286-293; Taylor, J. P., Mata, I. F. и Farrer, M. J. (2006) LRRK2: a common pathway for parkinsonism, pathogenesis and prevention? *Trends Mol Med*. 12, 76-82).

Предпринятый на сегодняшний день генетический анализ показывает, что мутации в LRRK2 относительно часты, не только составляют 5-10% случаев семейной БП, но также были найдены в значительной части спорадических случаев БП (см. Farrer, M., Stone, J., Mata, I. F., Lincoln, S., Kachergus, J., Hulihan, M., Strain, K. J. и Maraganore, D. M. (2005) LRRK2 mutations in Parkinson disease. *Neurology*. 65, 738-740; Zabetian, C. P., Samii, A., Mosley, A. D., Roberts, J. W., Leis, B. C., Yearout, D., Raskind, W. H. и Griffith, A. (2005). A clinic-based study of the LRRK2 gene in Parkinson disease yields new mutations. *Neurology*. 65, 741-744. Мало что известно о том, как LRRK2 регулируется в клетках, каковыми являются ее физиологические субстраты и какие мутации вызывают или увеличивают риск БП.

Полногеномные исследования ассоциаций показывают ее возможное участие в дальнейших нейродегенеративных заболеваниях, подобных болезни Альцгеймера, более того, проказе, а также выявляют более высокую вероятность возникновения рака для носителей LRRK2 мутантов, и могут указывать на вовлечение этой киназы и мутантов в развитие рака. Inzelberg, и др. The LRRK2 G2019S mutation is associated with Parkinson disease and concomitant non-skin cancers. *Neurology*, 2012, 78, 781-786. Zhao, Y., Ho, P., Yih, Y., Chen, C., Lee, W. L., & Tan, E. K. (2011). LRRK2 variant associated with Alzheimer's disease. *Neurobiology of aging*, 32(11), 1990–1993. Lewis, P. A., & Manzoni, C. (2012).

LRRK2 and Human Disease: A Complicated Question or a Question of Complexes? *Science Signaling*, 5(207).

Неожиданным было открытие участия LRRK2 в качестве главного гена предрасположенности к болезни Крона (CD) и другим родственным воспалительным заболеваниям. Дефицит LRRK2 у мышей придает повышенную восприимчивость к экспериментальному колиту. Сложная природа мультидоменного LRRK2 белка делает вероятным то, что LRRK2 также может регулировать различные пути в иммунных реакциях посредством его вовлечения в NFAT1 регуляцию путем участия в NRON комплексе в иммунных клетках. Liu, Z., & Lenardo, M. J. (2012) "The role of LRRK2 in inflammatory bowel disease", *Cell research*; "LRRK2 as a negative regulator of NFAT: implications for the pathogenesis of inflammatory bowel disease", Puja Vora, Dermot PB McGovern, *Expert Review of Clinical Immunology*, март 2012, т. 8, № 3, с. 227-229.

В соответствии с одним вариантом осуществления, настоящее изобретение обеспечивает соединения, которые способны ингибировать одну или несколько киназ, более предпочтительно, LRRK, еще более предпочтительно LRRK2.

Киназа легких цепей миозина (MLCK или MYLK)

Ингибиторы MYLK (или MLCK) представляют интерес для лечения и/или предотвращения любых нарушений, при которых дисфункция тканевых барьеров или изменения подвижности клеток являются частью механизма заболевания или прогрессирования патофизиологии. Они включают большое число заболеваний в различных категориях, включая, но не ограничиваясь перечисленным, нарушения кожи: включая вульгарный ихтиоз, атопический дерматит, псориаз, экзему, аллергическое заболевание кожи, и реакции гиперчувствительности; расстройства кишечника: включая воспалительное заболевание кишечника, болезнь Крона, язвы, бактериальные инфекции, геморрагический шок, диарею, колит, вирусную и алкогольную болезнь печени, панкреатит; нарушения легких: включая острое повреждение легких после инфекции, повреждение, вызванное искусственной вентиляцией легких, сепсис, повреждение легких, вызванное тромбином, повреждение легких после реперфузии; интерстициальный цистит мочевого пузыря; ишемическую болезнь сердца после ишемически-реперфузионного повреждения, поток-зависимое повреждение, аневризму аорты, гипертензию; повреждение, вызванное ожогом; хориоретинальное сосудистое заболевание; неврологические нарушения:

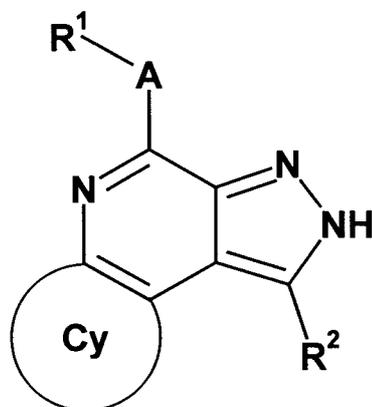
включая рассеянный склероз, болезнь Альцгеймера, сосудистую деменцию, травматическое повреждение головного мозга, ALS, болезнь Паркинсона, удар, менингоэнцефалит, внутримозговое кровоизлияние, синдром Гийена-Барре, вазогенный отек головного мозга, повреждение, индуцированное гипоксией и нарушение гематоэнцефалического барьера вследствие токсичности этанола; и различные типы рака, включая метастатические типы рака, такие как немелкоклеточный рак легких, рак поджелудочной железы, аденокарцинома и рак предстательной железы. См., например, Behanna H A, Watterson D M и Ralay Ranaivo H (2006) Development of a novel bioavailable inhibitor of the calmodulin-regulated protein kinase MLCK: a lead compound that attenuates vascular leak. *Biochim Biophys Acta* 1763: 1266-1274; Behanna H A, Bergan R и Watterson D M (2007), неопубликованные наблюдения; Bratcher J M и Korelitz B I (2006) Toxicity of infliximab in the course of Crohn's disease. *Expert Opin Drug Saf* 5: 9-16; Clayburgh D R, Shen L и Turner J R (2004) A porous defense: the leaky epithelial barrier in intestinal disease. *Lab Invest* 84: 282-291; Clayburgh D R, Barrett T A, Tang Y, Meddings J B, Van Eldik L J, Watterson D M, Clarke L L, Mrsny R J и Turner J R (2005) Epithelial myosin light chain kinase-dependent barrier dysfunction mediates T cell activation-induced diarrhea in vivo. *J Clin Invest* 115: 2702-2715; Demling R H (2005) The burn edema process: current concepts. *J Burn Care Rehabil* 26: 207-227; Dreyfuss D и Saumon G (1998) Ventilator-induced lung injury: lessons from experimental studies. *Am J Respir Crit. Care Med* 157: 294-323; Haorah J, Heilman D, Knipe B, Chrastil J, Leibhart J, Ghorpade A, Miller D W и Persidsky Y (2005) Ethanol-induced activation of myosin light chain kinase leads to dysfunction of tight junctions and blood-brain barrier compromise. *Alcohol Clin Exp Res* 29: 999-1009; Huang Q, Xu W, Ustinova E, Wu M, Childs E, Hunter F и Yuan S (2003) Myosin light chain kinase-dependent microvascular hyperpermeability in thermal injury. *Shock* 20: 363-368; Kaneko K, Satoh K, Masamune A, Satoh A и Shimosegawa T (2002) Myosin light chain kinase inhibitors can block invasion and adhesion of human pancreatic cancer cell lines. *Pancreas* 24: 34-41; Ma T Y, Boivin M A, Ye D, Pedram A и Said H M (2005) Mechanism of TNFalpha modulation of Caco-2 intestinal epithelial tight junction barrier: role of myosin light-chain kinase protein expression. *Am J Physiol Gastrointest Liver Physiol* 288: G422-G430; Minamiya Y, Nakagawa T, Saito H, Matsuzaki I, Taguchi K, Ito M и Ogawa J (2005) Increased expression of myosin light chain kinase mRNA is related to metastasis in

non-small cell lung cancer. *Tumour Biol* 26: 153-157; Ralay Ranaivo H, Carusio N, Wangensteen R, Ohlmann P, Loichot C, Tesse A, Chalupsky K, Lobysheva I, Haiech J, Watterson D M и Andriantsitohaina R (2007) Protection against endotoxic shock as a consequence of reduced nitrosative stress in MLCK210-null mice. *Am J Pathol* 170:439-446; Reynoso R, Perrin R M, Breslin J W, Daines D A, Watson K D, Watterson D M, Wu M H и Yuan S A role for long chain myosin light chain kinase (MLCK-210) in microvascular hyperpermeability during severe burns. *Shock*, Июнь 14 epub; Rossi J, Bayram M, Udelson J E, Lloyd-Jones D, Adams K F, Oconnor C M, Stough W G, Ouyang J, Shin D D, Orlandi C и Gheorghide M (2007) Improvement in hyponatremia during hospitalization for worsening heart failure is associated with improved outcomes: insights from the Acute and Chronic Therapeutic Impact of a Vasopressin Antagonist in Chronic Heart Failure (ACTIV in CHF) trial. *Acute Card Care* 9:82-86; Scott K G, Meddings J B, Kirk D R, Lees-Miller S P и Buret A G (2002) Intestinal infection with *Giardia* spp. reduces epithelial barrier function in a myosin light chain kinase-dependent fashion. *Gastroenterology* 123: 1179-1190; Tohtong R, Phattarasakul K, Jiraviriyakul A и Sutthiphongchai T (2003) Dependence of metastatic cancer cell invasion on MLCK-catalyzed phosphorylation of myosin regulatory light chain. *Prostate Cancer Prostatic Dis* 6: 212-216; Yuan S Y (2002) Protein kinase signaling in the modulation of microvascular permeability. *Vascul Pharmacol* 39: 213-223; Yuan S Y, Wu M H, Ustinova E E, Guo M, Tinsley J H, De Lanerolle P и Xu W (2002) Myosin light chain phosphorylation in neutrophil-stimulated coronary microvascular leakage. *Circ Res* 90: 1214-1221; Zolotarevsky Y, Hecht G, Koutsouris A, Gonzalez D E, Quan C, Tom J, Mrsny R J и Turner JR (2002) A membrane-permeant peptide that inhibits MLC kinase restores barrier function in in vitro models of intestinal disease. *Gastroenterology* 123 (2002) 163-172. Role of myosin light chain kinase in regulation of basal blood pressure and maintenance of salt-induced hypertension. (2011). Role of myosin light chain kinase in regulation of basal blood pressure and maintenance of salt-induced hypertension. *American journal of physiology. Heart and circulatory physiology*, 301(2).

30 В соответствии с одним вариантом осуществления, настоящее изобретение обеспечивает соединения, которые способны ингибировать одну или несколько киназ, в особенности, MYLK (или MLCK).

## ИЗЛОЖЕНИЕ СУЩНОСТИ ИЗОБРЕТЕНИЯ

Настоящее изобретение обеспечивает одно или несколько соединений формулы (I)



(I)

где

A означает O, S, C=O, NR<sup>3</sup> или CR<sup>4</sup>R<sup>5</sup> (в особенности, NH);

Cy означает необязательно замещенную арильную, гетероарильную, циклоалкильную, гетероциклоалкильную, алкилциклоалкильную, гетероалкилциклоалкильную, аралкильную или гетероаралкильную группу;

R<sup>1</sup> означает необязательно замещенную алкильную, алкенильную, алкинильную, гетероалкильную, арильную, гетероарильную, циклоалкильную, алкилциклоалкильную, гетероалкилциклоалкильную, гетероциклоалкильную, аралкильную или гетероаралкильную группу;

R<sup>2</sup> означает атом водорода, атом галогена, NO<sub>2</sub>, N<sub>3</sub>, OH, SH, NH<sub>2</sub> или алкильную, алкенильную, алкинильную, гетероалкильную, арильную, гетероарильную, циклоалкильную, алкилциклоалкильную, гетероалкилциклоалкильную, гетероциклоалкильную, аралкильную или гетероаралкильную группу;

R<sup>3</sup> означает атом водорода или алкильную, алкенильную, алкинильную, гетероалкильную, арильную, гетероарильную, циклоалкильную,

алкилциклоалкильную, гетероалкилциклоалкильную, гетероциклоалкильную, аралкильную или гетероаралкильную группу;

5  $R^4$  означает атом водорода,  $\text{NO}_2$ ,  $\text{N}_3$ ,  $\text{OH}$ ,  $\text{SH}$ ,  $\text{NH}_2$  или алкильную, алкенильную, алкинильную, гетероалкильную, арильную, гетероарильную, циклоалкильную, алкилциклоалкильную, гетероалкилциклоалкильную, гетероциклоалкильную, аралкильную или гетероаралкильную группу; и

10  $R^5$  означает атом водорода,  $\text{NO}_2$ ,  $\text{N}_3$ ,  $\text{OH}$ ,  $\text{SH}$ ,  $\text{NH}_2$  или алкильную, алкенильную, алкинильную, гетероалкильную, арильную, гетероарильную, циклоалкильную, алкилциклоалкильную, гетероалкилциклоалкильную, гетероциклоалкильную, аралкильную или гетероаралкильную группу;

15 или его фармацевтически приемлемую соль, сложный эфир, сольват или гидрат, или фармацевтически приемлемый состав.

20 Выражение алкил относится к насыщенной углеводородной группе с неразветвленной или разветвленной цепью, которая содержит от 1 до 20 атомов углерода, предпочтительно от 1 до 12 атомов углерода, в особенности, от 1 до 6 (например, 1, 2, 3 или 4) атомов углерода, например, означает метильную, этильную, пропильную, изо-пропильную, н-бутильную, изо-бутильную, втор-бутильную, трет-бутильную, н-пентильную, изо-пентильную, н-гексильную, 2,2-диметилбутильную или н-октильную группу.

25 Выражения алкенил и алкинил относятся к по меньшей мере частично ненасыщенным углеводородным группам с неразветвленной или разветвленной цепью, которые содержат от 2 до 20 атомов углерода, предпочтительно от 2 до 12 атомов углерода, в особенности, от 2 до 6 (например, 2, 3 или 4) атомов углерода, например, означают этенильную (винильную), пропенильную (аллильную), изо-пропенильную, бутенильную, этинильную, пропинильную, бутинильную, ацетиленильную, пропаргильную, изопренильную или гекс-2-енильную группу. Предпочтительно, алкенильные группы содержат одну или 30 две (особенно предпочтительно одну) двойную(-ые) связь(-и), и алкинильные

группы содержат одну или две (особенно предпочтительно одну) тройную(-ые) связь(-и).

5 Более того, термины алкил, алкенил и алкинил относятся к группам, в которых один или несколько атомов водорода заменены на атом галогена (предпочтительно F или Cl), таким как, например, 2,2,2-трихлорэтильная или трифторметильная группа.

10 Выражение гетероалкил относится к алкильной, алкенильной или алкинильной группе, в которой один или несколько (предпочтительно 1, 2 или 3) атомов углерода заменены на атом кислорода, азота, фосфора, бора, селена, кремния или серы (предпочтительно на атом кислорода, серы или азота). Более того, выражение гетероалкил относится к карбоновой кислоте или к группе, полученной из карбоновой кислоты, такой как, например, ацил, ацилалкил, 15 алкоксикарбонил, ацилокси, ацилоксиалкил, карбоксиалкиламид или алкоксикарбонилокси.

Предпочтительно, гетероалкильная группа содержит от 1 до 12 атомов углерода и от 1 до 4 гетероатомов, выбранных из кислорода, азота и серы (в 20 особенности, кислорода и азота). Особенно предпочтительно, гетероалкильная группа содержит от 1 до 6 (например, 1, 2, 3 или 4) атомов углерода и 1, 2 или 3 (в особенности, 1 или 2) гетероатомов, выбранных из кислорода, азота и серы (в особенности, кислорода и азота). Термин C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> гетероалкил относится к гетероалкильной группе, содержащей от 1 до 6 атомов углерода и 1, 2 или 3 25 гетероатома, выбранных из O, S и/или N (в особенности, O и/или N). Термин C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> гетероалкил относится к гетероалкильной группе, содержащей от 1 до 4 атомов углерода и 1, 2 или 3 гетероатома, выбранных из O, S и/или N (в особенности, O и/или N). Более того, термин гетероалкил относится к группам, в 30 которых один или несколько атомов водорода заменены на атом галогена (предпочтительно F или Cl).

Примерами гетероалкильных групп являются группы формул: R<sup>a</sup>-O-Y<sup>a</sup>-, R<sup>a</sup>-S-Y<sup>a</sup>-, R<sup>a</sup>-N(R<sup>b</sup>)-Y<sup>a</sup>-, R<sup>a</sup>-CO-Y<sup>a</sup>-, R<sup>a</sup>-O-CO-Y<sup>a</sup>-, R<sup>a</sup>-CO-O-Y<sup>a</sup>-, R<sup>a</sup>-CO-N(R<sup>b</sup>)-Y<sup>a</sup>-, R<sup>a</sup>-N(R<sup>b</sup>)-CO-Y<sup>a</sup>-, R<sup>a</sup>-O-CO-N(R<sup>b</sup>)-Y<sup>a</sup>-, R<sup>a</sup>-N(R<sup>b</sup>)-CO-O-Y<sup>a</sup>-,

$R^a-N(R^b)-CO-N(R^c)-Y^a-$ ,  $R^a-O-CO-O-Y^a-$ ,  $R^a-N(R^b)-C(=NR^d)-N(R^c)-Y^a-$ ,  $R^a-CS-Y^a-$ ,  
 $R^a-O-CS-Y^a-$ ,  $R^a-CS-O-Y^a-$ ,  $R^a-CS-N(R^b)-Y^a-$ ,  $R^a-N(R^b)-CS-Y^a-$ ,  $R^a-O-CS-N(R^b)-Y^a-$ ,  
 $R^a-N(R^b)-CS-O-Y^a-$ ,  $R^a-N(R^b)-CS-N(R^c)-Y^a-$ ,  $R^a-O-CS-O-Y^a-$ ,  $R^a-S-CO-Y^a-$ ,  
 $R^a-CO-S-Y^a-$ ,  $R^a-S-CO-N(R^b)-Y^a-$ ,  $R^a-N(R^b)-CO-S-Y^a-$ ,  $R^a-S-CO-O-Y^a-$ ,  
5  $R^a-O-CO-S-Y^a-$ ,  $R^a-S-CO-S-Y^a-$ ,  $R^a-S-CS-Y^a-$ ,  $R^a-CS-S-Y^a-$ ,  $R^a-S-CS-N(R^b)-Y^a-$ ,  
 $R^a-N(R^b)-CS-S-Y^a-$ ,  $R^a-S-CS-O-Y^a-$ ,  $R^a-O-CS-S-Y^a-$ , где  $R^a$  представляет собой  
атом водорода,  $C_1-C_6$  алкильную,  $C_2-C_6$  алкенильную или  $C_2-C_6$  алкинильную  
группу;  $R^b$  представляет собой атом водорода,  $C_1-C_6$  алкильную,  $C_2-C_6$   
алкенильную или  $C_2-C_6$  алкинильную группу;  $R^c$  представляет собой атом  
10 водорода,  $C_1-C_6$  алкильную,  $C_2-C_6$  алкенильную или  $C_2-C_6$  алкинильную группу;  
 $R^d$  представляет собой атом водорода,  $C_1-C_6$  алкильную,  $C_2-C_6$  алкенильную или  
 $C_2-C_6$  алкинильную группу и  $Y^a$  представляет собой непосредственную связь,  
 $C_1-C_6$  алкиленовую,  $C_2-C_6$  алкениленовую или  $C_2-C_6$  алкиниленовую группу, где  
каждая гетероалкильная группа содержит по меньшей мере один атом углерода,  
15 и один или несколько атомов водорода могут быть заменены на атомы фтора или  
хлора.

Характерными примерами гетероалкильных групп являются такие группы,  
как метокси, трифторметокси, этокси, н-пропилокси, изопрпилокси, бутокси,  
20 *трет*-бутилокси, метоксиметил, этоксиметил,  $-CH_2CH_2OH$ ,  $-CH_2OH$ ,  
метоксиэтил, 1-метоксиэтил, 1-этоксиэтил, 2-метоксиэтил или 2-этоксиэтил,  
метиламино, этиламино, пропиламино, изопрпиламино, диметиламино,  
диэтиламино, изопрпилэтиламино, метиламинометил, этиламинометил,  
диизопрпиламиноэтил, метилтио, этилтио, изопрпилтио, енольный эфир,  
25 диметиламинометил, диметиламиноэтил, ацетил, пропионил, бутирилокси,  
ацетилокси, метоксикарбонил, этоксикарбонил, пропионилокси, ацетиламино  
или пропиониламино, карбоксиметил, карбоксиэтил или карбоксипропил, N-  
этил-N-метилкарбамоил или N-метилкарбамоил. Дополнительными примерами  
гетероалкильных групп являются нитрильная, изонитрильная, цианатная,  
30 тиоцианатная, изоцианатная, изотиоцианатная и алкилнитрильная группы.

Выражение циклоалкил относится к насыщенной или частично  
ненасыщенной циклической группе (например, циклоалкенильной группе),  
которая содержит одно или несколько колец (предпочтительно 1 или 2), и

содержит от 3 до 14 кольцевых атомов углерода, предпочтительно от 3 до 10 (в особенности, 3, 4, 5, 6 или 7) кольцевых атомов углерода. Выражение циклоалкил, более того, относится к группам, в которых один или несколько атомов водорода заменены на атомы фтора, хлора, брома или йода или на OH, =O, SH, =S, NH<sub>2</sub>, =NH, N<sub>3</sub> или NO<sub>2</sub> группы, таким образом, например, циклическим кетонам, таким как, например, циклогексанон, 2-циклогексенон или циклопентанон. Дополнительными характерными примерами циклоалкильных групп являются циклопропильная, циклобутильная, циклопентильная, спиро[4,5]деканильная, норборнильная, циклогексильная, циклопентенильная, циклогексадиенильная, декалинильная, бицикло[4.3.0]нонильная, тетралиновая, циклопентилциклогексильная, фторциклогексильная или циклогекс-2-енильная группа.

Выражение гетероциклоалкил относится к циклоалкильной группе согласно вышеприведенному определению, в которой один или несколько (предпочтительно 1, 2 или 3) кольцевых атомов углерода заменены на атом кислорода, азота, кремния, селена, фосфора или серы (предпочтительно на атом кислорода, серы или азота). Гетероциклоалкильная группа предпочтительно имеет 1 или 2 кольцо(-а), содержащее(-их) от 3 до 10 (в особенности, 3, 4, 5, 6 или 7) кольцевых атомов (предпочтительно выбранных из C, O, N и S). Выражение гетероциклоалкил, более того, относится к группам, в которых один или несколько атомов водорода заменены на атомы фтора, хлора, брома или йода или на группы OH, =O, SH, =S, NH<sub>2</sub>, =NH, N<sub>3</sub> или NO<sub>2</sub>. Примерами являются пиперидильная, пролинильная, имидазолидинильная, пиперазинильная, морфолинильная, уротропинильная, пирролидинильная, тетрагидротиофенильная, тетрагидропиранильная, тетрагидрофурильная или 2-пиразолинильная группа, а также лактамы, лактоны, циклические имиды и циклические ангидриды.

Выражение алкилциклоалкил относится к группам, которые содержат как циклоалкильную, так и алкильную, алкенильную или алкинильную группы в соответствии с приведенными выше определениями, например, означает алкилциклоалкильную, циклоалкилалкильную, алкилциклоалкенильную, алкенилциклоалкильную и алкинилциклоалкильную группы.

Алкилциклоалкильная группа предпочтительно содержит циклоалкильную группу, которая содержит один или два кольца, содержащих от 3 до 10 (в особенности, 3, 4, 5, 6 или 7) кольцевых атомов углерода, и одну или две алкильные, алкенильные или алкинильные группы (в особенности, алкильные группы), содержащие 1 или от 2 до 6 атомов углерода.

Выражение гетероалкилциклоалкил относится к алкилциклоалкильным группам согласно вышеприведенному определению, в которых один или несколько (предпочтительно 1, 2 или 3) атомов углерода заменены на атом кислорода, азота, кремния, селена, фосфора или серы (предпочтительно на атом кислорода, серы или азота). Гетероалкилциклоалкильная группа предпочтительно содержит 1 или 2 кольца, содержащих от 3 до 10 (в особенности, 3, 4, 5, 6 или 7) кольцевых атомов, и одну или две алкильные, алкенильные, алкинильные или гетероалкильные группы (в особенности, алкильные или гетероалкильные группы), содержащие от 1 или 2 до 6 атомов углерода. Примерами таких групп являются алкилгетероциклоалкил, алкилгетероциклоалкенил, алкенилгетероциклоалкил, алкинилгетероциклоалкил, гетероалкилциклоалкил, гетероалкилгетероциклоалкил и гетероалкилгетероциклоалкенил, циклические группы являются насыщенными или моно-, ди- или три-ненасыщенными.

Выражение арил относится к ароматической группе, которая содержит одно или несколько колец, содержащих от 6 до 14 кольцевых атомов углерода, предпочтительно от 6 до 10 (в особенности, 6) кольцевых атомов углерода. Выражение арил, более того, относится к группам, в которых один или несколько атомов водорода заменены на атомы фтора, хлора, брома или йода или на группы OH, SH, NH<sub>2</sub>, N<sub>3</sub> или NO<sub>2</sub>. Примерами являются фенильная, нафтильная, бифенильная, 2-фторфенильная, анилинильная, 3-нитрофенильная или 4-гидроксифенильная группа.

Выражение гетероарил относится к ароматической группе, которая содержит одно или несколько колец, содержащих от 5 до 14 кольцевых атомов, предпочтительно от 5 до 10 (в особенности, 5 или 6 или 9 или 10) кольцевых атомов, и содержит один или несколько (предпочтительно 1, 2, 3 или 4)

кольцевых атомов кислорода, азота, фосфора или серы (предпочтительно O, S или N). Выражение гетероарил, более того, относится к группам, в которых один или несколько атомов водорода заменены на атомы фтора, хлора, брома или йода или на группы OH, SH, N<sub>3</sub>, NH<sub>2</sub> или NO<sub>2</sub>. Примерами являются такие группы, как пиридил (например, 4-пиридил), имидазолил (например, 2-имидазолил), фенилпирролил (например, 3-фенилпирролил), тиазолил, изотиазолил, 1,2,3-триазолил, 1,2,4-триазолил, оксадиазолил, тиадиазолил, индолил, индазолил, тетразолил, пиазинил, пиримидинил, пиридазинил, оксазолил, изоксазолил, триазолил, тетразолил, изоксазолил, индазолил, индолил, бензимидазолил, бензоксазолил, бензизоксазолил, бензтиазолил, пиридазинил, хиолинил, изохиолинил, пирролил, пуринил, карбазолил, акридинил, пиримидил, 2,3'-бифурил, пиазолил (например, 3-пиазолил) и изохиолинил.

15           Выражение аралкил относится к группам, содержащим как арильную, так и алкильную, алкенильную, алкинильную и/или циклоалкильную группы в соответствии с приведенными выше определениями, таким как, например, арилалкильная, арилалкенильная, арилалкинильная, арилциклоалкильная, арилциклоалкенильная, алкиларилциклоалкильная и алкиларилциклоалкенильная группы. Характерными примерами аралкилов являются толуол, ксилол, мезитилен, стирол, бензилхлорид, о-фтортолуол, 1H-инден, тетралин, дигидронафталин, инданон, фенилциклопентил, кумол, циклогексилфенил, флуорен и индан. Аралкильная группа предпочтительно содержит системы с одним или двумя ароматическими кольцами (1 или 2 кольцевые), содержащими от 6 до 10 атомов углерода, и одну или две алкильные, алкенильные и/или алкинильные группы, содержащие от 1 или 2 до 6 атомов углерода и/или циклоалкильную группу, содержащую 5 или 6 кольцевых атомов углерода.

30           Выражение гетероаралкил относится к аралкильной группе согласно вышеприведенному определению, в которой один или несколько (предпочтительно 1, 2, 3 или 4) атомов углерода заменены на атом кислорода, азота, кремния, селена, фосфора, бора или серы (предпочтительно кислорода, серы или азота), другими словами, к группам, содержащим как арильную или

гетероарильную, соответственно, так и алкильные, алкенильные, алкинильные и/или гетероалкильные и/или циклоалкильные и/или гетероциклоалкильные группы в соответствии с приведенными выше определениями. Гетероаралкильная группа предпочтительно содержит системы с одним или  
 5 двумя ароматическими кольцами (1 или 2 кольцевые), содержащими от 5 или 6 до 10 кольцевых атомов углерода и одну или две алкильные, алкенильные и/или алкинильные группы, содержащие 1 или от 2 до 6 атомов углерода и/или циклоалкильную группу, содержащую 5 или 6 кольцевых атомов углерода, где 1,  
 10 2, 3 или 4 из этих атомов углерода заменены на атомы кислорода, серы или азота.

Примерами являются такие группы, как арилгетероалкил, арилгетероциклоалкил, арилгетероциклоалкенил, арилалкилгетероциклоалкил, арилалкенилгетероциклоалкил,  
 15 арилалкинилгетероциклоалкил, арилалкилгетероциклоалкенил, гетероарилалкил, гетероарилалкенил, гетероарилалкинил, гетероарилгетероалкил, гетероарилциклоалкил, гетероарилциклоалкенил, гетероарилгетероциклоалкил, гетероарилгетероциклоалкенил, гетероарилалкилциклоалкил, гетероарилалкилгетероциклоалкенил, гетероарилгетероалкилциклоалкил,  
 20 гетероарилгетероалкилциклоалкенил и гетероарилгетероалкилгетероциклоалкил, циклические группы являются насыщенными или моно-, ди- или три-ненасыщенными. Характерными примерами являются тетрагидроизохинолинильная, бензоильная, 2- или 3-этилиндолильная, 4-метилпиридино, 2-, 3- или 4-метоксифенильная, 4-этоксифенильная, 2-, 3- или  
 25 4-карбоксифенилалкильная группа.

Как уже было определено выше, выражение циклоалкил, гетероциклоалкил, алкилциклоалкил, гетероалкилциклоалкил, арил, гетероарил, аралкил и гетероаралкил также относятся к группам, где один или несколько атомов  
 30 водорода таких групп заменены на атомы фтора, хлора, брома или йода или на группы OH, =O, SH, =S, NH<sub>2</sub>, =NH, N<sub>3</sub> или NO<sub>2</sub>.

Выражение “необязательно замещенный”, в особенности, относится к группам, в которых один, два, три или больше атомов водорода могут быть

заменены на атомы фтора, хлора, брома или йода или на группы OH, =O, SH, =S, NH<sub>2</sub>, =NH, N<sub>3</sub> или NO<sub>2</sub>. Это выражение, более того, относится к группам, которые могут быть замещены один, два, три или больше раз незамещенными C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> алкильными, C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub> алкенильными, C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub> алкинильными, C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> гетероалкильными, C<sub>3</sub>-C<sub>18</sub> циклоалкильными, C<sub>2</sub>-C<sub>17</sub> гетероциклоалкильными, C<sub>4</sub>-C<sub>20</sub> алкилциклоалкильными, C<sub>2</sub>-C<sub>19</sub> гетероалкилциклоалкильными, C<sub>6</sub>-C<sub>18</sub> арильными, C<sub>1</sub>-C<sub>17</sub> гетероарильными, C<sub>7</sub>-C<sub>20</sub> аралкильными или C<sub>2</sub>-C<sub>19</sub> гетероаралкильными группами. Более того, это выражение особенно относится к группам, которые могут быть замещены один, два, три или больше раз незамещенными C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкильными, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкенильными, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкинильными, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> гетероалкильными, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> циклоалкильными, C<sub>2</sub>-C<sub>9</sub> гетероциклоалкильными, C<sub>7</sub>-C<sub>12</sub> алкилциклоалкильными, C<sub>2</sub>-C<sub>11</sub> гетероалкилциклоалкильными, C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> арильными, C<sub>1</sub>-C<sub>9</sub> гетероарильными, C<sub>7</sub>-C<sub>12</sub> аралкильными или C<sub>2</sub>-C<sub>11</sub> гетероаралкильными группами.

Предпочтительными заместителями являются F, Cl, Br, OH, =O, NH<sub>2</sub>, C<sub>1-4</sub> алкил (например, метил, этил, трет-бутил), NMe<sub>2</sub>, CONH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>NMe<sub>2</sub>, NHSO<sub>2</sub>Me, C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>CN, COMe, OMe, SMe, COOMe, COOEt, CH<sub>2</sub>COOH, OCH<sub>2</sub>COOH, COOH, SOMe, SO<sub>2</sub>Me, циклопропил, SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, SO<sub>2</sub>NHMe, SO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OH, SF<sub>5</sub>, SO<sub>2</sub>NMe<sub>2</sub>, OCF<sub>3</sub>, SO<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, COMe, CN или CF<sub>3</sub>.

В особенности, предпочтительными заместителями являются F, Cl, Br, Me, OMe, CN или CF<sub>3</sub>.

В соответствии с предпочтительным вариантом осуществления, все алкильные, алкенильные, алкинильные, гетероалкильные, арильные, гетероарильные, циклоалкильные, гетероциклоалкильные, алкилциклоалкильные, гетероалкилциклоалкильные, аралкильные и гетероаралкильные группы, описанные в данном документе, необязательно могут быть замещенными.

Когда арильная, гетероарильная, циклоалкильная, алкилциклоалкильная, гетероалкилциклоалкильная, гетероциклоалкильная, аралкильная или гетероаралкильная группа содержит более одного кольца, эти кольца могут быть

присоединены друг к другу через одинарную или двойную связь или эти кольца могут быть аннелированными.

Предпочтительными являются соединения формулы (I), где А означает NH.

5

Более того, предпочтительными являются соединения формулы (I), где R<sup>2</sup> означает H, F, Cl, CH<sub>3</sub>, CF<sub>3</sub>, NO<sub>2</sub>, циклопропил, CN, N<sub>3</sub>, OH, SH, OMe, SMe, NHMe, NMe<sub>2</sub> или NH<sub>2</sub>.

10

Кроме того, предпочтительными являются соединения формулы (I), где R<sup>2</sup> означает атом водорода, NO<sub>2</sub> группу, CF<sub>3</sub> группу или метильную группу (в особенности, H или CH<sub>3</sub>; особенно предпочтительно H).

15

В особенности, предпочтительными являются соединения формулы (I), где А означает NH и R<sup>2</sup> означает H, NO<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub> или CH<sub>3</sub> (в особенности, H или CH<sub>3</sub>; особенно предпочтительно H).

20

Более того, предпочтительными являются соединения формулы (I), где Су означает необязательно замещенную фенильную (или фениленовую; или С<sub>6</sub> арильную) группу или необязательно замещенную гетероарильную (или гетероариленовую) группу, содержащую 5 или 6 кольцевых атомов и 1, 2 или 3 гетероатома, выбранных из O, S и N. Предпочтительно, эти группы являются незамещенными или замещены одной или двумя группами, выбранными из следующих: С<sub>1-6</sub> алкил, С<sub>1-6</sub> гетероалкил и/или атом(-ы) галогена(-ов). Особенно

25 предпочтительно, эти группы являются незамещенными или замещены одной или двумя группами, выбранными из следующих: CH<sub>3</sub>, OCH<sub>3</sub>, COOMe, OCH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CN и/или атом галогена, подобный, например, Br. Наиболее предпочтительно, эти группы являются незамещенными или замещены посредством OMe, F или CN.

30

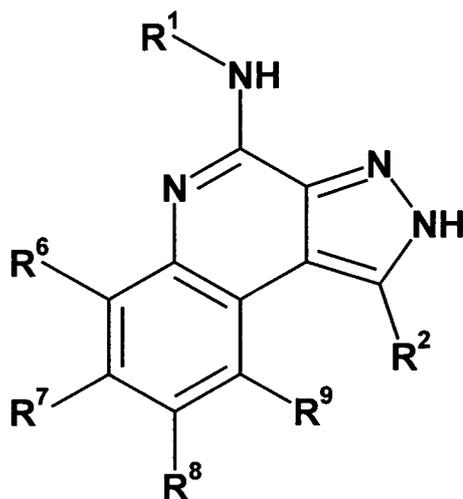
Кроме того, предпочтительными являются соединения формулы (I), где Су означает необязательно замещенную фенильную группу или необязательно замещенную пиридинильную группу, необязательно замещенную тиофенильную группу или необязательно замещенную изотиазольную группу.

Предпочтительно, эти группы являются незамещенными или замещены одной или двумя группами, выбранными из следующих: C<sub>1-6</sub> алкил, C<sub>1-6</sub> гетероалкил и/или атом(-ы) галогена(-ов). Особенно предпочтительно, эти группы являются незамещенными или замещены одной или двумя группами, выбранными из  
5 следующих: CH<sub>3</sub>, OCH<sub>3</sub>, OCH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, COOMe, CN и/или атом галогена, подобный, например, Br. Наиболее предпочтительно, эти группы являются незамещенными или замещены посредством OMe, F или CN.

Более того, предпочтительными являются соединения формулы (I), где Су  
10 означает оксазол, тиазол, изоксазол, 1,2,5-тиадиазол, фуран, тиофен, 1,2,3-тиадиазол, 1,2,5-оксадиазол, 1,2,3-оксадиазол, 1Н-имидазол, 1Н-1,2,4-триазол, 1Н-пиррол, 1Н-1,2,3-триазол, 1Н-тетразол, 4Н-1,2,4-триазол, 1Н-пиразол, 1,2,5-селенадиазол, 1,3-селеназол, селенофен, 2Н-1,2,3-триазол, 1,3-дитиол-1-ий, бензол, пиримидин, пиразин, пиридин, пиридазин, 1,2,4-триазин, 1,2,3-триазин,  
15 1,4-дитиин или их региоизомеры. Эти группы могут быть незамещенными или замещенными. Предпочтительно, эти группы являются незамещенными или замещены одной или двумя группами, выбранными из следующих: C<sub>1-6</sub> алкил, C<sub>1-6</sub> гетероалкил и/или атом галогена. Особенно предпочтительно, эти группы являются незамещенными или замещены одной или двумя группами,  
20 выбранными из следующих: CH<sub>3</sub>, OCH<sub>3</sub>, OCH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, COOMe, CN и/или атом галогена, подобный, например, Br. Наиболее предпочтительно, эти группы являются незамещенными или замещены посредством OMe, F или CN.

Более того, предпочтительными являются соединения формулы (Ia):

25



(Ia)

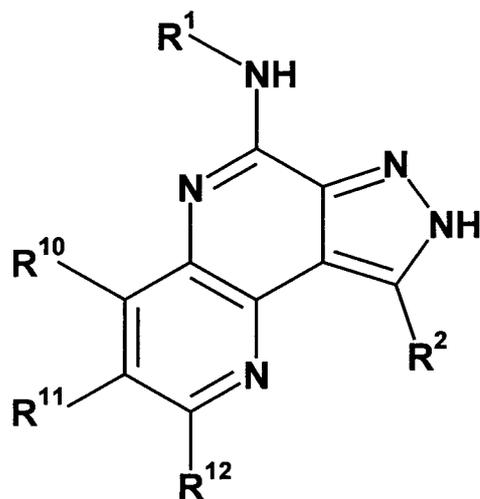
где  $R^6$ ,  $R^7$ ,  $R^8$  и  $R^9$  независимо выбирают из H, OH,  $C_{1-6}$  алкила,  $C_{1-6}$   
 5 гетероалкила и атома галогена и, где  $R^1$  и  $R^2$  принимают значения согласно  
 вышеприведенному определению.

Предпочтительно,  $R^6$ ,  $R^7$ ,  $R^8$  и  $R^9$  независимо выбирают из H, OH,  $OCH_3$ ,  
 10 CN и атома галогена (подобного, например, F, Cl, Br или I).

Особенно предпочтительно,  $R^6$ ,  $R^7$ ,  $R^8$  и  $R^9$  независимо выбирают из H, OH,  
 CN, OMe, F, Cl, Br и I (например, H, OH, OMe, F, Cl, Br и I; предпочтительно из  
 H, F, OMe и CN; в особенности, из H и  $OCH_3$ ), где предпочтительно 2, 3 или 4  
 радикала из  $R^6$ ,  $R^7$ ,  $R^8$  и  $R^9$  означают H.

Кроме того, предпочтительно, один или два радикала из  $R^6$ ,  $R^7$ ,  $R^8$  и  $R^9$   
 15 означают F, CN или OMe (в особенности, OMe), и другие радикалы  $R^6$ ,  $R^7$ ,  $R^8$  и  
 $R^9$  означают H.

20 Более того, предпочтительными являются соединения формулы (Ib):



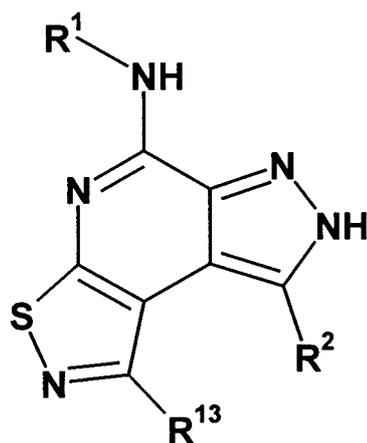
(Ib)

где R<sup>10</sup>, R<sup>11</sup> и R<sup>12</sup> независимо выбирают из H, C<sub>1-6</sub> алкила, C<sub>1-6</sub> гетероалкила  
5 и атома галогена и, где R<sup>1</sup> и R<sup>2</sup> принимают значения согласно  
вышеприведенному определению.

Предпочтительно, R<sup>10</sup>, R<sup>11</sup> и R<sup>12</sup> независимо выбирают из H, OCH<sub>3</sub>, CN и  
10 атома галогена (подобного, например, Br); особенно предпочтительно из H, F,  
CN и OMe.

Особенно предпочтительно, R<sup>10</sup>, R<sup>11</sup> и R<sup>12</sup> независимо выбирают из H, F, CN  
и OMe (предпочтительно H и OCH<sub>3</sub>; в особенности, H), где предпочтительно 2  
15 или 3 радикала из R<sup>10</sup>, R<sup>11</sup> и R<sup>12</sup> означают H.

Более того, предпочтительными являются соединения формулы (Ic):



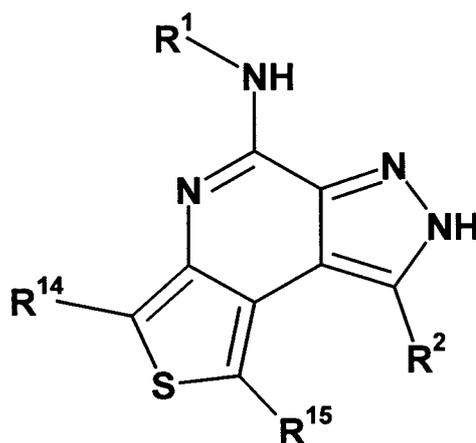
(Ic)

где  $R^{13}$  выбирают из H,  $C_{1-6}$  алкила,  $C_{1-6}$  гетероалкила и атома галогена и,  
 5 где  $R^1$  и  $R^2$  принимают значения согласно вышеприведенному определению.

Предпочтительно,  $R^{13}$  выбирают из H,  $CH_3$ ,  $OCH_3$ , CN и атома галогена  
 (подобного, например, Br).

10 Особенно предпочтительно,  $R^{13}$  означает метил.

Кроме того, предпочтительными являются соединения формулы (Id):



(Id)

15

где  $R^{14}$  и  $R^{15}$  независимо выбирают из H,  $C_{1-6}$  алкила,  $C_{1-6}$  гетероалкила и  
 атома галогена и, где  $R^1$  и  $R^2$  принимают значения согласно вышеприведенному  
 определению.

Предпочтительно,  $R^{14}$  означает  $COOMe$  и  $R^{15}$  означает  $H$ .

5 Более того, предпочтительными являются соединения формулы (I), (Ia), (Ib), (Ic) и (Id), где  $R^1$  означает арильную, гетероарильную, циклоалкильную, гетероциклоалкильную, алкилциклоалкильную, гетероалкилциклоалкильную, аралкильную или гетероаралкильную группу, каждая из которых может быть необязательно замещена.

10 Более того, предпочтительными являются соединения формулы (I), (Ia), (Ib), (Ic) и (Id), где  $R^1$  означает арильную, гетероарильную,  $CH_2$ -арильную или  $CH_2$ -гетероарильную группу, каждая из которых может быть необязательно замещена.

15 Кроме того, предпочтительными являются соединения формулы (I), (Ia), (Ib), (Ic) и (Id), где  $R^1$  означает необязательно замещенную фенильную или нафтильную группу или необязательно замещенную гетероарильную группу, имеющую одно или два кольца, содержащих 5, 6, 7, 8, 9 или 10 кольцевых атомов, или необязательно замещенную арилгетероциклоалкильную, гетероарилциклоалкильную или гетероарилгетероциклоалкильную группу, содержащую два или три кольца (в особенности, два аннелированных кольца) и от 9 до 20 (в особенности, 9 или 10) кольцевых атомов. Предпочтительно, гетероатомы выбирают из S, O и N, в особенности, из N и O. Кроме того, предпочтительно, число гетероатомов составляет от 1 до 6 (в особенности, 1, 2, 25 3 или 4).

Особенно предпочтительно,  $R^1$  означает необязательно замещенную фенильную группу или необязательно замещенную гетероарильную группу, имеющую одно кольцо, содержащее 5 или 6 кольцевых атомов. Предпочтительно  
30 данная фенильная или гетероарильная группа замещена одной или несколькими (в особенности, одной) группой(-ами), такой(-ими) как  $C_1$ - $C_{10}$  алкил,  $C_2$ - $C_{10}$  алкенил,  $C_2$ - $C_{10}$  алкинил,  $C_1$ - $C_{10}$  гетероалкил,  $C_3$ - $C_{18}$  циклоалкил,  $C_2$ - $C_{17}$  гетероциклоалкил,  $C_4$ - $C_{20}$  алкилциклоалкил,  $C_2$ - $C_{19}$  гетероалкилциклоалкил,  $C_6$ - $C_{18}$  арил,  $C_1$ - $C_{17}$  гетероарил,  $C_7$ - $C_{20}$  аралкил или  $C_2$ - $C_{19}$  гетероаралкил.

Предпочтительно, гетероатомы выбирают из S, O и N, в особенности, из N и O. Особенно предпочтительно, фенильная или гетероарильная группа замещена одной или несколькими (в особенности, одной) группой(-ами), такой(-ими) как C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкил, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкенил, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкинил, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> гетероалкил, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> циклоалкил, C<sub>2</sub>-C<sub>9</sub> гетероциклоалкил, C<sub>7</sub>-C<sub>12</sub> алкилциклоалкил, C<sub>2</sub>-C<sub>11</sub> гетероалкилциклоалкил, C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> арил, C<sub>1</sub>-C<sub>9</sub> гетероарил, C<sub>7</sub>-C<sub>12</sub> аралкил или C<sub>2</sub>-C<sub>11</sub> гетероаралкил. Предпочтительно, гетероатомы выбирают из S, O и N, в особенности, из N и O.

10 Более того, предпочтительными являются соединения формулы (I), (Ia), (Ib), (Ic) и (Id), где R<sup>1</sup> означает группу формулы -CH<sub>2</sub>-Ar, где Ar означает необязательно замещенную фенильную или нафтильную группу или необязательно замещенную гетероарильную группу, имеющую одно или два кольца, содержащих 5, 6, 7, 8, 9 или 10 кольцевых атомов, или необязательно  
15 замещенную арилгетероциклоалкильную, гетероарилциклоалкильную или гетероарилгетероциклоалкильную группу, содержащую два или три кольца (в особенности, два аннелированных кольца) и от 9 до 20 (в особенности, 9 или 10) кольцевых атомов. Предпочтительно, гетероатомы выбирают из S, O и N, в особенности, из N и O. Кроме того, предпочтительно, число гетероатомов  
20 составляет от 1 до 6 (в особенности, 1, 2, 3 или 4).

Особенно предпочтительно, Ar означает необязательно замещенную фенильную группу или необязательно замещенную гетероарильную группу, имеющую одно кольцо, содержащее 5 или 6 кольцевых атомов. Предпочтительно  
25 данная фенильная или гетероарильная группа замещена одной или несколькими (в особенности, одной) группой(-ами), такой(-ими) как C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> алкил, C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub> алкенил, C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub> алкинил, C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> гетероалкил, C<sub>3</sub>-C<sub>18</sub> циклоалкил, C<sub>2</sub>-C<sub>17</sub> гетероциклоалкил, C<sub>4</sub>-C<sub>20</sub> алкилциклоалкил, C<sub>2</sub>-C<sub>19</sub> гетероалкилциклоалкил, C<sub>6</sub>-C<sub>18</sub> арил, C<sub>1</sub>-C<sub>17</sub> гетероарил, C<sub>7</sub>-C<sub>20</sub> аралкил или C<sub>2</sub>-C<sub>19</sub> гетероаралкил.  
30 Предпочтительно, гетероатомы выбирают из S, O и N, в особенности, из N и O. Особенно предпочтительно фенильная или гетероарильная группа замещена одной или несколькими (в особенности, одной) группой(-ами), такой(-ими) как C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкил, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкенил, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкинил, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> гетероалкил, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> циклоалкил, C<sub>2</sub>-C<sub>9</sub> гетероциклоалкил, C<sub>7</sub>-C<sub>12</sub> алкилциклоалкил, C<sub>2</sub>-C<sub>11</sub>

гетероалкилциклоалкил, C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> арил, C<sub>1</sub>-C<sub>9</sub> гетероарил, C<sub>7</sub>-C<sub>12</sub> аралкил или C<sub>2</sub>-C<sub>11</sub> гетероаралкил. Предпочтительно, гетероатомы выбирают из S, O и N, в особенности, из N и O.

5 Кроме того, предпочтительно, R<sup>1</sup> означает группу формулы -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OCH<sub>3</sub> или 2-аминоциклогексильную группу.

Кроме того, предпочтительно, R<sup>1</sup> означает группу формулы X<sup>1</sup>-L<sup>1</sup>-Y<sup>1</sup> или группу формулы X<sup>1</sup>-L<sup>1</sup>-Y<sup>1</sup>-L<sup>2</sup>-Z<sup>1</sup>, где

10 X<sup>1</sup> означает необязательно замещенную фенильную группу или необязательно замещенную гетероарильную группу, содержащую 5 или 6 кольцевых атомов и 1, 2, 3 или 4 гетероатома, выбранных из O, S и N;

L<sup>1</sup> означает связь или группу формулы -CH<sub>2</sub>-, -C(=O)-, -SO-, -SO<sub>2</sub>-, -NH-C(=O)-, -C(=O)-NH-; -C(=O)-O-, -O-C(=O)-, -NH-C(=O)-O-, -O-C(=O)-NH-, -NH-SO<sub>2</sub>-NH-, -CH<sub>2</sub>-NH-CH<sub>2</sub>-, -NH-SO<sub>2</sub>-, -SO<sub>2</sub>-NH- или -NH-C(=O)-NH- (предпочтительно, L<sup>1</sup> означает связь или группу формулы -CH<sub>2</sub>-, -C(=O)-, -SO<sub>2</sub>- или -NH-C(=O)-NH-);

Y<sup>1</sup> означает необязательно замещенную фенильную группу, необязательно замещенную гетероарильную группу, содержащую 5 или 6 кольцевых атомов и 1, 2, 3 или 4 гетероатома, выбранных из O, S и N, необязательно замещенную C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub> циклоалкильную группу или необязательно замещенную гетероциклоалкильную группу, содержащую 3, 4, 5, 6 или 7 кольцевых атомов и 1, 2, 3 или 4 гетероатома, выбранных из O, S и N (предпочтительно, Y<sup>1</sup> означает необязательно замещенную C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub> циклоалкильную группу или необязательно замещенную гетероциклоалкильную группу, содержащую 3, 4, 5, 6 или 7 кольцевых атомов и 1, 2, 3 или 4 гетероатома, выбранных из O, S и N);

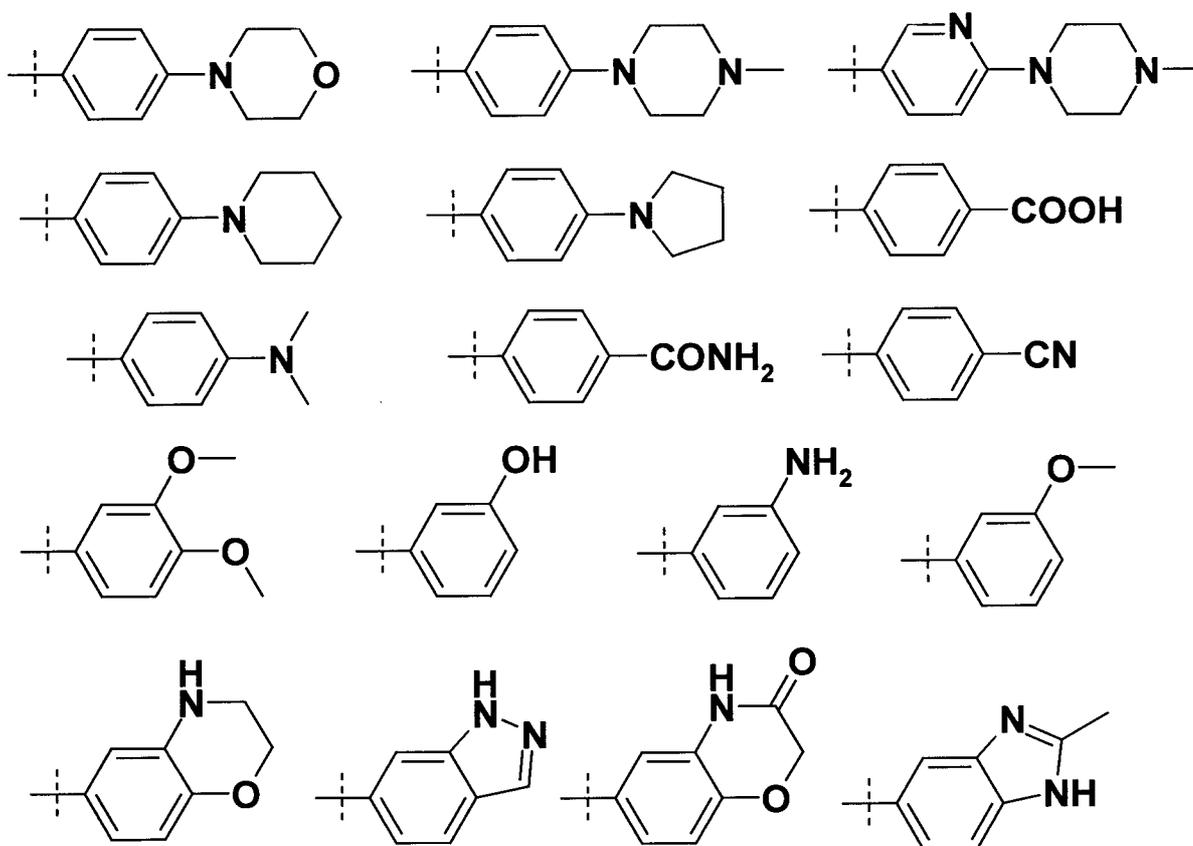
L<sup>2</sup> означает связь или группу формулы -CH<sub>2</sub>-, -C(=O)-, -SO-, -SO<sub>2</sub>-, -NH-C(=O)-, -C(=O)-NH-; -C(=O)-O-, -O-C(=O)-, -NH-C(=O)-O-, -O-C(=O)-NH-, -NH-SO<sub>2</sub>-NH-, -CH<sub>2</sub>-NH-CH<sub>2</sub>-, -NH-SO<sub>2</sub>-, -SO<sub>2</sub>-NH- или -NH-C(=O)-NH- (предпочтительно, L<sup>2</sup> означает связь или группу формулы -CH<sub>2</sub>-, -C(=O)-, -SO<sub>2</sub>- или -NH-C(=O)-NH-; особенно предпочтительно, L<sup>2</sup> означает связь); и

Z<sup>1</sup> означает необязательно замещенную фенильную группу, необязательно замещенную гетероарильную группу, содержащую 5 или 6 кольцевых атомов и 1, 2, 3 или 4 гетероатома, выбранных из O, S и N, необязательно замещенную C<sub>3</sub>-

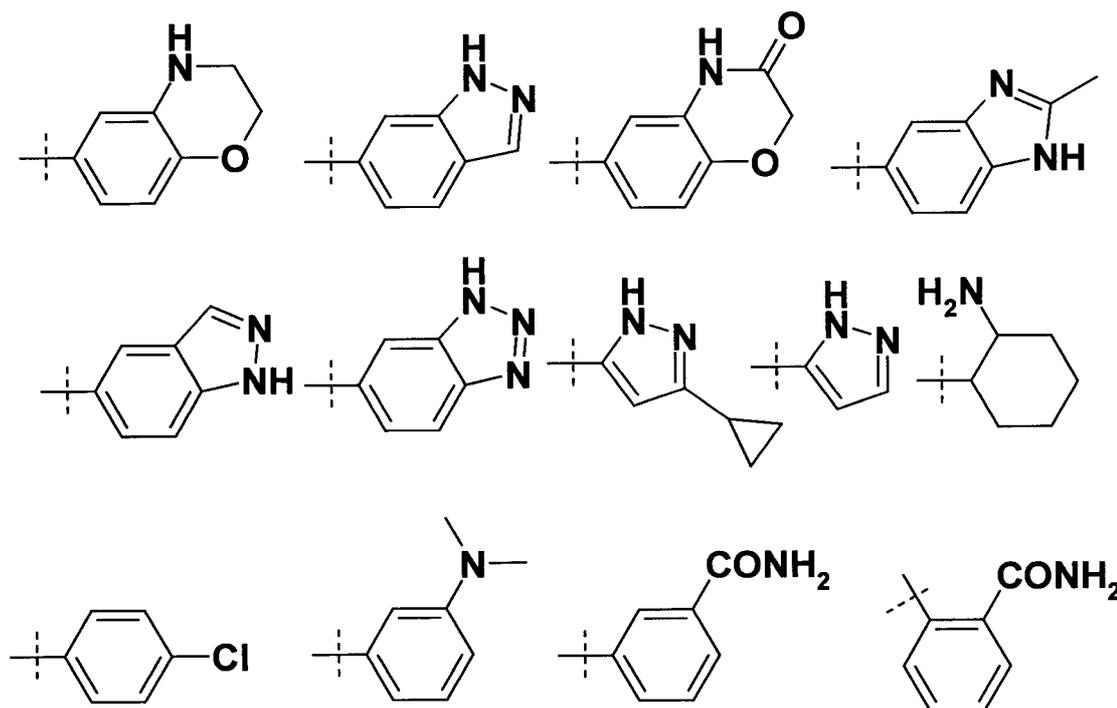
С<sub>7</sub> циклоалкильную группу или необязательно замещенную гетероциклоалкильную группу, содержащую 3, 4, 5, 6 или 7 кольцевых атомов и 1, 2, 3 или 4 гетероатома, выбранных из O, S и N (предпочтительно, Z<sup>1</sup> означает необязательно замещенную С<sub>3</sub>-С<sub>7</sub> циклоалкильную группу или необязательно замещенную гетероциклоалкильную группу, содержащую 3, 4, 5, 6 или 7 кольцевых атомов и 1, 2, 3 или 4 гетероатома, выбранных из O, S и N).

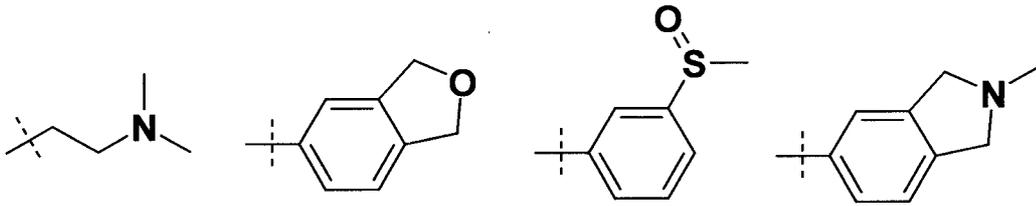
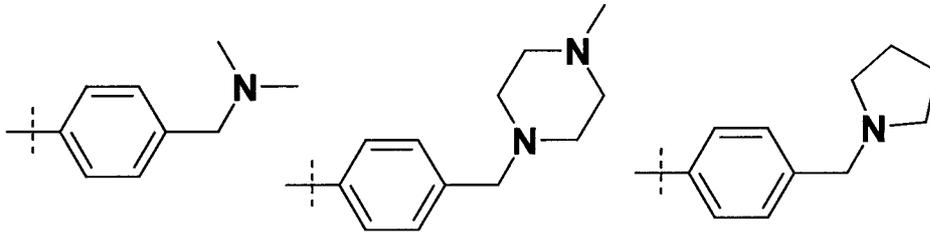
Особенно предпочтительно, R<sup>1</sup> выбирают из следующих групп:

10

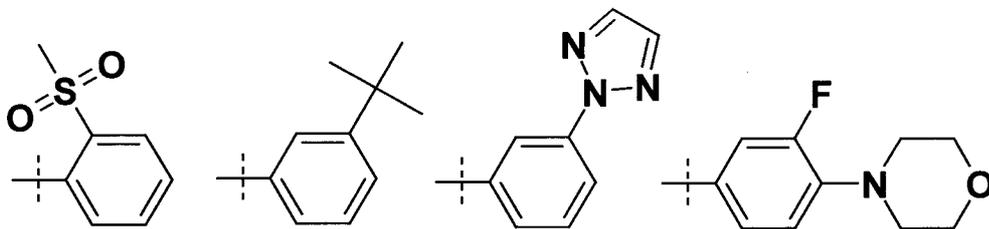
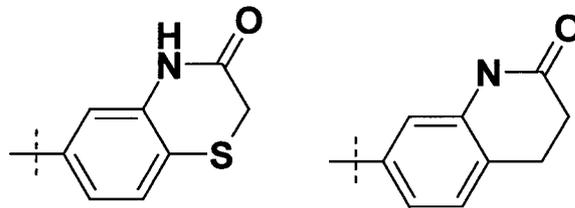
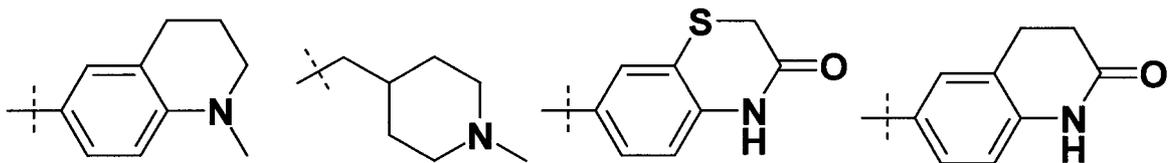


15

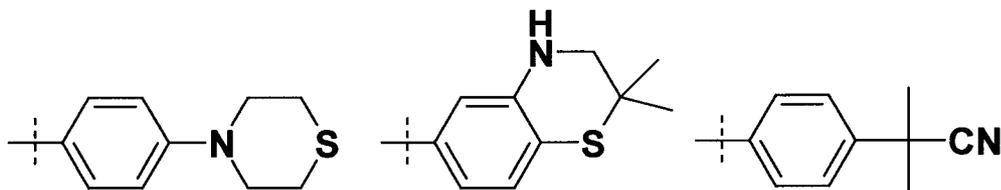


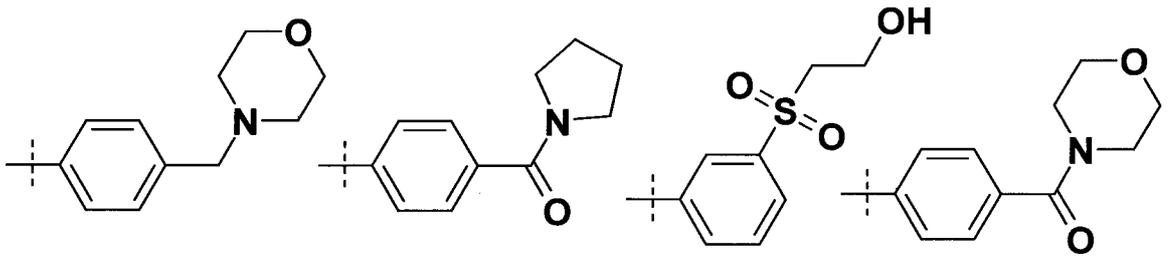
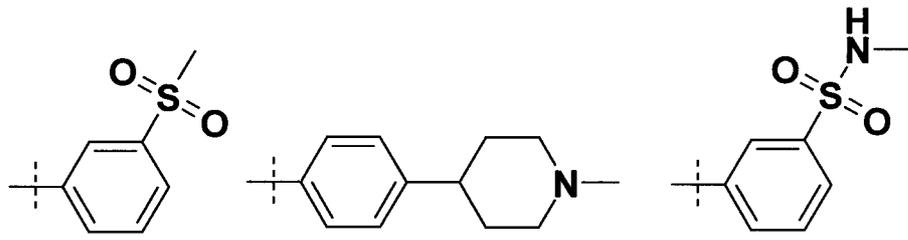


5

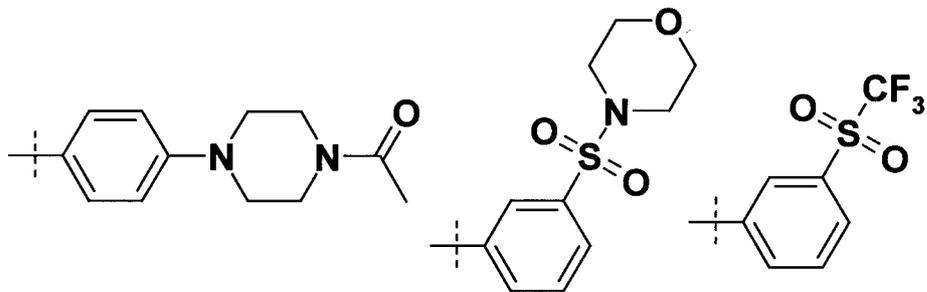
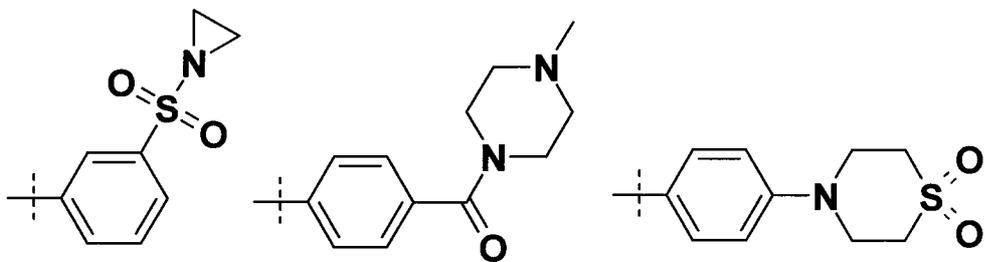
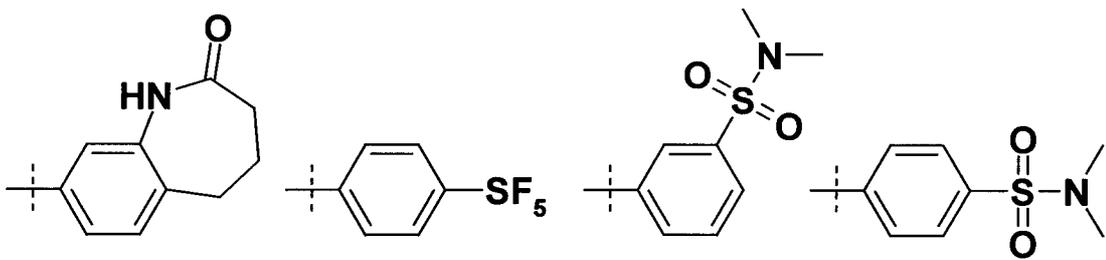


10

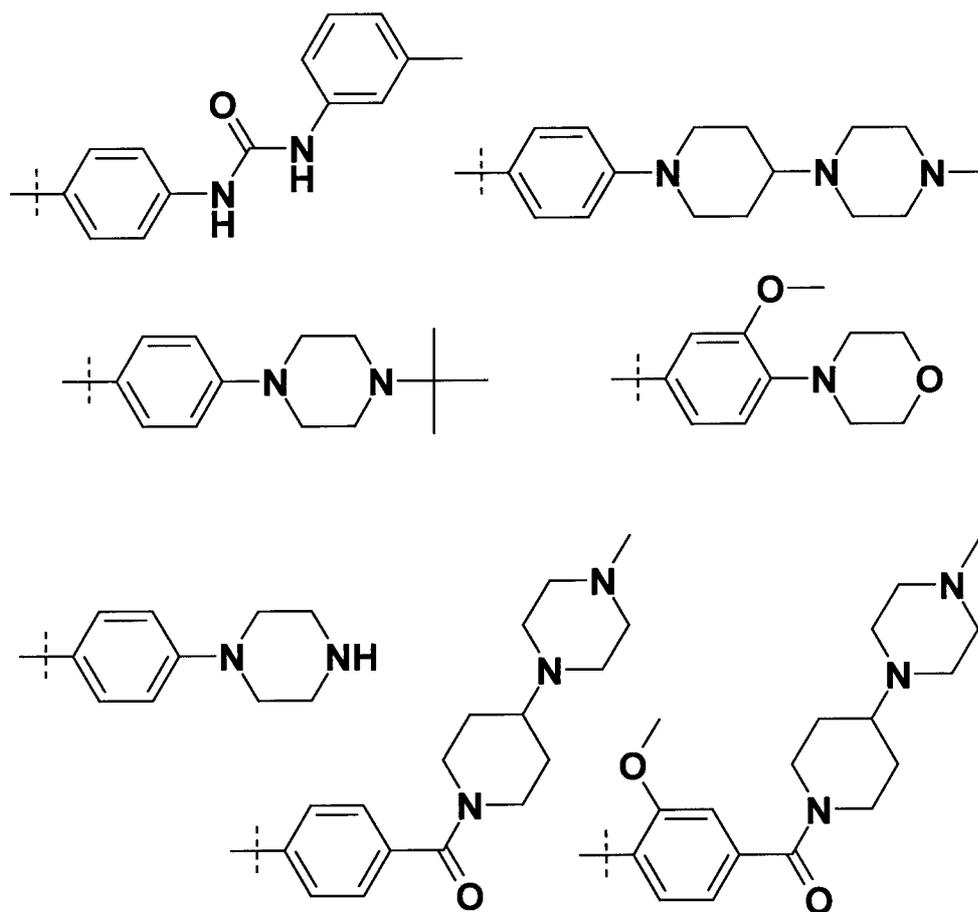




5



10



5

В особенности, предпочтительными являются соединения формулы (I), (Ia), (Ib), (Ic) и/или (Id), где R<sup>1</sup> получен из следующих аминов:

м-толуидин; 3-(трифторметил)анилин; 3,4,5-триметоксианилин; 1H-  
 10 индазол-5-амин; анилин; 1H-индазол-6-амин; 3-хлоранилин; 7-метил-1H-  
 индазол-5-амин; 2-метоксиэтан-1-амин; тиофен-2-илметанамин; 6-метил-1H-  
 индазол-5-амин; 2H-индазол-6-амин; метил 4-аминобензоат; 1H-  
 бензо[d]имидазол-5-амин; 2H-индазол-7-амин; (1-метил-1H-пиррол-2-  
 ил)метанамин; бензо[d][1,3]диоксол-5-амин; пиридин-3-амин; 1-метил-1H-  
 15 индазол-6-амин; 6-метоксипиридин-3-амин; 4-(4-метилпиперазин-1-ил)анилин;  
 4-(4-метил-1,4-дiazепан-1-ил)анилин; пиридин-2-амин; 5-бромпиридин-2-амин;  
 изохинолин-3-амин; 4-метилпиридин-2-амин; 4,6-диметилпиридин-2-амин; 1H-  
 индазол-7-амин; бензол-1,3-диамин; 6-амино-2H-бензо[b][1,4]оксазин-3(4H)-он;  
 1H-бензо[d][1,2,3]триазол-5-амин; 3-аминобензимидаид; 4-(пиперидин-1-  
 20 ил)анилин; N1,N1-диметилбензол-1,4-диамин; 3-аминобензамид; 3,4-

диметоксианилин; 4-морфолиноанилин; 2-метил-1Н-бензо[d]имидазол-6-амин; 4-аминобензойная кислота; 4-аминобензамид; 4-аминобензонитрил; 3-метоксианилин; 4-метоксианилин; 3-аминобензонитрил; бензо[c][1,2,5]тиадиазол-5-амин; 3-аминопиридин-2(1Н)-он; 2-этоксианилин;

5 1Н-пиразол-3-амин; 5-амино-1Н-пиразол-4-карбоксамид; 2-феноксианилин; 3-феноксианилин; 5-амино-1Н-бензо[d]имидазол-2(3Н)-он; 1Н-индол-5-амин; 4-(аминометил)анилин; 1Н-индол-6-амин; N1,N1-диметилбензол-1,3-диамин; 3-фенил-1Н-пиразол-5-амин; N1,N1-диэтилбензол-1,4-диамин; 4-(пирролидин-1-ил)анилин; 4Н-1,2,4-триазол-3,5-диамин; 3-морфолиноанилин; 3-циклобутил-1Н-

10 пиразол-5-амин; 4-(4,5-дигидро-1Н-имидазол-2-ил)анилин; 4-(4-аминофенил)морфолин-3-он; 2,2-диметил-3,4-дигидро-2Н-бензо[b][1,4]тиазин-6-амин; 7-амино-3,4-дигидрохинолин-2(1Н)-он; 6-амино-2Н-бензо[b][1,4]тиазин-3(4Н)-он; 5-(трет-бутил)-1Н-пиразол-3-амин; 3-метил-1Н-пиразол-5-амин; 5-циклопропил-1Н-пиразол-3-амин; 4-(1Н-тетразол-5-ил)анилин; 2,3-

15 дигидробензо[b][1,4]диоксин-6-амин; 4-(1-метилпиперидин-4-ил)анилин; 6-морфолинопиридин-3-амин; 4-(2-метоксиэтокси)анилин; 4-этокси-3-метоксианилин; 1-(4-аминофенил)пирролидин-2-он; 4-тиоморфолиноанилин; 5-аминобензо[d]оксазол-2(3Н)-он; 3,4-дигидро-2Н-бензо[b][1,4]оксазин-6-амин; 7-аминохиназолин-4-ол; 1,1-диоксид 4-(4-аминофенил)тиоморфолина; 2-(4-

20 аминофенил)ацетамид; 3-аминофенол; 3,4-диэтоксианилин; 6-амино-1Н-бензо[d][1,3]оксазин-2,4-дион; 5-амино-2-метоксифенол; 3-метокси-N-метиланилин; N-(3-аминофенил)ацетамид; 1Н-пиразол-4-амин; 4-фтор-3-метоксианилин; 3-фтор-4-метоксианилин; 1-метил-1Н-бензо[d]имидазол-5-амин; 1-(3-аминофенил)этан-1-он; N-(4-аминофенил)ацетамид; 1Н-пирроло[2,3-

25 b]пиридин-6-амин; 3-аминобензолсульфонамид; 4-аминобензолсульфонамид; пиридин-2,6-диамин; 1,2,3-триметил-1Н-индол-5-амин; пиримидин-2,4-диамин; 5-(метилтио)-4Н-1,2,4-триазол-3-амин; 5-циклопропил-4Н-1,2,4-триазол-3-амин; N-(5-амино-2-метоксифенил)ацетамид; 1Н-бензо[d]имидазол-2-амин; 1Н-имидазол-2-амин; 1-(4-аминофенил)этан-1-он; 4Н-бензо[d][1,3]диоксин-6-амин;

30 1,3-дигидроизобензофуран-5-амин; 1-метил-1Н-бензо[d]имидазол-6-амин; 4,5-диметилтиазол-2-амин; 2-метил-4-(4-метилпиперазин-1-ил)анилин; 6-метилпиридин-2-амин; 4-метилтиазол-2-амин; 4,5,6,7-тетрагидробензо[d]тиазол-2-амин; 4-феноксианилин; 2-метил-1,2,3,4-тетрагидробензо[4,5]имидазо[1,2-a]пиазин-8-амин; 4-(пиридин-4-илметил)анилин; 4-аминобензол-1,2-диол; 4-((1-

метилпиперидин-4-ил)окси)анилин; 1-(4-(4-аминофенил)пиперазин-1-ил)этан-1-он; 6-(4-метилпиперазин-1-ил)пиридин-3-амин; N1,N1,2-триметилбензол-1,4-диамин; 4-(4-циклопропилпиперазин-1-ил)анилин; аммиак; 3-фтор-4-морфолиноанилин; 7-аминохиноксалин-2(1H)-он; 3-метил-4-(4-метилпиперазин-1-ил)анилин; 4-(пиперазин-1-ил)анилин; 4-((диметиламино)метил)анилин; 2-фтор-4-морфолиноанилин; 4-(4-этилпиперазин-1-ил)анилин; 8-амино-4,5-дигидро-1H-бензо[b]азепин-2(3H)-он; 5-амино-1,3-диметил-1H-бензо[d]имидазол-2(3H)-он; 4-бензиланилин; 2-метил-4-морфолиноанилин; N1-метил-N1-(1-метилпиперидин-4-ил)бензол-1,4-диамин; 4-(2-морфолиноэтил)анилин; 3-хлор-4-(4-метилпиперазин-1-ил)анилин; 1,2,3,4-тетрагидрохинолин-7-амин; циклогексан-1,2-диамин; пиридин-4-амин; 2-(4-аминофенил)-N-(4-метоксифенетил)ацетамид; 3-(пиперазин-1-ил)анилин; 4-амино-N-(2-(диэтиламино)этил)бензамид; 2-(4-метилпиперазин-1-ил)пиримидин-5-амин; 7-амино-2H-бензо[b][1,4]оксазин-3(4H)-он; 3,4-дигидро-2H-бензо[b][1,4]оксазин-7-амин; 3-(4-метилпиперазин-1-ил)анилин; 3-(2-(пиперазин-1-ил)этоксид)анилин; 6-метил-5,6,7,8-тетрагидро-1,6-нафтиридин-3-амин; (4-аминофенил)(пирролидин-1-ил)метанон; (4-аминофенил)(морфолино)метанон; 4-(пирролидин-1-илметил)анилин; (4-аминофенил)(4-метилпиперазин-1-ил)метанон; N2-(2-(диметиламино)этил)пиримидин-2,5-диамин; 4-(морфолинометил)анилин; 4-((4-метилпиперазин-1-ил)метил)анилин; 4-(4-этилпиперазин-1-ил)-3-фторанилин; 4-(2-(4-бензилпиперидин-1-ил)этил)анилин; 4-((4-бензилпиперидин-1-ил)метил)анилин; п-толуидин; 6-(2-(диметиламино)этоксид)пиридин-3-амин; 2-метил-1H-бензо[d]имидазол-5-амин; N2-(3-(диметиламино)пропил)пиридин-2,5-диамин; N2-(2-(диметиламино)этил)пиридин-2,5-диамин; 6-((1-метилпиперидин-4-ил)окси)пиридин-3-амин; 4-(4-циклопентилпиперазин-1-ил)анилин; 4-(4-изобутилпиперазин-1-ил)анилин; 4-(4-изопропилпиперазин-1-ил)анилин; 4-(4-(циклопропилметил)пиперазин-1-ил)анилин; 4-(4-(трет-бутил)пиперазин-1-ил)анилин; 2-(4-(4-аминофенил)пиперазин-1-ил)уксусная кислота; 2-(4-амино-2-метоксифенокси)уксусная кислота; (4-аминофенил)метанол; 4-(4-(2-(диметиламино)этил)пиперазин-1-ил)анилин; 2-(4-аминофенил)уксусная кислота; 6-амино-2-нафтойная кислота; 3-аминобензойная кислота; 4'-амино-[1,1'-бифенил]-4-карбоновая кислота; 1-(4-аминофенил)-3-(м-толил)мочевина; 2-(4-аминофенокси)уксусная кислота; 2-метилизоиндолин-5-амин; (4-амино-3-

метоксифенил)(4-(4-метилпиперазин-1-ил)пиперидин-1-ил)метанон; 4-амино-N-(2-(диметиламино)этил)-N-метилбензамид; (4-аминофенил)(2-(метоксиметил)пирролидин-1-ил)метанон; (4-аминофенил)(азетидин-1-ил)метанон; 4-амино-N,N-диметилбензамид; (4-аминофенил)(4-метил-1,4-дiazепан-1-ил)метанон; 1-(4-аминобензоил)пиперидин-4-он; (4-аминофенил)(1,4-диокса-8-азаспиро[4.5]декан-8-ил)метанон; (4-аминофенил)(3-(диметиламино)пирролидин-1-ил)метанон; 1-метил-1,2,3,4-тетрагидрохинолин-6-амин; 3-аминофенил-серы пентафторид; 4-фторанилин; 3,4-дифторанилин; N-(4-аминофенил)-2,2,2-трифторацетамид; 3-((6-амино-2H-бензо[b][1,4]оксазин-3-ил)амино)пропан-1-ол; N3-фенетил-2H-бензо[b][1,4]оксазин-3,6-диамин; 3,5-дифторанилин; 3-фтор-4-метиланилин; 3,4,5-трифторанилин; 4-нитроанилин; 3-метокси-4-морфолиноанилин; 3-(метилсульфонил)анилин; 2-(4-аминофенил)-1,1,1,3,3,3-гексафторпропан-2-ол; 4-(дифторметокси)-3-метоксианилин; 3-фтор-4-(трифторметил)анилин; 3-фтор-4-(трифторметокси)анилин; 2,3-диметоксианилин; 2,4-диметоксианилин; 3,5-диметоксианилин; 4-амино-N,N-диметилбензолсульфонамид; 3-амино-N-циклопропилбензолсульфонамид; 4-(2H-1,2,3-триазол-2-ил)анилин; 3-(метилсульфинил)анилин; 3-(2H-1,2,3-триазол-2-ил)анилин; 3-амино-N-метилбензолсульфонамид; 3-(морфолиносульфонил)анилин; 3-((трифторметил)сульфонил)анилин; 2-((3-аминофенил)сульфонил)этан-1-ол; N-(4-аминофенил)-4-фторбензамид; 4-морфолино-3-нитроанилин; 2,4-дифторанилин; 2-аминобензамид; 4-хлоранилин; N1,N1-диметилэтан-1,2-диамин; (1-метилпиперидин-4-ил)метанамин; 1-метил-1,2,3,4-тетрагидрохинолин-7-амин; 2-(4-аминофенил)-2-метилпропаннитрил; 4-аминофенил-серы пентафторид; 3-амино-N,N-диметилбензолсульфонамид; 2-(метилсульфонил)анилин; 4-(4-(4-метилпиперазин-1-ил)пиперидин-1-ил)анилин; 3-((диметиламино)метил)анилин; (4-аминофенил)(4-(4-метилпиперазин-1-ил)пиперидин-1-ил)метанон.

30 Более того, предпочтительно, R<sup>1</sup> может быть получен из следующих аминов:

формамид; 2-аминоэтан-1-ол; проп-2-ин-1-амин; N1-метилэтан-1,2-диамин; 2-аминоацетонитрил; 3-аминопропан-1-ол; бутан-1-амин; циклопропанамин; пропан-2-амин; 3-аминопропаннитрил; 4-аминобутан-1-ол; циклобутанамин; 2-аминопропан-1-ол; ацетамид; циклопропилметанамин; 5-аминопентан-1-ол; 2-

аминокетид; изоксазол-3-амин; тиазол-2-амин; 3-аминопропан-1,2-диол; циклопентанамин; пиперидин-4-амин; пиперидин-3-амин; пиримидин-2-амин; 2-аминоциклопентанол; 3-аминопропанамид; тетрагидро-2Н-пиран-4-амин; 2-метилпропан-2-амин; о-толуидин; 2,2,2-трифторэтан-1-амин; фенилметанамин;

5 пиперидин-4-илметанамин; 2-аминоциклогексанол; 4-аминобутанамид; пиперидин-3-илметанамин; 1-метил-1Н-пиразол-4-амин; 2-метоксианилин; 2-хлоранилин; 2-аминопропанамид; 4-метилтиофен-2-амин; 2-фенилэтан-1-амин; 1Н-пиразол-5-амин; 5-метилизоксазол-3-амин; 2-морфолиноэтан-1-амин; 1-

10 (аминометил)-N-метилциклопропанамин; 1-метил-1Н-пиррол-3-амин; 5-метилтиазол-2-амин; 5-метилтиофен-2-амин; 4-аминофенол; 3-фторанилин; 3,5-диметилизоксазол-4-амин; 3-морфолинопропан-1-амин; 2-аминобутанамид; 4-йоданилин; (3-аминофенил)метанол; 2-аминотиазол-4-карбальдегид; 3-броманилин; 2,6-диметиланилин; 4-этиланилин; 3-амино-2-метилфенол; 4-(метилтио)анилин; 3-этиланилин; 1-фенилэтан-1-амин; 2-(4-аминофенил)этан-1-

15 ол; 5-аминоникотинальдегид; 6-аминоникотинальдегид; 4-аминобензальдегид; 3-аминобензальдегид; индолин-6-амин; 4-амино-2-метоксифенол; 2-аминопиримидин-5-карбальдегид; 5-аминопиразин-2-карбальдегид; 5-аминопиколинальдегид; 3-метокси-4-метиланилин; 6-аминопиразин-2-карбальдегид; N1,6-диметилбензол-1,3-диамин; 5-метил-1Н-пиразол-3-амин; 4-

20 этоксианилин; 2,3-дигидробензофуран-5-амин; 3-этоксианилин; бензо[d]тиазол-5-амин; бензо[d]тиазол-6-амин; пиперидин-3-карбоксамид; имидазо[1,2-а]пиридин-6-амин; пиперидин-4-карбоксамид; бензо[d]тиазол-7-амин; бензо[d]изоксазол-5-амин; 4-метокси-3-метиланилин; бензо[d]тиазол-2-амин; 4-виниланилин; бензо[c][1,2,5]тиадиазол-4-амин; 1-

25 аминоклопропанкарбоксамид; 2-фенилциклопропанамин; 2-аминоклопентанкарбоксамид; 3-виниланилин; (5-амино-2-метоксифенил)метанол; 2-(4-аминофеноксид)этан-1-ол; 1,2,3,4-тетрагидроизохинолин-6-амин; (4-амино-2-метоксифенил)метанол; 2-амино-4-метилпиримидин-5-карбальдегид; 6-амино-4-метилникотинальдегид; 2-

30 изопропоксианилин; 6-амино-2-метилникотинальдегид; 4-амино-2-метилфенол; 5-амино-2-метилфенол; 3-хлор-4-метоксианилин; 3,5-диметиланилин; N-(3-аминофенил)формаид; 2-(3-аминофеноксид)этан-1-ол; N-(6-аминопиридин-2-ил)формаид; 4-амино-2-фторфенол; 5-амино-2-гидроксибензонитрил; 4-амино-3-фторфенол; N-(4-аминофенил)формаид; 2,4-диметиланилин; 3,4-

диметиланилин; 2-фтор-5-метиланилин; 2,5-диметиланилин; хиноксалин-6-амин; хинолин-6-амин; 2-амино-3-метилбутанамид; хиноксалин-5-амин; нафталин-1-амин; нафталин-2-амин; 4-фтор-3-метиланилин; хинолин-5-амин; хинолин-8-амин; 2,6-диметилпиримидин-4-амин; 1-(4-аминофенил)этан-1-ол; 2,3,4,5-тетрагидробензо[b][1,4]оксазепин-7-амин; 3-метокси-4-(метоксиметил)анилин; 2-фтор-4-метоксианилин; 5-амино-6-метоксипиразин-2-карбальдегид; 2-амино-4-метоксипиримидин-5-карбальдегид; 6-амино-5-метоксиникотинальдегид; 3-хлор-4-фторанилин; 4Н-бензо[b][1,4]оксазин-6-амин; 4-изопропиланилин; 4-амино-2,5-диметилфенол; 4-амино-2-хлорфенол; 4Н-бензо[b][1,4]оксазин-7-амин; 3-(2-метоксиэтокси)анилин; 4-метокси-2-метиланилин; 5-метокси-2-метиланилин; 3-(2-(метиламино)этокси)анилин; 3-изопропиланилин; 4-амино-2,3-диметилфенол; N-(5-амино-2-метилфенил)формаид; 2-амино-4-метилпентанамид; 4-хлор-3-метиланилин; 3-аминоциклопентанкарбоксамид; 2-хлор-5-фторпиримидин-4-амин; 3,4-дигидрохинолин-6-амин; 2-амино-4-метилпентантиоамид; 2-(изопентилокси)анилин; 6-амино-5-метилникотинальдегид; 5-амино-6-метилпиразин-2-карбальдегид; 2-амино-6-метилпиримидин-4-карбальдегид; 2-метил-2Н-индазол-6-амин; 5-амино-6-метилпиколинальдегид; 5-амино-4-метилпиколинальдегид; 4-изопропоксианилин; 1-метил-1Н-индазол-5-амин; 3,5-дихлоранилин; 3,4-дихлоранилин; [1,1'-бифенил]-2-амин; 2,6-диметоксипиримидин-3-амин; 4-метокси-3,5-диметиланилин; 2-метил-2Н-индазол-5-амин; 3-(этил(гидрокси)амино)анилин; 3-изопропоксианилин; N1-изопропилбензол-1,3-диамин; 4-амино-5-хлор-2-метилфенол; 1-метил-1Н-индол-4-амин; 1Н-индазол-4-амин; 1-метил-1Н-индазол-4-амин; 2-метил-2Н-индазол-4-амин; 1Н-индол-4-амин; 1Н-бензо[d]имидазол-6-амин; 1Н-бензо[d][1,2,3]триазол-6-амин; 2-метилбензо[d]тиазол-5-амин; 4-(метилсульфинил)анилин; 1-метил-1Н-индол-5-амин; 3-(2-аминофенил)пропанамид; 2-((2-аминоциклогексил)амино)уксусная кислота; (2,3,6-трифторфенил)метанамин; 5-бром-2-хлорпиримидин-4-амин; 1-метил-1Н-индазол-7-амин; 1-метил-1Н-бензо[d]имидазол-4-амин; 2-метил-2Н-индазол-7-амин; 2-метилбензо[d]оксазол-7-амин; 4-метил-3,4-дигидро-2Н-бензо[b][1,4]оксазин-7-амин; 4-метил-3,4-дигидро-2Н-бензо[b][1,4]оксазин-6-амин; 4-(4Н-1,2,4-триазол-4-ил)анилин; 4-(1Н-имидазол-1-ил)анилин; 4-(1Н-пиразол-1-ил)анилин; 5-аминоиндолин-2-он; 6-аминоиндолин-2-он; 3-метокси-4-(2-метоксиэтокси)анилин; 3-(4-амино-2-метоксифеноксипропан-1-ол; 2-((4-

аминофенил)(метил)амино)этан-1-ол; 2-метил-1,2,3,4-тетрагидроизохинолин-6-амин; 4-амино-N-метилбензамид; 3-амино-N-метилбензамид; 1-(пиперидин-4-ил)-1H-пиразол-4-амин; 4-(оксазол-4-ил)анилин; 4-(пирролидин-3-ил)анилин; 2-(трифторметокси)анилин; 3-хлор-4-метокси-5-метиланилин; 2-((2-аминофенил)имино)уксусная кислота; 3-(оксазол-5-ил)анилин; (5-аминобензофуран-2-ил)метанол; 3,4,5-триметиланилин; N-(5-амино-2-фторфенил)формаид; метил 4-амино-1-метил-1H-пиррол-2-карбоксилат; метил 3-аминобензоат; N-(3-амино-4-этоксифенил)формаид; 2-((3-аминофенил)амино)пропан-1-ол; 2-метил-2,3-дигидробензо[b][1,4]диоксин-6-амин; 4-(1H-1,2,4-триазол-1-ил)анилин; 3-(1H-пиразол-1-ил)анилин; 2-амино-2-фенилацетамид; 4-(тиазол-4-ил)анилин; 1,2-диметил-1H-индол-4-амин; 4-(оксазол-5-ил)анилин; 1-этил-1H-индол-4-амин; 3-(тиазол-2-ил)анилин; 4-(1,2,3-тиадиазол-4-ил)анилин; 3-(изоксазол-3-ил)анилин; 4-(изоксазол-3-ил)анилин; 4-(изоксазол-5-ил)анилин; 4-(тиофен-2-ил)анилин; 3-(1H-тетразол-1-ил)анилин; 4-(1H-тетразол-1-ил)анилин; 3-(1H-имидазол-1-ил)анилин; 5-аминобензофуран-2(3H)-он; 8-метилхинолин-4-амин; 2-амино-2-(пиридин-3-ил)ацетамид; 1-фенил-1H-пиразол-4-амин; 1-фенил-1H-пиррол-3-амин; 3-(2H-тетразол-2-ил)анилин; 3-(1H-1,2,4-триазол-1-ил)анилин; 3-(1H-1,2,3-триазол-1-ил)анилин; 4-(1H-1,2,3-триазол-1-ил)анилин; 3-(пирролидин-1-ил)анилин; 3-(1H-пиррол-1-ил)анилин; 4-(1H-пиррол-1-ил)анилин; 4-(1,3,4-оксадиазол-2-ил)анилин; 4-(тиазол-2-ил)анилин; 3-(тиазол-4-ил)анилин; 3-(оксазол-4-ил)анилин; 3-(тиазол-5-ил)анилин; 4-(тиазол-5-ил)анилин; 6-фторнафталин-2-амин; метил 2-((2-аминоциклогексил)амино)ацетат; 4-изобутоксанилин; 2-метилхинолин-6-амин; 2-метилхинолин-8-амин; 3-метилциннолин-5-амин; 2-(4-аминофенил)пропан-2-ол; 2-((4-аминофенил)(этил)амино)этан-1-ол; 4-(2-(диметиламино)этокси)анилин; 4-(тетрагидро-2H-пиран-4-ил)анилин; 3-метокси-4-((2-метоксиэтокси)метил)анилин; N1-(2-метоксиэтил)-N1-метилбензол-1,4-диамин; 4-изопропокси-3-метоксианилин; 4-амино-2-метоксибензойная кислота; 4-(пиперидин-4-ил)анилин; 4-амино-N,2-диметилбензамид; 6-(тетрагидро-2H-пиран-4-ил)пиридин-3-амин; 6-(пиперидин-4-ил)пиридин-3-амин; 4-(3-(диметиламино)пропил)анилин; 4-(пиридин-3-ил)анилин; 4-(пиперидин-3-ил)анилин; 2-этил-1,2,3,4-тетрагидроизохинолин-6-амин; 3,5-дихлор-4-метоксианилин; 4-амино-2-хлор-6-метилфенол; 3-(4-аминофеноксипропан-1,2-диол; 3-(трет-бутил)анилин; 2-(5-амино-1H-индазол-1-ил)этан-1-ол; 2-(6-амино-

1Н-индазол-1-ил)этан-1-ол; 4-хлор-2,5-диметоксианилин; этил 3-аминобензоат; 4-(трет-бутил)анилин; 4-хлор-3,5-диметиланилин; N-(3-амино-5-хлорфенил)формаид; 4-(трифторметил)анилин; [1,1'-бифенил]-3-амин; 6-амино-2Н-хромен-2-он; 7-амино-2Н-хромен-2-он; метил 2-(4-аминофенил)ацетат; метил 2-(3-аминофенил)ацетат; метил 5-амино-2-гидроксibenзоат; метил 4-амино-2-гидроксibenзоат; 5-амино-2-метоксибензойная кислота; 3-(2-(диметиламино)этокси)анилин; 4-метил-4Н-бензо[b][1,4]оксазин-7-амин; 3-амино-4-изопропилфенол; 5-метил-3-фенилизоксазол-4-амин; 3-(пиримидин-2-ил)анилин; 3-(пиримидин-5-ил)анилин; 2,3-дигидро-1Н-пирроло[1,2-а]индол-8-амин; 4-(пиримидин-2-ил)анилин; 3-(пиридин-3-ил)анилин; 4-(пиридин-2-ил)анилин; 6-метоксинафталин-2-амин; 2-метил-2Н-индол-4-амин; 4-хлорнафталин-1-амин; 3-(пиридин-4-ил)анилин; 4-амино-2-метоксибензамид; 3-(5-метил-1Н-тетразол-1-ил)анилин; 2-фтор-4-(1Н-пиразол-1-ил)анилин; 2-фтор-4-(тиазол-4-ил)анилин; 4-(пиримидин-5-ил)анилин; 3-(пиразин-2-ил)анилин; 4-(пиразин-2-ил)анилин; 3-(тетрагидро-2Н-пиран-4-ил)анилин; 3-(пиридазин-4-ил)анилин; 4-(пиридазин-4-ил)анилин; 4-(пиридин-4-ил)анилин; 3-(пиридин-2-ил)анилин; [1,1'-бифенил]-4-амин; 7-хлор-1Н-индазол-6-амин; 6-бромнафталин-2-амин; 3-(1-метил-1Н-тетразол-5-ил)анилин; 4-(4-метил-4Н-1,2,4-триазол-3-ил)анилин; 4-(1-метил-1Н-имидазол-2-ил)анилин; 3-(1-метил-1Н-имидазол-2-ил)анилин; 4-(2-метил-1Н-имидазол-1-ил)анилин; 3-(2-метил-1Н-имидазол-1-ил)анилин; 2-(4-аминофенил)-2-метилпропан-1-ол; 1-(4-аминофенил)азетидин-3-ол; 2-аминохиназолин-6-карбальдегид; 1-(4-аминофенил)-2-метилпропан-2-ол; 2-(4-аминофенокси)-N-метилацетамид; 4-(1,4-оксазепан-4-ил)анилин; 3-метокси-4-(пирролидин-1-ил)анилин; 4-амино-N-пропилбензамид; 3-аминохинолин-6-карбальдегид; 4-((тетрагидрофуран-2-ил)метокси)анилин; 4-((тетрагидро-2Н-пиран-4-ил)окси)анилин; 4-(пиридин-4-илокси)анилин; 4-(3-фторазетидин-1-ил)анилин; 4-амино-N-(2-гидроксиэтил)бензамид; 1-(4-аминофенил)циклобутанол; 2-аминохинолин-6-карбальдегид; 4-(2-метоксипропан-2-ил)анилин; 2-((4-амино-2-метоксифенил)(метил)амино)этан-1-ол; 4-метокси-3-(пирролидин-1-ил)анилин; 4-(3-метилазетидин-1-ил)анилин; 2,3-диметил-2Н-индазол-6-амин; 4-(трифторметокси)анилин; 3-метил-1Н-индазол-6-амин; 1-(2-морфолиноэтил)-1Н-пиразол-4-амин; 3-(трифторметокси)анилин; 4-амино-N-этоксibenзамид; 3-амино-N-пропилбензамид; 4-((2-метил-1Н-имидазол-1-ил)метил)анилин; 3-(5-амино-1Н-индазол-1-ил)пропан-1-ол; 4-

5  
 10  
 15  
 20  
 25  
 30

амино-2,6-дихлорфенол; 3-(6-амино-1Н-индазол-1-ил)пропан-1-ол; 2-((3-аминофенил)имино)ацетамид; метил 5-амино-2-метоксибензоат; этил 2-((2-аминофенил)имино)ацетат; 4-((трифторметил)тио)анилин; 5-амино-2-гидроксибензойная кислота; 4-амино-2-гидроксибензойная кислота; 2-((3-аминофенил)имино)уксусная кислота; 2,2'-((3-аминофенил)азанедиил)бис(этан-1-ол); 2,2-дифторбензо[d][1,3]диоксол-5-амин; 2-((метиламино)метилден)-2,3-дигидробензофуран-5-амин; 3-аминофенил этилкарбамат; 1-(4-аминофенил)-3-этилмочевина; 1-(3-аминофенил)-3-этилмочевина; 6-амино-2-метил-2Н-бензо[b][1,4]оксазин-3(4Н)-он; 4-метил-[1,1'-бифенил]-3-амин; 2-метил-1Н-индол-4-амин; 3-(4-аминопиперидин-1-ил)-3-оксопропаннитрил; 4-(пиридин-3-илокси)анилин; 1-(3-аминофенил)пирролидин-2-он; 4-(5,6-дигидро-4Н-1,3-оксазин-2-ил)анилин; 4-(3,6-дигидро-2Н-пиран-4-ил)анилин; 6-аминохинолин-2-карбонитрил; 2-хлор-5-циклопропилпиримидин-4-амин; 3-(3-аминопиперидин-1-ил)-3-оксопропаннитрил; 3-((тетрагидро-2Н-пиран-4-ил)окси)анилин; 3-(3,6-дигидро-2Н-пиран-4-ил)анилин; дибензо[b,d]фуран-2-амин; 3-метокси-4-(оксазол-5-ил)анилин; 4-метокси-3-(2Н-1,2,3-триазол-2-ил)анилин; 1-(4-аминофенил)пирролидин-3-ол; 1-(4-аминофенокси)-2-метилпропан-2-ол; 4-((тетрагидро-2Н-пиран-4-ил)метокси)анилин; (4-(4-аминофенил)морфолин-3-ил)метанол; 4-(2Н-тетразол-5-ил)анилин; 2-метокси-N1-(2-метоксиэтил)-N1-метилбензол-1,4-диамин; 4-(1-метокси-2-метилпропан-2-ил)анилин; 5-амино-1-метил-6-оксо-1,6-дигидропиридин-3-карбальдегид; 2-((4-амино-2-этоксифенил)(метил)амино)этан-1-ол; 4-(2-(пирролидин-1-ил)этокси)анилин; 4-(1-метил-1Н-пиразол-4-ил)анилин; 4-(1Н-имидазол-4-ил)анилин; 4-(метилсульфонил)анилин; 2-метокси-[1,1'-бифенил]-4-амин; 4-(1-метилпирролидин-3-ил)анилин; 5-амино-2-метилизоиндолин-1-он; 6-амино-2-метилизоиндолин-1-он; 3-(2-(пирролидин-1-ил)этокси)анилин; 2-(2-метоксиэтил)-1,2,3,4-тетрагидроизохинолин-6-амин; 4-метокси-3-(трифторметил)анилин; 2-((3-аминофенил)имино)-N-метилацетамид; 3-(1Н-тетразол-5-ил)анилин; N-(4-аминофенил)-N-метилацетамид; 3-(бензилокси)анилин; 3-(1Н-пиразол-3-ил)анилин; 2-амино-7-оксабицикло[4.2.0]окта-1,3,5-триен-8-карбоновая кислота; (5-амино-1Н-индол-2-ил)метанол; 6-метокси-[1,1'-бифенил]-3-амин; 4-метокси-[1,1'-бифенил]-3-амин; этил (4-амино-2-гидроксифенил)карбамат; 3-фтор-4-(тиазол-4-ил)анилин; 3-фтор-4-(1Н-пиразол-1-ил)анилин; 4-амино-N-(3-гидроксипропил)бензамид; 3-

фтор-4-(1H-имидазол-1-ил)анилин; 1-(4-аминофенил)пиридин-2(1H)-он; 1-(4-аминофенил)-1-метилмочевина; бутил 4-аминобензоат; 4-(5-метил-1,2,4-оксадиазол-3-ил)анилин; 3-(2-метилтиазол-4-ил)анилин; 4-(3-метил-1H-пиразол-1-ил)анилин; 3-метил-5-(2H-1,2,3-триазол-2-ил)анилин; 4-метил-3-(2H-1,2,3-триазол-2-ил)анилин; 2-амино-2-(3-гидроксифенил)ацетамид; 2-амино-2-(3-фторфенил)ацетамид; 3-фтор-5-(2H-1,2,3-триазол-2-ил)анилин; 4-фтор-3-(2H-1,2,3-триазол-2-ил)анилин; 4-амино-2-(2H-1,2,3-триазол-2-ил)бензонитрил; 3-фтор-4-(2H-1,2,3-триазол-2-ил)анилин; 3-(2H-тетразол-5-ил)анилин; 3-хлор-1H-индазол-5-амин; 4-(метилтио)-7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-2-амин; 4-(2-метоксиметил)пирролидин-1-ил)анилин; 2'-метокси-[1,1'-бифенил]-3-амин; 4-(1-метил-1H-пиразол-3-ил)анилин; 3-(1-метил-1H-пиразол-3-ил)анилин; 3-(1-метил-1H-пиразол-4-ил)анилин; 4-(5-метил-1,3,4-тиадиазол-2-ил)анилин; 3-(5-метил-1,2,4-оксадиазол-3-ил)анилин; 3-(4-метил-2H-1,2,3-триазол-2-ил)анилин; 3-(4-метил-1H-1,2,3-триазол-1-ил)анилин; 3-(5-метилизоксазол-3-ил)анилин; 3-метил-5-(2H-тетразол-2-ил)анилин; 3-метил-4-(2H-1,2,3-триазол-2-ил)анилин; 3-метил-4-(1H-пиразол-1-ил)анилин; 3-(5-метилфуран-2-ил)анилин; 2-амино-2-(м-толил)ацетамид; 2-амино-2-(п-толил)ацетамид; 3-амино-1H-индазол-6-карбальдегид; 3-этокси-4-морфолиноанилин; 3-амино-1H-индазол-5-карбальдегид; 1-(4-аминофенил)пиперидин-3-ол; 3-метокси-4-((тетрагидро-2H-пиран-4-ил)окси)анилин; 2-(4-амино-2-метоксифенокси)-N-метилацетамид; 2-амино-1H-бензо[d]имидазол-6-карбальдегид; 2-(4-аминофенокси)-N-(2-гидроксиэтил)ацетамид; 5-амино-2-морфолинобензонитрил; 1-(4-аминофенил)пиперидин-4-ол; (1-(4-аминофенил)пирролидин-3-ил)метанол; 4-(4-фторпиперидин-1-ил)анилин; 3-(метоксиметил)-4-морфолиноанилин; 3-метокси-4-((тетрагидрофуран-2-ил)метокси)анилин; 4-(3-(диметиламино)пропокси)-3-метоксианилин; 1-(4-амино-2-метоксифенил)азетидин-3-ол; 4-амино-N-(2-гидроксиэтил)-2-метоксибензамид; 1-(4-амино-2-метоксифенил)-2-метилпропан-2-ол; 3-(4-аминофенокси)-2,2-диметилпропан-1-ол; 4-(2-метилморфолино)анилин; 6-(2-метилморфолино)пиридин-3-амин; 3-метил-4-(пиперидин-4-ил)анилин; 4-(2-морфолиноэтокси)анилин; 3-(2-морфолиноэтокси)анилин; 3-метил-4-морфолиноанилин; (1-(4-аминофенетил)пирролидин-2-ил)метанол; 4-(2-метилпиридин-4-ил)анилин; 6-(1-метилпиперидин-4-ил)пиридин-3-амин; 2-(2-метилморфолино)пиримидин-5-амин; 3-метил-4-(тетрагидро-2H-пиран-4-ил)анилин; 4-амино-N-

циклопропилбензамид; 4-(1-метилпиперидин-3-ил)анилин; 4-(1-этилпирролидин-3-ил)анилин; 5-метил-6-морфолинопиридин-3-амин; 4-метил-3-(трифторметил)анилин; 5-аминобензофуран-2-карбоновая кислота; 2-((диметиламино)метил)бензофуран-5-амин; этил 2-((3-аминофенил)имино)ацетат; 3-фтор-5-(трифторметил)анилин; 4-амино-2-(трифторметил)фенол; 5-амино-2,3-дигидробензофуран-2-карбоновая кислота; N-(4-аминофенил)метансульфонамид; 7-амино-4-метил-2H-бензо[b][1,4]оксазин-3(4H)-он; 6-амино-4-метил-2H-бензо[b][1,4]оксазин-3(4H)-он; 3-метил-5-(трифторметил)анилин; 6-амино-1-метил-3,4-дигидрохинолин-2(1H)-он; метил (4-аминофенил)(метил)карбамат; N-(4-аминофенил)-2-гидрокси-N-метилацетамид; 6-аминохинолин-2(1H)-он; 6-амино-1-метилхинолин-2(1H)-он; 4-(этилсульфонил)анилин; N-(4-аминофенил)-N-метилпропионамид; 4-(3,5-диметил-1H-пиразол-1-ил)анилин; 2-амино-2-(3-хлорфенил)ацетамид; 5-фтор-4-(пиперазин-1-ил)пиримидин-2-амин; 4-(2-(пиперидин-1-ил)этоксид)анилин; 3-хлор-5-(2H-1,2,3-триазол-2-ил)анилин; 4-хлор-3-(2H-1,2,3-триазол-2-ил)анилин; (1-(4-аминофенил)-1H-1,2,3-триазол-4-ил)метанол; 3-(5-фторпиримидин-2-ил)анилин; 4'-фтор-[1,1'-бифенил]-3-амин; 3'-фтор-[1,1'-бифенил]-3-амин; 4-бром-3-(2H-1,2,3-триазол-2-ил)анилин; дибензо[b,d]фуран-3-амин; 3-бром-5-(2H-1,2,3-триазол-2-ил)анилин; 3-метокси-5-(2H-1,2,3-триазол-2-ил)анилин; 3-метокси-5-(1H-тетразол-1-ил)анилин; 2-амино-2-(4-метоксифенил)ацетамид; 1-(4-аминофенил)-3-метилазетидин-3-ол; (4-(4-аминофенил)морфолин-2-ил)метанол; 1-(4-амино-2-метоксифенил)пирролидин-3-ол; 2-(5-амино-2-морфолинофеноксид)этан-1-ол; (1-(4-аминофенил)пиперидин-4-ил)метанол; 4-(4-аминофеноксид)циклогексанол; 4-(4-аминофенил)пиперазин-2-он; 4-(3,3-дифторазетидин-1-ил)анилин; 2-(1-(4-аминофенил)пирролидин-3-ил)этан-1-ол; 4-амино-N-(оксетан-3-ил)бензамид; 1-(4-аминофенил)-2,2,2-трифторэтан-1-ол; 1-(4-амино-2-метоксифеноксид)-2-метилпропан-2-ол; 3-метокси-4-((тетрагидро-2H-пиран-4-ил)метокси)анилин; 4-амино-N-(2-гидроксиэтил)-N-метилбензамид; 2-(4-аминофеноксид)-N,N-диметилацетамид; 4-(3-фтор-3-метилазетидин-1-ил)анилин; 3-метил-4-(2-метилморфолино)анилин; 4-(1-этилпиперидин-4-ил)анилин; 3-фтор-4-(2-метилморфолино)анилин; 3-метил-4-(1-метилпиперидин-4-ил)анилин; 4-(2,3-дигидроимидазо[2,1-b]тиазол-6-ил)анилин; 3-фтор-4-(1-метилпиперидин-4-ил)анилин; 5-метил-6-(2-метилморфолино)пиридин-3-амин; 3-фтор-4-(пиперазин-1-илметил)анилин; 4'-метокси-[1,1'-бифенил]-4-амин; 1-(6-

5 амино-3,4-дигидроизохинолин-2(1H)-ил)этан-1-он; 4-амино-N,N-  
 диэтилбензамид; 5-(4-этилпиперазин-1-ил)пиридин-2-амин; 2-  
 (изопропилсульфонил)анилин; 3-метил-4-(1,2,3,6-тетрагидропиридин-4-  
 ил)анилин; 2-метил-5-(2-морфолиноэтокси)анилин; метил 5-аминобензофуран-2-  
 карбоксилат; 5-амино-N-метил-2,3-дигидробензофуран-2-карбоксамид; метил 5-  
 10 амино-2,3-дигидробензофуран-2-карбоксилат; 3-метокси-5-  
 (трифторметил)анилин; 5-амино-N-метилбензофуран-2-карбоксамид; 2-((3-  
 аминофенил)имино)-N-(2-гидроксиэтил)ацетамид; 4-хлор-3-  
 (трифторметил)анилин; 3-нитроанилин; метил 4-амино-2,3-дигидробензофуран-  
 7-карбоксилат; 6-амино-N-метил-1H-индол-1-карбоксамид; этил 2-амино-7-  
 оксабицикло[4.2.0]окта-1(6),2,4-триен-8-карбоксилат; 3-аминофенил  
 изопропилкарбамат; 3-хлор-4-морфолиноанилин; 2-(6-амино-1H-индазол-1-  
 ил)ацетамид; 1-(4-аминофенил)азетидин-2-карбоксамид; 6-амино-2-нафтамид; 3-  
 15 амино-5-(2H-1,2,3-триазол-2-ил)бензонитрил; 3-амино-5-(1H-1,2,3-триазол-1-  
 ил)бензонитрил; 4-амино-N-циклобутилбензамид; 3-(4-метоксипиримидин-2-  
 ил)анилин; 4-(6-метоксипиридин-3-ил)анилин; 3-(6-метоксипиридин-2-  
 ил)анилин; 3-(6-метоксипиридин-3-ил)анилин; 3'-метокси-[1,1'-бифенил]-3-амин;  
 4'-метокси-[1,1'-бифенил]-3-амин; N-(4-аминофенил)-3-гидрокси-N-  
 метилпропанамид; 9-метил-9H-карбазол-3-амин; 2-(1-(4-аминофенил)пиперидин-  
 20 4-ил)этан-1-ол; 1-(4-амино-2-метоксифенил)пиперидин-3-ол; 1-(4-аминофенил)-  
 3-метилпирролидин-3-ол; 2-(4-(4-аминофенил)пиперазин-1-ил)этан-1-ол; 4-(3,3-  
 дифторпирролидин-1-ил)анилин; 4-(2-окса-6-азаспиро[3.3]гептан-6-ил)анилин;  
 3-(2-метоксиэтокси)-4-морфолиноанилин; 3-(4-амино-2-метоксифенокси)-2,2-  
 диметилпропан-1-ол; 1-(4-амино-2-метоксифенил)пиперидин-4-ол; (1-(4-амино-  
 25 2-метоксифенил)пирролидин-3-ил)метанол; 4-(3-метокси-3-метилазетидин-1-  
 ил)анилин; 1-(4-амино-2-этоксифенокси)-2-метилпропан-2-ол; 1-(4-амино-2-  
 этоксифенил)пирролидин-3-ол; 4-амино-N-этил-N-(2-гидроксиэтил)бензамид; 4-  
 ((4-этилпиперазин-1-ил)метил)анилин; 1-(4-аминофенил)-3-этилазетидин-3-ол;  
 3-метил-4-(2-(пирролидин-1-ил)этокси)анилин; 4-метил-3-(2-(пирролидин-1-  
 30 ил)этокси)анилин; 1-(4-аминофенетил)пиперидин-4-ол; 2-(4-(4-  
 аминофенил)пиперидин-1-ил)этан-1-ол; 3-метил-4-((1-метилпиперидин-4-  
 ил)окси)анилин; 2-метокси-5-метил-4-(пиперидин-4-ил)анилин; 4-(1-(2-  
 метоксиэтил)-1H-пирразол-4-ил)анилин; 3-фтор-4-(2-(пирролидин-1-  
 ил)этокси)анилин; 4-амино-N-циклопентилбензамид; 4-(1-(2-

метоксиэтил)пирролидин-3-ил)анилин; 2-метокси-4-(4-метилпиперазин-1-ил)анилин; 2-(4-(4-амино-1Н-пиразол-1-ил)пиперидин-1-ил)ацетонитрил; (4-аминофенил)(пиперазин-1-ил)метанон; 1-(1-(2-метоксиэтил)пиперидин-4-ил)-1Н-пиразол-4-амин; 4-(2-(4-метилпиперазин-1-ил)этил)анилин; 4-(1,2-диметилпиперидин-4-ил)-3-фторанилин; метил 2-(5-амино-1Н-индазол-1-ил)ацетат; метил 2-(6-амино-1Н-индазол-1-ил)ацетат; 2-(5-амино-1Н-индазол-1-ил)-N-метилацетамид; 3-хлор-4-(трифторметокси)анилин; 4-(4,5-дихлор-1Н-имидазол-1-ил)анилин; 2-(6-амино-1Н-индазол-1-ил)-N-метилацетамид; (3-аминофенил)(фенил)метанон; метил 3-амино-5-формамидобензоат; 5-метокси-2-метил-[1,1'-бифенил]-4-амин; 2-((3-аминофенил)имино)-N,N-диметилацетамид; 2-((3-аминофенил)имино)-N-(2-(метиламино)этил)ацетамид; этил 5-аминобензофуран-2-карбоксилат; 1-(4-аминофенил)пирролидин-2-карбоксамид; (1-(2-амино-5-фторпиримидин-4-ил)пиперидин-4-ил)метанол; 4-амино-N-(2-гидроксиэтил)бензолсульфонамид; 4-(2-амино-5-фторпиримидин-4-ил)пиперазин-2-он; 3-(1Н-бензо[d][1,2,3]триазол-1-ил)анилин; 3-(1Н-индазол-1-ил)анилин; 3-(2Н-бензо[d][1,2,3]триазол-2-ил)анилин; 3-(1Н-бензо[d]имидазол-1-ил)анилин; 3-(2Н-индазол-2-ил)анилин; 3-(имидазо[1,2-а]пиридин-2-ил)анилин; 3-(4-аминофенил)пиридин-2(1Н)-он; 3-(бензо[d][1,3]диоксол-4-ил)анилин; 3-(бензо[d][1,3]диоксол-5-ил)анилин; 3-(2,3-дигидробензофуран-5-ил)анилин; 3-(имидазо[1,2-а]пиридин-6-ил)анилин; 4-(имидазо[1,2-а]пиридин-6-ил)анилин; 6-амино-N-метил-2-нафтамид; 3-фтор-4-(4-метил-1Н-пиразол-1-ил)анилин; 1-(4-аминофенил)-4-метилпиперидин-4-ол; 1-(4-амино-2-метоксифенил)-3-метилазетидин-3-ол; (4-(4-амино-2-метоксифенил)морфолин-2-ил)метанол; 2-(4-(4-аминофенил)пиперазин-1-ил)ацетальдегид; 4-(4-(3-фторпропил)пиперазин-1-ил)анилин; 4-(4,4-дифторпиперидин-1-ил)анилин; 4-(3,3-дифторпиперидин-1-ил)анилин; 4-(8-окса-3-азабицикло[3.2.1]октан-3-ил)анилин; 4-амино-N-(тетрагидро-2Н-пиран-4-ил)бензамид; (4-аминофенил)(3-гидроксиазетидин-1-ил)метанон; 3-(4-амино-2-этоксифеноксид)-2,2-диметилпропан-1-ол; 4-(4-этилпиперазин-1-ил)-3-метоксианилин; 4-(2,6-диметилморфолино)анилин; 1-(4-аминофенил)-3-метилпиперидин-3-ол; 2-(4-аминофенил)-N,2-диметилпропанамида; 4-(1-(2-метоксиэтил)пиперидин-4-ил)анилин; 4-(1-(3-фторпропил)пиперидин-4-ил)анилин; 4-(2-(4-этилпиперазин-1-ил)этил)анилин; 4-амино-N-фенилбензамид; 3-((диметиламино)метил)-1Н-индазол-6-амин; 1-(4-аминофенил)-N,N-диметилпирролидин-3-амин; 4-(4-

этоксипиперидин-1-ил)-3-фторанилин; 6-(2,6-диметилморфолино)пиперидин-3-амин; 6-(1-(2-метоксиэтил)пиперидин-4-ил)пиперидин-3-амин; 4-метил-3-(2-морфолиноэтокси)анилин; 6-амино-2,2-диметил-2Н-бензо[b][1,4]оксазин-3(4Н)-он; 3-(5-амино-1Н-индазол-1-ил)-N-метилпропанамид; 3-(6-амино-1Н-индазол-1-ил)-N-метилпропанамид; 5-амино-N-(2-гидроксиэтил)бензофуран-2-карбоксамид; 3-(5-амино-2Н-индазол-2-ил)-N-метилпропанамид; N-(3-амино-5-(трифторметил)фенил)формаид; 4-(бензилокси)-3-хлоранилин; 6-амино-2,2-дифтор-2Н-бензо[b][1,4]оксазин-3(4Н)-он; 5-амино-N-(2-гидроксиэтил)-2,3-дигидробензофуран-2-карбоксамид; 5-амино-1Н-индол-2-карбоновая кислота; метил 5-амино-3-оксо-2,3-дигидробензофуран-2-карбоксилат; метил 2-амино-8-метил-7-оксабицикло[4.2.0]окта-1,3,5-триен-5-карбоксилат; 2-метокси-5-нитроанилин; N-(3-аминофенил)пиваламид; N-(4-аминофенил)-N-метилциклопропанкарбоксамид; N-(4-амино-2-хлорфенил)-N-метилацетамид; 3-((4-аминофенил)сульфонил)пропаннитрил; 2-морфолинохинолин-6-амин; 4-амино-N-(2-метоксиэтил)бензолсульфонамид; 4-амино-N-циклопропил-N-метилбензамид; трет-бутил 4-аминопиперидин-1-карбоксилат; 1-(4-аминофенил)пиперидин-2-карбоксамид; 3,5-дифтор-4-морфолиноанилин; 4-(4-аминофенил)тиоморфолин-2,3-дион; 3-(2Н-бензо[b][1,4]оксазин-4(3Н)-ил)анилин; 3-(хинолин-3-ил)анилин; 3-(хинолин-4-ил)анилин; 3',4'-дифтор-[1,1'-бифенил]-3-амин; 3-(хинолин-5-ил)анилин; 3-(хинолин-8-ил)анилин; 3-(2,3-дигидробензо[b][1,4]диоксин-6-ил)анилин; 4-(2,3-дигидробензо[b][1,4]диоксин-6-ил)анилин; 3-(хинолин-6-ил)анилин; 4-(метилсульфинил)-7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-2-амин; 4-(4-(2-метоксиэтил)пиперазин-1-ил)анилин; 2',4'-диметокси-[1,1'-бифенил]-3-амин; 2',3'-диметокси-[1,1'-бифенил]-3-амин; 3',4'-диметокси-[1,1'-бифенил]-3-амин; 1-(4-аминофенил)-N-метилпирролидин-2-карбоксамид; трет-бутил 3-аминопиперидин-1-карбоксилат; 2-(4-(4-амино-2-метоксифенил)пиперазин-1-ил)этан-1-ол; 1-(4-амино-2-этоксифенил)-3-метилазетидин-3-ол; 4-(2-окса-7-азаспиро[3.5]нонан-7-ил)анилин; 4-(7-окса-2-азаспиро[3.5]нонан-2-ил)анилин; 1-(4-амино-2-метоксифенил)-3-метилпирролидин-3-ол; 1-(4-аминофенил)-N,N-диметилпиперидин-4-амин; 2-(4-аминофенил)-1,1,1-трифторпропан-2-ол; 1-(4-амино-2-фторфенил)-3-метилазетидин-3-ол; 4-(1-циклопропилпиперидин-4-ил)анилин; 4-(1-(2-метоксиэтил)пиперидин-4-ил)-3-метиланилин; 3-(4-(4-аминофенил)пиперидин-1-ил)пропаннитрил; 4-амино-N-(3-метоксипропил)бензолсульфонамид; 2-фтор-5-

метил-4-(1-метилпиперидин-4-ил)анилин; 4-(1-изопропилпиперидин-4-ил)анилин; 2-(3-аминофенокси)-1-морфолиноэтан-1-он; 2-(4-(4-амино-2-метилфенил)пиперидин-1-ил)ацетонитрил; 4-(1-(3-фторпропил)пиперидин-4-ил)-3-метиланилин; этил 3-(5-амино-1H-индазол-1-ил)пропаноат; этил 3-(6-амино-1H-индазол-1-ил)пропаноат; 5-амино-N,N-диметил-2,3-дигидробензофуран-2-карбоксамид; этил 2-(4-аминофенил)-2-метилпропаноат; этил 3-(5-амино-2H-индазол-2-ил)пропаноат; 4-фтор-3-нитроанилин; 2-фтор-5-нитроанилин; метил 5-амино-1H-индол-2-карбоксилат; трет-бутил (4-аминофенил)карбамат; трет-бутил (3-аминофенил)карбамат; 4-метил-3-нитроанилин; 2-метил-5-нитроанилин; 1-(4-аминофенил)-N-метилпиперидин-2-карбоксамид; трет-бутил 4-(аминометил)пиперидин-1-карбоксилат; изопропил (4-аминофенил)(метил)карбамат; 2-(морфолинометил)хинолин-6-амин; 4-(пирролидин-1-ил)-7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-2-амин; бензил 4-аминоциклогексанкарбоксилат; 4-амино-N-циклобутил-N-метилбензамид; 1-(4-аминофенил)-1H-1,2,3-триазол-4-карбоксамид; 2-(4-аминофенокси)-1-морфолиноэтан-1-он; 4-амино-N-циклопропилбензолсульфонамид; 2'-(пирролидин-3-ил)-[1,1'-бифенил]-3-амин; 1-(метилсульфонил)-1H-индазол-6-амин; N-(4-аминофенил)-2-(диметиламино)-N-метилацетамид; 5-(4-аминофенил)-N,N-диметилпиридин-2-амин; 4-(2-метил-1-морфолинопропан-2-ил)анилин; 1-(4-амино-2-метоксифенил)-4-метилпиперидин-4-ол; 5-амино-2-морфолинобензамид; (4-аминофенил)(4-гидроксипиперидин-1-ил)метанон; 3-метокси-4-(4-(2-метоксиэтил)пиперазин-1-ил)анилин; 1-(4-амино-2-метоксифенил)-3-метилпиперидин-3-ол; 3-(4-аминофенил)-1,4-диметилпиперазин-2-он; 1-(4-(4-аминофенил)пиперидин-1-ил)этан-1-он; 4-(2-(4-(2-метоксиэтил)пиперазин-1-ил)этил)анилин; 4-амино-N-(2-морфолиноэтил)бензамид; 2-(метилсульфонил)-1,2,3,4-тетрагидроизохинолин-6-амин; 1-(4-аминофенил)-N,N-диметилпирролидин-3-амин; 3-метил-4-(3-(4-метилпиперазин-1-ил)пропокси)анилин; 3-(4-(4-амино-2-метилфенил)пиперидин-1-ил)пропаннитрил; 3-хлор-4-(2,6-диметилморфолино)анилин; этил 5-амино-1H-индол-2-карбоксилат; 2-((3-аминофенил)имино)-1-морфолиноэтан-1-он; 2-((3-аминофенил)имино)-N-(2,3-дигидроксипропил)ацетамид; 2-((3-аминофенил)имино)-1-(пиперазин-1-ил)этан-1-он; 4-хлор-3-нитроанилин; 4-(пирролидин-1-илсульфонил)анилин; 2,2,3,3-тетрафтор-2,3-дигидробензо[b][1,4]диоксин-6-амин; метил 5-амино-2-

(трифторметокси)бензоат; этил 7-амино-1H-индол-2-карбоксилат; 5-амино-N-изопропил-2,3-дигидробензофуран-2-карбоксамид; 1-(4-(5-аминопиридин-2-ил)пиперазин-1-ил)этан-1-он; бензил 3-(аминометил)пиперидин-1-карбоксилат; 6-амино-N,N-диметил-2-нафтамид; 4-(4-аминофенил)пиперазин-1-карбоксамид; 5 1-(4-аминофенил)пиперидин-3-карбоксамид; 4-(пиперидин-1-ил)-7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-2-амин; 4-амино-N-циклобутилбензолсульфонамид; 1-(4-аминофенил)пиперидин-4-карбоновая кислота; 1-(4-аминофенил)-4-гидрокси-пирролидин-2-карбоксамид; 1-(4-аминофенил)пиперидин-4-карбоксамид; 2'-(пиперидин-4-ил)-[1,1'-бифенил]-3-амин; 2'-(пиперидин-3-ил)-[1,1'-бифенил]-3-амин; 2-фенил-1H-индол-4-амин; 2',5'-диметокси-[1,1'-бифенил]-3-амин; 1-(4-аминофенил)-N-метилпирролидин-3-карбоксамид; трет-бутил 2-(4-аминофенокси)ацетат; (4-аминофенил)(2-(гидроксиметил)морфолино)метанон; 4-амино-N-метил-N-(тетрагидро-2H-пиран-4-ил)бензамид; 1-(4-амино-2-этоксифенил)-4-метилпиперидин-4-ол; (4-аминофенил)(3-гидрокси-3-метилазетидин-1-ил)метанон; 3-(4-(4-аминофенил)пиперидин-1-ил)пропан-1,2-диол; 1-(4-аминофенетил)-N,N-диметилпиперидин-4-амин; 4-(2,2-диметилморфолино)-3-метиланилин; 4-амино-N-(1-метилпиперидин-4-ил)бензамид; 4-(2-(тетрагидро-2H-пиран-4-ил)тиазол-4-ил)анилин; 4-(2-(пиперидин-3-ил)тиазол-4-ил)анилин; 4-(2-(пиридин-3-ил)тиазол-4-ил)анилин; 4-(1-(пиперидин-4-ил)-1H-пиразол-4-ил)анилин; 4-(1-циклопентилпиперидин-4-ил)анилин; 3-(1,2,3,6-тетрагидропиридин-4-ил)-1H-индазол-6-амин; 4-(1-этилпиперидин-4-ил)-2-метокси-5-метиланилин; метил 4-(4-аминофенил)пиперазин-1-карбоксилат; трет-бутил 2-((3-аминофенил)имино)ацетат; (5-аминобензофуран-2-ил)(пирролидин-1-ил)метанон; метил 3-амино-5-(трифторметил)бензоат; 2-((3-аминофенил)имино)-N-(3-(диметиламино)пропил)ацетамид; этил 6-амино-4H-бензо[b]имидазо[1,5-d][1,4]оксазин-3-карбоксилат; 1-(2-амино-5-фторпиримидин-4-ил)пиперидин-3-карбоксамид; 1-(4-(4-аминофенил)пиперазин-1-ил)пропан-1-он; 2-амино-4-(м-толил)пиримидин-5-карбоксамид; 2-амино-4-(2-(2-гидроксиэтил)пиперидин-1-ил)пиримидин-5-карбоксамид; 4-(морфолиносulфонил)анилин; 4-((тиазол-4-илметил)сульфонил)анилин; 4-((тетрагидро-2H-пиран-4-ил)сульфонил)анилин; 3-(2H-1,2,3-триазол-2-ил)-5-(трифторметил)анилин; 1-(4-аминофенил)-N-метилпиперидин-3-карбоксамид; 1-(4-аминофенил)-N-метилпиперидин-4-карбоксамид; 6-амино-2,2,4-триметил-2H-бензо[b][1,4]оксазин-3(4H)-он; 1-(4-(4-

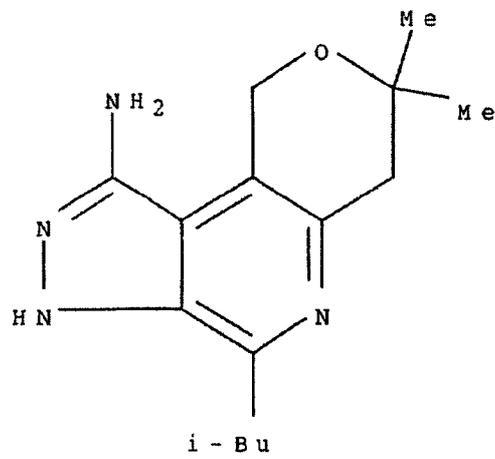
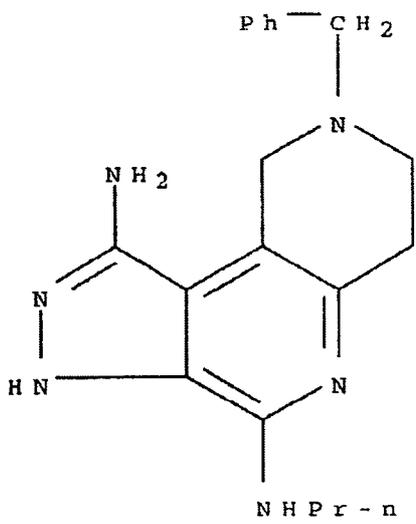
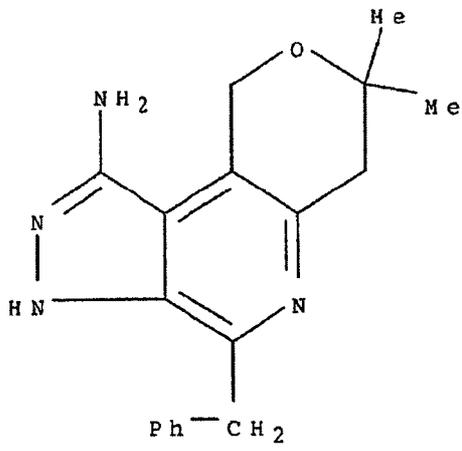
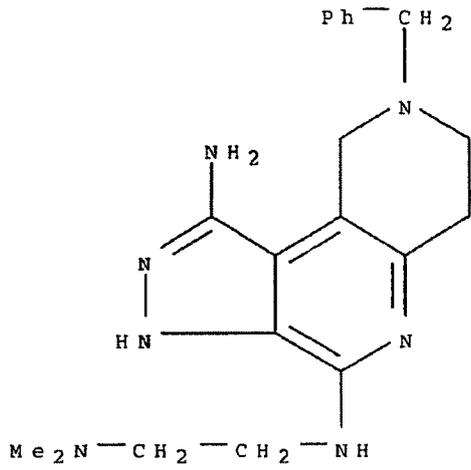
аминофенил)-3-метилпиперазин-1-ил)этан-1-он; 2-(4-  
 аминофенилсульфонамидо)ацетамид; 4-(фенилсульфонил)анилин; 3-(2Н-1,2,3-  
 триазол-2-ил)-4-(трифторметил)анилин; 3-морфолино-4-(1Н-пиразол-1-  
 ил)анилин; 3-(1Н-1,2,3-триазол-1-ил)-4-(трифторметил)анилин; 4-(3-  
 5 (трифторметил)-1Н-пиразол-1-ил)анилин; 2-(6-амино-2-оксо-3,4-  
 дигидрохиолин-1(2Н)-ил)уксусная кислота; 1-(4-аминофенил)-4-гидрокси-N-  
 метилпирролидин-2-карбоксамид; 1-(4-аминофенил)-N,N-диметилпирролидин-2-  
 карбоксамид; 4-(4-((диметиламино)метил)пиперидин-1-ил)-5-фторпиримидин-2-  
 амин; 7-амино-2,2,4-триметил-2Н-бензо[b][1,4]оксазин-3(4Н)-он; 3-(4-метил-3,4-  
 10 дигидро-2Н-бензо[b][1,4]оксазин-7-ил)анилин; N-(1-(4-аминофенил)пиперидин-  
 4-ил)ацетамид; 1-(4-(4-аминофенил)-1,4-дiazепан-1-ил)этан-1-он; 1-(4-(4-  
 аминофенил)-5,6-дигидропиридин-1(2Н)-ил)этан-1-он; 1-(4-(4-аминофенил)-  
 1,2,3,6-тетрагидропиридин-2-ил)этан-1-он; 2-(1-(4-аминофенил)пиперидин-4-  
 ил)пропан-2-ол; 4-(пиперидин-4-ил)-3-(трифторметил)анилин; 4-(1-  
 15 циклопропилпиперидин-4-ил)-3-метиланилин; 4-(пиперазин-1-ил)-3-  
 (трифторметил)анилин; 1-(4-аминофенетил)пиперидин-3-карбоновая кислота; 1-  
 (4-аминофенетил)пиперидин-4-карбоновая кислота; 4-морфолино-3-  
 (трифторметил)анилин; 4-амино-N-(4-хлорфенил)бензамид; 4-(4-(4-  
 аминофенил)пиперидин-1-ил)бутан-2-он; 4-(4-аминофенил)-N-этилпиперидин-1-  
 20 карбоксамид; 4-(1-изопропилпиперидин-4-ил)-3-метиланилин; 2-(4-(4-амино-2-  
 метилфенил)пиперидин-1-ил)ацетамид; (5-аминобензофуран-2-  
 ил)(морфолино)метанон; 5-амино-N-(2,3-дигидроксипропил)-2,3-  
 дигидробензофуран-2-карбоксамид; 5-амино-N-(2,3-  
 дигидроксипропил)бензофуран-2-карбоксамид; 5-амино-N-(1,3-  
 25 дигидроксипропан-2-ил)бензофуран-2-карбоксамид; 2-амино-4-(3-  
 метоксифенил)пиримидин-5-карбоксамид; 3-амино-N-метокси-N-  
 фенилбензамид; 1-(4-аминофенил)-N,N-диметилпиперидин-2-карбоксамид; 2-  
 амино-4-(3-этилфенил)пиримидин-5-карбоксамид; 1-(1-(2-амино-5-  
 фторпиримидин-4-ил)пиперидин-4-ил)мочевина; 2-(1-(2-амино-5-  
 30 фторпиримидин-4-ил)пиперидин-4-ил)ацетамид; 2-амино-4-(3-  
 (гидроксиметил)пиперидин-1-ил)пиримидин-5-карбоксамид; 4-(4-(пиридин-2-  
 ил)пиперазин-1-ил)анилин; 3-(4-фенилпиперазин-1-ил)анилин; 3'-морфолино-  
 [1,1'-бифенил]-3-амин; 4'-морфолино-[1,1'-бифенил]-3-амин; 3'-морфолино-[1,1'-  
 бифенил]-4-амин; 4'-морфолино-[1,1'-бифенил]-4-амин; 2'-(метилсульфонил)-

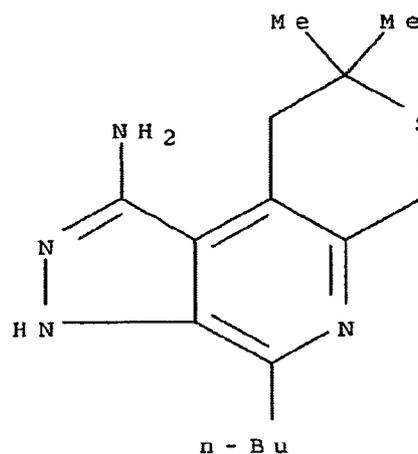
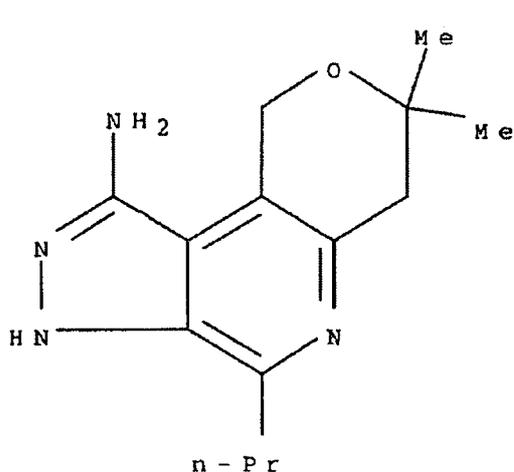
[1,1'-бифенил]-3-амин; 1-(4-(4-аминофенил)пиперазин-1-ил)-2-метоксиэтан-1-он;  
 2',3',4'-триметокси-[1,1'-бифенил]-3-амин; 4-ацетил-1-(4-аминофенил)пиперазин-  
 2-он; (2-аминоциклогексил)(трет-бутил)карбамат; 4-(4-(1-  
 метилциклопропил)пиперазин-1-ил)анилин; 2-(4-аминофенокси)-1-(3-гидрокси-  
 5 3-метилазетидин-1-ил)этан-1-он; (4-аминофенил)(4-гидрокси-4-метилпиперидин-  
 1-ил)метанон; 4-(2-(4-(пирролидин-1-ил)пиперидин-1-ил)этил)анилин; 1-(4-(4-  
 амино-2-метилфенил)пиперидин-1-ил)этан-1-он; 4-(1-  
 (метилсульфонил)пирролидин-3-ил)анилин; 4-(1-(2-морфолиноэтил)-1Н-  
 пиразол-4-ил)анилин; 4-(1-метилпиперидин-4-ил)-3-(трифторметил)анилин; 1-(4-  
 10 (4-аминофенил)пиперидин-1-ил)-2-(этиламино)этан-1-он; 4-(1-(2,2,2-  
 трифторэтил)пиперидин-4-ил)анилин; 4-(4-аминофенил)пиперидин-1-  
 карбоксилат; 1-(4-(4-амино-2-метилфенил)пиперидин-1-ил)-3-метоксипропан-2-  
 ол; 2-(4-(4-амино-2-метилфенил)пиперидин-1-ил)-N-метилацетамид; 4-(4-  
 бензилпиперазин-1-ил)анилин; 2-((3-аминофенил)имино)-1-(4-метилпиперазин-  
 15 1-ил)этан-1-он; 2-((3-аминофенил)имино)-N-(2-морфолиноэтил)ацетамид; (5-  
 аминобензофуран-2-ил)(1,4-дiazепан-1-ил)метанон; (6-аминонафталин-2-  
 ил)(морфолино)метанон; 1-(4-(4-амино-3-метилфенил)пиперазин-1-ил)этан-1-он;  
 1-((1-(2-амино-5-фторпиримидин-4-ил)пиперидин-4-ил)метил)мочевина; 4-(2-  
 20 амино-5-фторпиримидин-4-ил)пиперазин-1-карбоксамид; 1-(4-(4-амино-2-  
 фторфенил)пиперазин-1-ил)этан-1-он; 1-(4-(4-аминофенил)-2-метилпиперазин-1-  
 ил)этан-1-он; 4-(1-(метилсульфонил)пиперидин-4-ил)анилин; 4-(2-(4-  
 морфолинопиперидин-1-ил)этил)анилин; 3-метил-4-(1-(пиперидин-4-ил)-1Н-  
 пиразол-4-ил)анилин; 4-(1-(метилсульфонил)пиперидин-3-ил)анилин; 1-(4-(4-  
 25 амино-2-метилфенил)пиперидин-1-ил)-2-(этиламино)этан-1-он; 1-(3-(4-  
 аминофенил)пирролидин-1-ил)-2-(диметиламино)этан-1-он; этил 3-(4-(4-  
 аминофенил)пиперидин-1-ил)пропаноат; трет-бутил 6-амино-3,4-  
 дигидроизохинолин-2(1Н)-карбоксилат; 4-(бензилокси)-3-  
 (трифторметил)анилин; 5-амино-N-(1-гидрокси-2-метилпропан-2-ил)бензофуран-  
 2-карбоксамид; 1-((4-аминофенил)сульфонил)пиперидин-4-ол; 4-(4-  
 30 (метилсульфонил)пиперазин-1-ил)анилин; 1-(4-аминофенил)-N,N-  
 диметилпиперидин-4-карбоксамид; 2-амино-4-(4-(2-гидроксиэтил)-1,4-diazепан-  
 1-ил)пиримидин-5-карбоксамид; 4-(4-аминофенил)-N,N-диметилпиперазин-1-  
 карбоксамид; 1-(4-(4-амино-2-хлорфенил)пиперазин-1-ил)этан-1-он; 3-(2-амино-  
 5-нитрофенил)пропанамид; 3-(4-(2-амино-5-фторпиримидин-4-ил)пиперазин-1-

ил)-3-оксопропаннитрил; 3-фтор-4-(3-(трифторметил)-1H-пиразол-1-ил)анилин;  
 (4-(4-аминофенил)пиперазин-1-ил)(циклопропил)метанон; 1-(3'-амино-[1,1'-  
 бифенил]-4-ил)пиперидин-2-он; 1-(3'-амино-[1,1'-бифенил]-3-ил)пиридин-2(1H)-  
 он; 1-(3'-амино-[1,1'-бифенил]-4-ил)пиридин-2(1H)-он; 4-(метилсульфонил)-3-  
 5 морфолиноанилин; 3'-(метилсульфонил)-[1,1'-бифенил]-4-амин; 4'-  
 (метилсульфонил)-[1,1'-бифенил]-4-амин; 3'-(метилсульфонил)-[1,1'-бифенил]-3-  
 амин; 4'-(метилсульфонил)-[1,1'-бифенил]-3-амин; метил 4-(4-аминофенил)-3-  
 метилпиперазин-1-карбоксилат; N-(4-аминофенил)-2-(бензилокси)-N-  
 метилацетамид; 2-(4-амино-N-метилфенилсульфонамидо)уксусная кислота; 1-(4-  
 10 аминофенил)-4-гидрокси-N,N-диметилпирролидин-2-карбоксамид; 1-(4-  
 аминофенил)-N,N-диметилпиперидин-3-карбоксамид; N-(1-(4-  
 аминофенил)пиперидин-4-ил)-N-метилацетамид; 1-(4-(4-  
 аминофенил)пиперидин-1-ил)-2-(диметиламино)этан-1-он; 4-(1-(4,4,4-  
 трифторбутил)пиперидин-4-ил)анилин; 3-метил-4-(6-(пиперазин-1-ил)пиридин-  
 15 3-ил)анилин; 1-(1-(2-(метилсульфонил)этил)пиперидин-4-ил)-1H-пиразол-4-  
 амин; 1-(4-(5-аминопиридин-2-ил)пиперидин-1-ил)-2-(диметиламино)этан-1-он;  
 4-(1-(этилсульфонил)пиперидин-4-ил)анилин; 2-((3-аминофенил)имино)-N-(2-  
 (бензиламино)этил)ацетамид; 1-(4-(4-аминофенил)-3-метилпиперазин-1-ил)-2-  
 метоксиэтан-1-он; N-(1-(2-амино-5-фторпиримидин-4-ил)пиперидин-4-ил)-2-  
 20 цианоацетамид; 4-((4-(метилсульфонил)пиперазин-1-ил)метил)анилин; 4-(4-  
 (метилсульфонил)-1,4-дiazепан-1-ил)анилин; 4-(1-(метилсульфонил)-1,2,3,6-  
 тетрагидропиридин-4-ил)анилин; 4-(2-(метилсульфонил)-1,2,3,6-  
 тетрагидропиридин-4-ил)анилин; 2-амино-4-(метил(1-метилпиперидин-4-  
 ил)амино)пиримидин-5-карбоксамид; 4-(4-(этилсульфонил)пиперазин-1-  
 25 ил)анилин; 1-(4-(4-аминобензоил)пиперазин-1-ил)этан-1-он; 4-(2-метил-4-  
 (метилсульфонил)пиперазин-1-ил)анилин; 2,6-диизопропил-4-феноксианилин; 2-  
 метил-4-(4-(метилсульфонил)пиперазин-1-ил)анилин; 3-метил-4-(1-(2-  
 морфолиноэтил)-1H-пиразол-4-ил)анилин; 4-(1-(2-  
 (метилсульфонил)этил)пиперидин-4-ил)анилин; 1-(4-(4-амино-2-  
 30 метилфенил)пиперидин-1-ил)-2-(диметиламино)этан-1-он; 5-амино-2-  
 (морфолин-4-карбонил)бензофуран-3(2H)-он; трет-бутил (6-амино-4H-хромен-4-  
 ил)карбамат; 2-амино-4-(3,5-диметилфенил)пиримидин-5-карбоксамид; (1-(4-  
 аминофенил)пиперидин-4-ил)(пирролидин-1-ил)метанон; 4-ацетил-1-(4-  
 аминофенил)пиперазин-2-карбоксамид; 3-(4-(4-аминофенил)пиперидин-1-ил)-

- 1,1,1-трифторпропан-2-ол; трет-бутил 3-(4-аминофенил)пирролидин-1-карбоксилат; этил 1-(3-аминобензоил)пиперидин-4-карбоксилат; (1-(4-аминофенил)пиперидин-4-ил)(морфолино)метанон; (1-(4-аминофенил)пиперидин-4-ил)(пиперидин-1-ил)метанон; 4-ацетил-1-(4-аминофенил)-N-метилпиперазин-2-карбоксамид; трет-бутил 4-(4-аминофенил)пиперидин-1-карбоксилат; бутил 2-(4-амино-N-метилфенилсульфонамидо)ацетат; 4-(4-(циклопропилсульфонил)пиперазин-1-ил)анилин; N-(1-(4-аминофенил)пиперидин-4-ил)-N-метилметансульфонамид; 4-(4-(этилсульфонил)-2-метилпиперазин-1-ил)анилин; 3-метил-4-(1-(2-(метилсульфонил)этил)пиперидин-4-ил)анилин; (4-аминофенил)(4-(метилсульфонил)пиперазин-1-ил)метанон; 4-(4-(циклопропилсульфонил)-2-метилпиперазин-1-ил)анилин; 1-(4-(4-аминофенил)пиперидин-1-ил)-2-(метилсульфонил)этан-1-он; метил 4-((6-амино-2H-индазол-2-ил)метил)-3-метоксибензоат; метил 4-((6-амино-1H-индазол-1-ил)метил)-3-метоксибензоат; 4-((6-амино-1H-индазол-1-ил)метил)-3-метокси-N-метилбензамид; 2-изопропил-5-метилциклогексил 5-амино-2,3-дигидробензофуран-2-карбоксилат; этил 4-амино-3-(2-амино-5-нитробензил)-4-оксобутаноат; 3,4-бис(3-(трифторметил)-1H-пиразол-1-ил)анилин.

- 20 Предпочтительно, из объема настоящей заявки исключены следующие соединения:





И

В особенности, предпочтительными соединениями формулы (I) являются:

- N-(*m*-толил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(3-
- 5 (трифторметил)фенил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(3,4,5-
- триметоксифенил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(1H-индазол-5-ил)-2H-
- пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-фенил-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-
- (1H-индазол-6-ил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(3-хлорфенил)-2H-
- пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(7-метил-1H-индазол-5-ил)-2H-пиразоло[3,4-
- 10 с]хинолин-4-амин; N-(2-метоксиэтил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 8-
- метокси-N-(7-метил-1H-индазол-5-ил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-
- (тиофен-2-илметил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(6-метил-1H-индазол-
- 5-ил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 8-метокси-N-фенил-2H-пиразоло[3,4-
- с]хинолин-4-амин; 8-метокси-N-(2-метоксиэтил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-
- 15 амин; N-(2H-индазол-6-ил)-8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; метил
- 4-((2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)бензоат; N-(1H-бензо[d]имидазол-5-
- ил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(2H-индазол-7-ил)-2H-пиразоло[3,4-
- с]хинолин-4-амин; 8-метокси-N-((1-метил-1H-пиррол-2-ил)метил)-2H-
- пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(2H-индазол-7-ил)-8-метокси-2H-
- 20 пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(бензо[d][1,3]диоксол-5-ил)-2H-пиразоло[3,4-
- с]хинолин-4-амин; N-(пиридин-3-ил)-3H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(1-
- метил-1H-индазол-6-ил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(6-
- метоксипиридин-3-ил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(4-(4-
- метилпиперазин-1-ил)фенил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(4-(4-метил-
- 25 1,4-дiazепан-1-ил)фенил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(пиридин-2-ил)-

3H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(5-бромпиридин-2-ил)-3H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(изохинолин-3-ил)-3H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(4-метилпиридин-2-ил)-3H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(4,6-диметилпиридин-2-ил)-3H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 8-бром-N-(1H-индазол-6-ил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(1H-бензо[d]имидазол-5-ил)-8-бром-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 8-бром-N-(1-метил-1H-индазол-6-ил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 8-бром-N-(1H-индазол-7-ил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 8-метокси-N-(m-толил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(1H-индазол-5-ил)-8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(1H-бензо[d]имидазол-5-ил)-8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 8-метокси-N-(1-метил-1H-индазол-6-ил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 8-бром-N-(7-метил-1H-индазол-5-ил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 8-метокси-N-(4-(4-метилпиперазин-1-ил)фенил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 8-бром-N-(4-(4-метилпиперазин-1-ил)фенил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N1-(8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)бензол-1,3-диамин; 8-бром-N-(1H-индазол-5-ил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 6-((3H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)-2H-бензо[b][1,4]оксазин-3(4H)-он; 6-((8-метокси-3H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)-2H-бензо[b][1,4]оксазин-3(4H)-он; N-(1H-бензо[d][1,2,3]триазол-5-ил)-8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 3-((8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)бензимидамид; 8-метокси-N-(4-(пиперидин-1-ил)фенил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N1-(8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-N4,N4-диметилбензол-1,4-диамин; 3-((8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)бензамид; N-(3,4-диметоксифенил)-8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 8-метокси-N-(4-морфолинофенил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 8-метокси-N-(2-метил-1H-бензо[d]имидазол-6-ил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(1H-индазол-5-ил)-8H-пиразоло[3,4-с][1,5]нафтиридин-6-амин; 4-((8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)бензойная кислота; 4-((8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)бензамид; 4-((8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)бензонитрил; 8-метокси-N-(3-метоксифенил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 8-метокси-N-(4-метоксифенил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 3-((8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)бензонитрил; N-(8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)бензо[с][1,2,5]тиадиазол-5-амин; 3-((8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-

ил)амино)пиридин-2(1H)-он; N-(2-этоксифенил)-8-метокси-2H-пиразоло[3,4-  
с]хиолин-4-амин; 8-метокси-N-(1H-пиразол-3-ил)-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-  
4-амин; 8-метокси-N-(3,4,5-триметоксифенил)-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-  
амин; 5-((8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-ил)амино)-1H-пиразол-4-  
5 карбоксамид; 8-метокси-N-(2-феноксифенил)-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-  
амин; 8-метокси-N-(3-феноксифенил)-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; 5-((8-  
метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-ил)амино)-1H-бензо[d]имидазол-2(3H)-  
он; N-(1H-индол-5-ил)-8-метокси-3H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; N-(4-  
(аминометил)фенил)-8-метокси-3H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; N-(1H-  
10 индазол-6-ил)-8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; N-(1H-индол-6-  
ил)-8-метокси-3H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; N1-(8-метокси-2H-  
пиразоло[3,4-с]хиолин-4-ил)-N3,N3-диметилбензол-1,3-диамин; 8-метокси-N-  
(3-фенил-1H-пиразол-5-ил)-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; N1,N1-диэтил-  
N4-(8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-ил)бензол-1,4-диамин; 8-метокси-  
15 N-(4-(пирролидин-1-ил)фенил)-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; N3-(8-  
метокси-3H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-ил)-4H-1,2,4-триазол-3,5-диамин; 8-  
метокси-N-(3-морфолинофенил)-3H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; N-(1H-  
индол-5-ил)-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; 8-бром-N-(4-(пиперидин-1-  
ил)фенил)-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; N1-(8-бром-2H-пиразоло[3,4-  
20 с]хиолин-4-ил)-N4,N4-диметилбензол-1,4-диамин; N-(3-циклобутил-1H-  
пиразол-5-ил)-8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; N-(4-(4,5-дигидро-  
1H-имидазол-2-ил)фенил)-8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; 4-(4-  
(8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-ил)амино)фенил)морфолин-3-он; N-(8-  
метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-ил)-2,2-диметил-3,4-дигидро-2H-  
25 бензо[b][1,4]тиазин-6-амин; N-(4-морфолинофенил)-8H-пиразоло[3,4-  
с][1,5]нафтиридин-6-амин; N-(1H-индазол-5-ил)-2-метокси-8H-пиразоло[3,4-  
с][1,5]нафтиридин-6-амин; N-(1H-индазол-6-ил)-2H-пиразоло[3,4-  
с][1,7]нафтиридин-4-амин; 7,8-диэтокси-N-(1H-индазол-6-ил)-2H-пиразоло[3,4-  
с]хиолин-4-амин; 7-((8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-ил)амино)-3,4-  
30 дигидрохиолин-2(1H)-он; 6-((8-метокси-3H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-  
ил)амино)-2H-бензо[b][1,4]тиазин-3(4H)-он; N-(5-(трет-бутил)-1H-пиразол-3-  
ил)-8-метокси-3H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; 8-метокси-N-(3-метил-1H-  
пиразол-5-ил)-3H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; N-(5-циклопропил-1H-  
пиразол-3-ил)-8-метокси-3H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; N-(4-(1H-тетразол-

5-ил)фенил)-8-метокси-3H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 8-бром-N-(1H-индол-5-ил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(бензо[d][1,3]диоксол-5-ил)-8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(2,3-дигидробензо[b][1,4]диоксин-6-ил)-8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 8-метокси-N-(4-(1-метилпиперидин-4-ил)фенил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 8-метокси-N-(6-морфолинопиридин-3-ил)-3H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 8-метокси-N-(4-(2-метоксиэтокси)фенил)-3H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(4-этокси-3-метоксифенил)-8-метокси-3H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 1-(4-((8-метокси-3H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)фенил)пирролидин-2-он; 8-метокси-N-(4-тиоморфолинофенил)-3H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 5-((8-метокси-3H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)бензо[d]оксазол-2(3H)-он; N-(8-метокси-3H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-3,4-дигидро-2H-бензо[b][1,4]оксазин-6-амин; 7-((8-метокси-3H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)хиназолин-4-ол; 1,1-диоксид 4-(4-((8-метокси-3H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)фенил)тиоморфолина; 2-(4-((8-метокси-3H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)фенил)ацетамид; 3-((8-метокси-3H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)фенол; N-(3,4-диэтоксифенил)-8-метокси-3H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 8-бром-N-(4-морфолинофенил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 6-((8-бром-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)-2H-бензо[b][1,4]оксазин-3(4H)-он; 6-((8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)-1H-бензо[d][1,3]оксазин-2,4-дион; 2-метокси-5-((8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)фенол; 8-бром-N-(1H-пиразол-3-ил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 8-метокси-N-(3-метоксифенил)-N-метил-3H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(3-((8-метокси-3H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)фенил)ацетамид; 8-метокси-N-(1H-пиразол-4-ил)-3H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(3,4-диметоксифенил)-7,8-диметокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(3,4-диметоксифенил)-8H-пиразоло[3,4-с][1,5]нафтиридин-6-амин; N-(4-фтор-3-метоксифенил)-8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(3-фтор-4-метоксифенил)-8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 8-метокси-N-(1-метил-1H-бензо[d]имидазол-5-ил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 1-(3-((8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)фенил)этан-1-он; N-(4-((8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)фенил)ацетамид; 8-метокси-N-(пиридин-2-ил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 8-метокси-N-(1H-пирроло[2,3-b]пиридин-6-ил)-

2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 3-((8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)бензолсульфонамид; 4-((8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)бензолсульфонамид; 7,8-диметокси-N-(4-морфолинофенил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 7,8-диметокси-N-(4-(4-метилпиперазин-1-ил)фенил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N1-(7,8-диметокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-N4,N4-диметилбензол-1,4-диамин; N-(1H-индазол-6-ил)-7,8-диметокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N2-(8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)пиридин-2,6-диамин; 8-метокси-N-(1,2,3-триметил-1H-индол-5-ил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N2-(8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)пиримидин-2,4-диамин; 8-метокси-N-(5-(метилтио)-4H-1,2,4-триазол-3-ил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(5-циклопропил-4H-1,2,4-триазол-3-ил)-8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(2-метокси-5-((8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)фенил)ацетамид; N-(1H-бензо[d]имидазол-2-ил)-8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(1H-имидазол-2-ил)-8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 1-(4-((8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)фенил)этан-1-он; N-(4H-бензо[d][1,3]диоксин-6-ил)-8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(1,3-дигидроизобензофуран-5-ил)-8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 8-метокси-N-(1-метил-1H-бензо[d]имидазол-6-ил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-4,5-диметилтиазол-2-амин; N-(5-циклопропил-1H-пиразол-3-ил)-7,8-диметокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(7,8-диметокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-3,4-дигидро-2H-бензо[b][1,4]оксазин-6-амин; 5-((7,8-диметокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)-2-метоксифенол; 8-метокси-N-(2-метил-4-(4-метилпиперазин-1-ил)фенил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 8-метокси-N-(4-метилпиридин-2-ил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 8-метокси-N-(6-метилпиридин-2-ил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(4,6-диметилпиридин-2-ил)-8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-4-метилтиазол-2-амин; N-(8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-4,5,6,7-тетрагидробензо[d]тиазол-2-амин; 8-метокси-N-(4-феноксифенил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 8-метокси-N-(2-метил-1,2,3,4-тетрагидробензо[4,5]имидазо[1,2-а]пиперазин-8-ил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 8-метокси-N-(4-(пиридин-4-илметил)фенил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-

амин; 4-((8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)бензол-1,2-диол; 8-метокси-N-(4-((1-метилпиперидин-4-ил)окси)фенил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 1-(4-(4-((8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)фенил)пиперазин-1-ил)этан-1-он; 8-метокси-N-(6-(4-метилпиперазин-1-ил)пиридин-3-ил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 6-метокси-N-(4-(4-метилпиперазин-1-ил)фенил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(3,4-диметоксифенил)-6-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(6-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-3,4-дигидро-2Н-бензо[b][1,4]оксазин-6-амин; N-(5-циклопропил-1Н-пиразол-3-ил)-6-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 6-метокси-N-(4-морфолинофенил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(1Н-индазол-6-ил)-6-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(1Н-индазол-6-ил)-7-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(7-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-3,4-дигидро-2Н-бензо[b][1,4]оксазин-6-амин; N-(3,4-диметоксифенил)-7-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 7-метокси-N-(4-(4-метилпиперазин-1-ил)фенил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 7-метокси-N-(4-морфолинофенил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N4-(8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-N1,N1,2-триметилбензол-1,4-диамин; N-(4-(4-циклопропилпиперазин-1-ил)фенил)-8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(3-фтор-4-морфолинофенил)-8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 7-((8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)хиноксалин-2(1Н)-он; 8-метокси-N-(3-метил-4-(4-метилпиперазин-1-ил)фенил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 8-метокси-N-(4-(пиперазин-1-ил)фенил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(4-((диметиламино)метил)фенил)-8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(2-фтор-4-морфолинофенил)-8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(4-(4-этилпиперазин-1-ил)фенил)-8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 8-((8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)-4,5-дигидро-1Н-бензо[b]азепин-2(3Н)-он; 5-((8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)-1,3-диметил-1Н-бензо[d]имидазол-2(3Н)-он; N-(4-бензилфенил)-8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 8-метокси-N-(2-метил-4-морфолинофенил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N1-(8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-N4-метил-N4-(1-метилпиперидин-4-ил)бензол-1,4-диамин; 8-метокси-N-(4-(2-морфолиноэтил)фенил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(3-хлор-4-(4-метилпиперазин-1-ил)фенил)-8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 8-

метокси-N-(1,2,3,4-тетрагидрохинолин-7-ил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 4-((1H-индазол-6-ил)амино)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-8-карбонитрил; N-(9-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-3,4-дигидро-2H-бензо[b][1,4]оксазин-6-амин; N-(5-циклопропил-1H-пиразол-3-ил)-9-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(3,4-диметоксифенил)-9-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 9-метокси-N-(4-(4-метилпиперазин-1-ил)фенил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 9-метокси-N-(4-морфолинофенил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(1H-индазол-6-ил)-9-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N1-(8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)циклогексан-1,2-диамин; 8-метокси-N-(пиридин-4-ил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 8-метокси-N-(6-метоксипиридин-3-ил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(3,4-диметоксифенил)-1-метил-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 1-метил-N-(4-(4-метилпиперазин-1-ил)фенил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(1H-индазол-6-ил)-1-метил-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(3,4-диметоксифенил)-1-(трифторметил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(4-(4-метилпиперазин-1-ил)фенил)-1-(трифторметил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(1H-индазол-6-ил)-1-(трифторметил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(3,4-диметоксифенил)-1-нитро-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(4-(4-метилпиперазин-1-ил)фенил)-1-нитро-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 2-(4-((8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)фенил)-N-(4-метоксифенетил)ацетамид; 4-((3,4-диметоксифенил)амино)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-8-карбонитрил; 4-((4-морфолинофенил)амино)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-8-карбонитрил; N-(3,4-диметоксифенил)-1-метил-7H-изотиазоло[5,4-b]пиразоло[4,3-d]пиридин-5-амин; N-(1H-индазол-6-ил)-1-метил-7H-изотиазоло[5,4-b]пиразоло[4,3-d]пиридин-5-амин; 1-метил-N-(4-(4-метилпиперазин-1-ил)фенил)-7H-изотиазоло[5,4-b]пиразоло[4,3-d]пиридин-5-амин; 8-метокси-N-(3-(пиперазин-1-ил)фенил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(2-(диэтиламино)этил)-4-((8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)бензамид; 8-метокси-N-(2-(4-метилпиперазин-1-ил)пиримидин-5-ил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 7-((8-метокси-3H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)-2H-бензо[b][1,4]оксазин-3(4H)-он; N-(8-метокси-3H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-3,4-дигидро-2H-бензо[b][1,4]оксазин-7-амин; 4-((3,4-диметоксифенил)амино)-1-метил-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-7-карбонитрил; 4-((1H-индазол-6-ил)амино)-1-метил-

2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-7-карбонитрил; 8-метокси-N-(3-(4-метилпиперазин-1-ил)фенил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 8-метокси-N-(3-(2-(пиперазин-1-ил)этокси)фенил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 8-метокси-N-(6-метил-5,6,7,8-тетрагидро-1,6-нафтиридин-3-ил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; (4-  
 5 ((8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)фенил)(пирролидин-1-ил)метанон; (4-((8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)фенил)(морфолино)метанон; N-(4-((диметиламино)метил)фенил)-6-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 8-метокси-N-(4-(пирролидин-1-илметил)фенил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; (4-((8-метокси-2Н-  
 10 пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)фенил)(4-метилпиперазин-1-ил)метанон; N2-(2-(диметиламино)этил)-N5-(8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)пиримидин-2,5-диамин; 8-метокси-N-(4-(морфолинометил)фенил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 8-метокси-N-(4-((4-метилпиперазин-1-ил)метил)фенил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(4-(4-этилпиперазин-1-  
 15 ил)фенил)-6-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(4-(4-этилпиперазин-1-ил)-3-фторфенил)-8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(4-(2-(4-бензилпиперидин-1-ил)этил)фенил)-8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(4-((4-бензилпиперидин-1-ил)метил)фенил)-  
 20 8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 8-((6-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)-4,5-дигидро-1Н-бензо[b]азепин-2(3Н)-он; N-(1Н-бензо[d]имидазол-5-ил)-6-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(4-(4-циклопропилпиперазин-1-ил)фенил)-9-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 8-метокси-N-(п-толил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(6-(2-(диметиламино)этокси)пиридин-3-ил)-8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-  
 25 амин; N-(3-фтор-4-морфолинофенил)-6-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 6-метокси-N-(4-тиоморфолинофенил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 6-метокси-N-(2-метил-1Н-бензо[d]имидазол-5-ил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(бензо[d][1,3]диоксол-5-ил)-6-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 6-((6-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)-2Н-  
 30 бензо[b][1,4]оксазин-3(4Н)-он; N-(3,4-диметоксифенил)-6,8-диметокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(4-(4-циклопропилпиперазин-1-ил)фенил)-6,8-диметокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N2-(3-(диметиламино)пропил)-N5-(8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)пиридин-2,5-диамин; N2-(2-(диметиламино)этил)-N5-(8-метокси-2Н-

пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)пиридин-2,5-диамин; 8-метокси-N-(6-((1-метилпиперидин-4-ил)окси)пиридин-3-ил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(1H-индазол-5-ил)-7-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 8-((7-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)-4,5-дигидро-1H-бензо[b]азепин-2(3H)-он; N-(2,3-дигидробензо[b][1,4]диоксин-6-ил)-6-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(4-((диметиламино)метил)фенил)-7-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(4-(4-этилпиперазин-1-ил)фенил)-7-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 6-метокси-N-фенил-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(4-(4-циклопропилпиперазин-1-ил)фенил)-7-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(1H-бензо[d]имидазол-5-ил)-7-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 7-метокси-N-(2-метил-1H-бензо[d]имидазол-5-ил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(2,3-дигидробензо[b][1,4]диоксин-6-ил)-7-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 6-((7-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)-2H-бензо[b][1,4]оксазин-3(4H)-он; N-(бензо[d][1,3]диоксол-5-ил)-7-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(1H-индазол-5-ил)-6-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(4-(4-циклопентилпиперазин-1-ил)фенил)-8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(4-(4-изобутилпиперазин-1-ил)фенил)-8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(4-(4-изопропилпиперазин-1-ил)фенил)-8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(4-(4-(циклопропилметил)пиперазин-1-ил)фенил)-8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(4-(4-(трет-бутил)пиперазин-1-ил)фенил)-8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 6-метокси-N-(п-толил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; метил 4-((3,4-диметоксифенил)амино)-2H-пиразоло[4,3-d]тиено[3,4-b]пиридин-6-карбоксилат; метил 4-((4-(4-циклопропилпиперазин-1-ил)фенил)амино)-2H-пиразоло[4,3-d]тиено[3,4-b]пиридин-6-карбоксилат; 2-(4-(4-((8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)фенил)пиперазин-1-ил)уксусная кислота; 6-метокси-N-(4-((4-метилпиперазин-1-ил)метил)фенил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 2-(2-метокси-4-((8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)феноксид)уксусная кислота; (4-((8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)фенил)метанол; N-(4-(4-(2-(диметиламино)этил)пиперазин-1-ил)фенил)-8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 6,8-диметокси-N-(4-((4-метилпиперазин-1-ил)метил)фенил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 4-((6,8-диметокси-2H-пиразоло[3,4-

с]хиолин-4-ил)амино)фенил)(4-метилпиперазин-1-ил)метанон; N-(4-  
 ((диметиламино)метил)фенил)-6,8-диметокси-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-  
 амин; 2-(4-((8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-ил)амино)фенил)уксусная  
 кислота; 6-((8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-ил)амино)-2-нафтойная  
 5 кислота; 3-((8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-ил)амино)бензойная  
 кислота; 4'-((8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-ил)амино)-[1,1'-бифенил]-  
 4-карбоновая кислота; 1-(4-((8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-  
 ил)амино)фенил)-3-(м-толил)мочевина; 2-(4-((8-метокси-2H-пиразоло[3,4-  
 с]хиолин-4-ил)амино)феноксид)уксусная кислота; 6-((8-метокси-2H-  
 10 пиразоло[3,4-с]хиолин-4-ил)амино)-2H-бензо[b][1,4]оксазин-3(4H)-он; 1,1-  
 диоксид 4-(4-((8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-  
 ил)амино)фенил)тиоморфолина; 8-метокси-N-(4-тиоморфолинофенил)-2H-  
 пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; 8-метокси-N-(2-метилизоиндолин-5-ил)-2H-  
 пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; (3-метокси-4-((8-метокси-2H-пиразоло[3,4-  
 15 с]хиолин-4-ил)амино)фенил)(4-(4-метилпиперазин-1-ил)пиперидин-1-  
 ил)метанон; 3-((8-гидрокси-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-ил)амино)бензойная  
 кислота; 1-(4-((6,8-диметокси-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-ил)амино)фенил)-3-  
 (м-толил)мочевина; 1-(4-((7-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-  
 ил)амино)фенил)-3-(м-толил)мочевина; 1-(4-((7,8-диметокси-2H-пиразоло[3,4-  
 20 с]хиолин-4-ил)амино)фенил)-3-(м-толил)мочевина; N-(2-(диметиламино)этил)-  
 4-((8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-ил)амино)-N-метилбензамид; (4-((8-  
 метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-ил)амино)фенил)(2-  
 (метоксиметил)пирролидин-1-ил)метанон; азетидин-1-ил(4-((8-метокси-2H-  
 пиразоло[3,4-с]хиолин-4-ил)амино)фенил)метанон; 4-((8-метокси-2H-  
 25 пиразоло[3,4-с]хиолин-4-ил)амино)-N,N-диметилбензамид; (4-((8-метокси-2H-  
 пиразоло[3,4-с]хиолин-4-ил)амино)фенил)(4-метил-1,4-дiazепан-1-ил)метанон;  
 1-(4-((8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-ил)амино)бензоил)пиперидин-4-  
 он; (4-((8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-ил)амино)фенил)(1,4-диокса-8-  
 азаспиро[4.5]декан-8-ил)метанон; (3-(диметиламино)пирролидин-1-ил)(4-((8-  
 30 метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-ил)амино)фенил)метанон; 8-метокси-N-  
 (1-метил-1,2,3,4-тетрагидрохиолин-6-ил)-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; 8-  
 метокси-N-(3-(пентафторсульфанил)фенил)-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин;  
 N-(4-фторфенил)-8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; N-(3,4-  
 дифторфенил)-8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; 2,2,2-трифтор-N-

(4-((8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)фенил)ацетамид; 3-((6-((8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)-2Н-бензо[б][1,4]оксазин-3-ил)амино)пропан-1-ол; N6-(8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-N3-фенетил-2Н-бензо[б][1,4]оксазин-3,6-диамин; N-(3,5-дифторфенил)-8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(3-фтор-4-метилфенил)-8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 8-метокси-N-(3,4,5-трифторфенил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 8-метокси-N-(4-нитрофенил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 8-метокси-N-(3-метокси-4-морфолинофенил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 8-метокси-N-(3-(метилсульфонил)фенил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 1,1,1,3,3,3-гексафтор-2-(4-((8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)фенил)пропан-2-ол; (4-((8-фтор-3Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)фенил)(пирролидин-1-ил)метанон; 1-(4-(4-((8-фтор-3Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)фенил)пиперазин-1-ил)этан-1-он; 6-((8-фтор-3Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)-2Н-бензо[б][1,4]оксазин-3(4Н)-он; 8-фтор-N-(4-морфолинофенил)-3Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 8-фтор-N-(4-(4-метилпиперазин-1-ил)фенил)-3Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(3,4-диметоксифенил)-8-фтор-3Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(4-(дифторметокси)-3-метоксифенил)-8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(3-фтор-4-(трифторметил)фенил)-8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(3-фтор-4-(трифторметокси)фенил)-8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(2,3-диметоксифенил)-8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(2,4-диметоксифенил)-8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 8-йод-N-(4-(4-метилпиперазин-1-ил)фенил)-3Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 6-((7-фтор-3Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)-2Н-бензо[б][1,4]оксазин-3(4Н)-он; 7-фтор-N-(4-морфолинофенил)-3Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(3,4-диметоксифенил)-7-фтор-3Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 7-фтор-N-(4-(4-метилпиперазин-1-ил)фенил)-3Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 9-метокси-N-(3-(метилсульфонил)фенил)-3Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 7-((9-метокси-3Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)-3,4-дигидрохинолин-2(1Н)-он; 1-(4-(4-((9-метокси-3Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)фенил)пиперазин-1-ил)этан-1-он; N-(3,5-диметоксифенил)-8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; (4-((7-фтор-3Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)фенил)(пирролидин-1-ил)метанон; 4-((8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)-N,N-

диметилбензолсульфонамид; N-циклопропил-3-((8-метокси-2H-пиразоло[3,4-  
 с]хиолин-4-ил)амино)бензолсульфонамид; N-(4-(2H-1,2,3-триазол-2-ил)фенил)-  
 8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; 8-метокси-N-(3-  
 (метилсульфинил)фенил)-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; N-(3-(2H-1,2,3-  
 5 триазол-2-ил)фенил)-8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; 3-((8-  
 метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-ил)амино)-N-метилбензолсульфонамид;  
 8-метокси-N-(3-(морфолиносulьфонил)фенил)-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-  
 амин; 8-метокси-N-(3-((трифторметил)сульфонил)фенил)-2H-пиразоло[3,4-  
 с]хиолин-4-амин; 2-((3-((8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-  
 10 ил)амино)фенил)сульфонил)этан-1-ол; 9-метокси-N-(2-метилизоиндолин-5-ил)-  
 3H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; N-(4-((диметиламино)метил)фенил)-9-  
 метокси-3H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; N-(3,4-диметоксифенил)-8-йод-3H-  
 пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; 8-йод-N-(4-морфолинофенил)-3H-пиразоло[3,4-  
 с]хиолин-4-амин; 4-((8-йод-3H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-  
 15 ил)амино)фенил)(пирролидин-1-ил)метанон; 1-(4-(4-((8-йод-3H-пиразоло[3,4-  
 с]хиолин-4-ил)амино)фенил)пиперазин-1-ил)этан-1-он; 4-фтор-N-(4-((8-  
 метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-ил)амино)фенил)бензамид; 8-метокси-N-  
 (4-морфолино-3-нитрофенил)-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; N-(2,4-  
 дифторфенил)-8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; N-(3,4-  
 20 диметоксифенил)-9-фтор-3H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; 9-фтор-N-(3-  
 (метилсульфонил)фенил)-3H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; 9-фтор-N-(4-(4-(4-  
 метилпиперазин-1-ил)пиперидин-1-ил)фенил)-3H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-  
 амин; 9-фтор-N-(3-фтор-4-морфолинофенил)-3H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин.

25 Настоящее изобретение далее обеспечивает фармацевтические композиции,  
 содержащие одно или несколько соединений формулы (I), (Ia), (Ib), (Ic) и/или  
 (Id), указанных в данном документе, или их фармацевтически приемлемые  
 сложные эфиры, пролекарства, гидраты, сольваты или соли, необязательно в  
 комбинации с фармацевтически приемлемым носителем.

30 Фармацевтическая композиция необязательно содержит одно или  
 несколько следующих соединений или вводится в комбинации с одним или  
 несколькими из этих соединений:

Хлоргексидин; полиноксиллин; домифен; оксихинолин; неомицин; миконазол; натамицин; различные; гексетидин; тетрациклин; мепартрицин; метронидазол; клотримазол; хлортетрациклин; доксициклин; миноциклин; триамцинолон; дексаметазон; гидрокортизон; эпинефрин; бензидамин; 5 адреналон; амлексанокс; бекаплермин; алгелдрат; алоглутамол; магалдрат; алмагат; гидроталцит; алмазилат; циметидин; ранитидин; фамотидин; низатидин; ниперотидин; роксатидин; лафутидин; мизопростол; энпростил; омепразол; пантопразол; лансопразол; рабепразол; езомепразол; карбеноксолон; сукральфат; пирензепин; проглумид; гефарнат; сулгликотид; ацетоксолон; 10 золимидин; троксирид; оксифенциклимин; камилофин; мебеверин; тримсбутин; роциверин; дицикловерин; дигексиверин; дифемерин; пиперидолат; бензилон; гликопирроний; оксифеноний; пентиенат; пропантелин; метантелин; тридигексетил; изопропамид; гексоциклил; полдин; мепензолат; бевоний; пипензолат; дифеманил; фенпивериний; диметиламинопропионилфенотиазин; 15 никофетамид; тиропрамид; папаверин; дротаверин; моксаверин; алосетрон; тегасерод; цилансетрон; прукалоприд; фенпипран; диизопромин; хлорбензоксамин; пинаверий; феноверин; иданпрамин; проксазол; альверин; трефибутон; изометептен; кароверин; флороглуцинол; силиконы; триметилдифенилпропиламин; атропин; гиосциамин; бутилскополамин; 20 метилатропин; метилскополамин; фентоний; метоклопрамид; цизаприд; домперидон; бромоприд; ализаприд; клебоприд; ондансетрон; гранисетрон; трописетрон; доласетрон; палоносетрон; скополамин; хлоробутанол; метопимазин; дронабинол; набилон; апрепитант; касопитант; пипрозолин; гимекромон; циклобутирол; силимарин; цитиолон; эпомедиол; оксифенизатин; 25 бисакодил; дантрон; фенолфталеин; каскара; бизоксатин; этулоза; стеркулия; линсид; метилцеллюлоза; лактулоза; лактитол; пентаэритритил; макрогол; маннит; сорбит; глицерин; масло; альвимопан; лубипростон; нистатин; стрептомицин; паромомицин; канамицин; ванкомицин; колистин; рифаксимин; фталилсульфатиазол; сульфагуанидин; сукцинилсульфатиазол; броксихинолин; 30 ацетарсол; нифуроксазид; нифурзид; пектин; каолин; кросповидон; аттапульгит; диосмектит; дифеноксилат; опий; лоперамид; дифеноксин; преднизолон; преднизон; бетаметазон; тиксокортол; будесонид; беклометазон; сульфасалазин; месалазин; олсалазин; балсалазид; цератония; рацекадотрил; фентермин; фенфлурамин; амфепрамон; дексфенфлурамин; мазиндол; этиламфетамин;

катин; клобензорекс; мефенорекс; сибутрамин; орлистат; римонабант; диастаза; пепсин; тилактаза; фенформин; метформин; буформин; глибенкламид; хлорпропамид; толбутамид; глиборнурид; толазамид; карбутамид; глипизид; гликвидон; гликлазид; метагексамид; глизоксепид; глимепирид; ацетогексамид; 5 глимидин; акарбоза; миглитол; воглибоза; троглитазон; росиглитазон; пиоглитазон; ситаглиптин; вилдаглиптин; саксаглиптин; алоглиптин; репаглинид; натеглинид; эксенатид; прамлинтид; бенфлуорекс; лираглутид; митиглинид; толрестат; бетакаротен; эргокальциферол; дигидротахистерол; альфакальцидол; кальцитриол; колекальциферол; кальцифедиол; сулбутиамин; 10 бенфотиамин; никотинамид; биотин; инозитол; токоферсолан; декспантенол; пантетин; андростанолон; станозолол; метандиенон; метенолон; оксиметолол; хинболон; прастерон; оксандролон; норэтандролон; нандролон; этилэстренол; левокарнитин; адеметионин; глутамин; меркаптамин; бетаин; алглюцераза; имиглюцераза; ларонидаза; сакрозидаза; галсульфаза; идурсульфаз; нитизинон; 15 миглустат; сапроптерин; дикумарол; фениндион; варфарин; фенпрокумон; аценокумарол; клориндион; дифенадион; тиокломарол; гепарин; далтепарин; эноксапарин; надропарин; парнапарин; ревипарин; данапароид; тинзапарин; сулодексид; бемипарин; дитазол; хлорикромен; пикотамид; клопидогрель; тиклопидин; дипиридамом; эпопростенол; индобуфен; илопрост; абциксимаб; 20 алоксиприн; эптифибатид; тирофибан; трифлузал; берапрост; трепростинил; прасугрель; стрептокиназа; алтеплаза; анистреплаза; урокиназа; фибринолизин; бриназа; ретеплаза; саруплаза; анкрод; тенектеплаза; десирудин; лепирудин; аргатробан; мелагатран; ксимелагатран; бивалирудин; дефибротид; фондапаринукс; ривароксабан; камостат; фитоменадион; менадион; тромбин; 25 коллаген; этамзилат; карбазохром; батроксобин; ромиплостим; элтромбопаг; декстриферрон; цианокобаламин; гидроксокобаламин; кобамамид; мекобаламин; эритропозетин; альбумин; декстран; гидроксиэтилкрахмал; эритроциты; тромбоциты; углеводы; электролиты; трометамол; карбамид; цетилпиридиний; нитрофурал; сульфаметизол; тауролидин; нокситиолин; глюкоза; глицин; лизин; 30 гиалуронидаза; химотрипсин; трипсин; дезоксирибонуклеаза; бромелаины; гематин; ацетилдигитоксин; ацетилдигоксин; дигитоксин; дигоксин; десланозид; метилдигоксин; гитоформат; просцилларидин; строфантин-г; кумарин; перувозид; хинидин; прокаинамид; дизопирамид; спартеин; аймалин; праймалин; лораймин; лидокаин; мексилетин; токаинид; априндин; пропафенон;

флекаинид; лоркаинид; энкаинид; амиодарон; бунафтин; дофетилид; ибутилид;  
 тедисамил; морацизин; цибензолин; этилэфрин; изопреналин; норэпинефрин;  
 допамин; норфенефрин; фенилэфрин; добутамин; окседрин; метараминол;  
 5 метоксамин; мефентермин; диметофрин; преналтерол; допексамин; гелефрин;  
 ибопамин; мидодрин; октопамин; фенолдопам; кафедрин; арбутамин;  
 теодреналин; амринон; милринон; эноксимон; букладезин; ангиотензинамид;  
 ксамотерол; левосимендан; пропатилнитрат; тролнитрат; тенитрамин;  
 флзехинан; прениламин; оксифедрин; бензиодарон; карбокромел; гексобендин;  
 этафенон; гептаминол; имоламин; дилазеп; трапидил; молсидомин; эфлоксат;  
 10 цинепазет; клоридарол; никорандил; линсидомин; несиритид; аллпростадил;  
 камфора; индометацин; креатинолфосфат; фосфокреатин; убидекаренон;  
 аденозин; тирацизин; акадезин; триметазидин; ибупрофен; ивабрадин;  
 ранолазин; икатибант; регаденосон; ресциннамин; резерпин; дезерпидин;  
 метозерпидин; биетазерпин; клонидин; гуанфацин; толонидин; моксонидин;  
 15 рилменидин; триметафан; мекамиламин; празозин; индорамин; тримазозин;  
 доксазозин; урапидил; бетанидин; гуанетидин; гуаноксан; дебризохин;  
 гуаноклор; гуаназодин; гуаноксабенз; диазоксид; дигидралазин; гидралазин;  
 эндралазин; кадралазин; миноксидил; нитропруссид; пинацидил; вератрум;  
 метирозин; паргилин; кетансерин; бозентан; амбрисентан; ситаксентан;  
 20 бендрофлуметиазид; гидрофлуметиазид; гидрохлоротиазид; хлоротиазид;  
 политиазид; трихлорметиазид; циклопентиазид; метиклотиазид; циклотиазид;  
 мебутизид; хинетазон; клопамид; хлорталидон; мефрусид; клофенамид;  
 метолазон; метикран; ксипамид; индапамид; клорексолон; фенквизон; мерсалил;  
 теобромин; циклетанин; фуросемид; буметанид; пиретанид; торасемид;  
 25 музолимин; этозолин; спиронолактон; канренон; эплеренон; амилорид;  
 триамтерен; толваптан; кониваптан; изокусуприн; буфенин; баметан; фентоламин;  
 толазолин; циклоникат; пентифиллин; пентоксифиллин; ницерголин;  
 дигидроэргокристин; каллидиногеназа; цикланделат; феноксибензамин;  
 винкамин; моксисилит; бенциклан; винбурнин; сулоктидил; буфломедил;  
 30 нафтидрофурил; буталамин; виснадин; цетиедил; цинепазид; ифенпродил;  
 азапетин; фасудил; флуорометолон; флуокортолон; флуоцинонид; тетракаин;  
 бензокаин; цинхокаин; прокаин; оксетакаин; прамокаин; трибенозид; органо-  
 гепариноид; полидоканол; фенол; рутозид; моноксерутин; диосмин;  
 троксерутин; гидросмин; алпренолол; окспренолол; пиндолол; пропранолол;

тимолол; соталол; надолол; мепиндолол; картеолол; тертатолол; бопиндолол; бупранолол; пенбутолол; клоранолол; практолол; метопролол; атенолол; ацебутолол; бетаксоллол; бевантолол; бисопролол; целипролол; эсмолол; эпаноолол; с-атенолол; небивоолол; талинолол; лабеталоо; карведилол; амлодипин; 5 фелодипин; исрадипин; никардипин; нифедипин; нимодипин; нисолдипин; нитрендипин; лацидипин; нилвадипин; манидипин; барнидипин; лерканидипин; цилнидипин; бенидипин; мибефрадил; верапамил; галлопамил; дилтиазем; фендилин; бепридил; лидофлазин; пергексиллин; каптоприл; эналаприл; лизиноприл; периндоприл; рамиприл; хинаприл; беназеприл; цилазаприл; 10 фозиноприл; трандолаприл; спираприл; делаприл; мозксиприл; темокаприл; зофеноприл; имидаприл; лозартан; эпросартан; валсартан; ирбесартан; тасосартан; кандесартан; телмисартан; ремикирен; алискирен; симвастатин; ловастатин; правастатин; флувастатин; аторвастатин; церивастатин; розувастатин; питавастатин; клофибрат; безафибрат; гемфиброзил; фенофибрат; 15 симфибрат; ронифибрат; ципрофибрат; этофибрат; клофибрид; колестирамин; колестипол; колекстран; колесевелам; ницеритрол; никофураноза; аципимокс; декстротироксин; пробукол; тиаденол; меглутол; поликосанол; эзетимиб; гахимицин; пецилоцин; пирролнитрин; гризеофульвин; эконазол; хлормидазол; изоконазол; тиабендазол; тиоконазол; кетоконазол; сулконазол; бифоназол; 20 оксиконазол; фентиконазол; омоконазол; сертаконазол; флуконазол; флутримазол; бромохлоросалициланилид; метилрозанилин; трибромометакрезол; хлорфенезин; тиклатон; сулбентин; галопрогин; циклопирокс; тербинафин; аморолфин; димазол; толнафтат; толциклат; флуцитозин; нафтифин; бутенафин; октиноксат; декстраномер; криланомер; 25 эноксолон; коллагеназа; тонзиламин; мепирамин; теналидин; трипеленамин; хлоропирамин; прометазин; толпропамин; диметинден; клемастин; бамипин; изотипендил; дифенгидрамин; хлорфеноксамин; оксипупрокаин; хинизокаин; дитранол; триоксисален; метоксален; кальципотриол; такальцитол; тазаротен; бергаптен; этретинат; ацитретин; демеклоциклин; окситетрациклин; 30 хлорамфеникол; бацитрацин; гентамицин; тиротрицин; мупироцин; виргиниамицин; амикацин; ретапамулин; сульфатиазол; мафенид; сульфаниламид; сульфамеразин; идоксуридин; тромантадин; ацикловир; подофиллотоксин; инозин; пенцикловир; лизозим; ибацитабин; эдоксудин; имиквимод; докозанол; метилпреднизолон; клобетазон; флуметазон;

флуокортин; флуперолон; флупредниден; десонид; алклометазон; клокортолон;  
 флуклоролон; дезоксиметазон; дифлукортолон; флудроксикортид; дифлоразон;  
 амцинонид; галометазон; мометазон; флутиказон; предникарбат; дифлупреднат;  
 улобетазол; клобетазол; галцинонид; аминокридин; эуфлавин;  
 5 дибромпропамидин; пропамидин; гексамидин; полигексанид; гексахлорофен;  
 поликрезулен; триклозан; хлороксиленол; бифенилол;  
 йодин/октилфеноксиполигликолевый эфир; повидон-йодин; йодин;  
 дийодогидроксипропан; деквалиний; хлорхинальдол; клиохинол; бензалконий;  
 цетримоний; цетримид; меркурохром; тиомерсал; серебро; эозин; пропанол;  
 10 изопропанол; этанол; фрамицетин; бензододециний; йодоформ; битионол; сера;  
 тиоксолон; месульфен; третиноин; ретинол; адапален; изотретиноин;  
 мотретинид; клиндамицин; эритромицин; меклоциклин; резорцин; дапсон;  
 ихтасол; ксенисалат; другие; такролимус; пимекролимус; мехинол; тиратрикол;  
 оксацепрол; финастерид; гидрохинон; монобензон; эфлорнитин; диклофенак;  
 15 алитретиноин; кандицидин; карфециллин; пентамицин; дийодогидроксихинолин;  
 Сульфонамиды: сульфатоламид; орнидазол; азанидазол; пропенидазол;  
 бутконазол; терконазол; клодантоин; нифурател; фуразолидон; протиофат;  
 метилэргометрин; эргометрин; динопрост; динопростон; гемепрост; карбопрост;  
 сульпростон; ритодрин; фенотерол; бромкриптин; лизурид; каберголин;  
 20 хиноголид; метерголин; тергурид; напроксен; флуноксапрофен; атосибан;  
 норэтистерон; линэстренол; левоноргестрел; хингестанол; мегестрол;  
 медроксипрогестерон; норгестриенон; этоноргестрел; дезогестрел;  
 флуоксиместерон; метилтестостерон; тестостерон; местеролон;  
 этинилэстрадиол; эстрадиол; эстриол; хлортианизен; эстрон; проместриен;  
 25 диенэстрол; диетилстилбестрол; металленестрил; моксэстрол; тиболон;  
 гестонорон; гидроксипрогестерон; прогестерон; дидрогестерон; медрогестон;  
 номегэстрол; демегестон; хлормадион; промегестон; аллилэстренол; этистерон;  
 этинодиол; метилэстренолон; урофоллитропин; циклофенил; кломифен;  
 эпиместрол; ципротерон; даназол; гестринон; мифепристон; ралоксифен;  
 30 базедоксифен; эмепроний; флавоксат; меладразин; оксибутинин; теродилин;  
 пропиверин; толтеродин; солифенацин; троспий; дарифенацин; фезотеродин;  
 силденафил; йохимбин; апоморфин; тадалафил; варденафил; феназопиридин;  
 сукцинимид; дапоксетин; альфузозин; тамсулозин; теразозин; силодозин;  
 дутастерид; кортикотропин; тетракозактид; тиротропин; соматропин; соматрем;

мекасермин; серморелин; пегвисомант; вазопрессин; десмопрессин; липрессин;  
 терлипрессин; орнипрессин; аргипрессин; демокситоцин; окситоцин;  
 карбетоцин; гонадорелин; нафарелин; гистрелин; соматостатин; октреотид;  
 ланреотид; вапреотид; ганиреликс; цетрореликс; альдостерон; флудрокортизон;  
 5 дезоксикортон; параметазон; кортизон; преднилен; римексолон; дефлазакорт;  
 клопреднол; мепреднизон; кортивазол; трилостан; метилтиоурацил;  
 пропилтиоурацил; бензилтиоурацил; карбимазол; тиамазол; дийодотирозин;  
 дибромотирозин; глюкагон; терипаратид; элкатонин; цинакалцет;  
 парикальцитол; доксеркальциферол; лимециклин; метациклин; ролитетрациклин;  
 10 пенимепициклин; кломоциклин; тигециклин; тиамфеникол; ампициллин;  
 пивампициллин; карбенициллин; амоксициллин; кариндациллин;  
 бакампациллин; эпициллин; пивмециллинам; азлоциллин; мезлоциллин;  
 мециллинам; пиперациллин; тикарциллин; метампициллин; талампациллин;  
 сулбенициллин; темоциллин; гетациллин; бензилпенициллин;  
 15 феноксиметилпенициллин; пропициллин; азидоциллин; фенетициллин;  
 пенамециллин; клометоциллин; диклоксациллин; клоксациллин; метициллин;  
 оксациллин; флуклоксациллин; сульбактам; тазобактам; сультамициллин;  
 цефалексин; цефалоридин; цефалотин; цефазолин; цефадроксил; цефазедон;  
 цефатризин; цефапирин; цефрадин; цефацетрил; цефроксадин; цефтезол;  
 20 цефокситин; цефуроксим; цефамандол; цефаклор; цефотетан; цефоницид;  
 цефотиам; лоракарбеф; цефметазол; цефпрозил; цефоранид; цефотаксим;  
 цефтазидим; цефсулодин; цефтриаксон; цефменоксим; латамоксеф;  
 цефтизоксим; цефиксим; цефодизим; цефетамет; цефпирамид; цефоперазон;  
 цефподоксим; цефтибутен; цефдинир; цефдиторен; цефкапен; цефепим;  
 25 цефпиром; цефозопран; меропенем; эртапенем; дорипенем; биापенем;  
 триметоприм; бродимоприм; иклаприм; сульфаизодимидин; сульфадимидин;  
 сульфапиридин; сульфафуразол; сульфатиомочевина; сульфаметоксазол;  
 сульфадиазин; сульфамоксол; сульфадиметоксин; сульфален; сульфаметомидин;  
 сульфаметоксидазин; сульфаметоксипиридазин; сульфапериин; сульфафеназол;  
 30 сульфамазон; спирамицин; мидекамицин; олеандомицин; рокситромицин;  
 джозамицин; тролеандомицин; кларитромицин; азитромицин; миокамицин;  
 рокитамицин; диритромицин; флуритромицин; телитромицин; линкомицин;  
 пристинамицин; хинупристин/дальфопристин; стрептодоуоцин; тобрамицин;  
 нетилмицин; сизомицин; дибекацин; рибостамицин; изепамицин; арбекацин;

офлоксацин; ципрофлоксацин; пефлоксацин; эноксацин; темафлоксацин;  
 норфлоксацин; ломефлоксацин; флероксацин; спарфлоксацин; руфлоксацин;  
 грепафлоксацин; левофлоксацин; тровафлоксацин; моксифлоксацин;  
 гемифлоксацин; гатифлоксацин; прулифлоксацин; пазуфлоксацин;  
 5 гареноксацин; росоксацин; циноксацин; флумеквин; тейкопланин; телаванцин;  
 далбаванцин; оритаванцин; тинидазол; нитрофурантоин; нифуртоинол;  
 фосфомицин; ксиборнол; клофоктол; спектиномицин; метенамин; нитроксолин;  
 линезолид; даптомицин; итраконазол; вориконазол; позаконазол; каспофунгин;  
 микафунгин; анидулафунгин; циклосерин; рифампицин; рифамицин; рифабутин;  
 10 рифапентин; капреомицин; изониазид; протионамид; тиокарлид; этионамид;  
 пиразинамид; этамбутол; теризидон; морионамид; клофазимин; метисазон;  
 видарабин; рибавирин; ганцикловир; фамцикловир; валацикловир; цидофовир;  
 валганцикловир; бривудин; римантадин; фоскарнет; фосфонет; сахинавир;  
 индинавир; ритонавир; нелфинавир; ампренавир; лопинавир; фосампренавир;  
 15 атазанавир; типранавир; дарунавир; зидовудин; диданозин; зальцитабин;  
 ставудин; ламивудин; абакавир; эмтрицитабин; энтекавир; телбивудин;  
 клебудин; невирапин; делавирдин; эфавиренз; этравирин; занамивир;  
 осельтамивир; мороксидин; плеконарил; энфувиртид; ралтегравир; маравирок;  
 марибавир; паливизумаб; небакумаб; вакцина дифтерия-полиомиелит-столбняк;  
 20 дифтерия-коклюш-полиомиелит-столбняк; дифтерия-краснуха-столбняк;  
 циклофосфамид; хлорамбуцил; мелфалан; хлорметин; ифосфамид; трофосфамид;  
 преднимустин; бендамустин; бусульфан; треосульфан; манносульфан; тиотепа;  
 триазиквон; карбоквон; кармустин; ломустин; семустин; стрептозоцин;  
 фотемустин; нимустин; ранимустин; этоглюцид; митобронитол; пипоброман;  
 25 темозоломид; дакарбазин; метотрексат; ралтитрексед; пеметрексед;  
 пралатрексат; меркаптопурин; тиогуанин; кладрибин; флударабин; клофарабин;  
 неларабин; цитарабин; фторурацил; тегафур; кармофур; гемцитабин;  
 капецитабин; азацитидин; децитабин; винбластин; винкристин; виндезин;  
 винорелбин; винфлунин; этопозид; тенипозид; демеколцин; паклитаксел;  
 30 доцетаксел; трабектедин; дактиномицин; доксорубицин; даунорубицин;  
 эпирубицин; акларубицин; зорубицин; идарубицин; митоксантрон; пирарубицин;  
 валрубицин; блеомицин; пликамицин; митомицин; иксабепилон; цисплатин;  
 карбоплатин; оксалиплатин; сатраплатин; прокарбазин; эдреколомаб;  
 ритуксимаб; трастузумаб; алемтузумаб; гемтузумаб; цетуксимаб; бевацизумаб;

панитумумаб; катумаксомаб; офатумумаб; темопорфин; эфапроксирал; иматиниб; гефитиниб; эрлотиниб; сунитиниб; сорафениб; дазатиниб; лапатиниб; нилотиниб; темсиролимус; эверолимус; пазопаниб; амсакрин; аспарагиназа; алтретамин; гидроксикарбамид; лонидамин; пентостатин; милтефозин;

5 масопрокол; эстрамустин; митогуазон; топотекан; тиазофурин; иринотекан; митотан; пегаспаргаза; бексаротен; бортезомиб; целекоксиб; анагрелид; облимерсен; вориностат; ромидепсин; фосфэстрол; бусерелин; лейпрорелин; гозерелин; трипторелин; тамоксифен; торемифен; фулвестрант; флутамид; нилутамид; бикалутамид; аминоклутетимид; форместан; анастрозол; летрозол;

10 ворозол; эксеместан; абареликс; дегареликс; филграстим; молграмостим; сарграмостим; ленограстим; анцестим; пегфилграстим; альдеслейкин; опрелвекин; лентинан; рохинимекс; пегадемаза; пидотимод; тимопентин; иммуноцианин; тасонермин; мифамуртид; плериксафор; муромонаб-CD3; сиролимус; лефлуномид; алефацепт; гусперимус; ефализумаб; абетимус;

15 натализумаб; абатацепт; екулизумаб; этанерцепт; инфликсимаб; афелимомаб; адалимумаб; голимумаб; даклизумаб; базиликсимаб; анакинра; рилонацепт; устекинумаб; меполизумаб; тоцилизумаб; канакинумаб; циклоспорин; азатиоприн; талидомид; леналидомид; фенилбутазон; мофебутазон; оксифенбутазон; клофезон; кебузон; сулиндак; толметин; зомепирак;

20 алклофенак; бумадизон; этодолак; лоназолак; фентиазак; ацеметацин; дифенпирамид; оксаметацин; проглуметацин; кеторолак; ацеклофенак; бифексамак; пироксикам; теноксикам; дроксикам; лорноксикам; мелоксикам; кетопрофен; фенопрофен; фенбуфен; беноксапрофен; супрофен; пирпрофен; флурбипрофен; индопрофен; оксапрозин; ибупроксам; дексипрофен;

25 алминопрофен; декскетопрофен; рофекоксиб; вальдекоксиб; парекоксиб; эторикоксиб; лумиракоксиб; набуметон; азапропазон; глюкозамин; проквазон; орготеин; нимесулид; фепразон; диацереин; морнифлумат; тенидап; оксидинхофен; ауранофин; ауротиоглюкоза; ауротиопрол; пеницилламин; буцилламин; этофенамат; фелбинак; бендазак; суксибузон; нифеназон;

30 капсаицин; зукапсаицин; алкуроний; тубокурарин; диметилтубокурарин; суксаметоний; панкуроний; галламин; векуроний; атракурий; гексафлуроний; цисатракурий; фенпробамаат; каризопродол; метокарбамол; стирамат; фебарбамаат; хлормезанон; хлорзоксазон; баклофен; тизанидин; придинол; толперизон; тиоколхикозид; мефенезин; тетразапам; циклобензаприн; эперизон;

фенирамидол; дантролен; аллопуринол; тизопурин; фебуксостат; пробенецид; сульфинпиразон; бензбромарон; изброминдион; колхицин; цинхофен; пеглотиказа; иприфлавон; деносуаб; гидрохинин; химопапаин; галотан; хлороформ; энфлуран; трихлорэтилен; изофлуран; десфлуран; севофлуран;

5 метогекситал; гексобарбитал; тиопентал; наркобарбитал; фентанил; альфентанил; суфентанил; феноперадин; анилэридин; ремифентанил; дроперидол; кетамин; пропанидид; альфаксалон; этомидат; пропофол; эскетамин; ксенон; متابутетамин; хлоропрокаин; бупивакаин; мепивакаин; прилокаин; бутаниликаин; этидокаин; артикаин; ропивакаин; левобупивакаин;

10 кокаин; диклонин; морфин; гидроморфон; никоморфин; оксикодон; дигидрокодеин; диаморфин; папаверетум; кетобемидон; петидин; декстроморамид; пиритрамид; декстропропоксифен; безитрамид; пентазоцин; феназоцин; бупренорфин; буторфанол; налбуфин; тилидин; трамадол; дезоцин; мептазинол; тапентадол; салициламид; салсалат; этензамид; дипироцетил;

15 бенорилат; дифлунисал; гуацетисал; феназон; аминофеназон; пропифеназон; парацетамол; фенацетин; буцетин; пропацетамол; римазолий; глафенин; флоктафенин; виминол; нефопам; флупиртин; зиконотид; метоксифлуран; набиксимолс; дигидроэрготамин; эрготамин; метисергид; флумедроксон; суматриптан; наратриптан; золмитриптан; ризатриптан; алмотриптан;

20 элетриптан; фроватриптан; пизотифен; ипразохром; диметотиазин; оксеторон; метилфенобарбитал; фенобарбитал; примидон; барбексаклон; метарбитал; этотоин; фенитоин; мифенитоин; фосфенитоин; параметадион; триметадион; этадион; этосуксимид; фенсуксимид; месуксимид; клоназепам; карбамазепин; окскарбазепин; руфинамид; эсликарбазепин; валпромид; вигабатрин; прогабид;

25 тиагабин; сультиам; фенацеид; ламотригин; фелбамат; топирамат; габапентин; фенетурид; леветирацетам; зонисамид; прегабалин; стирипентол; лакосамид; карисбамат; бекламид; тригексифенидил; бипериден; метиксен; проциклидин; профенамин; дексетимид; фенглутаримид; мазатикол; борнаприн; тропатепин; этанаутин; бензатропин; этибензатропин; леводопа; мелеводопа; амантадин;

30 перголид; ропинирол; прамипексол; пирибедил; ротиготин; селегилин; разагилин; толкапон; энтакапон; будипин; хлорпромазин; левомепромазин; промазин; ацепромазин; трифлупромазин; циамемазин; хлорпроэтазин; диксиразин; флуфеназин; перфеназин; прохлорперазин; тиопропазат; трифлуоперазин; ацетофеназин; тиопроперазин; бутаперазин; перазин;

перициазин; тиоридазин; мезоридазин; пипотиазин; галоперидол; трифлуперидол; мелперон; моперон; пипамперон; бромперидол; бенперидол; флуанизон; оксипертин; молиндон; сертиндол; зипрасидон; флупентиксол; клопентиксол; хлорпротиксен; тиотиксен; зуклопентиксол; флуспирилен;

5 пимозид; пенфлуридол; локсапин; клозапин; оланзапин; кветиапин; асенапин; клотиапин; #сульпирид; сультоприд; тиаприд; ремоксиприд; амисульприд; вералиприд; левосульпирид; литий; протипендил; рисперидон; мосапрамин; зотепин; арипипразол; палиперидон; диазепам; хлордиазепоксид; медазепам; оксазепам; лоразепам; адиназолам; бромазепам; клобазам; кетазолам; празепам;

10 алпразолам; галазепам; пиназепам; камазепам; нордазепам; флудиазепам; этизолам; клотиазепам; клоксазолам; тофизолам; гидроксизин; каптодиам; мепробамат; эмилкамат; мебутамат; бензоктамин; буспирон; мефеноксалон; гедокарнил; этифоксин; пентобарбитал; амобарбитал; бутобарбитал; барбитал; апробарбитал; секобарбитал; талбутал; винилбитал; винбарбитал;

15 циклобарбитал; гептабарбитал; репосал; эталлобарбитал; аллобарбитал; проксибарбал; хлоралодол; дихлоральфеназон; паральдегид; флуразепам; нитразепам; флунитразепам; эстазолам; триазолам; лорметазепам; темазепам; мидазолам; бротизолам; квазепам; лопразолам; доксефазепам; цинолазепам; глутетимид; метиприлон; пиритилдион; зопиклон; золпидем; залеплон;

20 эсзопиклон; мелатонин; рамелтеон; метаквалон; клометиазол; бромизовал; карбромал; пропиомазин; триклофос; этхлорвинол; валериана; гексапропимат; бромиды; апронал; валноктамид; метилпентинол; ниапразин; дексмедетомидин; дезипрамин; имипрамин; кломипрамин; опипрамол; тримипрамин; лофепрамин; дибензепин; амитриптилин; нортриптилин; протриптилин; доксепин; иприндол;

25 мелитрацен; бутриптилин; досулепин; амоксапин; диметакрин; аминептин; мапротилин; хинупрамин; зимелдин; флуоксетин; циталопрам; пароксетин; сертралин; алапроклат; флувоксамин; этоперидон; эсциталопрам; изокарбоксазид; ниаламид; фенелзин; транилципромин; ипрониазид; ипроклозид; моклобемид; толоксатон; окситриптан; триптофан; миансерин;

30 номифензин; тразодон; нефазодон; минаприн; бифемелан; виллоксазин; оксафлозан; миртазапин; бупропион; медифоксамин; тианептин; пивагабин; венлафаксин; милнаципран; ребоксетин; гепирон; дулоксетин; агомелатин; десвенлафаксин; амфетамин; дексамфетамин; метамфетамин; метилфенидат; пемолин; фенкамфамин; модафинил; фенозолон; атомоксетин; фенетиллин;

дексметилфенидат; кофеин; пропентофиллин; меклофеноксат; пиритинол; пирацетам; деанол; фипексид; цитиколин; оксирацетам; пирусуданол; линопирдин; низофенон; анирацетам; ацетилкарнитин; идебенон; пролинтан; пипрадрол; прамирацетам; адрафинил; винпоцетин; такрин; донепезил;

5 ривастигмин; галантамин; мемантин; неостигмин; пиридостигмин; дистигмин; амбеноний; карбахол; бетанехол; пилокарпин; цевимелин; никотин; варениклин; дисульфирам; акампросат; налтрексон; метадон; левацетилметадол; лофексидин; бетагистин; циннаризин; флунаризин; ацетиллейцин; тирилазад; рилузол; ксалипроден; амифампридин; тетрабеназин; тилброхинол; ниморазол;

10 секнидазол; дилоксанид; клсфамид; этофамид; теклозан; арстинол; дифетарзон; гликобиарсол; хиниофон; эметин; фанхинон; мепакрин; атоваквон; триметрексат; тенонитрозол; дигидроеметин; фумагиллин; нитазоксанид; хлорохин; гидроксихлорохин; примахин; амодиахин; прогуанил; хинин; мефлохин; пириметамин; артемизинин; артеметер; артесунат; артемотил;

15 артенимол; галофантрин; бензнидазол; нифуртимокс; меларсопрол; празиквантел; оксамнихин; метрифонат; ниридазол; стибофен; триклабендазол; мебендазол; албендазол; циклобендазол; флубендазол; фенбендазол; пиперазин; диетилкарбамазин; пирантел; оксантел; левамизол; ивермектин; пирвиний; бефений; никлосамид; десаспидин; дихлорофен; диксантоген; тирам;

20 клофенотан; линдан; пиретрум; биоаллетрин; фенотрин; перметрин; малатион; квассия; цифлутрин; циперметрин; декаметрин; тетраметрин; диэтилтолуамид; диметилфталат; дибутилфталат; дибутилсукцинат; диметилкарбат; этогексадиол; циклопентамин; эфедрин; оксиметазолин; тетризолин; ксилометазолин; нафазолин; трамазолин; метизолин; туаминогептан; феноксазолин; тимазолин;

25 левокабастин; азеластин; антазолин; недокромил; олопатадин; флунизолид; ритиометан; фенилпропаноламин; псевдоэфедрин; амбазон; бензетоний; миристил-бензалконий; гексилрезорцин; фузафунгин; грамицидин; орципреналин; салбутамол; тербуталин; римитерол; гексопреналин; изоэтарин; пирбутерол; третохинол; карбутерол; тулобутерол; салметерол; формотерол;

30 кленбутерол; репротерол; прокатерол; битолтерол; индакатерол; циклесонид; фенспирид; метоксифенамин; бамбутерол; дипрофиллин; проксифиллин; теофиллин; аминофиллин; этамифиллин; бамифиллин; буфиллин; доксофиллин; зафирлукаст; пранлукаст; монтелукаст; ибудиласт; эпрозинол; омализумаб; сератродаст; рофлумиласт; тилоксапол; гуаифенезин; ипекакуана; сенега;

креозот; гваяколсульфонат; левовербенон; ацетилцистеин; бромгексин; карбоцистеин; эпразинон; месна; амброксол; собрерол; домйодол; летостеин; степронин; тиопронин; нелтенексин; эрдостеин; этилморфин; гидрокодон; кодеин; норметадон; носкапин; фолкодин; декстрометорфан; тебакон;

5 димеморфан; ацетилдигидрокодеин; бензонатат; бенпроперин; клобутинол; изоаминил; пентоксиверин; оксоламин; окселадин; клофеданол; пипазетат; бутамират; федрилат; зипепрол; дибунат; дроксипропин; преноксидиазин; дропропизин; клоперастин; мепротиксол; пиперидион; типепидин; морклофон; непиналон; леводропропизин; диметоксанат; бромазин; дифенилпиралин;

10 карбиноксамин; доксиламин; бромфенирамин; дексхлорфенирамин; хлорфенамин; фенирамин; дексбромфенирамин; таластин; гистапирродин; метапирилен; алимемазин; тиэтилперазин; метдилазин; гидроксипрометазин; тиазинам; меквитазин; оксомемазин; буклизин; циклизин; хлорциклизин; меклозин; оксатомид; цетиризин; левоцетиризин;

15 ципрогептадин; фениндамин; трипролидин; пирробутаин; азатадин; астемизол; терфенадин; лоратадин; мебгидролин; дептропин; кетотифен; акривастин; тритогуалин; эбастин; пиметиксен; эпинастин; мизоластин; фексофенадин; дезлоратадин; рупатадин; доксапрам; никетамид; пентетразол; этамиван; бемеград; преткамид; алмитрин; димефлин; мепиксанокс; дигидрострептомицин;

20 микрономицин; азидамфеникол; сульфадикарамид; сульфацетамид; сульфафеназол; трифлуридин; интерферон; фомивирсен; биброкатол; пиклоксидин; медризон; формокортал; лотепреднол; пранопрофен; непафенак; бромфенак; дипивефрин; апраклонидин; бримонидин; экотиопат; демекарий; физостигмин; флуостигмин; ацеклидин; ацетилхолин; параоксон; ацетазоламид;

25 диклофенамид; дорзоламид; бринзоламид; метазоламид; левобунолол; метипранолол; бефунолол; латанопрост; унопростон; биматопрост; травопрост; тафлупрост; дапипразол; циклопентолат; гоматропин; тропикамид; лодоксамид; эмедастин; проксиметакаин; флуоресцеин; гипромеллоза; вертепорфин; анекортав; пегаптаниб; ранибизумаб; гвайазулен; алум; йодогепаринат;

30 налорфин; эдетаты; пралидоксим; тиосульфат; димеркапрол; обидоксим; протамин; налоксон; флумазенил; метионин; холинэстераза; глутатион; фомепизол; сугаммадекс; дефероксамин; деферипрон; деферазирокс; севеламер; дексразоксан; амифостин; расбуриказа; палифермин; глукарпидаза; кислород; гелий; азот; налфурафин; синкалид; церулетид; метирапон; кортикорелин;

соматорелин; галактоза; сульфобромофталеин; туберкулин; бетазол; пентагастрин; фенолсульфонфталеин; алсактид; протирелин; секретин; бентиромид; йодамид; метиодал; диодон; метризамид; йогексол; йопамидол; йопромид; йотролан; йоверсол; йопентол; йодиксанол; йомепрол; йобитридол; 5 йоксилан; адипиодон; йопидол; пропилайодон; йофендилат; гадодиамид; гадотеридол; мангафодипир; гадоверсетамид; гадобутрол; гадофосвесет; ферумоксил; ферристен; перфлуброн; перфленапент.

10 Еще одна цель настоящего изобретения заключается в обеспечении соединения формулы (I), (Ia), (Ib), (Ic) и/или (Id), указанного в данном документе, или фармацевтической композиции, указанной в данном документе, для приготовления лекарственного средства для лечения одного или нескольких упомянутых здесь заболеваний.

15 Предпочтительно соединения настоящего изобретения можно применять для лечения и/или предотвращения следующих состояний:

заболевания и нарушения дыхательных путей/обструктивные заболевания и нарушения дыхательных путей, в том числе:

20 ринорея, сужение трахеи, сжатие дыхательных путей, острый-, аллергический, атрофический ринит или хронический ринит (такой как хронический ринит с образованием казеозных масс, гипертрофический ринит, гнойный ринит, сухой ринит), медикаментозный ринит, мембранозный ринит (включая крупозный, фибринозный и псевдомембранозный ринит), 25 скрофулезный ринит, круглогодичный аллергический ринит, сезонный ринит (включая нервный ринит (сенную лихорадку) и вазомоторный ринит), поллиноз, астма (такая как бронхиальная, атопическая, аллергическая, наследственная, приобретенная астма, астма физического напряжения, астма, вызываемая холодным воздухом, профессиональная астма, астма, вызываемая бактериальной 30 инфекцией, и астма, вызываемая пылью, в частности, хроническая или застарелая астма (например, поздняя астма и гиперчувствительность дыхательных путей)), бронхит (включая хронический, острый, арахидиновый, катаральный, крупозный, гнойный туберкулезный и эозинофильный бронхит), кардиобронхит, пневмокониоз, хроническое воспалительное заболевание легких,

которое приводит к интерстициальному фиброзу, такое как интерстициальное заболевание легких (ИЗЛ) (например, идиопатический легочный фиброз, или ИЗЛ, связанное с ревматоидным артритом, или другими аутоиммунными состояниями), острое повреждение легких (ОПЛ), респираторный дистресс-синдром взрослых (РДСВ), хроническое обструктивное пульмональное заболевание, хроническое обструктивное заболевание дыхательных путей или легких (ХОРЗ, ХОЗДП, ХОЗЛ или ХОПЗ, такое как необратимое ХОПЗ), хронический синусит, конъюнктивит (например, аллергический конъюнктивит), фиброзно-кистозная дегенерация, приобретенный аллергический альвеолит (подобный аллергическому альвеолиту у сельскохозяйственных рабочих и связанным заболеваниям), пневмосклероз, заболевания гиперчувствительности легких, пневмонит гиперчувствительности, идиопатическая интерстициальная пневмония, заложенность носа, полипоз носа, отит среднего уха, и кашель (хронический кашель, связанный с воспалением или ятрогенно индуцированный), плеврит, легочная гиперемия, эмфизема, бронхоэктазия, саркоидоз, фиброз легких, включая криптогенный фиброзирующий альвеолит, фиброз, осложняющий противоопухолевую терапию и хроническую инфекцию, включая туберкулез и аспергиллез и другие микозы, васкулитные и тромботические нарушения сосудистой сети легкого, и легочная гипертензия, острая вирусная инфекция, включая простуду, и инфекция, вызванная респираторно-синцитиальным вирусом, гриппом, коронавирусом (включая ТОРС) и аденовирусом, аллергический бронхолегочный микоз, эмфизема, диффузный панбронхиолит, системные анафилактические реакции или реакции гиперчувствительности, лекарственные аллергии (например, к пенициллину, цефалоспорином), аллергические реакции на укус насекомого, и пищевые аллергии, которые могут оказывать действия, не имеющие отношения к пищеварительному тракту (такие как мигрень, ринит и экзема), анафилактический шок, спазмы сосудов;

заболевания и нарушения костей и суставов, в том числе:  
остеопороз, артрит (включая ревматический, инфекционный, аутоиммунный, хронический, злокачественный), серонегативная спондилоартропатия (такая как анкилозирующий спондилит, ревматоидный спондилит, псориатический артрит, энтезопатия, болезнь Бехчета, артрит

Штрюмпеля-Мари, артрит при воспалительном заболевании кишечника, и болезнь Рейтера), системный склероз, остеоартрит, остеоартроз, и первичный, и вторичный, например, к врожденной дисплазии тазобедренного сустава, шейный и поясничный спондилит, и поясничная боль и боль в шее, болезнь Стилла, реактивный артрит и недифференцированная спондилтропатия, септический артрит и другие связанные с инфекцией артропатии и нарушения костей, такие как туберкулез, включая болезнь Потта и синдром Понсе, острый и хронический кристалл-индуцированный синовит, включая уратную подагру, заболевание вследствие отложения пирофосфата кальция, и воспаление сухожилий, синовиальной сумки и синовиальной жидкости, связанное с апатитом кальция, первичный и вторичный синдром Шегрена, системный склероз и ограниченная склеродермия, заболевание соединительной ткани смешанного типа, и недифференцируемое заболевание соединительной ткани, воспалительные миопатии, включая, ревматическую полимиалгию, ювенильный артрит, включая идиопатические воспалительные артриты суставов любой локализации и ассоциированные синдромы, другое заболевание суставов (такое как дегенерация межпозвонковых дисков или дегенерация височно-нижнечелюстного сустава), ревматическая лихорадка и ее системные осложнения, васкулиты, включая гигантоклеточный артериит, синдром Такаясу, нодозный полиартериит, микроскопический полиартериит, и васкулиты, связанные с вирусной инфекцией, реакциями гиперчувствительности, криоглобулинами, парапротеинами, поясничная боль, семейная средиземноморская лихорадка, синдром Макла-Уэльса и семейная ирландская лихорадка, болезнь Кикучи, индуцированные приемом лекарственных препаратов артралгии, тендонитиды, полихондрия, и миопатии, остеопороз, остеомалация-подобный остеопороз, остеопения, несовершенный остеогенез, остеопетроз, остеофиброз, остеонекроз, болезнь Педжета (костей), гипофосфатемия, синдром Фелти, болезнь Стилла, ослабление имплантированного искусственного сустава, растяжение или переутомление мышцы или сустава, тендинит, фасцит, плечелопаточный периартрит, шейно-плечевой синдром, тендосиновит;

заболевания и нарушения кожи и глаз, в том числе:

глаукома, внутриглазная гипертензия, катаракта, отслоение сетчатки, псориаз (включая вульгарный псориаз, пустулезный псориаз, артритический псориаз, псориагическая эритродермия), ладонно-подошвенный пустулез, ксеродерма, экзематозные заболевания (подобные атопическому дерматиту, 5 дерматиту от воздействия ультрафиолетового излучения, контактному дерматиту, и себорейному дерматиту), фитодерматит, фотодерматит, кожная эозинофилия, хронические кожные язвы, кожная красная волчанка, контактная гиперчувствительность/аллергический контактный дерматит (включая чувствительность к ядовитому плющу, сумаху, или дубу), и эозинофильный 10 фолликулит (эозинофильный пустулез Офуджи), зуд, лекарственная сыпь, крапивница (острая или хроническая, аллергическая или неаллергическая), акне, эритема, герпетический дерматит, склеродермия, витилиго, красный плоский лишай, склеротический атрофический лишай, гангренозная приодермия, саркоид кожи, пузырчатка, пузырчатка глаз, пемфигоид, буллезный эпидермоз, 15 ангионевротический отек, васкулиты, токсические эритемы, кожная эозинофилия, гнездная алопеция, облысение по мужскому типу, синдром Свита, синдром Стивенса–Джонсона, синдром Вебера-Крисчена, мультиформная эритема, целлюлит, инфекционный и неинфекционный, панникулит, кожные лимфомы, немеланомный рак кожи и другие диспластические поражения, 20 блефарит, ирит, передний и задний увеит, хориоидит, аутоиммунные, дегенеративные или воспалительные нарушения, затрагивающие сетчатку, офтальмия, включая симпатическую офтальмию, саркоидоз, ксероз, инфекции, включая вирусные, грибковые, и бактериальные, аллергический конъюнктивит, усиленный фиброз, келоид, последствия иссечения келоида, послеоперационные 25 рубцы, буллезный эпидермоз, сухой глаз, воспаление глаз, аллергический конъюнктивит, весенний конъюнктивит, весенний кератоконъюнктивит, и гигантский папиллярный конъюнктивит, глазной ангиогенез, поражение и рубцы роговицы, все формы дегенерации желтого пятна, макулярный отек, макулярная дистрофия, аномальное заживление ран, склерит, эписклерит, пахидермия, 30 периферический язвенный кератит, кератит, вызванный грибковой инфекцией, герпетический кератит, инвазивный аспергиллез; коническая роговица, эпителиальная дистрофия роговицы, тяжелое внутриглазное воспаление;

заболевания и нарушения желудочно-кишечного тракта и абдоминальные заболевания и нарушения, в том числе:

5 глютеиновая болезнь/глютенная энтеропатия (например, целиакия-спру), холецистит, энтерит (включая инфекционный, ишемический, лучевой, лекарственный и эозинофильный гастроэнтерит), эозинофильный эзофагит, эозинофильное желудочно-кишечное воспаление, аллерген-индуцированная диарея, энтеропатия, связанная с серонегативными артропатиями, гастрит, аутоиммунный атрофический гастрит, ишемическая болезнь кишечника, воспалительное заболевание кишечника (болезнь Крона и неспецифический язвенный колит), колит, язва Мурена, раздражающий кишечный синдром, некротический энтероколит, ишемия кишечника, глоссит, гингивит, периодонтит, эзофагит, включая рефлюкс, проктит, фиброз и цирроз печени, панкреатит, как острый, так и хронический, фиброз поджелудочной железы, склероз поджелудочной железы, панкреатолитиаз, цирроз печени, гепатит 10 (застойный, аутоиммунный, острый, молниеносный, хронический, лекарственный, алкогольный, волчаночный, стеатогепатит и хронический вирусный), жировая инфильтрация печени, первичный билиарный цирроз, печеночная порфирия, и связанные с желудочно-кишечным трактом аллергические нарушения, синдром раздраженной ободочной кишки, дивертикулит, желудочно-кишечное кровотечение, болезнь Бехчета; частичная резекция печени, острый некроз печени (например, некроз, вызванный токсинами, вирусным гепатитом, ударом или аноксией), гемолитический уремический синдром;

25 нарушения со стороны кроветворной системы, в том числе:

анемии, нарушения коагуляции, миелопролиферативные нарушения, геморрагические расстройства, лейкопения, эозинофильные нарушения, лейкозы (например, миелогенный лейкоз, лимфомы, плазмноклеточная дегенерация, нарушения селезенки, болезнь Банти, гемофилия, пурпура (включая 30 идиопатическую тромбоцитопеническую пурпуру), синдром Вискотта-Олдрича;

нарушения обмена веществ, в том числе:

ожирение, амилоидоз, расстройства метаболизма аминов и кислот, подобные болезням разветвленных цепей, гипераминоацидемии,

гипераминоацидурии, расстройства метаболизма мочевины, гипераммониемия, мукополисахаридоз, например, синдром Марото-Лами, болезнь накопления, подобная болезням накопления гликогена и болезням накопления липидов, гликогенозные заболевания I, подобные болезни Кори, малабсорбционные

5 заболевания, подобные кишечной малабсорбции углеводов, дефицит олигосахаридов, подобный мальтазной-, лактазной-, сахарозной недостаточности, нарушения метаболизма фруктозы, нарушения метаболизма галактозы, галактоземия, расстройства потребления углеводов, подобные

10 диабету, гипогликемии, расстройства метаболизма пирувата, гипоплипидемия, гипопропротеинемия, гиперлипидемия, гиперпропротеинемия, дефицит карнитина или карнитин ацилтрансферазы, расстройства метаболизма порфирина, порфиринов, расстройства метаболизма пуринов, лизосомные

15 заболевания, заболевания обмена веществ нервов и нервных систем, подобные ганглиозидозу, сфинголипидозу, сульфатидозу, лейкодистрофии, синдрому Леша - Найхана;

нарушения функции мозжечка, расстройства обмена веществ в тканях головного мозга, такие как:

20 деменция, болезнь Альцгеймера, болезнь Хантингтона, болезнь Паркинсона, болезнь Пика, токсическая энцефалопатия, демиелинизирующая невропатия, подобная воспалительной невропатии, синдрому Гийена-Барре; заболевание Меньера и радикулопатия, первичные и вторичные нарушения

25 обмена веществ, связанные с гормональными дефектами, подобные любому нарушению, связанному либо с гиперфункцией, либо с гипофункцией некоторых секретирующих гормоны эндокринных желез, и любой их комбинации. Синдром

30 Сиппла, дисфункция гипофиза и ее влияние на другие эндокринные железы, такие как щитовидная железа, надпочечные железы, яичники, и семенники, акромегалия, гипер- и гипотиреозидизм, эутиреоидный зоб, синдром эутиреоидной слабости, тиреоидит, и рак щитовидной железы, избыточная или недостаточная

30 выработка стероидных гормонов надпочечников, адреногенитальный синдром, синдром Кушинга, болезнь Аддисона - коры надпочечников, пернициозная анемия Аддисона, первичный и вторичный альдостеронизм, несахарный диабет, сахарный диабет, карциноидный синдром, расстройства, вызванные дисфункцией паращитовидной железы, дисфункция островковых клеток

поджелудочной железы, диабет, расстройства эндокринной системы женщин, подобные дефициту эстрогена, синдрому резистентных яичников; мышечная слабость, миотония. Миопатия Дюшенна и другие мышечные дистрофии, миотоническая дистрофия Штейнерта, митохондриальные миопатии, подобные

5 расстройствам I катаболического метаболизма в мышцах, миопатия, обусловленная накоплением углеводов и липидов, гликогеноз, миоглобинурия, злокачественная гипертермия, ревматическая полимиалгия, дерматомиозит, множественный миозит, первичное заболевание миокарда, кардиомиопатия;

10 нарушения эктодермы, нейрофиброматоз, склеродермия и полиартериит, синдром Луи-Бара, болезнь Гиппеля-Линдау, синдром Стерджа-Вебера, туберозный склероз, амилоидоз, порфирия; сексуальная дисфункция у мужчин и женщин; спутанное сознание и приступы вследствие неуместной секреции антидиуретического гормона из гипофиза, синдром Лиддла, синдром Барттера, синдром Фанкони I, и потеря электролитов через почки;

15 состояния, связанные с отторжением трансплантата, в том числе:

острое и хроническое отторжение аллотрансплантата вследствие пересадки цельного органа, например, трансплантации почки, сердца, печени, легкого, и роговицы, хроническая болезнь "трансплантат против хозяина", отторжение

20 трансплантата кожи, и отторжение трансплантата костного мозга, иммуносупрессия;

состояния, связанные с мочеполовой системой, в том числе:

нефрит (интерстициальный, острый интерстициальный (аллергический), и

25 гломерулонефрит), нефротический синдром, цистит, включая острый и хронический (интерстициальный) цистит и язву Ханнера, острый и хронический уретрит, простатит, эпидидимит, оофорит, сальпингит, вульвовагинит, вульвовагинальный кандидоз, болезнь Пейрони, и эректильная дисфункция, заболевание почек, почечный фиброз, пиелонефрит, вторичная сморщенная

30 почка, стероид-зависимый и стероид-устойчивый нефроз, синдром Гудпасчера;

заболевания и нарушения ЦНС, в том числе:

нейродегенеративные заболевания, болезнь Альцгеймера и другие дементные нарушения, включая БКЯ и новый вариант БКЯ, амилоидоз, и другие

демиелинизирующие синдромы, церебральный атеросклероз и васкулит, темпоральный артериит, миастения гравис, острая и хроническая боль (острая, периодическая или постоянная, либо центрального, либо периферического происхождения), включая послеоперационную, висцеральную боль, головную боль, мигрень, невралгию (включая тройничную), атипичную лицевую боль, боль в суставах и костях, боль, возникающую в результате рака и опухолевой инвазии, невропатические болевые синдромы, включая диабетическую, постгерпетическую и ВИЧ-ассоциированную невропатии, нейросаркоидоз, травмы головного мозга, цереброваскулярные заболевания и их последствия, болезнь Паркинсона, кортикобазальная дегенерация, болезнь двигательного нейрона, деменция, включая ALS (амиотрофический боковой склероз), рассеянный склероз, травматическое повреждение головного мозга, удар, постинсультное, посттравматическое повреждение головного мозга и заболевание малых церебральных сосудов, деменции, сосудистая деменция, деменция с тельцами Леви, лобно-височная деменция и паркинсонизм, связанный с хромосомой 17, лобно-височные деменции, такие как болезнь Пика, прогрессирующий надъядерный паралич, кортикобазальная дегенерация, болезнь Хантингтона, таламическая дегенерация, ВИЧ деменция, шизофрения с деменцией, и психоз Корсакова, в значении определения также рассматривают ЦНС нарушения, осложнения центральной и периферической нервной системы в связи со злокачественными, инфекционными или аутоиммунными процессами, повышенная чувствительность к боли, церебральный инфаркт, атака, ишемия головного мозга, черепно-мозговая травма, повреждение спинного мозга, миелопатическая мышечная атрофия, синдром Шая-Дрейджера, синдром Рейе, прогрессирующая мультифокальная лейкоэнцефалопатия, нормотензивная гидроцефалия, склерозирующий панэнцефалит, деменция лобной доли, острый передний полиомиелит (полиомиелит), невроз, вирусный энцефалит, аллергический энцефаломиелит, эпилептическая энцефалопатия, болезнь Крейтцфельда - Якоба, заболевание Куру, губчатая энцефалопатия крупного рогатого скота (коровье бешенство), почесуха, эпилепсия, церебральная амилоидная ангиопатия, депрессия, мания, маниакально-депрессивный психоз, наследственная мозжечковая атаксия, периферическая нейропатия, синдром Насу-Хакола, болезнь Мачадо-Джозефа;

воспалительные или иммунологические заболевания или нарушения, в том числе:

5 неспецифическое воспаление (воспаление глаз, носовых ходов, легких и желудочно-кишечных путей), мастоцитоз/нарушения тучных клеток (кожный(-e), системный(-e), синдром активации тучных клеток, и заболевания тучных  
10 клеток у детей), мастит (молочной железы), вагинит, васкулит (например, некротический, кожный, и аллергический васкулит), гранулематоз Вегенера, миозит (включая полимиозит, дерматомиозит), заболевания, связанные с базофилами, включая базофильный лейкоз и базофильный лейкоцитоз, и  
15 заболевания, связанные с эозинофилами, такие как синдром Черджа-Строса, эозинофильная гранулема, эритематозная волчанка (такая как системная эритематозная волчанка, подострая кожная эритематозная волчанка, и дискоидная эритематозная волчанка), хронический тиреоидит, тиреоидит Хашимото, базедова болезнь, диабет I типа, осложнения, возникающие в связи с  
20 сахарным диабетом, другие иммунологические нарушения, эозинофильный фасцит, синдром гиперпродукции IgE, болезнь Аддисона, антифосфолипидный синдром, иммунодефицитное заболевание, синдром приобретенного иммунодефицита (СПИД), проказа, синдром Сезари, паранеопластический синдром, и другие аутоиммунные нарушения, повышение температуры тела,  
25 миозит, нервные заболевания, такие как множественный миозит, бурсит, синдром Эвана, лейкотриен В4-опосредованные заболевания, идиопатический гипопаратиреоз, нефротический синдром при волчанке, иммуносупрессия;

сердечно-сосудистые заболевания и нарушения, в том числе:

25 застойная сердечная недостаточность, инфаркт миокарда, ишемические заболевания сердца, все виды предсердной и желудочковой аритмии, гипертензия, травма головного мозга, окклюзионное заболевание сосудов, удар, нарушение мозгового кровообращения, атеросклероз, рестеноз, ухудшения коронарного и периферического кровообращения, перикардит, миокардит,  
30 воспалительная и аутоиммунная кардиомиопатии, включая миокардиальный саркоид, эндокардит, вальвулит, и аортит, включая инфекционный (например, сифилитический), гипертензия сосудистого происхождения, заболевания периферических кровеносных сосудов, и атеросклероз, васкулиты, нарушения проксимальных и периферических вен, включая флебит и тромбоз, включая

тромбоз глубоких вен и осложнения варикозных вен, аневризма аорты, узелковый периартериит, фиброз сердца, состояния после перенесенного инфаркта миокарда, идиопатическая кардиомиопатия; ангиопластика;

5 онкологические заболевания и нарушения, в том числе:

общий рак (опухоли предстательной железы, молочной железы, легкого, яичника, поджелудочной железы, кишечника и ободочной кишки, брюшной полости, желудка (и любые другие типы рака пищеварительной системы), печени, поджелудочной железы, брюшины, эндокринных желез (надпочечных желез, околощитовидной железы, гипофиза, яичек, яичников, вилочковой железы, щитовидной железы), глаза, головы, шеи, нервной системы (центральной и периферической), лимфатической системы, крови, таза, кожи, костей, мягких тканей, селезенки, грудной клетки, мочеполовой системы, и головного мозга), рак молочной железы, рак мочеполовой системы, рак легкого, 15 рак желудочно-кишечного тракта, плоскоклеточный рак, меланома, рак яичника, рак поджелудочной железы, нейробластома, злокачественные новообразования, затрагивающие костный мозг (включая лейкозы) и лимфопролиферативные системы, такие как лимфома Ходжкина и не-ходжкинская лимфома, В-клеточная лимфома, фолликулярная лимфома, метастатическое заболевание и рецидивы 20 опухолей, и паранеопластические синдромы, а также гипергаммаглобулинемия, лимфопролиферативные заболевания, нарушения и/или состояния, парапротеинемии, пурпура (включая идиопатическую тромбоцитопеническую пурпуру), макроглобулинемия Вальденстрема, болезнь Гоше, гистиоцитоз, ретинобластома и любое другое гиперпролиферативное заболевание, саркомы, 25 кахексия, рост опухоли, опухолевая инвазия, метастазирование, СПИД-ассоциированные лимфомы, злокачественные иммунопролиферативные заболевания, множественная миелома и злокачественные новообразования плазматических клеток, лимфоидный лейкоз, острый или хронический миелоидный лейкоз, острый или хронический лимфоцитарный лейкоз, 30 моноцитарный лейкоз, другие лейкозы из определенного типа клеток, лейкозы из неопределенного типа клеток, другие и неопределенные злокачественные новообразования лимфоидной, гематопозитической и родственных тканей, например, диффузная крупноклеточная лимфома, Т-клеточная лимфома или Т-

клеточная лимфома кожи. Миелоидный рак включает, например, острый или хронический миелоидный лейкоз, кератолейкому и

другие заболевания и нарушения, в том числе:

- 5           боль, мигрень, нарушения сна, лихорадка, сепсис, идиопатическая тромбоцитопеническая пурпура, послеоперационные спайки, гиперемия, ишемическое/реперфузионное повреждение в сердце, головном мозге, периферических конечностях, бактериальные инфекции, вирусные инфекции, грибковые инфекции, тромбоз, эндотоксиновый шок, септический шок,
- 10           нарушения терморегуляции, включая лихорадку, болезнь Рейно, гангрену, заболевания, требующие антикоагуляционной терапии, застойная сердечная недостаточность, нарушения секреции слизи, легочная гипертензия, индуцированное простаноидами сокращение гладких мышц, связанное с дисменореей и преждевременными родами, преждевременные роды при
- 15           незрелости плода, реперфузионное повреждение, ожог, термическое повреждение, кровотечение или травматический шок, менструальная боль, менструальные спазмы, дисменорея, периодонтит, риккетсиозное инфекционное заболевание, протозойное заболевание, заболевание репродуктивной системы, зубная боль, боль после удаления зуба, опоясывающий лишай, простой герпес,
- 20           ретроперитонеальный фиброз, различные радиационные поражения и т.п.

Терапевтически эффективное количество соединения в соответствии с настоящим изобретением означает количество соединения, которое является эффективным для предотвращения, облегчения или улучшения симптомов

25           заболевания или продления выживаемости субъекта, получающего лечение. Определение терапевтически эффективного количества находится в рамках специальных знаний в данной области техники.

Терапевтически эффективное количество или дозировка соединения в

30           соответствии с настоящим изобретением может изменяться в широких пределах и может быть определено(-а) способом, известным в данной области техники. Такая дозировка может быть отрегулирована с учетом индивидуальных требований в каждом отдельном случае, в том числе, с учетом конкретного

соединения, подлежащего введению, пути введения, состояния, подлежащего лечению, а также пациента, подлежащего лечению.

5           Примерами фармакологически приемлемых солей в достаточной мере  
основных соединений формулы (I), (Ia), (Ib), (Ic) и (Id) являются соли с  
физиологически приемлемыми минеральными кислотами, подобными  
хлористоводородной, бромистоводородной, серной и ортофосфорной кислоте;  
или соли с органическими кислотами, подобными метансульфоновой, п-  
10   толуолсульфоновой, молочной, уксусной, трифторуксусной, лимонной,  
янтарной, фумаровой, малеиновой и салициловой кислоте. Более того, в  
достаточной мере кислое соединение формулы (I), (Ia), (Ib), (Ic) и (Id) может  
образовывать соли с щелочным или щелочноземельным металлом, например,  
соли натрия, калия, лития, кальция или магния; соли аммония; или соли с  
органическим основанием, например, соли метиламина, диметиламина,  
15   триметиламина, триэтиламина, этилендиамина, этаноламина, гидроксида холина,  
меглюмина, пиперидина, морфолина, трис-(2-гидроксиэтил)амина, лизина или  
аргинина; все из которых также являются дополнительными примерами солей  
формул (I), (Ia), (Ib), (Ic) и (Id). Соединения формулы (I), (Ia), (Ib), (Ic) и (Id)  
могут быть сольватированными, в особенности, гидратированными.  
20   Гидратизация/гидратация может происходить в процессе получения или  
вследствие гигроскопической природы изначально безводных соединений  
формулы (I), (Ia), (Ib), (Ic) и (Id). Сольваты и/или гидраты, например, могут  
присутствовать в твердой или жидкой форме.

25           Следует учитывать, что определенные соединения формулы (I), (Ia), (Ib),  
(Ic) и (Id) могут иметь таутомерные формы, из которых только одна может быть  
особо упомянута или изображена в следующем описании, различные  
геометрические изомеры (которые обычно обозначаются как цис/транс-изомеры  
или в более общем смысле как (E) и (Z) изомеры) или различные оптические  
30   изомеры как результат наличия одного или нескольких хиральных атомов  
углерода (которые обычно называются по номенклатуре Кана-Ингольда-Прелога  
или системе R/S). Все эти таутомерные формы, геометрические или оптические  
изомеры (а также рацематы и диастереомеры) и полиморфные формы включены  
в изобретение. Поскольку соединения формулы (I), (Ia), (Ib), (Ic) и (Id) могут

содержать асимметричные С-атомы, они могут присутствовать либо в виде ахиральных соединений, смесей диастереомеров, смесей энантиомеров, или в виде оптически чистых соединений. Настоящее изобретение включает как все чистые энантиомеры, так и все чистые диастереомеры, а также их смеси с  
5 любым соотношением компонентов.

В соответствии с дальнейшим вариантом осуществления настоящего изобретения, один или несколько атомов водорода соединений настоящего изобретения могут быть заменены на дейтерий. Модификация дейтерием  
10 улучшает метаболические свойства лекарственного вещества при небольшом изменении или без изменения его собственной фармакологии. Замещение дейтерием в определенных положениях молекул улучшает метаболическую стабильность, уменьшает образование токсических метаболитов и/или увеличивает образование желаемых активных метаболитов. Соответственно,  
15 настоящее изобретение также охватывает частично и полностью дейтерированные соединения формулы (I), (Ia), (Ib) и (Ic). Термин водород также охватывает дейтерий.

Терапевтическое применение соединений в соответствии с формулой (I),  
20 (Ia), (Ib), (Ic) и (Id), их фармакологически приемлемых солей, сольватов и гидратов, соответственно, а также составов и фармацевтических композиций также лежит в пределах объема настоящего изобретения.

Фармацевтические композиции в соответствии с настоящим изобретением  
25 включают по меньшей мере одно соединение формулы (I), (Ia), (Ib), (Ic) и (Id) в качестве активного компонента и, необязательно, вещества-носители и/или вспомогательные вещества.

Настоящее изобретение также относится к пролекарствам, которые состоят  
30 из соединения формулы (I), (Ia), (Ib), (Ic) и/или (Id) и по меньшей мере одной фармакологически приемлемой защитной группы, которая будет отщепляться в физиологических условиях, такой как алкокси-, арилалкилокси-, ацил-, ацилоксиметильная группа (например, пивалоилоксиметил), 2-алкил-, 2-арил- или 2-арилалкил-оксикарбонил-2-алкилиденэтильная группа или ацилокси

группа, указанная в данном документе, например, этокси, бензилокси, ацетил или ацетилокси или, в особенности, для соединения формулы (I), (Ia), (Ib), (Ic) и/или (Id), несущего гидроксильную группу (-ОН): сульфат, фосфат (-OPO<sub>3</sub> или -OCH<sub>2</sub>OPO<sub>3</sub>) или сложный эфир аминокислоты. В особенности, предпочтительными являются пролекарства по гидроксильной группе соединения формулы (I), (Ia), (Ib), (Ic) и/или (Id).

В данном контексте, термин фармацевтически приемлемый сложный эфир, в особенности, относится к сложным эфирам, которые гидролизуются *in vivo* и включают те, которые легко распадаются в организме человека с предоставлением исходного соединения или его соли. Пригодные сложноэфирные группы включают, например, группы, полученные из фармацевтически приемлемых алифатических карбоновых кислот, в частности, алкановых, алкеновых, циклоалкановых и алкандиовых кислот, в которых каждый алкильный или алкенильный фрагмент преимущественно имеет не более 6 атомов углерода. Примеры конкретных сложных эфиров включают, но не ограничиваются перечисленным, формиаты, ацетаты, пропионаты, бутираты, акрилаты и этилсукцинаты.

Предпочтительно, настоящее изобретение также относится к пролекарству, биогидролизуемому сложному эфиру, биогидролизуемому амиду, полиморфу, таутомеру, стереоизомеру, метаболиту, N-оксиду, биогидролизуемому карбамату, биогидролизуемому простому эфиру, физиологически функциональному производному, атропоизомеру, или *in vivo*-гидролизуемому предшественнику, диастереомеру или смеси диастереомеров, химически защищенной форме, аффинному реагенту, комплексу, хелату и стереоизомеру соединений формулы (I), (Ia), (Ib), (Ic) и/или (Id).

Как упоминалось выше, терапевтически пригодные агенты, которые содержат соединения формулы (I), (Ia), (Ib), (Ic) и/или (Id), их сольваты, соли или составы, также включены в объем настоящего изобретения. В общем, соединения формулы (I), (Ia), (Ib), (Ic) и/или (Id) могут быть введены с применением известных и приемлемых методов, известных в данной области

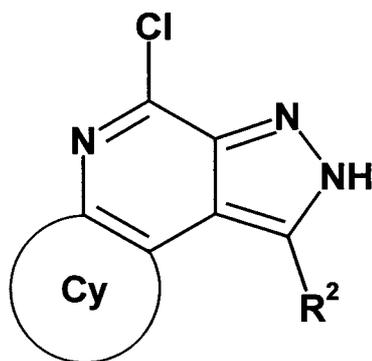
техники, либо самостоятельно, либо в комбинации с любым другим терапевтическим средством.

Для перорального введения такие терапевтически пригодные агенты могут  
5 быть введены одним из следующих путей: пероральным, например, в виде  
таблеток, драже, покрытых таблеток, пилюль, полутвердых, мягких или твердых  
капсул, например, мягких и твердых желатиновых капсул, водных или масляных  
растворов, эмульсий, суспензий или сиропов, парентеральным, включая  
10 внутривенную, внутримышечную и подкожную инъекцию, например, в виде  
инъекционного раствора или суспензии, ректальным в виде суппозиториев,  
путем ингаляции или инсуффляции, например, в виде порошкового состава, в  
виде микрокристаллов или в виде спрея (например, жидкого аэрозоля),  
трансдермальным, например, с помощью трансдермальной системы доставки  
(ТСД), такой как пластырь, содержащий активный компонент, или  
15 интраназальным путем. Для изготовления таких таблеток, пилюль, покрытых  
таблеток, драже, полутвердых и твердых, например, желатиновых, капсул,  
терапевтически пригодный продукт может быть смешан с фармацевтически  
инертными, неорганическими или органическими наполнителями, какими  
являются, например, лактоза, сахароза, глюкоза, желатин, солод, силикагель,  
20 крахмал или его производные, тальк, стеариновая кислота или ее соли, сухое  
обезжиренное молоко, и т.п. Для изготовления мягких капсул можно применять  
наполнители, какими являются, например, растительные, минеральные,  
животные или синтетические масла, воск, жир, полиолы. Для изготовления  
жидких растворов, эмульсий или суспензий или сиропов в качестве  
25 наполнителей можно применять, например, воду, спирты, водный соляной  
раствор, водную декстрозу, полиолы, глицерин, липиды, фосфолипиды,  
циклодекстрины, растительные, минеральные, животные или синтетические  
масла. В особенности, предпочтительными являются липиды, и более  
предпочтительными являются фосфолипиды (предпочтительно природного  
30 происхождения; в особенности, предпочтительно с размером частиц между 300 и  
350 нм), предпочтительно в фосфатно-солевом буферном растворе (рН = от 7 до  
8, предпочтительно 7.4). Для суппозиториев можно применять наполнители,  
какими являются, например, растительные, минеральные, животные или  
синтетические масла, воск, жир и полиолы. Для аэрозольных составов можно

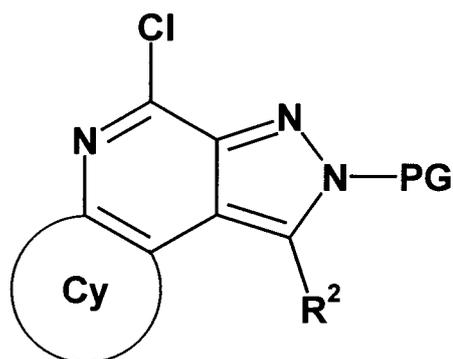
применять сжатые газы, пригодные для этой цели, какими являются, например, кислород, азот и диоксид углерода. Фармацевтически пригодные агенты также могут содержать добавки для консервации, стабилизации, например, УФ стабилизаторы, эмульгаторы, подсластители, ароматизаторы, соли для изменения осмотического давления, буферы, покрывающие добавки и антиоксиданты.

В общем, в случае перорального или парентерального введения взрослым людям весом приблизительно 80 кг, суточная дозировка должна соответствовать значению от приблизительно 10 мг до приблизительно 10,000 мг, предпочтительно от приблизительно 20 мг до приблизительно 1,000 мг, хотя верхний предел может быть превышен при наличии показаний. Суточная дозировка может быть введена в виде однократной дозы или в виде разделенных доз, или для парентерального введения, ее можно вводить в виде непрерывной инфузии или подкожной инъекции.

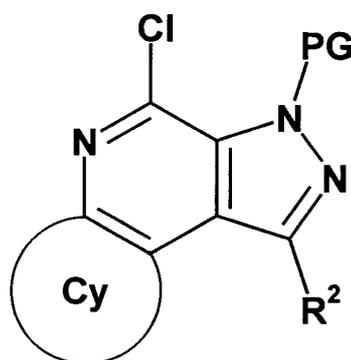
Более того, настоящее изобретение относится к соединениям формул (II), (IIIa) и/или (IIIb), где  $R^2$  и  $Cy$  принимают определенные выше значения и  $PG$  означает защитную группу.



(II)



(IIIa)



(IIIb)

5

Защитные группы известны специалисту в данной области техники и, например, описаны в P. J. Kocienski, *Protecting Groups*, Georg Thieme Verlag, Stuttgart, 1994 и в T. W. Greene, P. G. M. Wuts, *Protective Groups in Organic*  
 10 *Synthesis*, John Wiley & Sons, Нью-Йорк, 1999.

Предпочтительно, PG означает 4-метоксибензильную группу или карбоксибензильную (Cbz или Z) группу; особенно предпочтительно, PG означает 4-метоксибензильную группу.

15

Предпочтительными соединениями формулы (II) являются:

4-хлор-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин; 4-хлор-8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин; 8-бром-4-хлор-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин; 6-хлор-8H-пиразоло[3,4-с][1,5]нафтиридин; 6-хлор-2-метокси-8H-пиразоло[3,4-с][1,5]нафтиридин; 4-хлор-2H-пиразоло[3,4-с][1,7]нафтиридин; 4-хлор-7,8-диэтокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин; 4-хлор-7,8-диметокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин; 4-хлор-6-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин; 4-хлор-7-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин; 4-

20

хлор-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-8-карбонитрил; 4-хлор-9-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин; 4-хлор-1-метил-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин; 4-хлор-1-(трифторметил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин; 4-хлор-1-нитро-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин; 5-хлор-1-метил-7Н-изотиазоло[5,4-в]пиразоло[4,3-д]пиридин; 4-хлор-1-метил-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-7-карбонитрил; 4-хлор-6,8-диметокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин; метил 4-хлор-2Н-пиразоло[4,3-д]тиено[3,4-в]пиридин-6-карбоксилат; 4-хлор-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-8-ол; 4-хлор-8-фтор-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин; 4-хлор-8-йод-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин; 4-хлор-7-фтор-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин; 4-хлор-9-фтор-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин.

Предпочтительными соединениями формулы (IIIa) и (IIIb) являются:

4-хлор-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин; 4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин; 8-бром-4-хлор-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин; 6-хлор-8-(4-метоксибензил)-8Н-пиразоло[3,4-с][1,5]нафтиридин; 6-хлор-2-метокси-8-(4-метоксибензил)-8Н-пиразоло[3,4-с][1,5]нафтиридин; 4-хлор-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с][1,7]нафтиридин; 4-хлор-7,8-диэтокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин; 4-хлор-7,8-диметокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин; 4-хлор-6-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин; 4-хлор-7-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин; 4-хлор-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-8-карбонитрил; 4-хлор-9-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин; 4-хлор-2-(4-метоксибензил)-1-метил-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин; 4-хлор-2-(4-метоксибензил)-1-(трифторметил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин; 4-хлор-2-(4-метоксибензил)-1-нитро-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин; 5-хлор-7-(4-метоксибензил)-1-метил-7Н-изотиазоло[5,4-в]пиразоло[4,3-д]пиридин; 4-хлор-2-(4-метоксибензил)-1-метил-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-7-карбонитрил; 4-хлор-6,8-диметокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин; метил 4-хлор-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[4,3-д]тиено[3,4-в]пиридин-6-карбоксилат; 4-хлор-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-8-ол; 4-хлор-8-фтор-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин; 4-хлор-8-йод-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин; 4-хлор-7-фтор-2-(4-метоксибензил)-2Н-

пиразоло[3,4-с]хинолин; 4-хлор-9-фтор-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин.

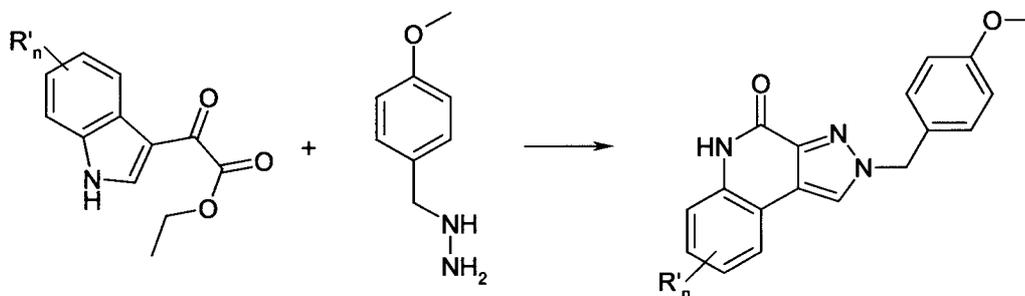
## ОБЩИЙ СИНТЕЗ

5

Следующие пути можно использовать для обеспечения хлоридов - промежуточных соединений. Эти хлориды - промежуточные соединения затем можно использовать в реакции аминирования с различными аминами с последующим снятием защиты с обеспечением конечных продуктов:

10

### ПУТЬ А



15 Сложный этиловый эфир (1Н-индол-3-ил)-оксо-уксусной кислоты (или альтернативно сложный метиловый эфир) вводят в реакцию с гидрохлоридом (4-метоксибензил)-гидразина. Это приводит к образованию 2-(4-метокси-бензил)-2,5-дигидро-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-она.

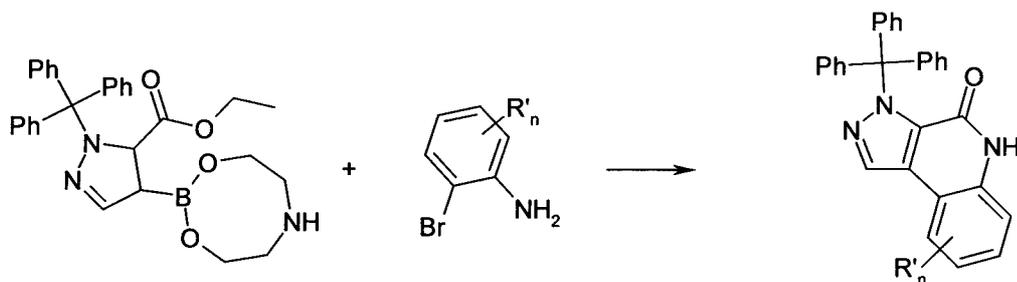
20 Подобным образом, используя гидразин гидрат или гидрохлорид гидразина, могут быть синтезированы соответствующие незащищенные трициклы.

Остатки R' соответствуют, например, остаткам R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>8</sup> и/или R<sup>9</sup> формулы (Ia) и n может означать 0, 1, 2, 3 или 4.

ПУТЬ В – через сочетание Сузуки

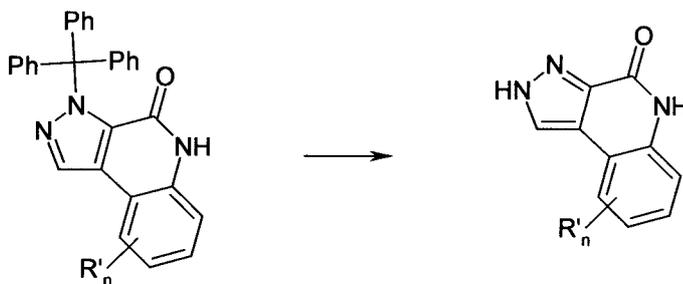
25

ПУТЬ В1



Сложный этиловый эфир 4-[1,3,6,2]диоксазаборокан-2-ил-2-тритил-2Н-пиразол-3-карбоновой кислоты сочетают в условиях сочетания Сузуки с 2-бром-фениламино с обеспечением 2,5-дигидро-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-она.

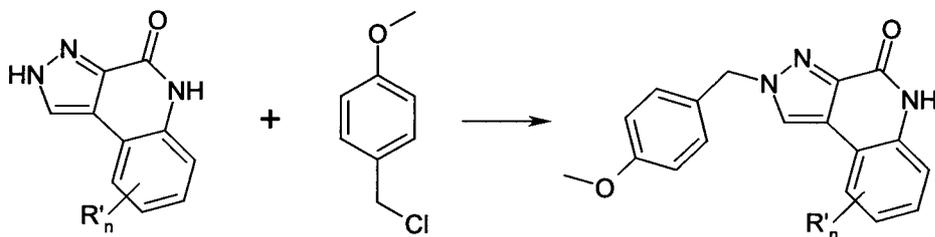
### ПУТЬ В2



10

Слабую тритильную защитную группу удаляют в кислых условиях и замещают на Стадии В3.

### ПУТЬ В3



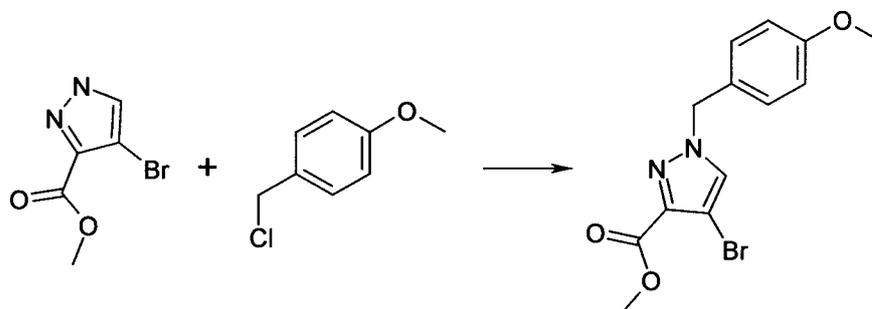
15

2,5-дигидро-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-он вводят в реакцию с параметоксибензилхлоридом. Это приводит к образованию 2-(4-метокси-бензил)-2,5-дигидро-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-она

20

ПУТЬ С – через сочетание Сузуки

ПУТЬ С1

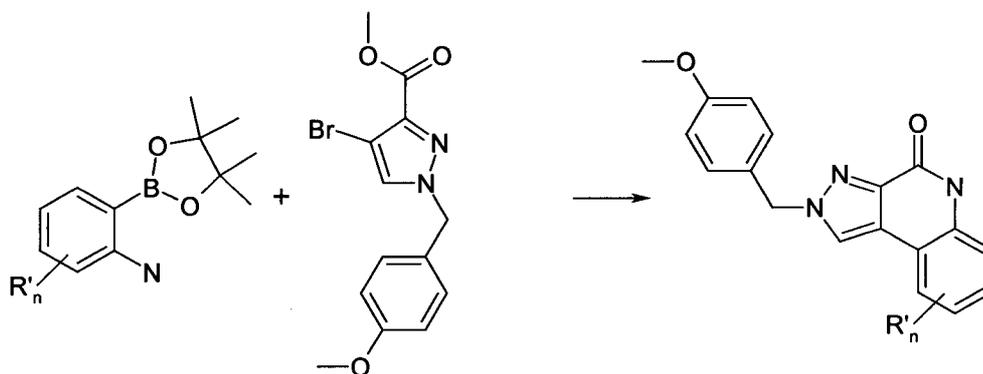


5

Защита пиразольного структурного элемента с использованием пара-метокси-бензилхлорида.

ПУТЬ С2

10



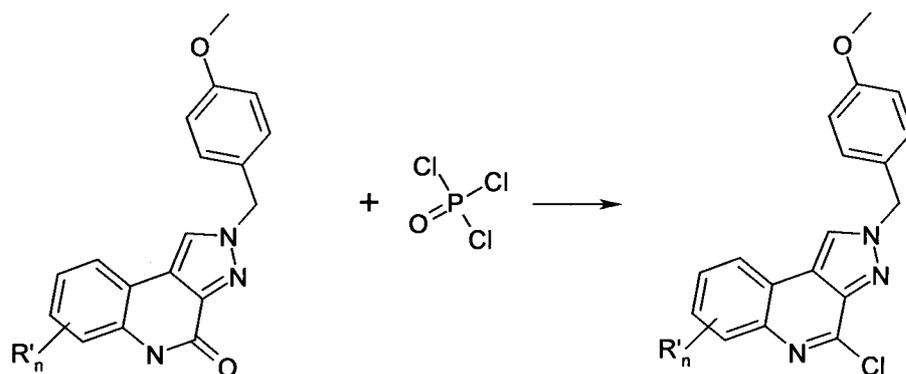
15

Защищенный пиразол сочетают в условиях сочетания Сузуки с 2-амино-фенилборонатом с обеспечением 2-(4-метокси-бензил)-2,5-дигидро-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-она.

ХЛОРИРОВАНИЕ:

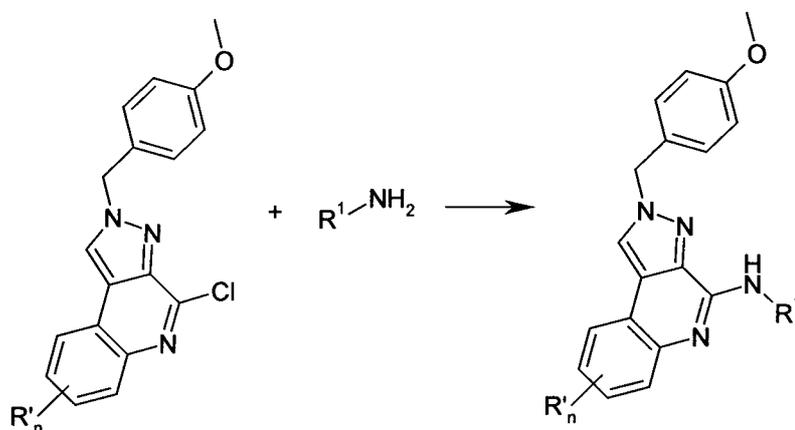
20

Обеспеченные амиды, например, с использованием вышеуказанных путей, можно использовать на стадии хлорирования:



2-(4-Метокси-бензил)-2,5-дигидро-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-он  
 суспендируют в POCl<sub>3</sub>. Осуществляют нагревание реакционной смеси, что  
 5 приводит к образованию 4-хлор-2-(4-метокси-бензил)-2Н-пиразоло[3,4-  
 с]хинолина.

Аминирование:

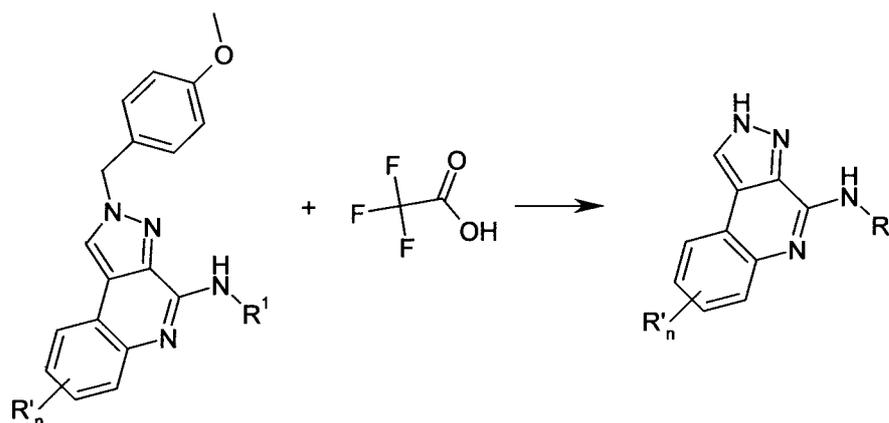


10

4-Хлор-2-(4-метокси-бензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин вводят в реакцию  
 с соответствующим амином, что приводит к образованию защищенного  
 конечного продукта.

15

Снятие защиты:



5 На конечной стадии пара-метоксибензильную защитную группу удаляют с помощью ТФУ с обеспечением конечного продукта для биологической характеристики.

## ПРИМЕРЫ

### Материалы и методы

10

### БИОЛОГИЧЕСКИЕ АНАЛИЗЫ – Анализ протеинкиназной активности

#### SYK анализ

15 В анализе OMNIA® KINASE ASSAY от Invitrogen Corporation (Carlsbad), действие соединений изобретения на фосфорилирование определяют путем измерения интенсивности флуоресценции усиленного образованием хелата флуорофора, называемого SOX. После фосфорилирования пептида интересующей киназой, Mg<sup>2+</sup> хелатируется с образованием мостика между SOX  
20 фрагментом и фосфатной группой, которая переносится на специфический тирозин на пептиде. Интенсивность флуоресценции прямо пропорциональна количеству фосфорилированного пептида.

К лункам 384-луночного малообъемного планшета (Greiner, Фриккенхаузен) добавляют (i) исследуемое соединение в смеси 5 %  
25 ДМСО/дистиллированная вода (2 мкл), (ii) 16 мкл мастер-микса, содержащего АТФ, DTT, буфер для киназной реакции, пептидный субстрат Omina Peptide

Substrate Tyr 7, что приводит к конечной концентрации 1 мМ АТФ, 0.2 мМ DTT и 10 мкМ пептидного субстрата.

Планшет с мастер-миксом и образцами для анализа перед измерением инкубировали при реакционной температуре (30° C). Реакцию начинали с помощью добавления (iii) 2 мкл 4 мкг/мл SYK киназы (Invitrogen, Карлсбад). Во время измерения интенсивности флуоресценции данные собирали с использованием прибора TECAN M1000 при длине волны  $\lambda_{ex}$  360/  $\lambda_{em}$  485 нм каждые 30 с в течение 30 минут. Скорость реакции наносили на график против концентрации ингибитора для определения IC50 с использованием XLFit 5.0 (IDBS, Гилдфорд) с целью подгонки сигмоидальной кривой зависимости "доза-эффект", и значения кажущейся  $K_i$  рассчитывали из IC50, используя уравнение Ченга-Пруссоффа (Cheng, Y.; Prusoff, W. N. *Biochem. Pharmacol.* 22, 3099-3108, 1973).

АТФ зависимость определяли в соответствии с методикой, раскрытой в публикации Lai C-J-, Wu JC A Simple Kinetic Method for Rapid Mechanistic Analysis of Reversible Enzyme Inhibitors. *Assays and Drug Dev. Technologies.* 2003;1(4):527-535. Чтобы продемонстрировать конкурентное действие исследуемых соединений по отношению к АТФ, соответствующее исследуемое соединение использовали при 50% ингибирующей концентрации. Придерживались условий анализа, описанных ранее. Используемые концентрации составляли 1000, 333, 100, 33.3, 10, 3.3, 1 мкМ.

#### LRRK2 - LRRK2 G2019S - АНАЛИЗ

В анализе LanthaScreen™ Eu Kinase Binding Assay от Invitrogen Corporation (Карлсбад), действие соединений изобретения на фосфорилирование определяют путем измерения соотношения интенсивностей флуоресцентных эмиссий исходя из связывания и замещения фирменного Alexa Fluor® 647-меченого остова АТФ-конкурентного ингибитора киназы (киназный изотопный индикатор) относительно интересующей киназы. Связывание изотопного индикатора с киназой детектируют с использованием европий-меченого анти-tag антитела, которое связывается с интересующей киназой. Одновременное связывание как изотопного индикатора так и антитела к киназе приводит к высокой степени FRET (резонансный перенос энергии флуоресценции) от европиевого (Eu)

донорного флуорофора к Alexa Fluor® 647 акцепторному флуорофору на киназном изотопном индикаторе. Связывание ингибитора с киназой конкурирует за связывание с изотопным индикатором, что приводит к потере FRET. Соотношение интенсивностей флуоресценции прямо пропорционально количеству фосфорилированного пептида.

К лункам 384-луночного малообъемного планшета (Greiner, Фриккенхаузен) добавляют (i) исследуемое соединение в смеси 5 % ДМСО/дистиллированная вода (5 мкл), (ii) 5 мкл смеси антитела к киназе, что приводит к конечной концентрации 5 нМ LRRK2 или ее мутантов, 2 нМ EU-Anti-GST антитела в 1x киназном буфере А. Реакцию начинали с помощью добавления (iii) 5 мкл изотопного индикатора, что приводит к конечной концентрации 10 нМ изотопного индикатора 236. Аналитический планшет инкубировали при к.т. в течение 1 ч. и данные интенсивности флуоресценции собирали с использованием прибора TECAN M1000 на двух длинах волн - лех 340/ лем 615 нм и лех 340/ лем 665 нм с выдержкой времени 100 мкс и временем интегрирования 200 мкс через 60 минут. Соотношения эмиссий рассчитывали путем деления эмиссии акцептор/изотопный индикатор (665 нм) на эмиссию антитело/донор (615 нм). Концентрации ингибитора наносили на график против соотношения эмиссий для определения IC50 с использованием XLFit 5.0 (IDBS, Гилдфорд) с целью подгонки сигмоидальной кривой зависимости "доза-эффект" с переменным наклоном.

## MYLK АНАЛИЗ

В анализе LanthaScreen™ Eu Kinase Binding Assay от Invitrogen Corporation (Карлсбад) действие соединений изобретения на фосфорилирование определяют путем измерения соотношения интенсивностей флуоресцентных эмиссий исходя из связывания и замещения фирменного Alexa Fluor® 647-меченого остова АТФ-конкурентного ингибитора киназы (киназный изотопный индикатор) относительно интересующей киназы, как описано выше.

К лункам 384-луночного малообъемного планшета (Greiner, Фриккенхаузен) добавляют (i) исследуемое соединение в смеси 5 % ДМСО/дистиллированная вода (5 мкл), (ii) 5 мкл смеси антитела к киназе, что приводит к конечной концентрации 5 нМ MYLK, 2 нМ EU-Anti-GST антитела в

1x киназном буфере А. Реакцию начинали с помощью добавления (iii) 5 мкл изотопного индикатора, что приводит к конечной концентрации 30 нМ изотопного индикатора 236. Аналитический планшет инкубировали при к.т. в течение 1 ч, и данные интенсивности флуоресценции собирали с использованием прибора TECAN M1000 на двух длинах волн -  $\lambda_{ex}$  340/  $\lambda_{em}$  615 нм и  $\lambda_{ex}$  340/  $\lambda_{em}$  665 нм с выдержкой времени время 100 мкс и временем интегрирования 200 мкс через 60 минут. Соотношения эмиссий рассчитывали путем деления эмиссии акцептор/изотопный индикатор (665 нм) на эмиссию антитело/донор (615 нм). Концентрации ингибитора наносили на график против соотношения эмиссий для определения IC50 с использованием XLFit 5.0 (IDBS, Гилдфорд) с целью подгонки сигмоидальной кривой зависимости "доза-эффект" с переменным наклоном.

## БИОЛОГИЧЕСКИЕ АНАЛИЗЫ - Клеточный анализ

15

### LAD2 Анализ

Ингибирование Syk также можно определить путем исследования IgE опосредованного высвобождения гистамина *in vitro* с использованием тучных клеток человеческой конъюнктивальной ткани или в LAD2 тучных клетках (Leuk Res. 2003 Aug. 27(8):677-82). Тучные клетки человеческой конъюнктивальной ткани (НСТМС) получают с использованием методики, изложенной, например, в патенте США № 5,360,720. Кратко, НСТМС ферментативным путем высвобождают из человеческой конъюнктивальной ткани и затем частично обогащают путем центрифугирования в градиенте плотности PERCOLL(R). Монодисперсную суспензию клеток получают из получающихся пеллет, и эти клетки используют для анализа высвобождения гистамина. Клетки подвергают воздействию лекарственного препарата или контроля перед стимуляцией античеловеческим IgE, который запускает дегрануляцию тучных клеток и высвобождение гистамина в супернатант. Гистамин затем измеряют в супернатанте с помощью EIA (Beckman Coulter), RIA (Beckman Coulter) или другого метода, известного специалисту в данной области техники. Снижение высвобождения гистамина в клетках, обработанных лекарственным препаратом,

указывает, что соединение обладает потенциалом для дальнейшего исследования.

5 Линию тучных клеток LAD2 используют почти таким же образом, за исключением того, что клетки пассивно сенсibiliзируют человеческим IgE миеломы перед стимулированием анти-человеческим IgE до сшивания рецептор-связанного IgE и запуска дегрануляции.

## ОБЩИЕ МЕТОДИКИ СИНТЕЗА СОЕДИНЕНИЙ ХРОМАТОГРАФИЯ

10

Подтверждение соединений с помощью аналитической ВЭЖХ-МС осуществляли после очистки, используя следующие приборы, колонки и методы:

Аналитический метод для очистки соединений

15

Приборы:

Agilent MSD 1100

Аналитические методы:

20

Растворители:

A: ацетонитрил

B: H<sub>2</sub>O

C: 2% HCOOH в ацетонитриле

D: 0.1% NEt<sub>3</sub> в ацетонитриле

25

Использовали следующие аналитические методы:

### Метод А

30 Колонка SunFire C18 от Waters 2.1x50 мм, размер частиц 2.5 мкм, термостатированная @ 40°

Градиент:

Время [мин]	%B	%C	%D	Поток [мл/мин]
0	90	5	0	0.6
2.5	10	5	0	0.6

Время [мин]	%B	%C	%D	Поток [мл/мин]
4	10	5	0	0.6
4.5	90	5	0	0.6
6	90	5	0	0.6

Время остановки @ 7 мин

5 МС: ИЭР - положительный режим, сканирование масс от 100 до 800  
градиентная фрагментация: от 50 до 125В

УФ: детектирование @ 220 и 254 нм

10 **Метод В**

Колонка ODS-AQ от YMC 4.0x50 мм, размер частиц 2.5 мкм,  
термостатированная @ К.Т.

Градиент:

Время [мин]	%B	%C	%D	Поток [мл/мин]
0	90	5	0	1.3
2.5	10	5	0	1.3
4	10	5	0	1.3
4.5	90	5	0	1.3
6	90	5	0	1.3

15 Время остановки @ 7 мин

МС: ИЭР - положительный режим, сканирование масс от 100 до 800  
градиентная фрагментация: от 50 до 125В

УФ: детектирование @ 220 и 254 нм

20

**Метод С**

Колонка ODS-AQ от YMC 2.1x50 мм, размер частиц 3 мкм,  
термостатированная @ 40°C

Градиент:

Время [мин]	%B	%C	%D	Поток [мл/мин]
0	90	5	0	0.6
2.5	10	5	0	0.6
4	10	5	0	0.6
4.5	90	5	0	0.6
6	90	5	0	0.6

Время остановки @ 7 мин

5 МС: ИЭР - положительный режим, сканирование масс от 100 до 800  
градиентная фрагментация: от 50 до 125В

УФ: детектирование @ 220 и 254 нм

#### Метод D

10 Колонка ODS-AQ от YMC 2.1x50 мм, размер частиц 3 мкм, вкл. GuardCol  
2.1x10 мм, размер частиц 3 мкм,  
термостатированная @ 40°C

Градиент:

Время [мин]	%B	%C	%D	Поток [мл/мин]
0	90	5	0	0.6
10.0	10	5	0	0.6
13.0	10	5	0	0.6
14.0	90	5	0	0.6

15 Время остановки @ 15 мин

МС: ИЭР - положительный режим, сканирование масс от 100 до 800  
градиентная фрагментация: от 50 до 125В

20 УФ: детектирование @ 220 и 254 нм

#### Метод E

Колонка ODS-AQ от YMC 2.1x50 мм, размер частиц 3 мкм,

термостатированная @ 40°C

Градиент:

Время [мин]	%B	%C	%D	Поток [мл/мин]
0	90	5	0	0.6
5.0	10	5	0	0.6
7.0	10	5	0	0.6
8.0	90	5	0	0.6

Время остановки @ 10 мин

5

МС: ИЭР - положительный режим, сканирование масс от 100 до 800  
градиентная фрагментация: от 50 до 125В

УФ: детектирование @ 220 и 254 нм

10

**Метод F**

Колонка SunFire C18 от Waters 2.1x50 мм, размер частиц 2.5 мкм,  
термостатированная @ 40°

Градиент:

Время [мин]	%B	%C	%D	Поток [мл/мин]
0	90	5	0	1.2
7.0	10	5	0	1.2
8.5	10	5	0	1.2
9.0	90	5	0	1.2
11.0	90	5	0	1.2

15

Время остановки @ 12 мин

МС: ИЭР - положительный режим, сканирование масс от 100 до 800  
градиентная фрагментация: от 50 до 125В

20

УФ: детектирование @ 220 и 254 нм

**Метод G**

Колонка YMC C8 OS 4.0x50 мм, размер частиц 4 мкм,  
термостатированная @ 40°

Градиент:

Время [мин]	%B	%C	%D	Поток [мл/мин]
0	90	5	0	1.5
2.5	10	5	0	1.5
4.0	10	5	0	1.5
4.5	90	5	0	1.5
6.0	90	5	0	1.5

5      Время остановки @ 6 мин

МС: ИЭР - положительный режим, сканирование масс от 100 до 800  
градиентная фрагментация: от 50 до 125В

10     УФ: детектирование @ 220 и 254 нм

#### Метод Н

Колонка Waters XBridge C18 2.1x50 мм, размер частиц 2.5 мкм,  
термостатированная @ 40°

15     Градиент:

Время [мин]	%B	%C	%D	Поток [мл/мин]
0	90	5	0	0.55
2.5	10	5	0	0.55
4.0	10	5	0	0.55
4.5	90	5	0	0.55
6.0	90	5	0	0.55

Время остановки @ 6 мин

МС: ИЭР - положительный режим, сканирование масс от 100 до 800  
градиентная фрагментация: от 50 до 125В

20     УФ: детектирование @ 220 и 254 нм

**Метод I**

Колонка Waters XBridge C18 2.1x50 мм, размер частиц 2.5 мкм,  
термостатированная @ 40°

Градиент:

Время [мин]	%B	%C	%D	Поток [мл/мин]
0	90	0	5	0.55
2.5	10	0	5	0.55
4.0	10	0	5	0.55
4.5	90	0	5	0.55
6.0	90	0	5	0.55

5

Время остановки @ 6 мин

МС: ИЭР - положительный режим, сканирование масс от 100 до 800  
градиентная фрагментация: от 50 до 125В

10

УФ: детектирование @ 220 и 254 нм

**Метод J**

Колонка Waters SunFire C18 2.1x50 мм, размер частиц 2.5 мкм,  
термостатированная @ 40°C

15

Градиент:

Время [мин]	%B	%C	%D	Поток [мл/мин]
0	90	5	0	0.6
10	10	5	0	0.6
13	10	5	0	0.6
14	90	5	0	0.6

Время остановки @15 мин

20

МС: положительная ИЭР, сканирование масс от 100 до 800  
градиентная фрагментация: от 50 до 125В

УФ: детектирование @ 220 и 254 нм

**Метод К**

Колонка YMC ODS-AQ 2.1x50 мм, размер частиц 3 мкм,  
 вкл. GuardCol 2.1x10 мм, размер частиц 3 мкм,  
 термостатированная @ 40°C

5

**Градиент:**

Время [мин]	%B	%C	%D	Поток [мл/мин]
0	99	5	0	0.6
2.5	10	5	0	0.6
4	10	5	0	0.6
4.5	99	5	0	0.6
6	99	5	0	0.6

Время остановки @7 мин

10

МС: положительная ИЭР, сканирование масс от 100 до 800  
 градиентная фрагментация: от 50 до 125В

УФ: детектирование @ 220 и 254 нм

15

**Метод L**

Колонка YMC TriArt C18 2.0x50 мм, 1.9 мкм, #TA12SP90502WT,  
 термостатированная @ 40°C

20

**Градиент:**

Время [мин]	%B	%C	%D	Поток [мл/мин]
0	90	5	0	0.45
0.5	90	5	0	0.45
4.5	10	5	0	0.45
5.5	10	5	0	0.45
5.6	90	5	0	0.45

Время остановки @ 10 мин

МС: положительная ИЭР, сканирование масс от 100 до 800

градиентная фрагментация: от 50 до 125В

5 УФ: детектирование @ 220 и 254 нм

### **Очистка и характеристика:**

10 Получающиеся сырые продукты реакций очищали в автоматическом процессе с использованием полупрепаративной ВЭЖХ-МС с масс-управляемым отбором образцов целевого пика:

### **Очистка с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС**

#### **15 Приборы:**

2x Varian PrepStar SD-1

1x Dionex P580 Pump 1 Channel(MakeUP I)

1x Dionex AXP-MS (MakeUP II)

1x Dionex MSQ

20 1x Dionex UVD 340V – Prep Flow Cell

Gilson 215 Liquid Handler

#### **Колонка:**

SunFire Prep C18 OBD 5 мкм 19x50 мм

25

#### **Типичный метод:**

Скорость потока в колонке: 30 мл/мин

Растворитель А: метанол, 0,3% уксусная кислота

Растворитель В: вода, 0,3 % уксусная кислота

30

#### **Типичная таблица времени для градиента:**

Время (мин)	Раств. А	Раств. В
0.0	30.00	70.00
10.0	100.00	0.00
14.0	100.00	0.00

Время (мин)	Раств. А	Раств. В
14.4	30.00	70.00
16.4	30.00	70.00

**Детектирование:**

УФ 254 нм, масс-спектрометрический детектор (ИАД-ЭР, положительный режим)

5

**ПОЛУЧЕНИЕ СОЕДИНЕНИЙ**

Там, где получение исходных соединений не описано, они либо доступны для приобретения, известны из литературы, либо могут быть легко получены специалистами в данной области техники с использованием стандартных методик. Там, где указано, что соединения получают аналогично приведенным ранее соединениям – примерам или промежуточным соединениям, специалистам в данной области будет ясно, что время реакции, число эквивалентов реагентов и температуры могут быть изменены для каждой конкретной реакции, и что может быть необходимо или желательно использовать различные методики обработки или очистки. Там, где реакции проводят с использованием микроволнового излучения, используемая микроволновая печь представляет собой печь Initiator 60, поставляемую фирмой Biotage. Вырабатываемая фактическая мощность изменяется в ходе реакции для того, чтобы поддерживать температуру постоянной.

20

**Сокращения**

ДХМ = Дихлорметан

ДМФА = N,N-Диметилформамид

25

ТГФ = Тетрагидрофуран

MeOH = Метанол

ТФУ = Трифторуксусная кислота

TEA = Триэтиламин

LiHMDS = бис(триметилсилил)амид лития

30

р.с. = Реакционная смесь

к.т. = Комнатная температура

AcOH = Уксусная кислота

MeCN = Ацетонитрил

EtOH = Этанол

EtOAc = Этилацетат

ЖХМС = Масс-спектрометрически направленная жидкостная  
 5 хроматография высокого давления  
 УФ = Ультрафиолетовый  
 ДМСО = Диметилсульфоксид

## ПРОМЕЖУТОЧНЫЕ СОЕДИНЕНИЯ

10

ПУТЬ А:

Промежуточное соединение #1:

15 4-хлор-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин

Сложный этиловый эфир (1Н-индол-3-ил)-оксо-уксусной кислоты (10 ммоль) суспендировали в EtOH (25 мл) и HOAc (3 мл). Добавляли гидрохлорид 4-метокси-бензилгидразина (11.5 ммоль). Смесь нагревали с обратным  
 20 холодильником в течение 24 ч., затем перемешивали в течение 16 ч. при к.т. Реакцию контролировали с помощью ЖХМС. Смесь концентрировали, ресуспендировали в EtOH (10 мл). Твердый продукт собирали путем фильтрования, промывали с помощью EtOH и Et<sub>2</sub>O. Фильтрат концентрировали и распределяли между EtOAc и водой. Органический слой сушили (Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>),  
 25 фильтровали и концентрировали. Вещество было достаточно чистым для дальнейших реакций.

2-(4-Метокси-бензил)-2,5-дигидро-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-он (4.4 ммоль) суспендировали в POCl<sub>3</sub>. Смесь нагревали до 100°C. Спустя 0,5 ч. ЖХМС показывала завершение реакции. Смесь охлаждали до к.т., и перемешивали в  
 30 течение ночи. Смесь концентрировали досуха, охлаждали до 0°C, и гасили смесью лед/вода. Смесь экстрагировали с помощью ДХМ. Органический слой промывали с помощью насыщ. водн. NaHCO<sub>3</sub> и водой, сушили (Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>), фильтровали и концентрировали.

Продукт использовали без дополнительной очистки.

## Промежуточное соединение #2

## 8-бром-4-хлор-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин

5

Сложный этиловый эфир 5-бром-(1Н-индол-3-ил)-оксо-уксусной кислоты (10 ммоль) суспендировали в EtOH (25 мл) и HOAc (3 мл). Добавляли гидрохлорид метоксибензилгидразина (11.5 ммоль). Смесь нагревали с обратным холодильником в течение 24 ч., затем перемешивали в течение 16 ч. при к.т.

10 Реакцию контролировали с помощью ЖХМС. Смесь концентрировали, ресуспендировали в EtOH (10 мл). Твердый продукт собирали путем фильтрования, промывали с помощью EtOH и Et<sub>2</sub>O. Фильтрат концентрировали и распределяли между EtOAc и водой. Органический слой сушили (Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>), фильтровали и концентрировали. Вещество было достаточно чистым для  
15 дальнейших реакций.

8-Бром-2-(4-метокси-бензил)-2,5-дигидро-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-он (4.4 ммоль) суспендировали в POCl<sub>3</sub>. Смесь нагревали до 100°C. Спустя 0,5 ч. ЖХМС показывала завершение реакции. Смесь охлаждали до к.т., и перемешивали в течение ночи. Смесь концентрировали досуха, охлаждали до  
20 0°C, и гасили смесью лед/вода. Смесь экстрагировали с помощью ДХМ. Органический слой промывали с помощью насыщ. водн. NaHCO<sub>3</sub> и водой, сушили (Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>), фильтровали и концентрировали.

Продукт использовали без дополнительной очистки.

## 25 Промежуточное соединение #3

## 4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин

Сложный этиловый эфир 5-метокси-(1Н-индол-3-ил)-оксо-уксусной кислоты (10 ммоль) суспендировали в EtOH (25 мл) и HOAc (3 мл). Добавляли  
30 гидрохлорид метоксибензилгидразина (11.5 ммоль). Смесь нагревали с обратным холодильником в течение 24 ч., затем перемешивали в течение 16 ч. при к.т. Реакцию контролировали с помощью ЖХМС. Смесь концентрировали, ресуспендировали в EtOH (10 мл). Твердый продукт собирали путем фильтрования, промывали с помощью EtOH и Et<sub>2</sub>O. Фильтрат концентрировали

и распределяли между EtOAc и водой. Органический слой сушили (Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>), фильтровали и концентрировали. Вещество было достаточно чистым для дальнейших реакций.

8-Метокси-2-(4-метокси-бензил)-2,5-дигидро-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-он  
 5 (4.4 ммоль) суспендировали в POCl<sub>3</sub>. Смесь нагревали до 100°C. Спустя 0,5 ч. ЖХМС показывала завершение реакции. Смесь охлаждали до к.т., и перемешивали в течение ночи. Смесь концентрировали досуха, охлаждали до 0°C, и гасили смесью лед/вода. Смесь экстрагировали с помощью ДХМ. Органический слой промывали с помощью насыщ. водн. NaHCO<sub>3</sub> и водой,  
 10 сушили (Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>), фильтровали и концентрировали.

Продукт использовали без дополнительной очистки.

Следующие промежуточные соединения синтезировали с использованием соответствующего метода, описанного в синтезе промежуточного соединения  
 15 #1-#3

Промежуточное соединение #4:

4-хлор-6-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин

Промежуточное соединение #5:

4-хлор-7-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин

20 Промежуточное соединение #6:

4-хлор-9-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин

Промежуточное соединение #7:

4-хлор-6,8-диметокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин

Промежуточное соединение #8:

25 4-хлор-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-8-ol

Промежуточное соединение #9:

4-хлор-8-фтор-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин

Промежуточное соединение #10:

4-хлор-8-йод-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин

30 Промежуточное соединение #11:

4-хлор-7-фтор-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин

Промежуточное соединение #12:

4-хлор-9-фтор-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин

## Путь В

Промежуточное соединение #13:

6-хлор-8-(4-метоксибензил)-8Н-пиразоло[3,4-с][1,5]нафтиридин

5

В сосуде для микроволновой печи, 2-бром-3-амино-пиридин (3.14 ммоль), сложный этиловый эфир 4-[1,3,6,2]диоксазаборокан-2-ил-2-тримил-2Н-пиразол-3-карбоновой кислоты (1.1 экв.), Pd(dppf)2Cl2xCH2CL2, комплекс [1,1'-бис(дифенилфосфино)-ферроцен]дихлорпалладия(II) с дихлорметаном (0.314 ммоль) смешивали вместе в 2М водном карбонате натрия (1.5 мл) и безводном ДМФА (10 мл).

10

Смесь нагревали в микроволновом реакторе в течение 30 мин. при 120°C.

15

Добавляли ДХМ и фильтровали через диатомовую землю. К фильтрату добавляли воду, и вещество экстрагировали с помощью ДХМ. Органические экстракты промывали соевым раствором, сушили над Na2SO4 и растворители удаляли в вакууме. Получающееся твердое вещество использовали без дополнительной очистки на следующей стадии.

20

Остаток реакционной смеси растворяли в 4М HCl в 1,4-диоксане (4 мл). Реакционную смесь перемешивали при комнатной температуре в течение ночи. Получающийся осадок отфильтровывали.

25

Раствор фильтрата (7 ммоль, 1 экв. в ДМФА (10 мл)) добавляли к суспензии 60% NaN в масле (3 экв.) в безводном ДМФА (25 мл) при 0°C. После завершения добавления охлаждающую баню удаляли, и смесь перемешивали при к.т. в течение 0.5 ч. и добавляли раствор 4-метоксибензилхлорида (PMB-Cl) (1.5 мл, 11 ммоль, 1.5 экв.). После перемешивания при к.т. в течение 1 ч. реакционную смесь выливали в воду (30 мл) и экстрагировали с помощью ДХМ.

Органическую фазу промывали водой, соляным раствором, сушили и концентрировали в вакууме.

30

Остаток, сырой продукт, использовали без дополнительной очистки на следующей стадии (хлорирование).

Следующие промежуточные соединения синтезировали с использованием соответствующего метода синтеза промежуточного соединения #8

Промежуточное соединение #14:

6-хлор-2-метокси-8-(4-метоксибензил)-8Н-пиразоло[3,4-с][1,5]нафтиридин

Промежуточное соединение #15:

4-хлор-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с][1,7]нафтиридин

5 Промежуточное соединение #16:

4-хлор-7,8-диэтокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин

Промежуточное соединение #17:

4-хлор-7,8-диметокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин

10 Путь С

Промежуточное соединение #18

4-хлор-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-8-карбонитрил

15 В сосуде для микроволновой печи, 2-амино-5-циано-фенилбороновую кислоту (3.14 ммоль), сложный метиловый эфир 4-бром-1Н-пиразол-3-карбоновой кислоты (1.1 экв.), Pd(dppf)<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub>·2CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub>, комплекс [1,1'-бис(дифенилфосфино)-ферроцен]дихлорпалладия(II) с дихлорметаном (0.314 ммоль) смешивали вместе в 2М водном карбонате натрия (1.5 мл) и безводном ДМФА (10 мл).

20 Смесь нагревали в микроволновом реакторе в течение 30 мин. при 120°C.

Добавляли ДХМ и фильтровали через диатомовую землю. К фильтрату добавляли воду, и вещество экстрагировали с помощью ДХМ. Органические экстракты промывали солевым раствором, сушили над Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> и растворители удаляли в вакууме. Получающееся твердое вещество использовали без  
25 дополнительной очистки на следующей стадии.

Раствор твердого вещества (7 ммоль, 1 экв. в ДМФА (10 мл)) добавляли к суспензии 60% NaN в масле (3 экв.) в безводном ДМФА (25 мл) при 0°C. После завершения добавления охлаждающую баню удаляли, и смесь перемешивали при к.т. в течение 0.5 ч. и добавляли раствор 4-метоксибензилхлорида (РМВ-С1) (1.5  
30 мл, 11 ммоль, 1.5 экв.). После перемешивания при к.т. в течение 1 ч. реакционную смесь выливали в воду (30 мл) и экстрагировали с помощью ДХМ.

Органическую фазу промывали водой, соляным раствором, сушили и концентрировали в вакууме.

Остаток, сырой продукт, использовали без дополнительной очистки на следующей стадии (хлорирование).

Промежуточное соединение #19:

5 4-хлор-2-(4-метоксибензил)-1-метил-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин

Промежуточное соединение #20:

4-хлор-2-(4-метоксибензил)-1-(трифторметил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин

Промежуточное соединение #21:

4-хлор-2-(4-метоксибензил)-1-нитро-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин

10 Промежуточное соединение #22:

5-хлор-7-(4-метоксибензил)-1-метил-7Н-изотиазоло[5,4-б]пиразоло[4,3-

d]пиридин

Промежуточное соединение #23:

4-хлор-2-(4-метоксибензил)-1-метил-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-7-

15 карбонитрил

Промежуточное соединение #24:

метил-4-хлор-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[4,3-d]тиено[3,4-b]пиридин-

6-карбоксилат

20 ПРОДУКТЫ

Пример # 1

Получение (2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-м-толил-амина

25

4-хлор-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и м-толуидин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

30

точная масса: 274.1415 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод А

5 в.у.: 2.56 мин. - найденная масса: 275 (m/z+H)

----

Пример # 2

10

Получение (2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-(3-трифторметил-фенил)-  
амина

15 4-хлор-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 3-  
(трифторметил)анилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл)  
в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3  
капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5  
мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без  
20 дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь  
облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную  
смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и  
лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 328.1052 г/моль

25

ВЭЖХ-МС: аналитический метод А

в.у.: 3.48 мин. - найденная масса: 329.4 (m/z+H)

----

30

Пример # 3

Получение (2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-(3,4,5-триметокси-фенил)-  
амина

4-хлор-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 3,4,5-триметоксианилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 350.1637 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод А

в.у.: 2.55 мин. - найденная масса: 351.4 (m/z+H)

----

Пример # 4

20

Получение (1Н-индазол-5-ил)-(2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

4-хлор-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 1Н-индазол-5-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 300.1265 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод E

в.у.: 3.34 мин. - найденная масса: 301.4 (m/z+H)

----

5

Пример # 5

Получение фенил-(2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

10 4-хлор-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и  
анилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для  
микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли).  
Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при  
140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной  
15 очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в  
микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь  
концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и  
лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

20 точная масса: 260.1219 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод A

в.у.: 2.43 мин. - найденная масса: 261.4 (m/z+H)

25

----

Пример # 6

Получение (1H-индазол-6-ил)-(2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

30

4-хлор-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 1H-  
индазол-6-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в  
пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3  
капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5

мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 300.1265 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод G

10 в.у.: 1.45 мин. - найденная масса: 301.4 (m/z+H)

----

Пример # 7

15

Получение (3-хлор-фенил)-(2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

4-хлор-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 3-хлоранилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 294.0803 г/моль

30 ВЭЖХ-МС: аналитический метод A

в.у.: 3.15 мин. - найденная масса: 295.8 (m/z+H)

----

## Пример # 8

Получение (7-метил-1H-индазол-5-ил)-(2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

5

4-хлор-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 7-метил-1H-индазол-5-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

15

точная масса: 314.146 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод А

в.у.: 1.93 мин. - найденная масса: 315.4 (m/z+H)

20

----

## Пример # 9

Получение (2-метокси-этил)-(2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

25

4-хлор-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 2-метоксиэтан-1-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную

30

смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 242.1379 г/моль

5

ВЭЖХ-МС: аналитический метод G

в.у.: 0.99 мин. - найденная масса: 243.3 (m/z+H)

----

10

Пример # 10

Получение (8-метокси-2H-пиразоло[3,4-c]хинолин-4-ил)-(7-метил-1H-индазол-5-ил)-амина

15

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-c]хинолин (0.16 ммоль) и 7-метил-1H-индазол-5-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

25

точная масса: 344.1599 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод F

в.у.: 3.88 мин. - найденная масса: 345.4 (m/z+H)

30

----

Пример # 11

Получение N-(тиофен-2-илметил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амина

4-хлор-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и тиофен-2-илметанамина (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 280.0939 г/моль

15 ВЭЖХ-МС: аналитический метод G  
в.у.: 1.50 мин. - найденная масса: 281.4 (m/z+H)

----

20 Пример # 12

Получение (6-метил-1H-индазол-5-ил)-(2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

25 4-хлор-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 6-метил-1H-индазол-5-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 314.146 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод G

в.у.: 1.30 мин. - найденная масса: 315.4 (m/z+H)

5

----

Пример # 13

10 Получение (8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-фенил-амина

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и анилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3  
15 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и  
20 лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 290.1359 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод B

25 в.у.: 1.824 мин. - найденная масса: 291.1 (m/z+H)

----

Пример # 14

30

Получение (2-метокси-этил)-(8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 2-метоксиэтан-1-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

10

точная масса: 272.1518 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод А

в.у.: 1.80 мин. - найденная масса: 273.4 (m/z+H)

15

----

#### Пример # 15

20      Получение      (2Н-индазол-6-ил)-(8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 2Н-индазол-6-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

30

точная масса: 330.1404 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод G

в.у.: 1.51 мин. - найденная масса: 331.4 (m/z+H)

----

5

### Пример # 16

Получение сложного метилового эфира 4-(2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-иламино)-бензойной кислоты

10

4-хлор-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и сложный метиловый эфир 4-амино-бензойной кислоты (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

15

20

точная масса: 318.1298 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод A

в.у.: 3.18 мин. - найденная масса: 319.4 (m/z+H)

25

----

### Пример # 17

30

Получение (1Н-бензоимидазол-5-ил)-(2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

4-хлор-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 1Н-бензо[d]имидазол-5-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3

мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 300.1265 г/моль

10

ВЭЖХ-МС: аналитический метод А

в.у.: 0.46 мин. - найденная масса: 301 (m/z+H)

----

15

Пример # 18

Получение N-(тиофен-2-илметил)-8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амина

20

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и тиофен-2-илметанамин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

30

точная масса: 310.1079 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод А

в.у.: 2.05 мин. - найденная масса: 311.4 (m/z+H)

----

## Пример # 19

5

## Получение (2H-индазол-7-ил)-(2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

10

15

4-хлор-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 2H-индазол-7-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 300.1265 г/моль

20

ВЭЖХ-МС: аналитический метод F

в.у.: 3.89 мин. - найденная масса: 301.4 (m/z+H)

----

25

## Пример # 20

Получение (8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-(1-метил-1H-пиррол-2-илметил)-амина

30

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и (1-метил-1H-пиррол-2-ил)метанамин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь

упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

5

точная масса: 307.1684 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод А

в.у.: 3.62 мин. - найденная масса: 308.4 (m/z+H)

10

----

Пример # 21

15           Получение           (2H-индазол-7-ил)-(8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 2H-индазол-7-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 20   3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную 25   смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 330.1404 г/моль

30

ВЭЖХ-МС: аналитический метод А

в.у.: 2.10 мин. - найденная масса: 331.4 (m/z+H)

----

## Пример # 22

Получение бензо[1,3]диоксол-5-ил-(2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

5

4-хлор-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и бензо[d][1,3]диоксол-5-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

15

точная масса: 304.1103 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод E

в.у.: 3.66 мин. - найденная масса: 305.1 (m/z+H)

20

----

## Пример # 23

Получение (3Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-пиридин-3-ил-амина

25

4-хлор-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и пиридин-3-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную

30

смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 261.115 г/моль

5

ВЭЖХ-МС: аналитический метод E

в.у.: 3.44 мин. - найденная масса: 262.3 (m/z+H)

----

10

Пример # 24

Получение (1-метил-1H-индазол-6-ил)-(2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

15

4-хлор-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 1-метил-1H-индазол-6-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

25

точная масса: 314.146 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод E

в.у.: 3.63 мин. - найденная масса: 315.3 (m/z+H)

30

----

Пример # 25

Получение (6-метокси-пиридин-3-ил)-(2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

5 4-хлор-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 6-метоксипиридин-3-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь  
10 облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 291.1289 г/моль

15

ВЭЖХ-МС: аналитический метод E

в.у.: 3.46 мин. - найденная масса: 292.3 (m/z+H)

----

20

Пример # 26

Получение [4-(4-метил-пиперазин-1-ил)-фенил]-(2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

25

4-хлор-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 4-(4-метилпиперазин-1-ил)анилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе  
30 в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 358.2245 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод E

5 в.у.: 3 мин. - найденная масса: 359.2 (m/z+H)

----

Пример # 27

10

Получение [4-(4-метил-[1,4]дiazепан-1-ил)-фенил]-(2H-пиазоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

15 4-хлор-2-(4-метоксибензил)-2H-пиазоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 4-(4-метил-1,4-дiazепан-1-ил)анилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь  
20 облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 372.2441 г/моль

25

ВЭЖХ-МС: аналитический метод E

в.у.: 2.76 мин. - найденная масса: 373.2 (m/z+H)

----

30

Пример # 28

Получение (3H-пиазоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-пиадин-2-ил-амина

Пиридин-2-амин (0.4 ммоль 2 экв.) растворяли в ТГФ (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли 2М LiHMDS в ТГФ (0.6 ммоль 4 экв.). Смесь перемешивали в течение 20 мин. при к.т. и затем добавляли к раствору 4-хлор-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолина (0.16 ммоль, 1 экв.) в пиридине (2 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 20 мин. при 200°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 261.115 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 1.78 мин. - найденная масса: 262.1 (m/z+H)

----

Пример # 29

20

Получение (5-бром-пиридин-2-ил)-(3Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

5-бромпиридин-2-амин (0.4 ммоль 2 экв.) растворяли в ТГФ (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли 2М LiHMDS в ТГФ (0.6 ммоль 4 экв.). Смесь перемешивали в течение 20 мин. при к.т. и затем добавляли к раствору 4-хлор-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолина (0.16 ммоль, 1 экв.) в пиридине (2 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 20 мин. при 200°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 339.0228 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод А

в.у.: 2.22 мин. - найденная масса: 340.0 (m/z+H)

5 -----

### Пример # 30

Получение изохинолин-3-ил-(3H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

10

изохинолин-3-амин (0.4 ммоль 2 экв.) растворяли в ТГФ (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли 2M LiHMDS в ТГФ (0.6 ммоль 4 экв.). Смесь перемешивали в течение 20 мин. при к.т. и затем добавляли к раствору 4-хлор-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолина (0.16 ммоль, 1 экв.) в пиридине (2 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 20 мин. при 200°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

15

20

точная масса: 311.133 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод А

в.у.: 2.29 мин. - найденная масса: 312.1 (m/z+H)

25

-----

### Пример # 31

30

Получение (4-метил-пиридин-2-ил)-(3H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

4-метилпиридин-2-амин (0.4 ммоль 2 экв.) растворяли в ТГФ (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли 2М LiHMDS в ТГФ (0.6 ммоль 4 экв.). Смесь перемешивали в течение 20 мин. при к.т. и затем добавляли к раствору 4-хлор-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолина (0.16 ммоль, 1 экв.) в пиридине (2 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 20 мин. при 200°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 275.1345 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 1.86 мин. - найденная масса: 276.1 (m/z+H)

----

Получение (4,6-диметил-пиридин-2-ил)-(3H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

4,6-диметилпиридин-2-амин (0.4 ммоль 2 экв.) растворяли в ТГФ (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли 2М LiHMDS в ТГФ (0.6 ммоль 4 экв.). Смесь перемешивали в течение 20 мин. при к.т. и затем добавляли к раствору 4-хлор-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолина (0.16 ммоль, 1 экв.) в пиридине (2 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 20 мин. при 200°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 289.154 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 1.89 мин. - найденная масса: 290.2 (m/z+H)

----

5

Пример # 33

Получение (8-бром-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-(1H-индазол-6-ил)-амина

10

8-бром-4-хлор-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 1H-индазол-6-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

15

20

точная масса: 378.0344 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод А

в.у.: 2.39 мин. - найденная масса: 379.0 (m/z+H)

25

----

Пример # 34

30

Получение (1H-бензоимидазол-5-ил)-(8-бром-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

8-бром-4-хлор-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 1H-бензо[d]имидазол-5-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в

MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл).

5 Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 378.0344 г/моль

10

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 1.68 мин. - найденная масса: 379.0 (m/z+H)

----

15

Пример # 35

Получение (8-бром-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-(1-метил-1H-индазол-6-ил)-амина

20

8-бром-4-хлор-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 1-метил-1H-индазол-6-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

30

точная масса: 392.0539 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод А

в.у.: 2.72 мин. - найденная масса: 393.0 (m/z+H)

----

## Пример # 36

5

Получение (8-бром-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-(1Н-индазол-7-ил)-амина

8-бром-4-хлор-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 1Н-индазол-7-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

20

точная масса: 378.0344 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод А

в.у.: 2.62 мин. - найденная масса: 379.0 (m/z+H)

----

25

## Пример # 37

Получение (8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-м-толил-амина

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и м-толуидин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без

дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

5

точная масса: 304.1554 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод А

в.у.: 2.10 мин. - найденная масса: 305.2 (m/z+H)

10

----

Пример # 38

15           Получение           (1H-индазол-5-ил)-(8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 1H-индазол-5-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 20   3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную 25   смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 330.1404 г/моль

30           ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 1.70 мин. - найденная масса: 331.1 (m/z+H)

----

## Пример # 39

Получение (1Н-бензоимидазол-5-ил)-(8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

5

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 1Н-бензо[d]имидазол-5-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

15

точная масса: 330.1404 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 1.39 мин. - найденная масса: 331.1 (m/z+H)

20

----

## Пример # 40

25 Получение (8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-(1-метил-1Н-индазол-6-ил)-амина

30 4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 1-метил-1Н-индазол-6-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при

140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 344.1599 г/моль

5

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 1.82 мин. - найденная масса: 345.1 (m/z+H)

----

10

Пример # 41

Получение (8-бром-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-(7-метил-1H-индазол-5-ил)-амина

15

8-бром-4-хлор-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 7-метил-1H-индазол-5-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

25

точная масса: 392.0539 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод А

в.у.: 2.29 мин. - найденная масса: 393.0 (m/z+H)

30

----

Пример # 42

Получение (8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-[4-(4-метил-пиперазин-1-ил)-фенил]-амина

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 4-(4-метилпиперазин-1-ил)анилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл).  
 10 Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 388.2385 г/моль

15

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 1.43 мин. - найденная масса: 389.2 (m/z+H)

----

20

Пример # 43

Получение (8-бром-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-[4-(4-метил-пиперазин-1-ил)-фенил]-амина

25

8-бром-4-хлор-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 4-(4-метилпиперазин-1-ил)анилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл).  
 30 Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 436.1324 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

5 в.у.: 1.57 мин. - найденная масса: 437.1 (m/z+H)

----

Пример # 44

10

Получение N-(8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-бензол-1,3-  
диамина

15 4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16  
ммоль) и бензол-1,3-диамин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом,  
3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане  
(4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в  
течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без  
20 дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь  
облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную  
смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и  
лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 305.1484 г/моль

25

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 1.67 мин. - найденная масса: 306.1 (m/z+H)

----

30

Пример # 45

Получение (8-бром-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-(1H-индазол-5-ил)-  
амин

8-бром-4-хлор-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 1H-индазол-5-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 378.0344 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 1.85 мин. - найденная масса: 379.0 (m/z+H)

----

Пример # 46

20

Получение 6-(3H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-иламино)-4H-бензо[1,4]оксазин-3-она

4-хлор-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 6-амино-2H-бензо[b][1,4]оксазин-3(4H)-он (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 331.1223 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод I

в.у.: 2.36 мин. - найденная масса: 332.1 (m/z+H)

5 -----

Пример # 47

10 Получение 6-(8-метокси-3H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-иламино)-4H-бензо[1,4]оксазин-3-она

15 4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 6-амино-2H-бензо[b][1,4]оксазин-3(4H)-он (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью 20 полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 361.1363 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод I

25 в.у.: 2.42 мин. - найденная масса: 362.1 (m/z+H)

-----

Пример # 48

30 Получение (1H-бензотриазол-5-ил)-(8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 1Н-бензо[d][1,2,3]триазол-5-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 331.1334 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 1.66 мин. - найденная масса: 332.1 (m/z+H)

----

#### Пример # 49

Получение 3-(8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-иламино)-бензамидина

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 3-аминобензимидамид (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 332.1604 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 1.44 мин. - найденная масса: 333.1 (m/z+H)

----

5

Пример # 50

Получение (8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-(4-пиперидин-1-ил-фенил)-амина

10

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 4-(пиперидин-1-ил)анилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

15

20

точная масса: 373.226 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 1.83 мин. - найденная масса: 374.2 (m/z+H)

25

----

Пример # 51

30

Получение N-(8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-N',N'-диметилбензол-1,4-диамина

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и N1,N1-диметилбензол-1,4-диамин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в

MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл).

5 Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 333.1874 г/моль

10

ВЭЖХ-МС: аналитический метод I

в.у.: 2.50 мин. - найденная масса: 334.2 (m/z+H)

----

15

Пример # 52

Получение 3-(8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-иламино)-бензамида

20 4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 3-аминобензамид (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без

25 дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

30

точная масса: 333.1423 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод B

в.у.: 1.65 мин. - найденная масса: 334.1 (m/z+H)

----

## Пример # 53

## 5        Получение (3,4-диметокси-фенил)-(8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 3,4-диметоксианилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 350.1638 г/моль

20        ВЭЖХ-МС: аналитический метод В  
в.у.: 1.84 мин. - найденная масса: 351.1 (m/z+H)

----

## 25        Пример # 54

## Получение (8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-(4-морфолин-4-ил-фенил)-амина

30        4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 4-морфолиноанилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без

дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

5

точная масса: 375.2008 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 1.87 мин. - найденная масса: 367.2 (m/z+H)

10

----

Пример # 55

15           Получение           (8-метокси-2H-пиразоло[3,4-c]хинолин-4-ил)-(2-метил-3H-бензоимидазол-5-ил)-амина

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-c]хинолин (0.16 ммоль) и 2-метил-1H-бензоимидазол-6-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

25

точная масса: 344.1599 г/моль

30           ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 1.39 мин. - найденная масса: 345.2 (m/z+H)

----

## Пример # 56

Получение (1Н-индазол-5-ил)-(2Н-2,3,5,9-тетрааза-циклопента[а]нафталин-4-ил)-амина

5

6-хлор-8-(4-метоксибензил)-8Н-пиразоло[3,4-с][1,5]нафтиридин (0.16 ммоль) и 1Н-индазол-5-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

15

точная масса: 301.1195 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 1.48 мин. - найденная масса: 302.1 (m/z+H)

20

----

## Пример # 57

Получение 4-(8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-иламино)-бензойной кислоты

25

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 4-аминобензойную кислоту (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную

30

смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 334.1242 г/моль

5

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 1.87 мин. - найденная масса: 335.1 (m/z+H)

----

10

Пример # 58

Получение 4-(8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-иламино)-бензамида

15 4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 4-аминобензамид (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без  
20 дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

25 точная масса: 333.1423 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 1.66 мин. - найденная масса: 334.1 (m/z+H)

30

----

Пример # 59

Получение 4-(8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-иламино)-бензонитрила

5 4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 4-аминобензонитрил (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь 10 облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

15 точная масса: 315.1279 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 2.51 мин. - найденная масса: 317.1 (m/z+H)

----

20

Пример # 60

Получение (3-метокси-фенил)-(8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

25

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 3-метоксианилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без 30 дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 320.1498 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

5 в.у.: 1.90 мин. - найденная масса: 321.1 (m/z+H)

----

10 Пример # 61

Получение (4-метокси-фенил)-(8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

15 4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 4-метоксианилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь  
20 облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

25 точная масса: 320.1498 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 1.86 мин. - найденная масса: 321.1 (m/z+H)

----

30

Пример # 62

Получение 3-(8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-иламино)-бензонитрила

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 3-аминобензонитрил (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 315.1279 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 2.19 мин. - найденная масса: 316.1 (m/z+H)

----

Пример # 63

20

Получение бензо[с][1,2,5]тиадиазол-5-ил-(8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и бензо[с][1,2,5]тиадиазол-5-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

30

точная масса: 348.0925 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 2.47 мин. - найденная масса: 349.1 (m/z+H)

5 ----

Пример # 64

10 Получение 3-(8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-иламино)-1H-  
пиридин-2-она

15 4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16  
ммоль) и 3-аминопиридин-2(1H)-он (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH  
(сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в  
20 диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе  
в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без  
дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь  
облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную  
смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и  
лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 307.1233 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

25 в.у.: 1.69 мин. - найденная масса: 308.1 (m/z+H)

----

Пример # 65

30

Получение (2-этокси-фенил)-(8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-  
амина

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 2-этоксианилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

10

точная масса: 334.1693 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 1.96 мин. - найденная масса: 335.1 (m/z+H)

15

----

Пример # 66

20

Получение (8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-(1Н-пиразол-3-ил)-амина

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 1Н-пиразол-3-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

30

точная масса: 280.1224 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 1.73 мин. - найденная масса: 281.1 (m/z+H)

----

5

Пример # 67

Получение (8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-(3,4,5-триметокси-фенил)-амина

10

15

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 3,4,5-триметоксианилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

20

точная масса: 380.1777 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 1.89 мин. - найденная масса: 381.1 (m/z+H)

25

----

Пример # 68

30

Получение 5-(8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-иламино)-1H-пиразол-4-карбоксамида

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 5-амино-1H-пиразол-4-карбоксамид (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали

в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл).

5 Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 323.1288 г/моль

10

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 1.70 мин. - найденная масса: 324.1 (m/z+H)

----

15

Пример # 69

Получение (8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-(2-феноксифенил)-амина

20

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 2-феноксанилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

30

точная масса: 382.1674 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 2.17 мин. - найденная масса: 383.1 (m/z+H)

----

## Пример # 70

5

Получение (8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-(3-феноксифенил)-амина

10 4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 3-феноксанилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без

15 облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 382.1674 г/моль

20

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 2.36 мин. - найденная масса: 383.1 (m/z+H)

----

25

## Пример # 71

Получение 5-(8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-иламино)-1,3-дигидро-бензоимидазол-2-она

30

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 5-амино-1Н-бензо[d]имидазол-2(3Н)-он (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в

микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 346.1348 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

10 в.у.: 1.59 мин. - найденная масса: 347.1 (m/z+H)

----

Пример # 72

15

Получение (1H-индол-5-ил)-(8-метокси-3H-пиразоло[3,4-c]хинолин-4-ил)-амина

20 4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-c]хинолин (0.16 ммоль) и 1H-индол-5-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

25

точная масса: 329.1474 г/моль

30

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 1.93 мин. - найденная масса: 330.1 (m/z+H)

----

## Пример # 73

Получение (4-аминометил-фенил)-(8-метокси-3Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-  
5 4-ил)-амина

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16  
ммоль) и сложный трет-бутиловый эфир (4-амино-бензил)-карбаминовой  
кислоты (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке  
10 для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли).  
Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при  
140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной  
очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в  
микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь  
15 концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и  
лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 319.1679 г/моль

20 ВЭЖХ-МС: аналитический метод В  
в.у.: 1.32 мин. - найденная масса: 320.2 (m/z+H)

----

## 25 Пример # 74

Получение (1Н-индазол-6-ил)-(8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-  
ил)-амина

30 4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16  
ммоль) и 1Н-индазол-6-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом,  
3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане  
(4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в  
течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без

дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

5

точная масса: 330.1404 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 1.78 мин. - найденная масса: 331.1 (m/z+H)

10

----

Пример # 75

15 Получение (1H-индол-6-ил)-(8-метокси-3H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 1H-индол-6-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

25

точная масса: 329.1474 г/моль

30 ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 1.84 мин. - найденная масса: 330.1 (m/z+H)

----

## Пример # 76

Получение N-(8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-N',N'-диметил-бензол-1,3-диамина

5

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и N1,N1-диметилбензол-1,3-диамин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

15

точная масса: 333.1874 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 1.95 мин. - найденная масса: 334.2 (m/z+H)

20

----

## Пример # 77

Получение (8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-(5-фенил-2H-пиразол-3-ил)-амина

25

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 3-фенил-1H-пиразол-5-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при

30

140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 356.1594 г/моль

5

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 2.06 мин. - найденная масса: 357.1 (m/z+H)

----

10

Пример # 78

Получение N,N-диэтил-N'-(8-метокси-2H-пиразоло[3,4-c]хинолин-4-ил)-бензол-1,4-диамина

15

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-c]хинолин (0.16 ммоль) и N1,N1-диэтилбензол-1,4-диамин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

25

точная масса: 361.2265 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 1.77 мин. - найденная масса: 334.2 (m/z+H)

30

----

Пример # 79

Получение (8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-(4-пирролидин-1-ил-фенил)-амина

5 4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 4-(пирролидин-1-ил)анилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл).  
10 Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 359.2065 г/моль

15

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 2.15 мин. - найденная масса: 360.2 (m/z+H)

----

20

Пример # 80

Получение N-(8-метокси-3Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-4Н-[1,2,4]триазол-3,5-диамина

25

4Н-1,2,4-триазол-3,5-диамин (0.4 ммоль 2 экв.) растворяли в ТГФ (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли 2М LiHMDS в ТГФ (0.6 ммоль 4 экв.). Смесь перемешивали в течение 20 мин. при к.т. и затем добавляли к раствору 4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолина (0.16 ммоль, 1 экв.) в пиридине (2 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 20 мин. при 200°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5  
30

мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 296.1279 г/моль

5

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 2.13 мин. - найденная масса: 297.1 (m/z+H)

----

10

Пример # 81

Получение (8-метокси-3H-пиразоло[3,4-c]хинолин-4-ил)-(3-морфолин-4-ил-фенил)-амина

15

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-c]хинолин (0.16 ммоль) и 3-морфолиноанилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

25

точная масса: 375.2008 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 1.87 мин. - найденная масса: 376.2 (m/z+H)

30

----

Пример # 82

Получение (1H-индол-5-ил)-(2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

4-хлор-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 1H-индол-5-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 299.1335 г/моль

15 ВЭЖХ-МС: аналитический метод В  
в.у.: 1.86 мин. - найденная масса: 300.1 (m/z+H)

----

20 Пример # 83

Получение (8-бром-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-(4-пиперидин-1-ил-фенил)-амина

25 8-бром-4-хлор-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 4-(пиперидин-1-ил)анилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 421.1198 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 2.09 мин. - найденная масса: 422.1 (m/z+H)

5

----

Пример # 84

10            Получение            N-(8-бром-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-N',N'-диметил-  
бензол-1,4-диамина

8-бром-4-хлор-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин            (0.16  
ммоль) и N1,N1-диметилбензол-1,4-диамин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в  
15    MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли  
HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом  
реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и  
использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл).  
20    Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при  
140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью  
полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 381.0814 г/моль

25            ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 2.06 мин. - найденная масса: 382.1 (m/z+H)

----

30            Пример # 85

Получение            (5-циклобутил-2H-пиразол-3-ил)-(8-метокси-2H-пиразоло[3,4-  
с]хинолин-4-ил)-амина

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 3-циклобутил-1Н-пиразол-5-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 334.1805 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 2.02 мин. - найденная масса: 335.2 (m/z+H)

----

Пример # 86

Получение [4-(4,5-дигидро-1Н-имидазол-2-ил)-фенил]-(8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 4-(4,5-дигидро-1Н-имидазол-2-ил)анилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 358.1794 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 1.69 мин. - найденная масса: 359.2 (m/z+H)

----

5

Пример # 87

Получение 4-[4-(8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-иламино)-фенил]-морфолин-3-она

10

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 4-(4-аминофенил)морфолин-3-он (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

15

20

точная масса: 389.1752 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 1.72 мин. - найденная масса: 390.2 (m/z+H)

25

----

Пример # 88

Получение (2,2-диметил-3,4-дигидро-2Н-бензо[1,4]тиазин-6-ил)-(8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

30

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 2,2-диметил-3,4-дигидро-2Н-бензо[b][1,4]тиазин-6-амин (2 экв., 0.3

5 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

10 точная масса: 391.178 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 2.19 мин. - найденная масса: 392.1 (m/z+H)

15 ----

Пример # 89

20 Получение (4-морфолин-4-ил-фенил)-(2H-2,3,5,9-тетрааза-циклопента[а]нафталин-4-ил)-амина

25 6-хлор-8-(4-метоксибензил)-8H-пиразоло[3,4-с][1,5]нафтиридин (0.16 ммоль) и 4-морфолиноанилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и

30 лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 346.18 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод А

в.у.: 1.87 мин. - найденная масса: 347.2 (m/z+H)

----

5           Пример # 90

Получение                   (1H-индазол-5-ил)-(8-метокси-2H-2,3,5,9-тетрааза-циклопента[а]нафталин-4-ил)-амина

10           6-хлор-2-метокси-8-(4-метоксибензил)-8H-пиразоло[3,4-с][1,5]нафтиридин (0.16 ммоль) и 1H-индазол-5-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без  
15           дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

20           точная масса: 331.1334 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод А

в.у.: 1.97 мин. - найденная масса: 332.1 (m/z+H)

25           ----

Пример # 91

30           Получение   (1H-индазол-6-ил)-(2H-2,3,5,7-тетрааза-циклопента[а]нафталин-4-ил)-амина

4-хлор-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с][1,7]нафтиридин           (0.16 ммоль) и 1H-индазол-6-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане

(4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 301.1195 г/моль

10 ВЭЖХ-МС: аналитический метод А  
в.у.: 1.51 мин. - найденная масса: 302.0 (m/z+H)

----

15 Пример # 92

Получение (7,8-диэтокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-(1H-индазол-6-ил)-амина

20 4-хлор-7,8-диэтокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 1H-индазол-6-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без  
25 дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

30 точная масса: 388.1933 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод А  
в.у.: 2.20 мин. - найденная масса: 389.2 (m/z+H)

----

## Пример # 93

5           Получение           7-(8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-иламино)-3,4-дигидро-1H-хинолин-2-она

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 7-амино-3,4-дигидрохинолин-2(1H)-он (2 экв., 0.3 ммоль) 10 суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 15 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 359.1614 г/моль

20           ВЭЖХ-МС: аналитический метод В  
в.у.: 1.75 мин. - найденная масса: 360.2 (m/z+H)

----

## 25           Пример # 94

Получение           6-(8-метокси-3H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-иламино)-4H-бензо[1,4]тиазин-3-она

30           4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 6-амино-2H-бензо[b][1,4]тиазин-3(4H)-он (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь

упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

5

точная масса: 377.1134 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 1.88 мин. - найденная масса: 378.1 (m/z+H)

10

----

Пример # 95

15           Получение       (5-трет-бутил-1Н-пиразол-3-ил)-(8-метокси-3Н-пиразоло[3,4-  
с]хинолин-4-ил)-амина

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин       (0.16  
ммоль) и 5-(трет-бутил)-1Н-пиразол-3-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в  
20       MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли  
HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом  
реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и  
использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл).  
25       Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при  
140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью  
полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 336.2004 г/моль

30           ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 2.05 мин. - найденная масса: 337.2 (m/z+H)

----

## Пример # 96

Получение (8-метокси-3Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-(5-метил-2Н-пиразол-3-ил)-амина

5

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 3-метил-1Н-пиразол-5-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

15

точная масса: 294.1419 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 1.82 мин. - найденная масса: 295.1 (m/z+H)

20

----

## Пример # 97

Получение (5-циклопропил-1Н-пиразол-3-ил)-(8-метокси-3Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

25

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 5-циклопропил-1Н-пиразол-3-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при

30

140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 320.1609 г/моль

5

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 1.95 мин. - найденная масса: 321.1 (m/z+H)

----

10

Пример # 98

Получение (8-метокси-3H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-[4-(1H-тетразол-5-ил)-фенил]-амина

15

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 4-(1H-тетразол-5-ил)анилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

25

точная масса: 358.1454 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 1.89 мин. - найденная масса: 359.1 (m/z+H)

30

----

Пример # 99

Получение (8-бром-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-(1Н-индол-5-ил)-амина

8-бром-4-хлор-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 1Н-индол-5-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 377.0414 г/моль

15

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 2.06 мин. - найденная масса: 378.1 (m/z+H)

----

20

Пример # 100

Получение бензо[1,3]диоксол-5-ил-(8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

25

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и бензо[d][1,3]диоксол-5-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

30

точная масса: 334.1242 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

5 в.у.: 1.87 мин. - найденная масса: 335.1 (m/z+H)

----

10 Пример # 101

Получение (2,3-дигидро-бензо[1,4]диоксин-6-ил)-(8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

15 4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 2,3-дигидробензо[b][1,4]диоксин-6-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в 20 ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

25 точная масса: 348.1438 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 1.89 мин. - найденная масса: 349.1 (m/z+H)

----

30

Пример # 102

Получение (8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-[4-(1-метилпиперидин-4-ил)-фенил]-амина

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 4-(1-метилпиперидин-4-ил)анилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 387.2455 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 1.98 мин. - найденная масса: 388.2 (m/z+H)

----

Пример # 103

Получение (8-метокси-3Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-(6-морфолин-4-ил-пиперидин-3-ил)-амина

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 6-морфолинопиперидин-3-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 376.1938 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 1.75 мин. - найденная масса: 377.2 (m/z+H)

5 -----

Пример # 104

10 Получение [4-(2-метокси-этокси)-фенил]-(8-метокси-3Н-пиразоло[3,4-  
с]хинолин-4-ил)-амина

15 4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16  
ммоль) и 4-(2-метоксиэтокси)анилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH  
(сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в  
диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе  
в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без  
дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь  
20 облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную  
смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и  
лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 364.1833 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

25 в.у.: 1.90 мин. - найденная масса: 365.2 (m/z+H)

-----

Пример # 105

30 Получение (4-этокси-3-метокси-фенил)-(8-метокси-3Н-пиразоло[3,4-  
с]хинолин-4-ил)-амина

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 4-этокси-3-метоксианилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 364.1832 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 1.99 мин. - найденная масса: 365.2 (m/z+H)

----

#### Пример # 106

Получение 1-[4-(8-метокси-3Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-иламино)-фенил]-пирролидин-2-она

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 1-(4-аминофенил)пирролидин-2-он (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 373.1808 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 1.81 мин. - найденная масса: 374.2 (m/z+H)

----

5

Пример # 107

Получение (8-метокси-3Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-(4-тиоморфолин-4-ил-фенил)-амина

10

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 4-тиоморфолиноанилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

15

20

точная масса: 391.1779 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 2.10 мин. - найденная масса: 392.2 (m/z+H)

25

----

Пример # 108

30

Получение 5-(8-метокси-3Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-иламино)-3Н-бензооксазол-2-она

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 5-аминобензо[d]оксазол-2(3Н)-он (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в

MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл).

5 Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 347.1168 г/моль

10

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 1.74 мин. - найденная масса: 348.1 (m/z+H)

----

15

Пример # 109

Получение (3,4-дигидро-2H-бензо[1,4]оксазин-6-ил)-(8-метокси-3H-пиразоло[3,4-c]хинолин-4-ил)-амина

20

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-c]хинолин (0.16 ммоль) и сложный трет-бутиловый эфир 6-амино-2,3-дигидро-бензо[1,4]оксазин-4-карбоновой кислоты (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

30

точная масса: 347.1619 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 1.87 мин. - найденная масса: 348.2 (m/z+H)

----

5           Пример # 110

Получение                   7-(8-метокси-3H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-иламино)-  
хиназолин-4-ола

10           4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин       (0.16  
ммоль) и 7-аминохиназолин-4-ол (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH  
(сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в  
диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе  
в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без  
15           дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь  
облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную  
смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и  
лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

20           точная масса: 358.1343 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 1.88 мин. - найденная масса: 359.2 (m/z+H)

25           ----

Пример # 111

30           Получение                   [4-(1,1-диоксо-1лямбда-6-тиоморфолин-4-ил)-фенил]-(8-  
метокси-3H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин       (0.16  
ммоль) и 1,1-диоксид 4-(4-аминофенил)тиоморфолина (2 экв., 0.3 ммоль)  
суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5

мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 423.1667 г/моль

10 ВЭЖХ-МС: аналитический метод В  
в.у.: 1.78 мин. - найденная масса: 424.1 (m/z+H)

----

15 Пример # 112

Получение 2-[4-(8-метокси-3H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-иламино)-фенил]-ацетамида

20 4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 2-(4-аминофенил)ацетамид (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без  
25 дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

30 точная масса: 347.1619 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В  
в.у.: 1.64 мин. - найденная масса: 348.2 (m/z+H)

-----  
Пример # 113

## 5 Получение 3-(8-метокси-3Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-иламино)-фенола

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 3-аминофенол (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

15 точная масса: 306.1303 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

20 в.у.: 1.76 мин. - найденная масса: 307.1 (m/z+H)

-----  
Пример # 114

25

Получение (3,4-диэтокси-фенил)-(8-метокси-3Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 3,4-диэтоксианилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь

облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

5            точная масса: 378.2027 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 2.04 мин. - найденная масса: 379.2 (m/z+H)

10            ----

Пример # 115

15            Получение        (8-бром-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-(4-морфолин-4-ил-фенил)-амина

20            8-бром-4-хлор-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин        (0.16 ммоль) и 4-морфолиноанилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

25

                  точная масса: 423.0947 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

30            в.у.: 2.05 мин. - найденная масса: 424.1 (m/z+H)

-----

Пример # 116

Получение 6-(8-бром-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-иламино)-4H-бензо[1,4]оксазин-3-она

5 8-бром-4-хлор-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 6-амино-2H-бензо[b][1,4]оксазин-3(4H)-он (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь 10 упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

15 точная масса: 409.0302 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 1.98 мин. - найденная масса: 410.0 (m/z+H)

20 ----

Пример # 117

Получение 6-(8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-иламино)-1H-бензо[d][1,3]оксазин-2,4-диона

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 6-амино-1H-бензо[d][1,3]оксазин-2,4-дион (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь 30 упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5

мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 375.1107 г/моль

5

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 1.77 мин. - найденная масса: 376.1 (m/z+H)

----

10

Пример # 118

Получение 2-метокси-5-(8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-иламино)-фенола

15

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 5-амино-2-метоксифенол (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

25

точная масса: 336.1442 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 1.74 мин. - найденная масса: 337.1 (m/z+H)

30

----

Пример # 119

Получение (8-бром-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-(1H-пиразол-3-ил)-амина

8-бром-4-хлор-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 1H-пиразол-3-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 328.0163 г/моль

15

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 1.84 мин. - найденная масса: 329.0 (m/z+H)

----

20

Пример # 120

Получение N-[3-(8-метокси-3H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-иламино)-фенил]-ацетамида

25

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и N-(3-аминофенил)ацетамид (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

30

точная масса: 347.1618 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

5 в.у.: 1.73 мин. - найденная масса: 348.1 (m/z+H)

----

10 Пример # 121

Получение (8-метокси-3H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-(1H-пиразол-4-ил)-амина

15 4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 1H-пиразол-4-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь  
20 облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 280.1224 г/моль

25

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 1.54 мин. - найденная масса: 281.1 (m/z+H)

----

30

Пример # 122

Получение (3,4-диметокси-фенил)-(7,8-диметокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

4-хлор-7,8-диметокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин  
 (0.16 ммоль) и 3,4-диметоксианилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH  
 (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в  
 5 диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе  
 в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без  
 дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь  
 облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную  
 смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и  
 10 лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 380.1776 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод I

15 в.у.: 2.19 мин. - найденная масса: 381.2 (m/z+H)

----

Пример # 123

20

Получение (3,4-диметокси-фенил)-(2Н-2,3,5,9-тетрааза-  
 циклопента[а]нафталин-4-ил)-амина

6-хлор-8-(4-метоксибензил)-8Н-пиразоло[3,4-с][1,5]нафтиридин (0.16  
 25 ммоль) и 3,4-диметоксианилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH  
 (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в  
 диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе  
 в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без  
 дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь  
 30 облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную  
 смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и  
 лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 321.1428 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод А

в.у.: 1.92 мин. - найденная масса: 322.1 (m/z+H)

5 ----

Пример # 124

10 Получение (4-фтор-3-метокси-фенил)-(8-метокси-2H-пиразоло[3,4-  
с]хинолин-4-ил)-амина

15 4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16  
ммоль) и 4-фтор-3-метоксианилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH  
(сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в  
20 диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе  
в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без  
дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь  
облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную  
смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и  
лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 338.1377 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

25 в.у.: 1.97 мин. - найденная масса: 339.1 (m/z+H)

----

Пример # 125

30

Получение (3-фтор-4-метокси-фенил)-(8-метокси-2H-пиразоло[3,4-  
с]хинолин-4-ил)-амина

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 3-фтор-4-метоксианилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

10

точная масса: 338.1377 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 1.98 мин. - найденная масса: 339.1 (m/z+H)

15

----

Пример # 126

20      Получение      (8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-(1-метил-1Н-бензоимидазол-5-ил)-амина

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 1-метил-1Н-бензоимидазол-5-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

30

точная масса: 344.1599 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 1.51 мин. - найденная масса: 345.2 (m/z+H)

----

5

Пример # 127

Получение 1-[3-(8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-иламино)-фенил]-этанона

10

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 1-(3-аминофенил)этан-1-он (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

20

точная масса: 332.1493 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 1.92 мин. - найденная масса: 333.1 (m/z+H)

25

----

Пример # 128

30

Получение N-[4-(8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-иламино)-фенил]-ацетамида

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и N-(4-аминофенил)ацетамид (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH

(сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 347.1618 г/моль

10

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 1.73 мин. - найденная масса: 348.2 (m/z+H)

----

15

Пример # 129

Получение (8-метокси-2H-пиразоло[3,4-c]хинолин-4-ил)-пиридин-2-ил-амина

20

Пиридин-2-ил-амин (0.4 ммоль 2 экв.) растворяли в ТГФ (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли 2M LiHMDS в ТГФ (0.6 ммоль 4 экв.). Смесь перемешивали в течение 20 мин. при к.т. и затем добавляли к раствору 4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-c]хинолина (0.16 ммоль, 1 экв.) в пиридине (2 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 20 мин. при 200°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

30

точная масса: 291.1289 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 1.937 мин. - найденная масса: 292.1 (m/z+H)

----

5           Пример # 130

Получение   (8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-(1H-пирроло[2,3-  
b]пиридин-6-ил)-амина

10           1H-пирроло[2,3-b]пиридин-6-амин (0.4 ммоль 2 экв.) растворяли в ТГФ  
(сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли 2M  
LiHMDS в ТГФ (0.6 ммоль 4 экв.). Смесь перемешивали в течение 20 мин. при  
к.т. и затем добавляли к раствору 4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-  
15           пиразоло[3,4-с]хинолина (0.16 ммоль, 1 экв.) в пиридине (2 мл). Реакционную  
смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 20 мин. при 200°C.  
Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки.  
Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в  
микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь  
20           концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и  
лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 330.1404 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

25           в.у.: 2.352 мин. - найденная масса: 331.1 (m/z+H)

----

Пример # 131

30           Получение                   3-(8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-иламино)-  
бензолсульфонамида

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 3-аминобензолсульфонамид (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 369.1087 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 1.791 мин. - найденная масса: 370.1 (m/z+H)

----

#### Пример # 132

Получение 4-(8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-иламино)-бензолсульфонамида

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 4-аминобензолсульфонамид (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 369.1087 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 1.881 мин. - найденная масса: 370.1 (m/z+H)

----

5

Пример # 133

Получение (7,8-диметокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-(4-морфолин-4-ил-фенил)-амина

10

4-хлор-7,8-диметокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 4-морфолиноанилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

20

точная масса: 405.2148 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 1.83 мин. - найденная масса: 406 (m/z+H)

25

----

Пример # 134

30

Получение (7,8-диметокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-[4-(4-метилпиперазин-1-ил)-фенил]-амина

4-хлор-7,8-диметокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 4-(4-метилпиперазин-1-ил)анилин (2 экв., 0.3 ммоль)

5 суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

10 точная масса: 418.2524 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 1,43 мин. - найденная масса: 419 (m/z+H)

----

15

Пример # 135

Получение N-(7,8-диметокси-2H-пиразоло[3,4-c]хинолин-4-ил)-N',N'-  
диметил-бензол-1,4-диамина

20

4-хлор-7,8-диметокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-c]хинолин  
(0.16 ммоль) и N1,N1-диметилбензол-1,4-диамин (2 экв., 0.3 ммоль)  
25 суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

30

точная масса: 363.2013 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 1.87 мин. - найденная масса: 364 (m/z+H)

----

## Пример # 136

5

Получение (7,8-диметокси-2H-пиразоло[3,4-c]хинолин-4-ил)-(1H-индазол-6-ил)-амина

10 4-хлор-7,8-диметокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-c]хинолин (0.16 ммоль) и 1H-индазол-6-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь  
15 облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 360.1543 г/моль

20

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 1,98 мин. - найденная масса: 361 (m/z+H)

----

25

## Пример # 137

Получение N-(8-метокси-2H-пиразоло[3,4-c]хинолин-4-ил)-пиридин-2,6-диамина

30

Пиридин-2,6-диамин (0.4 ммоль 2 экв.) растворяли в ТГФ (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли 2M LiHMDS в ТГФ (0.6 ммоль 4 экв.). Смесь перемешивали в течение 20 мин. при к.т. и затем добавляли к раствору 4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-c]хинолина

(0.16 ммоль, 1 экв.) в пиридине (2 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 20 мин. при 200°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 306.1414 г/моль

10 ВЭЖХ-МС: аналитический метод В  
в.у.: 1.905 мин. - найденная масса: 307.1 (m/z+H)

----

15 Пример # 138

Получение (8-метокси-2H-пиразоло[3,4-c]хинолин-4-ил)-(1,2,3-триметил-1H-индол-5-ил)-амина

20 4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-c]хинолин (0.16 ммоль) и 1,2,3-триметил-1H-индол-5-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и  
25 использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

30 точная масса: 371.206 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В  
в.у.: 2.207 мин. - найденная масса: 372.2 (m/z+H)

----

## Пример # 139

5 Получение N2-(8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)пиримидин-2,4-диамина

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и пиримидин-2,4-диамин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

15

точная масса: 307.1344 г/моль

20 ВЭЖХ-МС: аналитический метод В  
в.у.: 1.695 мин. - найденная масса: 308.1 (m/z+H)

----

## 25 Пример # 140

Получение (8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-(5-метилсульфанил-4H-[1,2,4]триазол-3-ил)-амина

30 5-(метилтио)-4H-1,2,4-триазол-3-амин (0.4 ммоль 2 экв.) растворяли в ТГФ (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли 2M LiHMDS в ТГФ (0.6 ммоль 4 экв.). Смесь перемешивали в течение 20 мин. при к.т. и затем добавляли к раствору 4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолина (0.16 ммоль, 1 экв.) в пиридине (2 мл). Реакционную

смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 20 мин. при 200°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 327.1064 г/моль

10 ВЭЖХ-МС: аналитический метод В  
в.у.: 2.73 мин. - найденная масса: 328.1 (m/z+H)

----

15 Пример # 141

Получение (5-циклопропил-4Н-[1,2,4]триазол-3-ил)-(8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

20 5-циклопропил-4Н-1,2,4-триазол-3-амин (0.4 ммоль 2 экв.) растворяли в ТГФ (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли 2М LiHMDS в ТГФ (0.6 ммоль 4 экв.). Смесь перемешивали в течение 20 мин. при к.т. и затем добавляли к раствору 4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолина (0.16 ммоль, 1 экв.) в пиридине (2 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 20 мин. при 200°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 321.154 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 1.895 мин. - найденная масса: 322.1 (m/z+H)

----

5           Пример # 142

Получение           N-[2-метокси-5-(8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-иламино)-фенил]-ацетамида

10           4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и N-(5-амино-2-метоксифенил)ацетамид (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь  
15 упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

20           точная масса: 377.1758 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 1.793 мин. - найденная масса: 378.2 (m/z+H)

25           ----

Пример # 143

30           Получение           (1H-бензоимидазол-2-ил)-(8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

1H-бензоимидазол-2-амин (0.4 ммоль 2 экв.) растворяли в ТГФ (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли 2M LiHMDS в ТГФ (0.6 ммоль 4 экв.). Смесь перемешивали в течение 20 мин. при к.т. и затем

добавляли к раствору 4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолина (0.16 ммоль, 1 экв.) в пиридине (2 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 20 мин. при 200°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 330.1404 г/моль

10

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 1.936 мин. - найденная масса: 330.2 (m/z+H)

----

15

Пример # 144

Получение (1H-имидазол-2-ил)-(8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

20

1H-имидазол-2-амин (0.4 ммоль 2 экв.) растворяли в ТГФ (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли 2M LiHMDS в ТГФ (0.6 ммоль 4 экв.). Смесь перемешивали в течение 20 мин. при к.т. и затем добавляли к раствору 4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолина (0.16 ммоль, 1 экв.) в пиридине (2 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 20 мин. при 200°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

30

точная масса: 280.1224 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 1.924 мин. - найденная масса: 331.1 (m/z+H)

----

5           Пример # 145

Получение   1-[4-(8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-иламино)-фенил]-этанона

10           4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин       (0.16 ммоль) и 1-(4-аминофенил)этан-1-он (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без  
15           дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

20           точная масса: 332.1493 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В

в.у.: 2.196 мин. - найденная масса: 333.1 (m/z+H)

25           ----

Пример # 146

30           Получение       (4H-бензо[1,3]диоксин-6-ил)-(8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин       (0.16 ммоль) и 4H-бензо[d][1,3]диоксин-6-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли

НСI в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл).  
 5 Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 348.1438 г/моль

10 ВЭЖХ-МС: аналитический метод В  
 в.у.: 1.844 мин. - найденная масса: 349.1 (m/z+H)

----

15 Пример # 147

Получение (1,3-дигидро-изобензофуран-5-ил)-(8-метокси-2H-пиразоло[3,4-  
 с]хинолин-4-ил)-амина

20 4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 1,3-дигидроизобензофуран-5-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли НСI в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и  
 25 использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

30 точная масса: 332.1493 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод В  
 в.у.: 1.806 мин. - найденная масса: 333.1 (m/z+H)

----

## Пример # 148

5           Получение           (8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-(3-метил-3H-бензоимидазол-5-ил)-амина

          4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин           (0.16  
 ммоль) и 1-метил-1H-бензоимидазол-6-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали  
 10 в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли  
 HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом  
 реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и  
 использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл).  
 15 Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при  
 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью  
 полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

          точная масса: 344.1599 г/моль

20           ВЭЖХ-МС: аналитический метод В  
           в.у.: 1.518 мин. - найденная масса: 345.1 (m/z+H)

----

## 25           Пример # 149

          Получение           (4,5-диметил-тиазол-2-ил)-(8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

30           4,5-диметилтиазол-2-амин (0.4 ммоль 2 экв.) растворяли в ТГФ (сухом, 3  
 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли 2M LiHMDS в  
 ТГФ (0.6 ммоль 4 экв.). Смесь перемешивали в течение 20 мин. при к.т. и затем  
 добавляли к раствору 4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-  
 с]хинолина (0.16 ммоль, 1 экв.) в пиридине (2 мл). Реакционную смесь облучали

5 в микроволновом реакторе в течение 20 мин. при 200°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 325.1205 г/моль

10 ВЭЖХ-МС: аналитический метод В  
в.у.: 2.397 мин. - найденная масса: 326.1 (m/z+H)

----

#### 15 Пример # 150

Получение (5-циклопропил-1H-пиразол-3-ил)-(7,8-диметокси-2H-пиразоло[3,4-c]хинолин-4-ил)-амина

20 4-хлор-7,8-диметокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-c]хинолин  
(0.16 ммоль) и 5-циклопропил-1H-пиразол-3-амин (2 экв., 0.3 ммоль)  
суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5  
мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в  
микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь  
25 упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в  
ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5  
мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью  
полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

30 точная масса: 350.1748 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод А  
в.у.: 2,05 мин. - найденная масса: 351 (m/z+H)

----

## Пример # 151

Получение (3,4-дигидро-2H-бензо[1,4]оксазин-6-ил)-(7,8-диметокси-2H-  
5 пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

4-хлор-7,8-диметокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин  
(0.16 ммоль) и сложный трет-бутиловый эфир 6-амино-2,3-дигидро-  
бензо[1,4]оксазин-4-карбоновой кислоты (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в  
10 MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли  
HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом  
реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и  
использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл).  
15 Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при  
140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью  
полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 377.1758 г/моль

20 ВЭЖХ-МС: аналитический метод А  
в.у.: 2,06 мин. - найденная масса: 378 (m/z+H)

----

## 25 Пример # 152

Получение 5-(7,8-диметокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-иламино)-2-  
метокси-фенола

30 4-хлор-7,8-диметокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин  
(0.16 ммоль) и 5-амино-2-метоксифенол (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в  
MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли  
HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом  
реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и

использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

5

точная масса: 366.1581 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод А

в.у.: 1,96 мин. - найденная масса: 367 (m/z+H)

10

----

Пример # 153

15 Получение (8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-[2-метил-4-(4-метил-пиперазин-1-ил)-фенил]-амина

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 2-метил-4-(4-метилпиперазин-1-ил)анилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

25

точная масса: 402.258 г/моль

30 ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

в.у.: 1.457 мин. - найденная масса: 403.2 (m/z+H)

----

## Пример # 154

Получение (8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-(4-метил-пиридин-2-ил)-амина

5

4-метилпиридин-2-амин (0.4 ммоль 2 экв.) растворяли в ТГФ (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли 2М LiHMDS в ТГФ (0.6 ммоль 4 экв.). Смесь перемешивали в течение 20 мин. при к.т. и затем добавляли к раствору 4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолина (0.16 ммоль, 1 экв.) в пиридине (2 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 20 мин. при 200°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

15

точная масса: 305.1484 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

20

в.у.: 1.902 мин. - найденная масса: 306.1 (m/z+H)

----

## Пример # 155

25

Получение (8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-(6-метил-пиридин-2-ил)-амина

30

6-метилпиридин-2-амин (0.4 ммоль 2 экв.) растворяли в ТГФ (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли 2М LiHMDS в ТГФ (0.6 ммоль 4 экв.). Смесь перемешивали в течение 20 мин. при к.т. и затем добавляли к раствору 4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолина (0.16 ммоль, 1 экв.) в пиридине (2 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 20 мин. при 200°C. Реакционную смесь

упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

5

точная масса: 305.1484 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

в.у.: 1.964 мин. - найденная масса: 306.2 (m/z+H)

10

----

#### Пример # 156

15           Получение           (4,6-диметил-пиридин-2-ил)-(8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

4,6-диметилпиридин-2-амин (0.4 ммоль 2 экв.) растворяли в ТГФ (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли 2M LiHMDS в ТГФ (0.6 ммоль 4 экв.). Смесь перемешивали в течение 20 мин. при к.т. и затем добавляли к раствору 4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолина (0.16 ммоль, 1 экв.) в пиридине (2 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 20 мин. при 200°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

30

точная масса: 319.1679 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

в.у.: 1.996 мин. - найденная масса: 320.2 (m/z+H)

----

## Пример # 157

5 Получение (8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-(4-метил-тиазол-2-ил)-амина

4-метилтиазол-2-амин (0.4 ммоль 2 экв.) растворяли в ТГФ (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли 2M LiHMDS в ТГФ (0.6 ммоль 4 экв.). Смесь перемешивали в течение 20 мин. при к.т. и затем добавляли к раствору 4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолина (0.16 ммоль, 1 экв.) в пиридине (2 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 20 мин. при 200°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 311.1009 г/моль

20 ВЭЖХ-МС: аналитический метод С  
в.у.: 2.382 мин. - найденная масса: 312.1 (m/z+H)

----

## 25 Пример # 158

Получение (8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-(4,5,6,7-тетрагидро-бензотиазол-2-ил)-амина

30 4,5,6,7-тетрагидробензо[d]тиазол-2-амин (0.4 ммоль 2 экв.) растворяли в ТГФ (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли 2M LiHMDS в ТГФ (0.6 ммоль 4 экв.). Смесь перемешивали в течение 20 мин. при к.т. и затем добавляли к раствору 4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолина (0.16 ммоль, 1 экв.) в пиридине (2 мл). Реакционную

смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 20 мин. при 200°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 351.1395 г/моль

10 ВЭЖХ-МС: аналитический метод С  
в.у.: 2.642 мин. - найденная масса: 352.1 (m/z+H)

----

15 Пример # 159

Получение (8-метокси-2H-пиразоло[3,4-c]хинолин-4-ил)-(4-феноксифенил)-амина

20 4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-c]хинолин (0.16 ммоль) и 4-феноксанилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

30 точная масса: 382.1674 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С  
в.у.: 2.223 мин. - найденная масса: 383.2 (m/z+H)

----

## Пример # 160

5 Получение (8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-(2-метил-1,2,3,4-тетрагидро-бензо[4,5]имидазо[1,2-а]пиразин-8-ил)-амина

10 4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 2-метил-1,2,3,4-тетрагидробензо[4,5]имидазо[1,2-а]пиразин-8-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в 15 микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

20 точная масса: 399.211 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

в.у.: 1.385 мин. - найденная масса: 400.2 (m/z+H)

----

25

## Пример # 161

Получение (8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-(4-пиридин-4-илметил-фенил)-амина

30

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 4-(пиридин-4-илметил)анилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом

реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 381.1855 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

10 в.у.: 1.496 мин. - найденная масса: 382.2 (m/z+H)

----

Пример # 162

15

Получение 4-(8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-иламино)-бензол-1,2-диола

20 4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 4-аминобензол-1,2-диол (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

25

точная масса: 322.1247 г/моль

30

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

в.у.: 1.628 мин. - найденная масса: 323.1 (m/z+H)

----

## Пример # 163

Получение (8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-[4-(1-метил-  
5 пиперидин-4-илокси)-фенил]-амина

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16  
ммоль) и 4-((1-метилпиперидин-4-ил)окси)анилин (2 экв., 0.3 ммоль)  
10 суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5  
мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в  
микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь  
упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в  
ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5  
15 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью  
полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 403.2399 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

20 в.у.: 1.460 мин. - найденная масса: 404.2 (m/z+H)

----

## Пример # 164

25

Получение 1-{4-[4-(8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-иламино)-  
фенил]-пиперазин-1-ил}-этанона

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16  
30 ммоль) и 1-(4-(4-аминофенил)пиперазин-1-ил)этан-1-он (2 экв., 0.3 ммоль)  
суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5  
мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в  
микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь  
упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в

ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

5 точная масса: 416.2324 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

в.у.: 1.707 мин. - найденная масса: 417.2 (m/z+H)

10 ----

Пример # 165

15 Получение (8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-[6-(4-метил-пиперазин-1-ил)-пиридин-3-ил]-амина

20 4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 6-(4-метилпиперазин-1-ил)пиридин-3-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью

25 полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 389.2315 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

30 в.у.: 1.356 мин. - найденная масса: 390.2 (m/z+H)

----

Пример # 166

Получение (6-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-[4-(4-метилпиперазин-1-ил)-фенил]-амина

5 4-хлор-6-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 4-(4-метилпиперазин-1-ил)анилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и  
10 использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

15 точная масса: 388.2384 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

в.у.: 1,43 мин. - найденная масса: 389 (m/z+H)

20 ----

Пример # 167

Получение (3,4-диметокси-фенил)-(6-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-  
25 4-ил)-амина

4-хлор-6-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 3,4-диметоксианилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе  
30 в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную

смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 350.1637 г/моль

5

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

в.у.: 1.84 мин. - найденная масса: 351 (m/z+H)

----

10

Пример # 168

Получение (3,4-дигидро-2H-бензо[1,4]оксазин-6-ил)-(6-метокси-2H-пиразоло[3,4-c]хинолин-4-ил)-амина

15

4-хлор-6-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-c]хинолин (0.16 ммоль) и сложный трет-бутиловый эфир 6-амино-2,3-дигидро-бензо[1,4]оксазин-4-карбоновой кислоты (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

25

точная масса: 347.1618 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод А

в.у.: 2,08 мин. - найденная масса: 348 (m/z+H)

30

----

Пример # 169

Получение (5-циклопропил-1Н-пиразол-3-ил)-(6-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амин

5 4-хлор-6-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 5-циклопропил-1Н-пиразол-3-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и  
10 использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

15 точная масса: 320.1609 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

в.у.: 1.9 мин. - найденная масса: 321 (m/z+H)

20 ----

Пример # 170

25 Получение (6-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-(4-морфолин-4-ил-фенил)-амина

4-хлор-6-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 4-морфолиноанилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе  
30 в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную

смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 375.2007 г/моль

5

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

в.у.: 1.87 мин. - найденная масса: 376 (m/z+H)

----

10

Пример # 171

Получение (1H-индазол-6-ил)-(6-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

15

4-хлор-6-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 1H-индазол-6-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

25

точная масса: 330.1404 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

в.у.: 1.74 мин. - найденная масса: 331 (m/z+H)

30

----

Пример # 172

Получение (1H-индазол-6-ил)-(7-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

4-хлор-7-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 1H-индазол-6-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 330.1404 г/моль

15

ВЭЖХ-МС: аналитический метод Н

в.у.: 2,32 мин. - найденная масса: 331 (m/z+H)

----

20

Пример # 173

Получение (3,4-дигидро-2H-бензо[1,4]оксазин-6-ил)-(7-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

25

4-хлор-7-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и сложный трет-бутиловый эфир 6-амино-2,3-дигидро-бензо[1,4]оксазин-4-карбоновой кислоты (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную

30

смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 347.1618 г/моль

5

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

в.у.: 1.83 мин. - найденная масса: 348 (m/z+H)

----

10

Пример # 174

Получение (5-циклопропил-1H-пиразол-3-ил)-(7-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

15

4-хлор-7-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 5-циклопропил-1H-пиразол-3-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

25

точная масса: 320.1609 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

в.у.: 1.88 мин. - найденная масса: 321 (m/z+H)

30

----

Пример # 175

Получение (3,4-диметокси-фенил)-(7-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

5 4-хлор-7-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 3,4-диметоксианилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь 10 облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 350.1637 г/моль

15

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

в.у.: 1.82 мин. - найденная масса: 351 (m/z+H)

----

20

Пример # 176

Получение (7-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-[4-(4-метил-пиперазин-1-ил)-фенил]-амина

25

30 4-хлор-7-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 4-(4-метилпиперазин-1-ил)анилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 388.2384 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод А

5 в.у.: 0,83 мин. - найденная масса: 389 (m/z+H)

----

10 Пример # 177

Получение (7-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-(4-морфолин-4-ил-фенил)-амина

15 4-хлор-7-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 4-морфолиноанилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь 20 облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

25 точная масса: 375.2007 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод А

в.у.: 1.99 мин. - найденная масса: 376 (m/z+H)

----

30

Пример # 178

Получение N4-(8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-2,N1,N1-триметил-бензол-1,4-диамина

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и N1,N1,2-триметилбензол-1,4-диамин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 347.2069 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод А

в.у.: 2.095 мин. - найденная масса: 348.2 (m/z+H)

----

Пример # 179

20

Получение [4-(4-циклопропил-пиперазин-1-ил)-фенил]-(8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 4-(4-циклопропилпиперазин-1-ил)анилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 414.2575 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод А

в.у.: 1.386 мин. - найденная масса: 415.2 (m/z+H)

5 ----

Пример # 181

10 Получение (3-фтор-4-морфолин-4-ил-фенил)-(8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

15 4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 3-фтор-4-морфолиноанилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл).  
20 Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 393.1888 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

25 в.у.: 1.942 мин. - найденная масса: 394.2 (m/z+H)

----

Пример # 182

30

Получение 7-(8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-иламино)-3,4-дигидро-1H-хиноксалин-2-она

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 7-амино-3,4-дигидрохиноксалин-2(1Н)-он (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

10

точная масса: 360.1544 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

в.у.: 1.61 мин. - найденная масса: 361.1 (m/z+H)

15

----

Пример # 183

20 Получение (8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-[3-метил-4-(4-метил-пиперазин-1-ил)-фенил]-амина

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 3-метил-4-(4-метилпиперазин-1-ил)анилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

30

точная масса: 402.258 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

в.у.: 1.526 мин. - найденная масса: 403.2 (m/z+H)

----

5

Пример # 184

Получение (8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-(4-пиперазин-1-ил-фенил)-амина

10

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и сложный трет-бутиловый эфир 4-(4-амино-фенил)-пиперазин-1-карбоновой кислоты (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

15

20

точная масса: 374.219 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

в.у.: 1.370 мин. - найденная масса: 375.2 (m/z+H)

25

----

Пример # 185

30

Получение (4-диметиламинометил-фенил)-(8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 4-((диметиламино)метил)анилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

10

точная масса: 347.2069 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

в.у.: 1.388 мин. - найденная масса: 348.2 (m/z+H)

15

----

#### Пример # 186

20 Получение (2-фтор-4-морфолин-4-ил-фенил)-(8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 2-фтор-4-морфолиноанилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

30

точная масса: 393.1888 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

в.у.: 1.902 мин. - найденная масса: 394.2 (m/z+H)

----

5

Пример # 187

Получение [4-(4-этил-пиперазин-1-ил)-фенил]-(8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

10

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 4-(4-этилпиперазин-1-ил)анилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

15

20

точная масса: 402.258 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

в.у.: 1.415 мин. - найденная масса: 403.2 (m/z+H)

25

----

Пример # 188

Получение 8-(8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-иламино)-1,3,4,5-тетрагидро-бензо[b]азепин-2-она

30

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 8-амино-4,5-дигидро-1H-бензо[b]азепин-2(3H)-он (2 экв., 0.3 ммоль)

5 суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

10 точная масса: 373.1809 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

в.у.: 1.753 мин. - найденная масса: 374.2 (m/z+H)

----

15

Пример # 189

Получение 5-(8-метокси-2H-пиразоло[3,4-c]хинолин-4-иламино)-1,3-диметил-1,3-дигидро-бензоимидазол-2-она

20

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-c]хинолин (0.16 ммоль) и 5-амино-1,3-диметил-1H-бензо[d]имидазол-2(3H)-он (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

30

точная масса: 374.1739 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

в.у.: 1.704 мин. - найденная масса: 375.2 (m/z+H)

----

## Пример # 190

5

Получение (4-бензил-фенил)-(8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

10 4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 4-бензиланилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь  
15 облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 380.1925 г/моль

20

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

в.у.: 2.288 мин. - найденная масса: 381.2 (m/z+H)

----

25

## Пример # 191

Получение (8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-(2-метил-4-морфолин-4-ил-фенил)-амина

30

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 2-метил-4-морфолиноанилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом

реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 389.2203 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

в.у.: 1.884 мин. - найденная масса: 390.2 (m/z+H)

----

Пример # 192

Получение N-(8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-N'-метил-N'-(1-метил-пиперидин-4-ил)-бензол-1,4-диамина

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и N1-метил-N1-(1-метилпиперидин-4-ил)бензол-1,4-диамин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 416.2775 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

в.у.: 1.508 мин. - найденная масса: 417.2 (m/z+H)

----

## Пример # 193

5 Получение (8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-[4-(2-морфолин-4-ил-этил)-фенил]-амина

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 4-(2-морфолиноэтил)анилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в 10 MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). 15 Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 403.2399 г/моль

20 ВЭЖХ-МС: аналитический метод С  
в.у.: 1.416 мин. - найденная масса: 404.2 (m/z+H)

----

## 25 Пример # 194

Получение 7-(8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-иламино)-1Н-хиноксалин-2-она

30 4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 7-аминохиноксалин-2(1Н)-он (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и

использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

5

точная масса: 358.1343 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод А

в.у.: 2.268 мин. - найденная масса: 359.1 (m/z+H)

10

----

Пример # 195

15 Получение [3-хлор-4-(4-метил-пиперазин-1-ил)-фенил]-(8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 3-хлор-4-(4-метилпиперазин-1-ил)анилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

25

точная масса: 422.1968 г/моль

30 ВЭЖХ-МС: аналитический метод А

в.у.: 1.768 мин. - найденная масса: 423.2 (m/z+H)

----

## Пример # 196

Получение (8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-(1,2,3,4-тетрагидро-хинолин-7-ил)-амина

5

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и сложный трет-бутиловый эфир 7-амино-3,4-дигидро-2H-хинолин-1-карбоновой кислоты (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

15

точная масса: 345.187 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

20

в.у.: 2.156 мин. - найденная масса: 346.2 (m/z+H)

----

## Пример # 197

25

Получение 4-(1H-индазол-6-иламино)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-8-карбонитрила

30

4-хлор-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-8-карбонитрил (0.16 ммоль) и 1H-индазол-6-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь

облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

5 точная масса: 325.1185 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

в.у.: 2.07 мин. - найденная масса: 326 (m/z+H)

10 ----

Пример # 198

15 Получение (3,4-дигидро-2H-бензо[1,4]оксазин-6-ил)-(9-метокси-2H-пиразоло[3,4-c]хинолин-4-ил)-амина

4-хлор-9-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-c]хинолин (0.16 ммоль) и сложный трет-бутиловый эфир 6-амино-2,3-дигидро-бензо[1,4]оксазин-4-карбоновой кислоты (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

20

25

точная масса: 347.1619 г/моль

30 ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

в.у.: 1.83 мин. - найденная масса: 348 (m/z+H)

----

## Пример # 199

Получение (5-циклопропил-1Н-пиразол-3-ил)-(9-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

5

4-хлор-9-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 5-циклопропил-1Н-пиразол-3-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

15

точная масса: 320.1609 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

в.у.: 1.89 мин. - найденная масса: 321 (m/z+H)

20

----

## Пример # 200

Получение (3,4-диметокси-фенил)-(9-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

25

4-хлор-9-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 3,4-диметоксианилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную

30

смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 350.1637 г/моль

5

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

в.у.: 1.83 мин. - найденная масса: 351 (m/z+H)

----

10

Пример # 201

Получение (9-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-[4-(4-метилпиперазин-1-ил)-фенил]-амина

15

4-хлор-9-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 4-(4-метилпиперазин-1-ил)анилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

25

точная масса: 388.2384 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

в.у.: 1,44 мин. - найденная масса: 389 (m/z+H)

30

----

Пример # 202

Получение (9-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-(4-морфолин-4-ил-фенил)-амина

4-хлор-9-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 4-морфолиноанилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 375.2008 г/моль

15

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

в.у.: 1.84 мин. - найденная масса: 376 (m/z+H)

----

20

Пример # 203

Получение (1Н-индазол-6-ил)-(9-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

25

4-хлор-9-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 1Н-индазол-6-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

30

точная масса: 330.1404 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

5 в.у.: 1.75 мин. - найденная масса: 331 (m/z+H)

----

Пример # 204

10

Получение (1S,2R)-N-(8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-  
циклогексан-1,2-диамина

15 4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16  
ммоль) и сложный трет-бутиловый эфир ((1R,2S)-2-амино-циклогексил)-  
карбаминовой кислоты (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл)  
в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3  
капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5  
мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без  
20 дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь  
облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную  
смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и  
лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

25 точная масса: 311.2085 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

в.у.: 1.373 мин. - найденная масса: 312.2 (m/z+H)

30 ----

Пример # 205

Получение (8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-пиридин-4-ил-амина

5 4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и пиридин-4-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь 10 облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

15 точная масса: 291.1289 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

в.у.: 1.790 мин. - найденная масса: 292.2 (m/z+H)

----

20

Пример # 206

Получение (8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-(6-метокси-пиридин-3-ил)-амина

25

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 6-метоксипиридин-3-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без 30 дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 321.1428 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

5 в.у.: 1.790 мин. - найденная масса: 322.1 (m/z+H)

----

Пример # 207

10

Получение (3,4-диметокси-фенил)-(1-метил-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

15 4-хлор-2-(4-метоксибензил)-1-метил-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 3,4-диметоксианилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь  
20 облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 334.1693 г/моль

25

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

в.у.: 1.84 мин. - найденная масса: 335 (m/z+H)

----

30

Пример # 208

Получение [4-(4-метил-пиперазин-1-ил)-фенил]-(1-метил-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

4-хлор-2-(4-метоксибензил)-1-метил-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 4-(4-метилпиперазин-1-ил)анилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 372.244 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

в.у.: 1,43 мин. - найденная масса: 373 (m/z+H)

----

Пример # 209

Получение (1Н-индазол-6-ил)-(1-метил-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

4-хлор-2-(4-метоксибензил)-1-метил-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 1Н-индазол-6-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 314.146 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

в.у.: 1.78 мин. - найденная масса: 315 (m/z+H)

5 -----

Пример # 210

10 Получение (3,4-диметокси-фенил)-(1-трифторметил-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

15 4-хлор-2-(4-метоксибензил)-1-(трифторметил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 3,4-диметоксианилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и  
20 лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 388.133 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

25 в.у.: 2.84 мин. - найденная масса: 389 (m/z+H)

-----

Пример # 211

30 Получение [4-(4-метил-пиперазин-1-ил)-фенил]-(1-трифторметил-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

4-хлор-2-(4-метоксибензил)-1-(трифторметил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 4-(4-метилпиперазин-1-ил)анилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

10

точная масса: 426.2077 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

в.у.: 2.01 мин. - найденная масса: 427 (m/z+H)

15

----

Пример # 212

20           Получение                           (1Н-индазол-6-ил)-(1-трифторметил-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

4-хлор-2-(4-метоксибензил)-1-(трифторметил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 1Н-индазол-6-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

30

точная масса: 368.1098 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

в.у.: 2.81 мин. - найденная масса: 369 (m/z+H)

----

5

Пример # 213

Получение (3,4-диметокси-фенил)-(1-нитро-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

10

4-хлор-2-(4-метоксибензил)-1-нитро-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 3,4-диметоксанилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

15

20

точная масса: 365.131 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

в.у.: 2.53 мин. - найденная масса: 366 (m/z+H)

25

----

Пример # 214

30

Получение [4-(4-метил-пиперазин-1-ил)-фенил]-(1-нитро-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

4-хлор-2-(4-метоксибензил)-1-нитро-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 4-(4-метилпиперазин-1-ил)анилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в

MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл).

5 Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 403.2058 г/моль

10

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

в.у.: 1.84 мин. - найденная масса: 404 (m/z+H)

----

15

Пример # 215

Получение N-[2-(4-метокси-фенил)-этил]-2-[4-(8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-иламино)-фенил]-ацетамида

20

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 2-(4-аминофенил)-N-(4-метоксифенетил)ацетамид (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

30

точная масса: 481.2519 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

в.у.: 2.065 мин. - найденная масса: 482.3 (m/z+H)

----

## Пример # 216

5

Получение 4-(3,4-диметокси-фениламино)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-8-карбонитрила

4-хлор-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-8-карбонитрил  
10 (0.16 ммоль) и 3,4-диметоксианилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без  
15 дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 345.1418 г/моль

20

ВЭЖХ-МС: аналитический метод А  
в.у.: 2.35 мин. - найденная масса: 346 (m/z+H)

----

25

## Пример # 217

Получение 4-(4-морфолин-4-ил-фениламино)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-8-карбонитрила

30

4-хлор-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-8-карбонитрил  
(0.16 ммоль) и 4-морфолиноанилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе

5 в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 370.179 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод А

10 в.у.: 2.31 мин. - найденная масса: 371 (m/z+H)

----

Пример # 218

15

Получение (3,4-диметокси-фенил)-(1-метил-7Н-3-тиа-2,4,6,7-тетрааза-ас-индацен-5-ил)-амина

20 5-хлор-7-(4-метоксибензил)-1-метил-7Н-изотиазоло[5,4-b]пиразоло[4,3-d]пиридин (0.16 ммоль) и 3,4-диметоксианилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

25

точная масса: 341.1148 г/моль

30

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

в.у.: 2.42 мин. - найденная масса: 342 (m/z+H)

----

## Пример # 219

5 Получение (1H-индазол-6-ил)-(1-метил-7H-3-тия-2,4,6,7-тетрааза-as-индацен-5-ил)-амина

10 5-хлор-7-(4-метоксибензил)-1-метил-7H-изотиазоло[5,4-b]пиразоло[4,3-d]пиридин (0.16 ммоль) и 1H-индазол-6-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл).  
 15 Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 321.0915 г/моль

20 ВЭЖХ-МС: аналитический метод А  
 в.у.: 2.62 мин. - найденная масса: 322 (m/z+H)

----

## Пример # 220

25 Получение [4-(4-метил-пиперазин-1-ил)-фенил]-(1-метил-7H-3-тия-2,4,6,7-тетрааза-as-индацен-5-ил)-амина

30 5-хлор-7-(4-метоксибензил)-1-метил-7H-изотиазоло[5,4-b]пиразоло[4,3-d]пиридин (0.16 ммоль) и 4-(4-метилпиперазин-1-ил)анилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в

ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

5            точная масса: 379.1896 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод А

в.у.: 1.87 мин. - найденная масса: 380 (m/z+H)

10            ----

Пример # 221

15            Получение (8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-(3-пиперазин-1-ил-фенил)-амина

20            4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и сложный трет-бутиловый эфир 4-(3-амино-фенил)-пиперазин-1-карбоновой кислоты (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

25            точная масса: 374.219 г/моль

30            ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

в.у.: 1.497 мин. - найденная масса: 375.2 (m/z+H)

----

## Пример # 222

Получение N-(2-диэтиламино-этил)-4-(8-метокси-2H-пиразоло[3,4-  
с]хинолин-4-иламино)-бензамида

5

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 4-амино-N-(2-(диэтиламино)этил)бензамид (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

15

точная масса: 432.2719 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

в.у.: 1.604 мин. - найденная масса: 433.2 (m/z+H)

20

----

## Пример # 223

Получение (8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-[2-(4-метил-  
пиперазин-1-ил)-пиримидин-5-ил]-амина

25

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 2-(4-метилпиперазин-1-ил)пиримидин-5-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5

30

мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 390.2245 г/моль

5

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

в.у.: 1.431 мин. - найденная масса: 391.2 (m/z+H)

----

10

Пример # 224

Получение 7-(8-метокси-3H-пиразоло[3,4-c]хинолин-4-иламино)-4H-бензо[1,4]оксазин-3-она

15

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-c]хинолин (0.16 ммоль) и 7-амино-2H-бензо[b][1,4]оксазин-3(4H)-он (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

25

точная масса: 361.1363 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

в.у.: 1.722 мин. - найденная масса: 362.1 (m/z+H)

30

----

Пример # 225

Получение (3,4-дигидро-2H-бензо[1,4]оксазин-7-ил)-(8-метокси-3H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и сложный трет-бутиловый эфир 6-амино-2,3-дигидро-бензо[1,4]оксазин-4-карбоновой кислоты (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

15 точная масса: 347.1619 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

в.у.: 1.839 мин. - найденная масса: 348.1 (m/z+H)

20 ----

Пример # 226

Получение 4-(3,4-диметокси-фениламино)-1-метил-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-7-карбонитрила

4-хлор-2-(4-метоксибензил)-1-метил-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-7-карбонитрил (0.16 ммоль) и 3,4-диметоксианилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5

мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 359.1613 г/моль

5

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

в.у.: 2.03 мин. - найденная масса: 360 (m/z+H)

----

10

Пример # 227

Получение 4-(1H-индазол-6-иламино)-1-метил-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-7-карбонитрила

15

4-хлор-2-(4-метоксибензил)-1-метил-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-7-карбонитрил (0.16 ммоль) и 1H-индазол-6-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

20

точная масса: 339.138 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

в.у.: 2.13 мин. - найденная масса: 340 (m/z+H)

25

----

Пример # 228

30

Получение (8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-[3-(4-метил-пиперазин-1-ил)-фенил]-амина

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 3-(4-метилпиперазин-1-ил)анилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в МеОН (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 388.2385 г/моль

15

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

в.у.: 1.513 мин. - найденная масса: 389.1 (m/z+H)

----

20

Пример # 229

Получение (8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-[3-(2-пиперазин-1-ил-этокси)-фенил]-амина

25

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и сложный трет-бутиловый эфир 4-[2-(3-амино-фенокси)-этил]-пиперазин-1-карбоновой кислоты (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в МеОН (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную

30

смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 418.2524 г/моль

5

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

в.у.: 1.446 мин. - найденная масса: 419.2 (m/z+H)

----

10

Пример # 230

Получение (8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-(6-метил-5,6,7,8-тетрагидро-[1,6]нафтиридин-3-ил)-амина

15

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 6-метил-5,6,7,8-тетрагидро-1,6-нафтиридин-3-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

25

точная масса: 360.1995 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

в.у.: 1.441 мин. - найденная масса: 361.1 (m/z+H)

30

----

Пример # 231

Получение [4-(8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-иламино)-фенил]-пирролидин-1-ил-метанона

5 4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и (4-аминофенил)(пирролидин-1-ил)метанон (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в 10 ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

15 точная масса: 387.2003 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

в.у.: 1.911 мин. - найденная масса: 388.1 (m/z+H)

----

20

Пример # 232

Получение [4-(8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-иламино)-фенил]-морфолин-4-ил-метанона

25

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и (4-аминофенил)(морфолино)метанон (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в 30 ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 403.1947 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

5 в.у.: 1.806 мин. - найденная масса: 404.1 (m/z+H)

----

Пример # 233

10

Получение (4-диметиламинометил-фенил)-(6-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

15 4-хлор-6-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 4-((диметиламино)метил)анилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл).  
 20 Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 347.2069 г/моль

25

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

в.у.: 1,44 мин. - найденная масса: 348 (m/z+H)

----

30

Пример # 234

Получение (8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-(4-пирролидин-1-илметил-фенил)-амина

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и (4-амино-фенил)-пирролидин-1-ил-метанон (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 10 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и растворяли в ТГФ (сухом), и добавляли порошок LiAlH<sub>4</sub> (избыток, 2 на 2 экв.) до тех пор, пока не наблюдали завершение реакции (с помощью ЖХМС). Реакцию гасили водой (1 мл на грамм LiAlH<sub>4</sub>), затем NaOH (приблизительно 15% водн., 1 мл на г LiAlH<sub>4</sub>), водой (3 мл на грамм LiAlH<sub>4</sub>). Смесь фильтровали, промывали ТГФ, MeOH, MeCN (приблизительно 10 мл каждого). Реакционную смесь 15 концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 373.226 г/моль

20 ВЭЖХ-МС: аналитический метод С  
в.у.: 1.480 мин. - найденная масса: 374.2 (m/z+H)

----

25 Пример # 235

Получение (4-((8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)фенил)(4-метилпиперазин-1-ил)метанона

30 4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и (4-аминофенил)(4-метилпиперазин-1-ил)метанон (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь

упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

5

точная масса: 416.2324 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

в.у.: 1.429 мин. - найденная масса: 417.2 (m/z+H)

10

----

Пример # 236

15 Получение N2-(2-(диметиламино)этил)-N5-(8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)пиримидин-2,5-диамина

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и N2-(2-(диметиламино)этил)пиримидин-2,5-диамин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

25

точная масса: 378.225 г/моль

30

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

в.у.: 1.425 мин. - найденная масса: 390.2 (m/z+H)

----

## Пример # 237

Получение (8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-(4-морфолин-4-илметил-фенил)-амина

5

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и (4-амино-фенил)-морфолин-4-ил-метанон (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и растворяли в ТГФ (сухом), и добавляли порошок LiAlH<sub>4</sub> (избыток, 2 на 2 экв.) до тех пор, пока не наблюдали завершение реакции (с помощью ЖХМС). Реакцию гасили водой (1 мл на грамм LiAlH<sub>4</sub>), затем NaOH (приблизительно 15% водн., 1 мл на г LiAlH<sub>4</sub>), водой (3 мл на грамм LiAlH<sub>4</sub>). Смесь фильтровали, промывали ТГФ, MeOH, MeCN (приблизительно 10 мл каждого). Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

15

20

точная масса: 389.2204 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

25 в.у.: 1.425 мин. - найденная масса: 390.2 (m/z+H)

----

## Пример # 238

30

Получение (8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-[4-(4-метил-пиперазин-1-илметил)-фенил]-амина

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и (4-амино-фенил)-(4-метил-пиперазин-1-ил)-метанон (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и растворяли в ТГФ (сухом), и добавляли порошок LiAlH<sub>4</sub> (избыток, 2 на 2 экв.) до тех пор, пока не наблюдали завершение реакции (с помощью ЖХМС). Реакцию гасили водой (1 мл на грамм LiAlH<sub>4</sub>), затем NaOH (приблизительно 15% водн., 1 мл на г LiAlH<sub>4</sub>), водой (3 мл на грамм LiAlH<sub>4</sub>). Смесь фильтровали, промывали ТГФ, MeOH, MeCN (приблизительно 10 мл каждого). Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 402.258 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

в.у.: 1.456 мин. - найденная масса: 403.2 (m/z+H)

----

Пример # 239

Получение [4-(4-этил-пиперазин-1-ил)-фенил]-(6-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

4-хлор-6-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 4-(4-этилпиперазин-1-ил)анилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл).

Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

5 точная масса: 402.2581 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

в.у.: 1,49 мин. - найденная масса: 403 (m/z+H)

10 ----

Пример # 240

15 Получение [4-(4-этил-пиперазин-1-ил)-3-фтор-фенил]-(8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

20 4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 4-(4-этилпиперазин-1-ил)-3-фторанилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью  
25 полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 420.2459 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

30 в.у.: 1.531 мин. - найденная масса: 421.2 (m/z+H)

----

Пример # 241

Получение 8-((6-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)-4,5-дигидро-1H-бензо[b]азепин-2(3H)-она

5 4-хлор-6-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 8-амино-4,5-дигидро-1H-бензо[b]азепин-2(3H)-он (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь  
10 упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

15 точная масса: 373.1808 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

в.у.: 1.78 мин. - найденная масса: 374 (m/z+H)

20 ----

Пример # 242

Получение (1H-бензоимидазол-5-ил)-(6-метокси-2H-пиразоло[3,4-  
25 с]хинолин-4-ил)-амина

4-хлор-6-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 1H-бензоимидазол-5-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе  
30 в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную

смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 330.1404 г/моль

5

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

в.у.: 1.48 мин. - найденная масса: 331 (m/z+H)

----

10

Пример # 243

Получение [4-(4-циклопропил-пиперазин-1-ил)-фенил]-(9-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

15

4-хлор-9-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 4-(4-циклопропилпиперазин-1-ил)анилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

25

точная масса: 414.2574 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

в.у.: 1.536 мин. - найденная масса: 415.2 (m/z+H)

30

----

Пример # 244

Получение (8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-п-толил-амина

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и п-толуидин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 304.1554 г/моль

15 ВЭЖХ-МС: аналитический метод С  
в.у.: 1.942 мин. - найденная масса: 305.1 (m/z+H)

----

20 Пример # 245

Получение [6-(2-диметиламино-этокси)-пиридин-3-ил]-(8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

25 4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 6-(2-(диметиламино)этокси)пиридин-3-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 378.2139 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

в.у.: 1.406 мин. - найденная масса: 379.2 (m/z+H)

5

----

Пример # 246

10           Получение   (3-фтор-4-морфолин-4-ил-фенил)-(6-метокси-2H-пиразоло[3,4-  
с]хинолин-4-ил)-амина

15           4-хлор-6-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин   (0.16  
ммоль) и 3-фтор-4-морфолиноанилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в  
MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли  
HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом  
реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и  
использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл).  
20           Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при  
140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью  
полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 393.1887 г/моль

25           ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

в.у.: 1.97 мин. - найденная масса: 394 (m/z+H)

----

30           Пример # 247

Получение (6-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-(4-тиоморфолин-4-  
ил-фенил)-амина

4-хлор-6-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 4-тиоморфолиноанилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

10

точная масса: 391.1779 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

в.у.: 2.09 мин. - найденная масса: 392 (m/z+H)

15

----

Пример # 248

20      Получение      (6-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-(2-метил-1Н-бензоимидазол-5-ил)-амина

4-хлор-6-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 2-метил-1Н-бензоимидазол-5-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

30

точная масса: 344.1599 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

в.у.: 143 мин. - найденная масса: 345 (m/z+H)

----

5

Пример # 249

Получение бензо[1,3]диоксол-5-ил-(6-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

10

4-хлор-6-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и бензо[d][1,3]диоксол-5-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

20

точная масса: 334.1242 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

в.у.: 1.918 мин. - найденная масса: 335.1 (m/z+H)

25

----

Пример # 250

30

Получение 6-((6-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)-2H-бензо[b][1,4]оксазин-3(4H)-она

4-хлор-6-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 6-амино-2H-бензо[b][1,4]оксазин-3(4H)-он (2 экв., 0.3 ммоль)

суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 361.1362 г/моль

10

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

в.у.: 1.776 мин. - найденная масса: 362.1 (m/z+H)

----

15

Пример # 251

Получение (3,4-диметокси-фенил)-(6,8-диметокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

20

4-хлор-6,8-диметокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 3,4-диметоксианилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

30

точная масса: 380.1777 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод А

в.у.: 2.262 мин. - найденная масса: 381.2 (m/z+H)

----

## Пример # 252

5

Получение [4-(4-циклопропил-пиперазин-1-ил)-фенил]-(6,8-диметокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

4-хлор-6,8-диметокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин  
 10 (0.16 ммоль) и 4-(4-циклопропилпиперазин-1-ил)анилин (2 экв., 0.3 ммоль)  
 суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5  
 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в  
 микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь  
 15 упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в  
 ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5  
 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью  
 полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 444.2714 г/моль

20

ВЭЖХ-МС: аналитический метод А

в.у.: 1.825 мин. - найденная масса: 445.3 (m/z+H)

----

25

## Пример # 253

Получение N2-(3-(диметиламино)пропил)-N5-(8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-  
 с]хинолин-4-ил)пиридин-2,5-диамина

30

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16  
 ммоль) и N2-(3-(диметиламино)пропил)пиридин-2,5-диамин (2 экв., 0.3 ммоль)  
 суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5  
 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в

5 микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 391.2515 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод Н

10 в.у.: 0.985 мин. - найденная масса: 392.2 (m/z+H)

----

15 Пример # 254

Получение N<sup>2</sup>-(2-(диметиламино)этил)-N<sup>5</sup>-(8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)пиридин-2,5-диамина

20 4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и N<sup>2</sup>-(2-(диметиламино)этил)пиридин-2,5-диамин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

30 точная масса: 377.232 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод Н

в.у.: 0.681 мин. - найденная масса: 378.2 (m/z+H)

----

## Пример # 255

5 Получение (8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-[6-(1-метил-  
пиперидин-4-илокси)-пиридин-3-ил]-амина

10 4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16  
ммоль) и 6-((1-метилпиперидин-4-ил)окси)пиридин-3-амин (2 экв., 0.3 ммоль)  
суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5  
15 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в  
микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь  
упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в  
ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5  
мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью  
15 полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 404.2329 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод Н

20 в.у.: 1.032 мин. - найденная масса: 405.2 (m/z+H)

----

## Пример # 256

25

Получение (1Н-индазол-5-ил)-(7-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-  
ил)-амина

30 4-хлор-7-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16  
ммоль) и 1Н-индазол-5-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом,  
3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане  
(4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в  
течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без  
дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь

облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

5 точная масса: 330.1404 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

в.у.: 2,14 мин. - найденная масса: 331 (m/z+H)

10 ----

Пример # 257

15 Получение 8-((7-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)-4,5-дигидро-1H-бензо[b]азепин-2(3H)-она

20 4-хлор-7-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 8-амино-4,5-дигидро-1H-бензо[b]азепин-2(3H)-он (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью  
25 полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 373.1808 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод Н

30 в.у.: 2.42 мин. - найденная масса: 374 (m/z+H)

----

Пример # 258

Получение (2,3-дигидро-бензо[1,4]диоксин-6-ил)-(6-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

5 4-хлор-6-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 2,3-дигидробензо[*b*][1,4]диоксин-6-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь  
10 упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/*t*-BuOH 4/1.

15 точная масса: 348.1437 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод Н

в.у.: 2.44 мин. - найденная масса: 349 (m/z+H)

20 ----

Пример # 259

25 Получение (4-диметиламинометил-фенил)-(7-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

4-хлор-7-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 4-((диметиламино)метил)анилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли  
30 HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при

140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 347.2069 г/моль

5

ВЭЖХ-МС: аналитический метод Н

в.у.: 2.414 мин. - найденная масса: 374 (m/z+H)

----

10

Пример # 260

Получение [4-(4-этил-пиперазин-1-ил)-фенил]-(7-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

15

4-хлор-7-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 4-(4-этилпиперазин-1-ил)анилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

25

точная масса: 402.258 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод Н

в.у.: 192 мин. - найденная масса: 403 (m/z+H)

30

----

Пример # 261

Получение (6-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-фенил-амина

4-хлор-6-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и анилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 290.1359 г/моль

15 ВЭЖХ-МС: аналитический метод А  
в.у.: 2.216 мин. - найденная масса: 291.2 (m/z+H)

----

20 Пример # 262

Получение [4-(4-циклопропил-пиперазин-1-ил)-фенил]-(7-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

25 4-хлор-7-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 4-(4-циклопропилпиперазин-1-ил)анилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 414.2574 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод Н

в.у.: 2,02 мин. - найденная масса: 415 (m/z+H)

5

----

Пример # 263

10            Получение            (1H-бензоимидазол-5-ил)-(7-метокси-2H-пиразоло[3,4-  
с]хинолин-4-ил)-амина

15            4-хлор-7-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин            (0.16  
ммоль) и 1H-бензоимидазол-5-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH  
(сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в  
диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе  
в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без  
дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь  
20            облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную  
смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и  
лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 330.1404 г/моль

25            ВЭЖХ-МС: аналитический метод Н

в.у.: 1,99 мин. - найденная масса: 331 (m/z+H)

----

30            Пример # 264

Получение            (7-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-(2-метил-1H-  
бензоимидазол-5-ил)-амина

4-хлор-7-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 2-метил-1Н-бензоимидазол-5-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

10

точная масса: 344.1599 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод Н

в.у.: 1,92 мин. - найденная масса: 345 (m/z+H)

15

----

Пример # 265

20      Получение                      (2,3-дигидро-бензо[1,4]диоксин-6-ил)-(7-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

4-хлор-7-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 2,3-дигидробензо[b][1,4]диоксин-6-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

30

точная масса: 348.1437 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод Н

в.у.: 236 мин. - найденная масса: 349 (m/z+H)

----

5

Пример # 266

Получение 6-((7-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)-2H-бензо[b][1,4]оксазин-3(4H)-она

10

4-хлор-7-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 6-амино-2H-бензо[b][1,4]оксазин-3(4H)-он (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

20

точная масса: 361.1362 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод Н

в.у.: 2.31 мин. - найденная масса: 362 (m/z+H)

25

----

Пример # 267

Получение бензо[1,3]диоксол-5-ил-(7-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

30

4-хлор-7-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и бензо[d][1,3]диоксол-5-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в

MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл).

5 Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 334.1242 г/моль

10

ВЭЖХ-МС: аналитический метод Н

в.у.: 243 мин. - найденная масса: 335 (m/z+H)

----

15

Пример # 268

Получение (1H-индазол-5-ил)-(6-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

20

4-хлор-6-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 1H-индазол-5-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

30

точная масса: 330.1404 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод Н

в.у.: 2.23 мин. - найденная масса: 331 (m/z+H)

----

## Пример # 269

5

Получение [4-(4-циклопентил-пиперазин-1-ил)-фенил]-(8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

10 4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 4-(4-циклопентилпиперазин-1-ил)анилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в 15 ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 442.2965 г/моль

20

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

в.у.: 1.965 мин. - найденная масса: 443.3 (m/z+H)

----

25

## Пример # 270

Получение [4-(4-изобутил-пиперазин-1-ил)-фенил]-(8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

30

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 4-(4-изобутилпиперазин-1-ил)анилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в

микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью  
5 полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 430.297 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

10 в.у.: 1.948 мин. - найденная масса: 431.3 (m/z+H)

----

Пример # 271

15

Получение [4-(4-изопропил-пиперазин-1-ил)-фенил]-(8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

20 4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 4-(4-изопропилпиперазин-1-ил)анилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в  
25 ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 416.2775 г/моль

30

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

в.у.: 1.213 мин. - найденная масса: 417.3 (m/z+H)

----

## Пример # 272

Получение [4-(4-циклопропилметил-пиперазин-1-ил)-фенил]-(8-метокси-  
5 2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16  
ммоль) и 4-(4-(циклопропилметил)пиперазин-1-ил)анилин (2 экв., 0.3 ммоль)  
10 суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5  
мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в  
микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь  
упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в  
ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5  
15 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью  
полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 428.277 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

20 в.у.: 1.905 мин. - найденная масса: 429.3 (m/z+H)

----

## Пример # 273

25

Получение [4-(4-трет-бутил-пиперазин-1-ил)-фенил]-(8-метокси-2Н-  
пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16  
30 ммоль) и 4-(4-(трет-бутил)пиперазин-1-ил)анилин (2 экв., 0.3 ммоль)  
суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5  
мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в  
микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь  
упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в

ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

5            точная масса: 430.297 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

в.у.: 1.863 мин. - найденная масса: 431.3 (m/z+H)

10            ----

Пример # 274

Получение (6-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-п-толил-амина

15

4-хлор-6-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и п-толуидин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

20

25            точная масса: 304.1554 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод А

в.у.: 2.239 мин. - найденная масса: 305.2 (m/z+H)

30

----

Пример # 275

Получение сложного метилового эфира 4-((3,4-диметоксифенил)амино)-2Н-пиразоло[4,3-d]тиено[3,4-b]пиридин-6-карбоновой кислоты

метил-4-хлор-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[4,3-d]тиено[3,4-b]пиридин-  
 5 6-карбоксилат (0.16 ммоль) и 3,4-диметоксианилин (2 экв., 0.3 ммоль)  
 суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5  
 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в  
 микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь  
 упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в  
 10 ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5  
 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью  
 полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 384.1101 г/моль

15

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

в.у.: 2,34 мин. - найденная масса: 385 (m/z+H)

----

20

Пример # 276

Получение сложного метилового эфира 4-((4-(4-циклопропилпиперазин-1-ил)фенил)амино)-2Н-пиразоло[4,3-d]тиено[3,4-b]пиридин-6-карбоновой кислоты

25

метил-4-хлор-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[4,3-d]тиено[3,4-b]пиридин-  
 6-карбоксилат (0.16 ммоль) и 4-(4-циклопропилпиперазин-1-ил)анилин (2 экв.,  
 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой  
 печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь  
 облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную  
 30 смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток  
 растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом  
 реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и

очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 448.2039 г/моль

5

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

в.у.: 1.84 мин. - найденная масса: 348 (m/z+H)

----

10

Пример # 277

Получение 2-(4-(4-((8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)фенил)пиперазин-1-ил)уксусной кислоты

15

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 2-(4-(4-аминофенил)пиперазин-1-ил)уксусную кислоту (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

25

точная масса: 432.2267 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод D

30

в.у.: 2.390 мин. - найденная масса: 433.3 (m/z+H)

----

Пример # 278

Получение (6-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-[4-(4-метил-пиперазин-1-илметил)-фенил]-амина

5 4-хлор-6-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и (4-амино-фенил)-(4-метил-пиперазин-1-ил)-метанон (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь  
10 упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и растворяли в ТГФ (сухом), и добавляли порошок LiAlH<sub>4</sub> (избыток, 2 на 2 экв.) до тех пор, пока не наблюдали завершение реакции (с помощью ЖХМС). Реакцию гасили водой (1  
15 мл на грамм LiAlH<sub>4</sub>), затем NaOH (приблизительно 15% водн., 1 мл на г LiAlH<sub>4</sub>), водой (3 мл на грамм LiAlH<sub>4</sub>). Смесь фильтровали, промывали ТГФ, MeOH, MeCN (приблизительно 10 мл каждого). Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

20

точная масса: 402.2579 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

в.у.: 1.840 мин. - найденная масса: 403.3 (m/z+H)

25

----

Пример # 279

30 Получение 2-(2-метокси-4-((8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)фенокси)уксусная кислота

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 2-(4-амино-2-метоксифенокси)уксусную кислоту (2 экв., 0.3 ммоль)

суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 394.1521 г/моль

10

ВЭЖХ-МС: аналитический метод D

в.у.: 3.179 мин. - найденная масса: 395.1 (m/z+H)

----

15

Пример # 280

Получение (4-((8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)фенил)метанола

20

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и (4-аминофенил)метанол (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

30

точная масса: 320.1498 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод D

в.у.: 3.38 мин. - найденная масса: 321.1 (m/z+H)

----

## Пример # 281

5

Получение {4-[4-(2-диметиламино-этил)-пиперазин-1-ил]-фенил}-(8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-амина

10 4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 4-(4-(2-(диметиламино)этил)пиперазин-1-ил)анилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в 15 ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 445.3095 г/моль

20

ВЭЖХ-МС: аналитический метод А

в.у.: 0.756 мин. - найденная масса: 446.3 (m/z+H)

----

25

## Пример # 282

Получение (6,8-диметокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-[4-(4-метил-пиперазин-1-илметил)-фенил]-амина

30

4-хлор-6,8-диметокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и (4-амино-фенил)-(4-метил-пиперазин-1-ил)-метанон (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь

облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и растворяли в ТГФ (сухом), и добавляли порошок LiAlH<sub>4</sub> (избыток, 2 на 2 экв.) до тех пор, пока не наблюдали завершение реакции (с помощью ЖХМС). Реакцию гасили водой (1 мл на грамм LiAlH<sub>4</sub>), затем NaOH (приблизительно 15% водн., 1 мл на г LiAlH<sub>4</sub>), водой (3 мл на грамм LiAlH<sub>4</sub>). Смесь фильтровали, промывали ТГФ, MeOH, MeCN (приблизительно 10 мл каждого). Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 432.2719 г/моль

15 ВЭЖХ-МС: аналитический метод D  
в.у.: 2.758 мин. - найденная масса: 433.2 (m/z+H)

----

20 Пример # 283

Получение (4-(((6,8-диметокси-2H-пиразоло[3,4-c]хинолин-4-ил)амино)фенил)(4-метилпиперазин-1-ил)метанона

25 4-хлор-6,8-диметокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-c]хинолин (0.16 ммоль) и (4-аминофенил)(4-метилпиперазин-1-ил)метанон (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 446.2462 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод D

5 в.у.: 2.720 мин. - найденная масса: 447.2 (m/z+H)

----

10 Пример # 284

Получение (6,8-диметокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-(4-диметиламинометил-фенил)-амина

15 4-хлор-6,8-диметокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин  
(0.16 ммоль) и 4-((диметиламино)метил)анилин (2 экв., 0.3 ммоль)  
суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5  
мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в  
микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь  
20 упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в  
ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5  
мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью  
полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

25 точная масса: 377.2209 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод D

в.у.: 2.563 мин. - найденная масса: 378.2 (m/z+H)

----

30

Пример # 285

Получение 2-(4-((8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)фенил)уксусной кислоты

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 2-(4-аминофенил)уксусную кислоту (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 348.1437 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод D

в.у.: 3.760 мин. - найденная масса: 349 (m/z+H)

----

Пример # 286

Получение 6-((8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)-2-нафтойной кислоты

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 6-амино-2-нафтойную кислоту (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 384.1422 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод D

в.у.: 4.767 мин. - найденная масса: 385 (m/z+H)

5 ----

Пример # 287

10 Получение 3-((8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)бензойной кислоты

15 4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 3-аминобензойную кислоту (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и  
20 лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 334.1242 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод D

25 в.у.: 3.827 мин. - найденная масса: 335 (m/z+H)

----

Пример # 288

30 Получение 4'-((8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)-[1,1'-бифенил]-4-карбоновой кислоты

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 4'-амино-[1,1'-бифенил]-4-карбоновую кислоту (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

10

точная масса: 410.1612 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод D

в.у.: 5.035 мин. - найденная масса: 411 (m/z+H)

15

----

Пример # 289

20           Получение                                   1-(4-((8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)фенил)-3-(м-толил)мочевины

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 1-(4-аминофенил)-3-(м-толил)мочевину (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

30

точная масса: 438.2115 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод D

в.у.: 5.37 мин. - найденная масса: 439 (m/z+H)

----

5

Пример # 290

Получение 2-(4-((8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)фенокси)уксусной кислоты

10

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 2-(4-аминофенокси)уксусную кислоту (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

20

точная масса: 364.1382 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод A

в.у.: 1.956 мин. - найденная масса: 365 (m/z+H)

25

----

Пример # 291

30

Получение 6-((8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)-2H-бензо[b][1,4]оксазин-3(4H)-она

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 6-амино-2H-бензо[b][1,4]оксазин-3(4H)-он (2 экв., 0.3 ммоль)

суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 361.1363 г/моль

10

ВЭЖХ-МС: аналитический метод D

в.у.: 3.699 мин. - найденная масса: 362 (m/z+H)

----

15

Пример # 292

Получение 1,1-диоксида 4-(4-((8-метокси-2H-пиразоло[3,4-c]хинолин-4-ил)амино)фенил)тиоморфолина

20

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-c]хинолин (0.16 ммоль) и 1,1-диоксид 4-(4-аминофенил)тиоморфолина (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

30

точная масса: 423.1667 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод D

в.у.: 3.876 мин. - найденная масса: 424 (m/z+H)

----

## Пример # 293

5

Получение 8-метокси-N-(4-тиоморфолинофенил)-2H-пиразоло[3,4-  
с]хинолин-4-амина

10 4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16  
ммоль) и 4-тиоморфолиноанилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH  
(сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в  
диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе  
в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без  
15 дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь  
облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную  
смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и  
лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

20 точная масса: 391.1779 г/моль

20

ВЭЖХ-МС: аналитический метод D

в.у.: 4.931 мин. - найденная масса: 392 (m/z+H)

----

25

## Пример # 294

Получение 8-метокси-N-(2-метилизоиндолин-5-ил)-2H-пиразоло[3,4-  
с]хинолин-4-амина

30

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16  
ммоль) и 2-метилизоиндолин-5-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH  
(сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в  
диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе

5 в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 345.1870 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод D

10 в.у.: 0.557 мин. - найденная масса: 346 (m/z+H)

----

15 Пример # 295

Получение (3-метокси-4-((8-метокси-2H-пиразоло[3,4-c]хинолин-4-ил)амино)фенил)(4-(4-метилпиперазин-1-ил)пиперидин-1-ил)метанона

20 4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-c]хинолин (0.16 ммоль) и (4-амино-3-метоксифенил)(4-(4-метилпиперазин-1-ил)пиперидин-1-ил)метанон (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной

25 очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

30 точная масса: 529.3362 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод D

в.у.: 0.59 мин. - найденная масса: 530 (m/z+H)





## Пример # 299

Получение 1-(4-((7,8-диметокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)фенил)-3-(м-толил)мочевины

5

4-хлор-7,8-диметокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 1-(4-аминофенил)-3-(м-толил)мочевину (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

15

точная масса: 468.2253 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод D

в.у.: 4.907 мин. - найденная масса: 469 (m/z+H)

20

----

## Пример # 300

Получение N-(2-(диметиламино)этил)-4-((8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)-N-метилбензамида

25

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 4-амино-N-(2-(диметиламино)этил)-N-метилбензамид (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом

30

реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

5 точная масса: 418.2524 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

в.у.: 1.83 мин. - найденная масса: 419 (m/z+H)

10 ----

Пример # 301

15 Получение (4-((8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)фенил)(2-(метоксиметил)пирролидин-1-ил)метанона

20 4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и (4-аминофенил)(2-(метоксиметил)пирролидин-1-ил)метанон (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и  
25 очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 431.2338 г/моль

30 ВЭЖХ-МС: аналитический метод А

в.у.: 2.41 мин. - найденная масса: 432 (m/z+H)

----

## Пример # 302

Получение азетидин-1-ил(4-((8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)фенил)метанона

5

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и (4-аминофенил)азетидин-1-ил)метанон (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

15

точная масса: 373.1808 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод А

в.у.: 2.30 мин. - найденная масса: 374 (m/z+H)

20

----

## Пример # 303

Получение 4-((8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)-N,N-диметилбензамида

25

30

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 4-амино-N,N-диметилбензамид (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при

140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 361.1814 г/моль

5

ВЭЖХ-МС: аналитический метод А

в.у.: 2.12 мин. - найденная масса: 362 (m/z+H)

----

10

Пример # 304

Получение (4-((8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)фенил)(4-метил-1,4-дiazепан-1-ил)метанона

15

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и (4-аминофенил)(4-метил-1,4-дiazепан-1-ил)метанон (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

25

точная масса: 430.2519 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

в.у.: 1.83 мин. - найденная масса: 431 (m/z+H)

30

----

Пример # 305

Получение 1-(4-((8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)бензоил)пиперидин-4-она

5 4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 1-(4-аминобензоил)пиперидин-4-он (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл).  
10 Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 415.1942 г/моль

15

ВЭЖХ-МС: аналитический метод А

в.у.: 2.12 мин. - найденная масса: 416 (m/z+H)

----

20

Пример # 306

Получение (4-((8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)фенил)(1,4-диокса-8-азаспиро[4.5]декан-8-ил)метанона

25

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и (4-аминофенил)(1,4-диокса-8-азаспиро[4.5]декан-8-ил)метанон (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и

30

очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 459.2276 г/моль

5

ВЭЖХ-МС: аналитический метод А

в.у.: 2.38 мин. - найденная масса: 460 (m/z+H)

----

10

Пример # 307

Получение (3-(диметиламино)пирролидин-1-ил)(4-((8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)фенил)метанона

15

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и (4-аминофенил)(3-(диметиламино)пирролидин-1-ил)метанон (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

25

точная масса: 430.2519 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

30

в.у.: 1.89 мин. - найденная масса: 431 (m/z+H)

----

Пример # 308

Получение 8-метокси-N-(1-метил-1,2,3,4-тетрагидрохинолин-6-ил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амина

5 4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 1-метил-1,2,3,4-тетрагидрохинолин-6-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь  
10 упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

15 точная масса: 359.2065 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод D

в.у.: 4.77 мин. - найденная масса: 360 (m/z+H)

20 ----

Пример # 309

25 Получение 8-метокси-N-(3-(пентафторсульфанил)фенил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амина

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 3-аминофенил-серы пентафторид (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли  
30 HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при

140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 416.0869 г/моль

5

ВЭЖХ-МС: аналитический метод D

в.у.: 7.747 мин. - найденная масса: 417 (m/z+H)

----

10

Пример # 310

Получение N-(4-фторфенил)-8-метокси-2H-пиразоло[3,4-c]хинолин-4-амина

15 4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-c]хинолин (0.16 ммоль) и 4-фторанилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без  
20 дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

25

точная масса: 308.1238 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод D

в.у.: 4 мин. - найденная масса: 309 (m/z+H)

30

----

Пример # 311

Получение N-(3,4-дифторфенил)-8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амина

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 3,4-дифторанилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 326.1117 г/моль

15

ВЭЖХ-МС: аналитический метод D

в.у.: 5.31 мин. - найденная масса: 327 (m/z+H)

----

20

Пример # 312

Получение 2,2,2-трифтор-N-(4-((8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)фенил)ацетамида

25

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и N-(4-аминофенил)-2,2,2-трифторацетамид (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 401.1256 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод D

5 в.у.: 4.89 мин. - найденная масса: 402 (m/z+H)

----

10 Пример # 313

Получение 3-((6-((8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)-2H-бензо[b][1,4]оксазин-3-ил)амино)пропан-1-ола

15 4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 3-((6-амино-2H-бензо[b][1,4]оксазин-3-ил)амино)пропан-1-ол (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток  
20 растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

25 точная масса: 418.2072 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод D

в.у.: 3.136 мин. - найденная масса: 419 (m/z+H)

30 ----

Пример # 314

Получение N6-(8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-N3-фенетил-2H-бензо[b][1,4]оксазин-3,6-диамина

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и N3-фенетил-2H-бензо[b][1,4]оксазин-3,6-диамин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 464.2305 г/моль

15

ВЭЖХ-МС: аналитический метод С

в.у.: 2.322 мин. - найденная масса: 465 (m/z+H)

----

20

Пример # 315

Получение N-(3,5-дифторфенил)-8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амина

25

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 3,5-дифторанилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

30

точная масса: 326.1117 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод D

5 в.у.: 6.98 мин. - найденная масса: 327 (m/z+H)

----

10 Пример # 316

Получение N-(3-фтор-4-метилфенил)-8-метокси-2H-пиразоло[3,4-  
с]хинолин-4-амина

15 4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16  
ммоль) и 3-фтор-4-метиланилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH  
(сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в  
диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе  
в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без  
20 дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь  
облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную  
смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и  
лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

25 точная масса: 322.1433 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод D

в.у.: 5.191 мин. - найденная масса: 323 (m/z+H)

----

30

Пример # 317

Получение 8-метокси-N-(3,4,5-трифторфенил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-  
4-амина

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 3,4,5-трифторанилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 344.0996 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод D

в.у.: 7.303 мин. - найденная масса: 345 (m/z+H)

----

Пример # 318

20

Получение 8-метокси-N-(4-нитрофенил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амина

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 4-нитроанилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

30

точная масса: 335.1172 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод D

в.у.: 7.227 мин. - найденная масса: 336 (m/z+H)

5 ----

Пример # 319

10 Получение 8-метокси-N-(3-метокси-4-морфолинофенил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амина

15 4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 3-метокси-4-морфолиноанилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью  
20 полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 405.2148 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод D

25 в.у.: 3.996 мин. - найденная масса: 406 (m/z+H)

----

Пример # 320

30 Получение 8-метокси-N-(3-(метилсульфонил)фенил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амина

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 3-(метилсульфонил)анилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

10

точная масса: 368.1158 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод D

в.у.: 4.716 мин. - найденная масса: 370 (m/z+H)

15

----

Пример # 321

20      Получение                    1,1,1,3,3,3-гексафтор-2-(4-((8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)фенил)пропан-2-ола

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 2-(4-аминофенил)-1,1,1,3,3,3-гексафторпропан-2-ол (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

30

точная масса: 456.1162 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод D

в.у.: 6.425 мин. - найденная масса: 457 (m/z+H)

----

5

Пример # 322

Получение (4-((8-фтор-3H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)фенил)(пирролидин-1-ил)метанона

10

4-хлор-8-фтор-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и (4-аминофенил)(пирролидин-1-ил)метанон (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

20

точная масса: 375.1744 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод D

в.у.: 5.249 мин. - найденная масса: 376 (m/z+H)

25

----

Пример # 323

30

Получение 1-(4-(4-((8-фтор-3H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)фенил)пиперазин-1-ил)этан-1-она

4-хлор-8-фтор-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 1-(4-(4-аминофенил)пиперазин-1-ил)этан-1-он (2 экв., 0.3 ммоль)

суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 404.2064 г/моль

10

ВЭЖХ-МС: аналитический метод D

в.у.: 4.104 мин. - найденная масса: 405 (m/z+H)

----

15

Пример # 324

Получение 6-((8-фтор-3H-пиразоло[3,4-c]хинолин-4-ил)амино)-2H-бензо[b][1,4]оксазин-3(4H)-она

20

4-хлор-8-фтор-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-c]хинолин (0.16 ммоль) и 6-амино-2H-бензо[b][1,4]оксазин-3(4H)-он (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

30

точная масса: 349.1103 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод D

в.у.: 3.913 мин. - найденная масса: 350 (m/z+H)

----

## Пример # 325

5

Получение 8-фтор-N-(4-морфолинофенил)-3H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амина

4-хлор-8-фтор-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 4-морфолиноанилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

20

точная масса: 363.1749 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод D

в.у.: 3.964 мин. - найденная масса: 364 (m/z+H)

----

25

## Пример # 326

Получение 8-фтор-N-(4-(4-метилпиперазин-1-ил)фенил)-3H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амина

30

4-хлор-8-фтор-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 4-(4-метилпиперазин-1-ил)анилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом

реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 376.2125 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод К

10 в.у.: 2.316 мин. - найденная масса: 377 (m/z+H)

----

Пример # 327

15

Получение N-(3,4-диметоксифенил)-8-фтор-3H-пиразоло[3,4-c]хинолин-4-амина

4-хлор-8-фтор-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-c]хинолин (0.16 ммоль) и 3,4-диметоксианилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

25

точная масса: 338.1377 г/моль

30

ВЭЖХ-МС: аналитический метод D

в.у.: 4.006 мин. - найденная масса: 339 (m/z+H)

----

## Пример # 328

5 Получение N-(4-(дифторметокси)-3-метоксифенил)-8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амина

10 4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 4-(дифторметокси)-3-метоксианилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью 15 полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 386.1396 г/моль

20 ВЭЖХ-МС: аналитический метод D  
в.у.: 5.34 мин. - найденная масса: 387 (m/z+H)

----

## Пример # 329

25

Получение N-(3-фтор-4-(трифторметил)фенил)-8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амина

30 4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 3-фтор-4-(трифторметил)анилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл).

Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

5 точная масса: 376.1070 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод D

в.у.: 8.413 мин. - найденная масса: 377 (m/z+H)

10 ----

Пример # 330

15 Получение N-(3-фтор-4-(трифторметокси)фенил)-8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амина

20 4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 3-фтор-4-(трифторметокси)анилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл).  
 25 Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 392.1015 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод D

30 в.у.: 7.887 мин. - найденная масса: 393 (m/z+H)

----

Пример # 331

Получение N-(2,3-диметоксифенил)-8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амина

5 4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 2,3-диметоксианилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без  
10 дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

15 точная масса: 350.1638 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод D

в.у.: 4.507 мин. - найденная масса: 352 (m/z+H)

20 ----

Пример # 332

25 Получение N-(2,4-диметоксифенил)-8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амина

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 2,4-диметоксианилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без  
30 дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную

смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 350.1637 г/моль

5

ВЭЖХ-МС: аналитический метод D

в.у.: 4.22 мин. - найденная масса: 352 (m/z+H)

----

10

Пример # 333

Получение 8-йод-N-(4-(4-метилпиперазин-1-ил)фенил)-3H-пиразоло[3,4-c]хинолин-4-амина

15

4-хлор-8-йод-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-c]хинолин (0.16 ммоль) и 4-(4-метилпиперазин-1-ил)анилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

20

точная масса: 484.1185 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод L

в.у.: 3.25 мин. - найденная масса: 485 (m/z+H)

25

----

Пример # 334

Получение 6-((7-фтор-3Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)-2Н-бензо[*b*][1,4]оксазин-3(4Н)-она

4-хлор-7-фтор-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 6-амино-2Н-бензо[*b*][1,4]оксазин-3(4Н)-он (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/*t*-BuOH 4/1.

точная масса: 349.1102 г/моль

15

ВЭЖХ-МС: аналитический метод L

в.у.: 3.856 мин. - найденная масса: 350 (m/z+H)

----

20

Пример # 335

Получение 7-фтор-N-(4-морфолинофенил)-3Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амина

25

4-хлор-7-фтор-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 4-морфолиноанилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/*t*-BuOH 4/1.

30

точная масса: 363.1748 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод L

5 в.у.: 3.846 мин. - найденная масса: 364 (m/z+H)

----

10 Пример # 336

Получение N-(3,4-диметоксифенил)-7-фтор-3H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амина

15 4-хлор-7-фтор-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 3,4-диметоксианилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь  
20 облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 338.1377 г/моль

25

ВЭЖХ-МС: аналитический метод D

в.у.: 4.269 мин. - найденная масса: 339 (m/z+H)

----

30

Пример # 337

Получение 7-фтор-N-(4-(4-метилпиперазин-1-ил)фенил)-3H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амина

4-хлор-7-фтор-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 4-(4-метилпиперазин-1-ил)анилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 376.2125 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод К

в.у.: 2.39 мин. - найденная масса: 377 (m/z+H)

----

Пример # 338

Получение 9-метокси-N-(3-(метилсульфонил)фенил)-3Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амина

4-хлор-9-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 3-(метилсульфонил)анилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 368.1157 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод D

в.у.: 5.01 мин. - найденная масса: 369 (m/z+H)

5 ----

Пример # 339

10 Получение 7-((9-метокси-3H-пиразоло[3,4-c]хинолин-4-ил)амино)-3,4-дигидрохинолин-2(1H)-она

15 4-хлор-9-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-c]хинолин (0.16 ммоль) и 7-амино-3,4-дигидрохинолин-2(1H)-он (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью  
20 полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 359.1613 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод D

25 в.у.: 4.03 мин. - найденная масса: 360 (m/z+H)

----

Пример # 340

30

Получение 1-(4-(4-((9-метокси-3H-пиразоло[3,4-c]хинолин-4-ил)амино)фенил)пиперазин-1-ил)этан-1-она

4-хлор-9-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 1-(4-(4-аминофенил)пиперазин-1-ил)этан-1-он (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 416.2323 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод D

в.у.: 4.14 мин. - найденная масса: 417 (m/z+H)

----

Пример # 341

Получение N-(3,5-диметоксифенил)-8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амина

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 3,5-диметоксианилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 350.1638 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод L

в.у.: 4.111 мин. - найденная масса: 351 (m/z+H)

----

5

Пример # 342

Получение (4-((7-фтор-3H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)фенил)(пирролидин-1-ил)метанона

10

4-хлор-7-фтор-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и (4-аминофенил)(пирролидин-1-ил)метанон (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

20

точная масса: 375.1743 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод D

в.у.: 5.78 мин. - найденная масса: 376 (m/z+H)

25

----

Пример # 343

Получение 4-((8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)-N,N-диметилбензолсульфонамида

30

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 4-амино-N,N-диметилбензолсульфонамид (2 экв., 0.3 ммоль)

суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 397.1478 г/моль

10

ВЭЖХ-МС: аналитический метод D

в.у.: 6.424 мин. - найденная масса: 398 (m/z+H)

----

15

Пример # 344

Получение N-циклопропил-3-((8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)бензолсульфонамида

20

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 3-амино-N-циклопропилбензолсульфонамид (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

30

точная масса: 409.1473 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод L

в.у.: 4.619 мин. - найденная масса: 410 (m/z+H)

----

## Пример # 345

5

Получение N-(4-(2H-1,2,3-триазол-2-ил)фенил)-8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амина

10 4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 4-(2H-1,2,3-триазол-2-ил)анилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл).  
15 Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 357.1524 г/моль

20

ВЭЖХ-МС: аналитический метод D

в.у.: 5.381 мин. - найденная масса: 358 (m/z+H)

----

25

## Пример # 346

Получение 8-метокси-N-(3-(метилсульфинил)фенил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амина

30

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 3-(метилсульфинил)анилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе

5 в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 352.1213 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод L

10 в.у.: 3.752 мин. - найденная масса: 353 (m/z+H)

----

Пример # 347

15

Получение N-(3-(2H-1,2,3-триазол-2-ил)фенил)-8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амина

20 4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 3-(2H-1,2,3-триазол-2-ил)анилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл).  
25 Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 357.1524 г/моль

30

ВЭЖХ-МС: аналитический метод L

в.у.: 4.707 мин. - найденная масса: 358 (m/z+H)

----

## Пример # 348

5 Получение 3-((8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)-N-метилбензолсульфонамида

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 3-амино-N-метилбензолсульфонамид (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 10 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 15 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 383.1283 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод L  
20 в.у.: 4.283 мин. - найденная масса: 384 (m/z+H)

----

## Пример # 349

25 Получение 8-метокси-N-(3-(морфолиносulфонил)фенил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин

30 4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 3-(морфолиносulфонил)анилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл).

Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

5 точная масса: 439.1611 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод L

в.у.: 4.78 мин. - найденная масса: 440 (m/z+H)

10 ----

Пример # 350

15 Получение 8-метокси-N-(3-((трифторметил)сульфонил)фенил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амина

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 3-((трифторметил)сульфонил)анилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 20 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 25 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 422.0794 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод D

30 в.у.: 7.966 мин. - найденная масса: 423 (m/z+H)

----

Пример # 351

Получение 2-((3-((8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)фенил)сульфонил)этан-1-ола

5 4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 2-((3-аминофенил)сульфонил)этан-1-ол (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь  
10 упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

15 точная масса: 398.1296 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод L

в.у.: 3.995 мин. - найденная масса: 399 (m/z+H)

20 ----

Пример # 352

Получение 9-метокси-N-(2-метилизоиндолин-5-ил)-3H-пиразоло[3,4-  
25 с]хинолин-4-амина

4-хлор-9-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 2-метилизоиндолин-5-амин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе  
30 в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную

смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 345.1869 г/моль

5

ВЭЖХ-МС: аналитический метод К

в.у.: 2.24 мин. - найденная масса: 345 (m/z+H)

-----

10

Пример # 353

Получение N-(4-((диметиламино)метил)фенил)-9-метокси-3H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амина

15

4-хлор-9-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 4-((диметиламино)метил)анилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

25

точная масса: 347.2069 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод К

в.у.: 2.32 мин. - найденная масса: 348 (m/z+H)

30

-----

Пример # 354

Получение N-(3,4-диметоксифенил)-8-йод-3H-пиразоло[3,4-c]хинолин-4-амина

5 4-хлор-8-йод-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-c]хинолин (0.16 ммоль)  
и 3,4-диметоксианилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл)  
в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3  
капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5  
мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без  
10 дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь  
облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную  
смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и  
лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 446.0438 г/моль

15

ВЭЖХ-МС: аналитический метод D

в.у.: 5.553 мин. - найденная масса: 447 (m/z+H)

----

20

Пример # 355

Получение 8-йод-N-(4-морфолинофенил)-3H-пиразоло[3,4-c]хинолин-4-амина

25

4-хлор-8-йод-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-c]хинолин (0.16 ммоль)  
и 4-морфолиноанилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл)  
в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3  
капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5  
30 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без  
дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь  
облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную  
смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и  
лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 471.0809 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод D

5 в.у.: 5.438 мин. - найденная масса: 472 (m/z+H)

----

10 Пример # 356

Получение (4-((8-йод-3H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)фенил)(пирролидин-1-ил)метанона

15 4-хлор-8-йод-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и (4-аминофенил)(пирролидин-1-ил)метанон (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл).  
20 Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

25 точная масса: 483.0804 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод L

в.у.: 5.219 мин. - найденная масса: 484 (m/z+H)

----

30

Пример # 357

Получение 1-(4-(4-((8-йод-3H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)фенил)пиперазин-1-ил)этан-1-она

4-хлор-8-йод-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 1-(4-(4-аминофенил)пиперазин-1-ил)этан-1-он (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью 10 полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 512.1124 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод L

15 в.у.: 4.101 мин. - найденная масса: 513 (m/z+H)

----

Пример # 358

20

Получение 4-фтор-N-(4-((8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)фенил)бензамида

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 25 ммоль) и N-(4-аминофенил)-4-фторбензамид (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). 30 Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 427.1673 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод L

в.у.: 1.104 мин. - найденная масса: 428 (m/z+H)

5 ----

Пример # 359

10 Получение 8-метокси-N-(4-морфолино-3-нитрофенил)-2H-пиразоло[3,4-  
с]хинолин-4-амина

15 4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16  
ммоль) и 4-морфолино-3-нитроанилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в  
MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли  
20 HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом  
реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и  
использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл).  
Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при  
140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью  
20 полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

точная масса: 420.1822 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод D

25 в.у.: 6.145 мин. - найденная масса: 421 (m/z+H)

----

Пример # 360

30 Получение N-(2,4-дифторфенил)-8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-  
амина

4-хлор-8-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 2,4-дифторанилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

10

точная масса: 326.1117 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод D

в.у.: 4.99 мин. - найденная масса: 327 (m/z+H)

15

----

Пример # 361

20      Получение    N-(3,4-диметоксифенил)-9-фтор-3Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амина

4-хлор-9-фтор-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 3,4-диметоксианилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4М, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

30

точная масса: 338.1377 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод D

в.у.: 2.81 мин. - найденная масса: 339 (m/z+H)

----

5

Пример # 362

Получение 9-фтор-N-(3-(метилсульфонил)фенил)-3H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амина

10

4-хлор-9-фтор-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 3-(метилсульфонил)анилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

20

точная масса: 356.0898 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод D

в.у.: 6.24 мин. - найденная масса: 357 (m/z+H)

25

----

Пример # 363

Получение 9-фтор-N-(4-(4-(4-метилпиперазин-1-ил)пиперидин-1-ил)фенил)-3H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амина

30

4-хлор-9-фтор-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 4-(4-(4-метилпиперазин-1-ил)пиперидин-1-ил)анилин (2 экв., 0.3

5 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

10 точная масса: 459.3026 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод К

в.у.: 2.35 мин. - найденная масса: 460 (m/z+H)

15 ----

Пример # 364

20 Получение 9-фтор-N-(3-фтор-4-морфолинофенил)-3H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амина

4-хлор-9-фтор-2-(4-метоксибензил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин (0.16 ммоль) и 3-фтор-4-морфолиноанилин (2 экв., 0.3 ммоль) суспендировали в MeOH (сухом, 3 мл) в пробирке для микроволновой печи (2-5 мл), и добавляли HCl в диоксане (4M, 3 капли). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь упаривали и использовали без дополнительной очистки. Остаток растворяли в ТФУ (3 мл). Реакционную смесь облучали в микроволновом реакторе в течение 5 мин. при 140°C. Реакционную смесь концентрировали и очищали с помощью полупрепаративной ВЭЖХ-МС и лиофилизировали из смеси вода/t-BuOH 4/1.

30

точная масса: 381.1627 г/моль

ВЭЖХ-МС: аналитический метод К

в.у.: 6.38 мин. - найденная масса: 382 (m/z+H)

## БИОЛОГИЧЕСКИЕ ДАННЫЕ

### 5 Активности СУК:

К<sub>i</sub> меньше чем 10 нМ:

Пример #40; Пример #43; Пример #47; Пример #56; Пример #67; Пример #85; Пример #93; Пример #97; Пример #118; Пример #164; Пример #169; Пример #177; Пример #184; Пример #187; Пример #188; Пример #197; Пример #209; Пример #217; Пример #222; Пример #226; Пример #233; Пример #246; Пример #251; Пример #257; Пример #263; Пример #266; Пример #270; Пример #271; Пример #272; Пример #291; Пример #292; Пример #293; Пример #318; Пример #333; Пример #358; Пример #359; Пример #362;

15

К<sub>i</sub> между 10 нМ и 100 нМ:

Пример #6; Пример #10; Пример #13; Пример #15; Пример #34; Пример #38; Пример #39; Пример #41; Пример #42; Пример #44; Пример #45; Пример #46; Пример #50; Пример #51; Пример #53; Пример #54; Пример #55; Пример #57; Пример #58; Пример #60; Пример #61; Пример #66; Пример #71; Пример #73; Пример #74; Пример #77; Пример #78; Пример #84; Пример #86; Пример #88; Пример #91; Пример #92; Пример #94; Пример #95; Пример #96; Пример #100; Пример #101; Пример #102; Пример #103; Пример #104; Пример #105; Пример #107; Пример #109; Пример #111; Пример #112; Пример #113; Пример #115; Пример #120; Пример #121; Пример #122; Пример #123; Пример #124; Пример #125; Пример #128; Пример #132; Пример #133; Пример #134; Пример #135; Пример #136; Пример #142; Пример #147; Пример #150; Пример #151; Пример #152; Пример #159; Пример #160; Пример #161; Пример #162; Пример #163; Пример #165; Пример #166; Пример #167; Пример #168; Пример #170; Пример #171; Пример #172; Пример #173; Пример #175; Пример #176; Пример #178; Пример #179; Пример #181; Пример #182; Пример #183; Пример #185; Пример #189; Пример #192; Пример #193; Пример #195; Пример #196; Пример #199; Пример #201; Пример #202; Пример #203; Пример #206; Пример #207; Пример #208; Пример #216; Пример #219; Пример #224; Пример #228; Пример

#232; Пример #234; Пример #235; Пример #237; Пример #238; Пример #239;  
Пример #240; Пример #241; Пример #242; Пример #243; Пример #244; Пример  
#247; Пример #250; Пример #254; Пример #255; Пример #256; Пример #259;  
Пример #260; Пример #261; Пример #262; Пример #264; Пример #265; Пример  
5 #267; Пример #268; Пример #273; Пример #274; Пример #276; Пример #277;  
Пример #280; Пример #281; Пример #282; Пример #283; Пример #284; Пример  
#286; Пример #289; Пример #290; Пример #294; Пример #300; Пример #301;  
Пример #302; Пример #308; Пример #310; Пример #311; Пример #313; Пример  
#314; Пример #317; Пример #319; Пример #324; Пример #325; Пример #326;  
10 Пример #334; Пример #335; Пример #336; Пример #337; Пример #339; Пример  
#340; Пример #343; Пример #344; Пример #348; Пример #353; Пример #355;  
Пример #357; Пример #363;

Кі между 100 нМ и 1000 нМ:

15 Пример #2; Пример #3; Пример #4; Пример #5; Пример #8; Пример #17;  
Пример #22; Пример #23; Пример #24; Пример #25; Пример #26; Пример #27;  
Пример #28; Пример #30; Пример #35; Пример #37; Пример #49; Пример #52;  
Пример #59; Пример #72; Пример #75; Пример #76; Пример #79; Пример #81;  
Пример #82; Пример #83; Пример #87; Пример #90; Пример #98; Пример #99;  
20 Пример #106; Пример #108; Пример #110; Пример #114; Пример #117; Пример  
#119; Пример #126; Пример #131; Пример #138; Пример #139; Пример #141;  
Пример #144; Пример #146; Пример #148; Пример #154; Пример #156; Пример  
#157; Пример #158; Пример #190; Пример #191; Пример #194; Пример #198;  
Пример #200; Пример #210; Пример #211; Пример #212; Пример #213; Пример  
25 #214; Пример #218; Пример #220; Пример #221; Пример #223; Пример #225;  
Пример #227; Пример #229; Пример #230; Пример #231; Пример #236; Пример  
#245; Пример #248; Пример #249; Пример #252; Пример #253; Пример #258;  
Пример #269; Пример #275; Пример #278; Пример #279; Пример #285; Пример  
#287; Пример #288; Пример #296; Пример #297; Пример #299; Пример #303;  
30 Пример #309; Пример #312; Пример #315; Пример #320; Пример #321; Пример  
#323; Пример #327; Пример #328; Пример #331; Пример #332; Пример #338;  
Пример #341; Пример #342; Пример #345; Пример #346; Пример #347; Пример  
#349; Пример #350; Пример #351; Пример #354; Пример #356; Пример #361;

## Активности LRRK2:

IC50 меньше чем 10 нМ:

Пример #77; Пример #85; Пример #88; Пример #93; Пример #286; Пример  
5 #302;

IC50 между 10 нМ и 100 нМ:

Пример #42; Пример #44; Пример #47; Пример #51; Пример #54; Пример  
#56; Пример #74; Пример #87; Пример #94; Пример #95; Пример #96; Пример  
10 #97; Пример #109; Пример #111; Пример #118; Пример #120; Пример #131;  
Пример #132; Пример #147; Пример #150; Пример #161; Пример #164; Пример  
#165; Пример #169; Пример #183; Пример #187; Пример #188; Пример #192;  
Пример #198; Пример #199; Пример #202; Пример #203; Пример #209; Пример  
#234; Пример #235; Пример #237; Пример #240; Пример #266; Пример #269;  
15 Пример #271; Пример #272; Пример #277; Пример #281; Пример #291; Пример  
#292; Пример #293; Пример #295; Пример #300; Пример #301; Пример #303;  
Пример #305; Пример #306; Пример #313; Пример #314; Пример #339; Пример  
#340; Пример #344; Пример #348; Пример #352; Пример #353; Пример #363;

20 IC50 между 100 нМ и 1000 нМ:

Пример #3; Пример #13; Пример #15; Пример #34; Пример #37; Пример  
#38; Пример #39; Пример #40; Пример #43; Пример #45; Пример #46; Пример  
#48; Пример #49; Пример #50; Пример #52; Пример #53; Пример #55; Пример  
#57; Пример #59; Пример #61; Пример #66; Пример #67; Пример #71; Пример  
25 #73; Пример #78; Пример #81; Пример #84; Пример #86; Пример #92; Пример  
#98; Пример #100; Пример #101; Пример #102; Пример #103; Пример #104;  
Пример #105; Пример #106; Пример #107; Пример #108; Пример #112; Пример  
#113; Пример #114; Пример #115; Пример #117; Пример #119; Пример #121;  
Пример #122; Пример #124; Пример #125; Пример #126; Пример #127; Пример  
30 #128; Пример #133; Пример #134; Пример #135; Пример #136; Пример #138;  
Пример #142; Пример #144; Пример #145; Пример #148; Пример #151; Пример  
#152; Пример #160; Пример #162; Пример #163; Пример #166; Пример #167;  
Пример #168; Пример #170; Пример #171; Пример #172; Пример #173; Пример  
#175; Пример #177; Пример #179; Пример #181; Пример #184; Пример #185;

Пример #189; Пример #193; Пример #195; Пример #196; Пример #200; Пример #201; Пример #206; Пример #207; Пример #208; Пример #215; Пример #216; Пример #221; Пример #222; Пример #223; Пример #224; Пример #225; Пример #228; Пример #229; Пример #230; Пример #232; Пример #236; Пример #238; 5 Пример #239; Пример #241; Пример #242; Пример #243; Пример #244; Пример #245; Пример #246; Пример #247; Пример #248; Пример #250; Пример #251; Пример #252; Пример #253; Пример #254; Пример #255; Пример #256; Пример #257; Пример #258; Пример #259; Пример #262; Пример #264; Пример #268; Пример #270; Пример #273; Пример #274; Пример #279; Пример #280; Пример 10 #282; Пример #283; Пример #284; Пример #285; Пример #290; Пример #294; Пример #296; Пример #304; Пример #307; Пример #308; Пример #310; Пример #312; Пример #317; Пример #319; Пример #320; Пример #321; Пример #323; Пример #324; Пример #325; Пример #328; Пример #333; Пример #338; Пример #343; Пример #346; Пример #351; Пример #355; Пример #356; Пример #357; 15 Пример #361; Пример #362; Пример #364;

#### Активности MYLK:

#### IC50 меньше чем 5000 нМ:

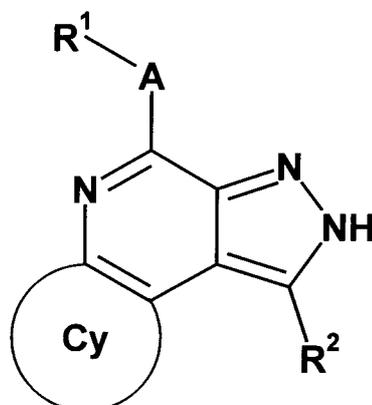
20 Пример #13; Пример #34; Пример #38; Пример #39; Пример #41; Пример #42; Пример #43; Пример #44; Пример #49; Пример #52; Пример #53; Пример #55; Пример #56; Пример #57; Пример #58; Пример #67; Пример #71; Пример #73; Пример #84; Пример #86; Пример #87; Пример #98; Пример #102; Пример #111; Пример #112; Пример #116; Пример #118; Пример #120; Пример #121; 25 Пример #122; Пример #126; Пример #127; Пример #128; Пример #131; Пример #132; Пример #133; Пример #134; Пример #136; Пример #139; Пример #142; Пример #147; Пример #148; Пример #150; Пример #152; Пример #160; Пример #162; Пример #163; Пример #164; Пример #165; Пример #166; Пример #167; Пример #169; Пример #171; Пример #172; Пример #179; Пример #183; Пример 30 #184; Пример #185; Пример #187; Пример #188; Пример #192; Пример #193; Пример #194; Пример #195; Пример #199; Пример #201; Пример #202; Пример #203; Пример #206; Пример #208; Пример #209; Пример #221; Пример #222; Пример #223; Пример #228; Пример #229; Пример #230; Пример #232; Пример #233; Пример #234; Пример #235; Пример #236; Пример #237; Пример #238;

Пример #239; Пример #240; Пример #241; Пример #242; Пример #243; Пример #245; Пример #246; Пример #248; Пример #251; Пример #252; Пример #253; Пример #254; Пример #255; Пример #257; Пример #258; Пример #259; Пример #261; Пример #262; Пример #263; Пример #264; Пример #266; Пример #268; 5 Пример #269; Пример #270; Пример #271; Пример #272; Пример #273; Пример #276; Пример #277; Пример #278; Пример #280; Пример #281; Пример #282; Пример #283; Пример #284; Пример #286; Пример #287; Пример #290; Пример #291; Пример #292; Пример #294; Пример #295; Пример #296; Пример #300; Пример #301; Пример #303; Пример #304; Пример #305; Пример #306; Пример 10 #307; Пример #308; Пример #320; Пример #322; Пример #323; Пример #324; Пример #326; Пример #327; Пример #333; Пример #337; Пример #338; Пример #339; Пример #340; Пример #341; Пример #346; Пример #348; Пример #349; Пример #350; Пример #352; Пример #353; Пример #354; Пример #360;

15           Фигура 1 показывает взаимозависимость LAD2-SYK.

## ФОРМУЛА ИЗОБРЕТЕНИЯ

1. Соединение формулы (I)



(I)

где

A означает NH, O, S, C=O, NR<sup>3</sup> или CR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>;

Cy означает необязательно замещенную ариленовую, гетероариленовую, циклоалкиленовую, гетероциклоалкиленовую, алкилциклоалкиленовую, гетероалкилциклоалкиленовую, аралкиленовую или гетероаралкиленовую группу;

R<sup>1</sup> означает необязательно замещенную алкильную, алкенильную, алкинильную, гетероалкильную, арильную, гетероарильную, циклоалкильную, алкилциклоалкильную, гетероалкилциклоалкильную, гетероциклоалкильную, аралкильную или гетероаралкильную группу;

R<sup>2</sup> означает атом водорода, атом галогена, NO<sub>2</sub>, N<sub>3</sub>, OH, SH, NH<sub>2</sub> или алкильную, алкенильную, алкинильную, гетероалкильную, арильную, гетероарильную, циклоалкильную, алкилциклоалкильную, гетероалкилциклоалкильную, гетероциклоалкильную, аралкильную или гетероаралкильную группу;

$R^3$  означает алкильную, алкенильную, алкинильную, гетероалкильную, арильную, гетероарильную, циклоалкильную, алкилциклоалкильную, гетероалкилциклоалкильную, гетероциклоалкильную, аралкильную или гетероаралкильную группу;

5

$R^4$  означает атом водорода,  $NO_2$ ,  $N_3$ ,  $OH$ ,  $SH$ ,  $NH_2$  или алкильную, алкенильную, алкинильную, гетероалкильную, арильную, гетероарильную, циклоалкильную, алкилциклоалкильную, гетероалкилциклоалкильную, гетероциклоалкильную, аралкильную или гетероаралкильную группу; и

10

$R^5$  означает атом водорода,  $NO_2$ ,  $N_3$ ,  $OH$ ,  $SH$ ,  $NH_2$  или алкильную, алкенильную, алкинильную, гетероалкильную, арильную, гетероарильную, циклоалкильную, алкилциклоалкильную, гетероалкилциклоалкильную, гетероциклоалкильную, аралкильную или гетероаралкильную группу;

15

или его фармацевтически приемлемая соль, сложный эфир, сольват или гидрат, или фармацевтически приемлемый состав.

2. Соединение по пункту 1, где А означает NH.

20

3. Соединение по пункту 1 или пункту 2, где  $R^2$  означает H, F, Cl,  $CH_3$ ,  $CF_3$ ,  $NO_2$ , циклопропил, CN,  $N_3$ , OH, SH, OMe, SMe, NHMe,  $NMe_2$  или  $NH_2$ .

25

4. Соединение по любому из предыдущих пунктов, где  $R^2$  означает атом водорода,  $NO_2$  группу,  $CF_3$  группу или метильную группу.

5. Соединение по любому из предыдущих пунктов, где А означает NH и  $R^2$  означает H или  $CH_3$ .

30

6. Соединение по любому из предыдущих пунктов, где  $R^1$  означает необязательно замещенную арильную, гетероарильную, циклоалкильную, гетероциклоалкильную, алкилциклоалкильную, гетероалкилциклоалкильную, аралкильную или гетероаралкильную группу.

7. Соединение по любому из предыдущих пунктов, где  $R^1$  означает необязательно замещенную фенильную или нафтильную группу или необязательно замещенную гетероарильную группу, имеющую одно или два кольца, содержащих 5, 6, 7, 8, 9 или 10 кольцевых атомов, или необязательно замещенную арилгетероциклоалкильную, гетероарилциклоалкильную или гетероарилгетероциклоалкильную группу, содержащую два или три кольца и от 9 до 20 кольцевых атомов; или, где  $R^1$  означает группу формулы  $-CH_2-Ar$ , где  $Ar$  означает необязательно замещенную фенильную или нафтильную группу или необязательно замещенную гетероарильную группу, имеющую одно или два кольца, содержащих 5, 6, 7, 8, 9 или 10 кольцевых атомов, или необязательно замещенную арилгетероциклоалкильную, гетероарилциклоалкильную или гетероарилгетероциклоалкильную группу, содержащую два или три кольца и от 9 до 20 кольцевых атомов.

8. Соединение по любому из предыдущих пунктов, где  $R^1$  означает группу формулы  $X^1-L^1-Y^1$  или группу формулы  $X^1-L^1-Y^1-L^2-Z^1$ , где

$X^1$  означает необязательно замещенную фенильную группу или необязательно замещенную гетероарильную группу, содержащую 5 или 6 кольцевых атомов и 1, 2, 3 или 4 гетероатома, выбранных из O, S и N;

$L^1$  означает связь или группу формулы  $-CH_2-$ ,  $-C(=O)-$ ,  $-SO-$ ,  $-SO_2-$ ,  $-NH-C(=O)-$ ,  $-C(=O)-NH-$ ;  $-C(=O)-O-$ ,  $-O-C(=O)-$ ,  $-NH-C(=O)-O-$ ,  $-O-C(=O)-NH-$ ,  $-NH-SO_2-NH-$ ,  $-CH_2-NH-CH_2-$ ,  $-NH-SO_2-$ ,  $-SO_2-NH-$  или  $-NH-C(=O)-NH-$ ;

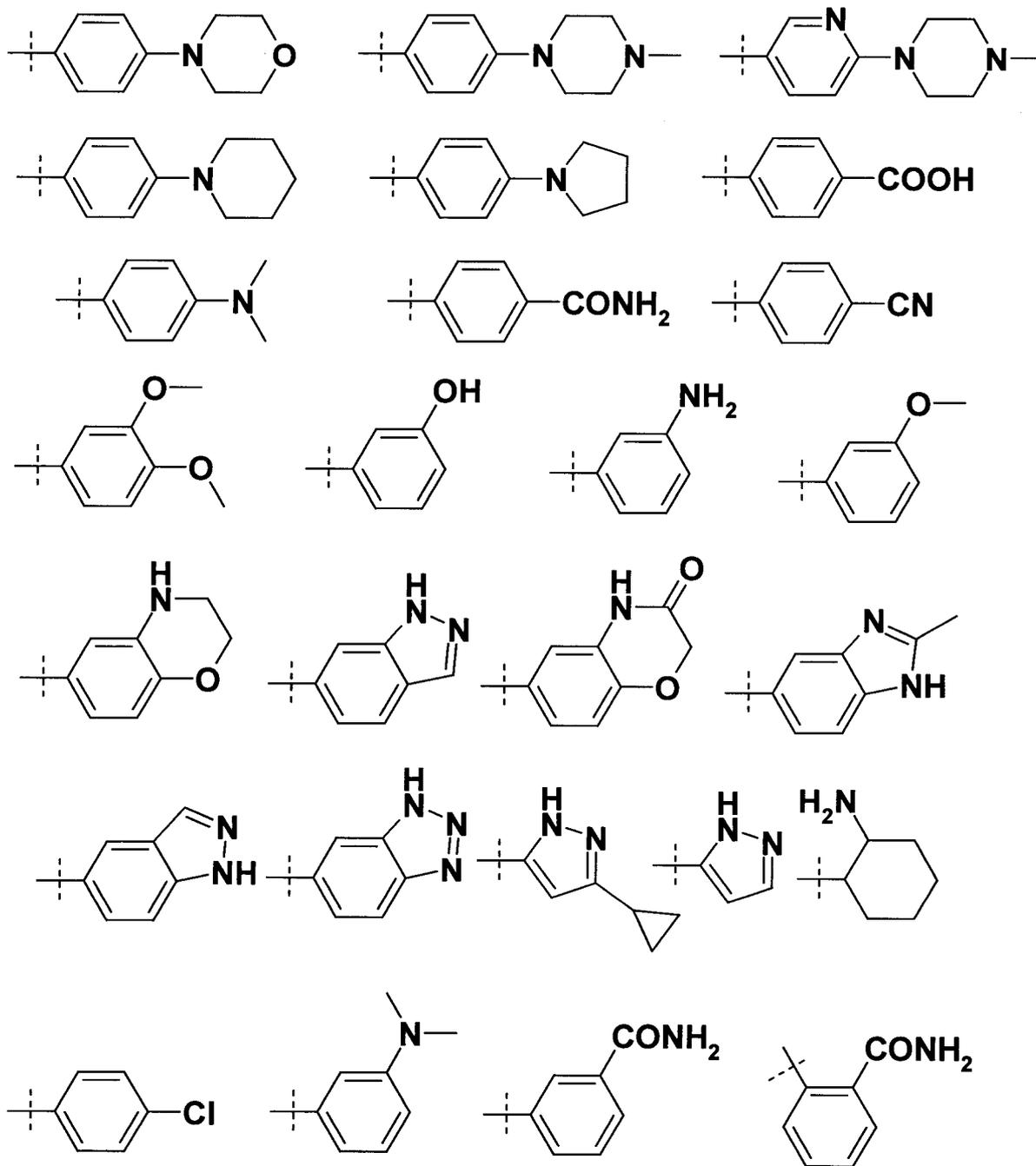
$Y^1$  означает необязательно замещенную фенильную группу, необязательно замещенную гетероарильную группу, содержащую 5 или 6 кольцевых атомов и 1, 2, 3 или 4 гетероатома, выбранных из O, S и N, необязательно замещенную  $C_3-C_7$  циклоалкильную группу или необязательно замещенную гетероциклоалкильную группу, содержащую 3, 4, 5, 6 или 7 кольцевых атомов и 1, 2, 3 или 4 гетероатома, выбранных из O, S и N;

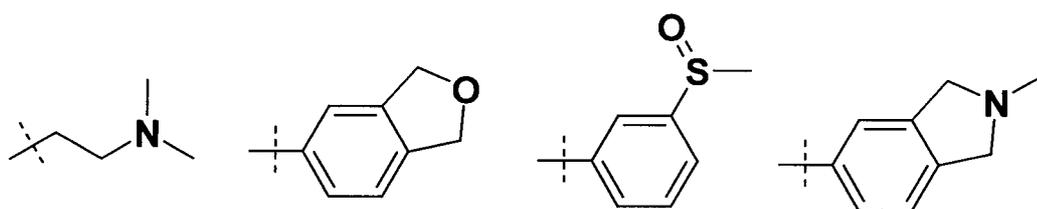
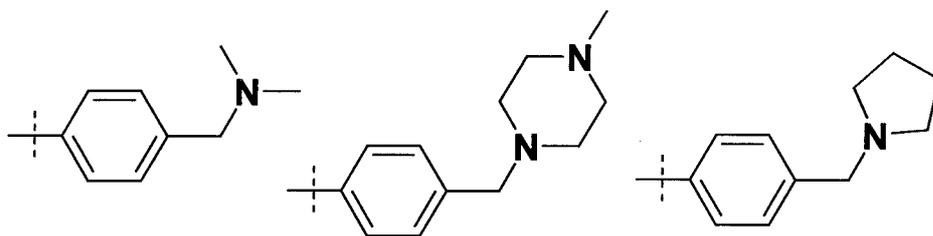
$L^2$  означает связь или группу формулы  $-CH_2-$ ,  $-C(=O)-$ ,  $-SO-$ ,  $-SO_2-$ ,  $-NH-C(=O)-$ ,  $-C(=O)-NH-$ ;  $-C(=O)-O-$ ,  $-O-C(=O)-$ ,  $-NH-C(=O)-O-$ ,  $-O-C(=O)-NH-$ ,  $-NH-SO_2-NH-$ ,  $-CH_2-NH-CH_2-$ ,  $-NH-SO_2-$ ,  $-SO_2-NH-$  или  $-NH-C(=O)-NH-$ ; и

$Z^1$  означает необязательно замещенную фенильную группу, необязательно замещенную гетероарильную группу, содержащую 5 или 6 кольцевых атомов и 1, 2, 3 или 4 гетероатома, выбранных из O, S и N, необязательно замещенную  $C_3-$

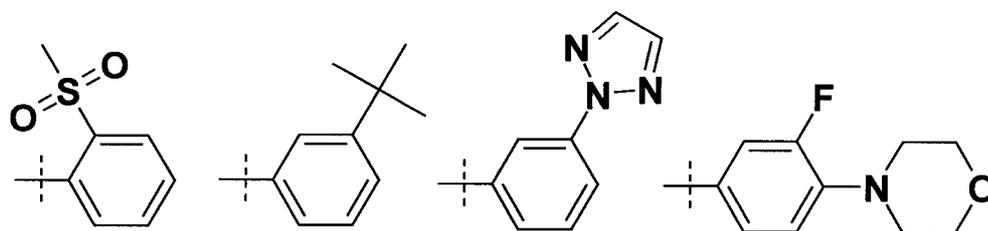
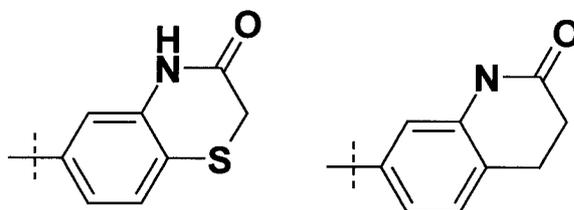
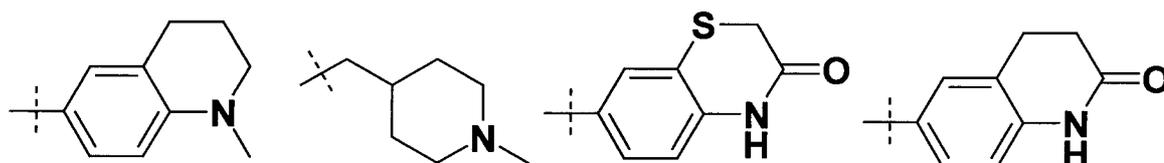
C<sub>7</sub> циклоалкильную группу или необязательно замещенную гетероциклоалкильную группу, содержащую 3, 4, 5, 6 или 7 кольцевых атомов и 1, 2, 3 или 4 гетероатома, выбранных из O, S и N.

5 9. Соединение по любому из предыдущих пунктов 1 - 5, где R<sup>1</sup> выбирают из следующих групп:

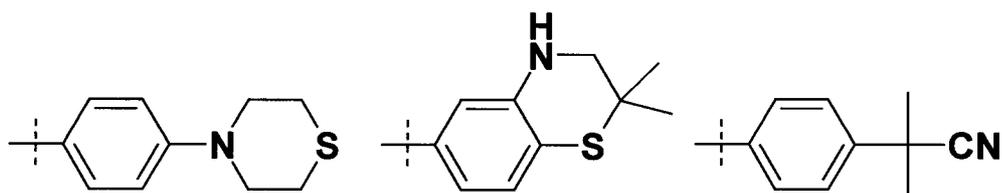


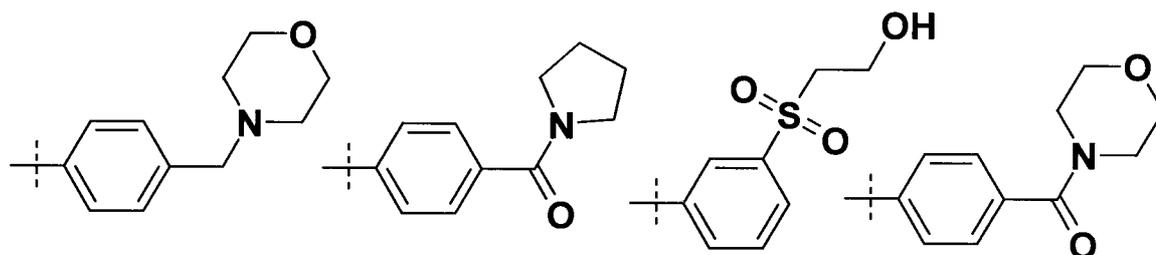
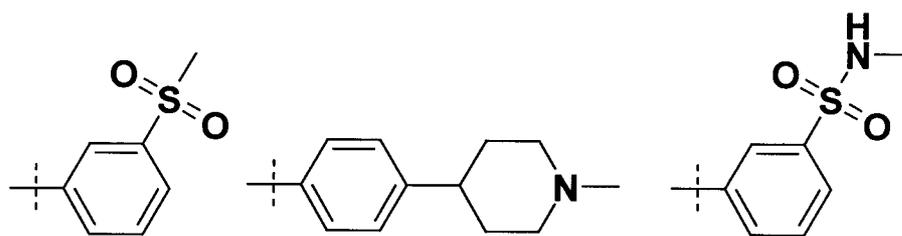


5

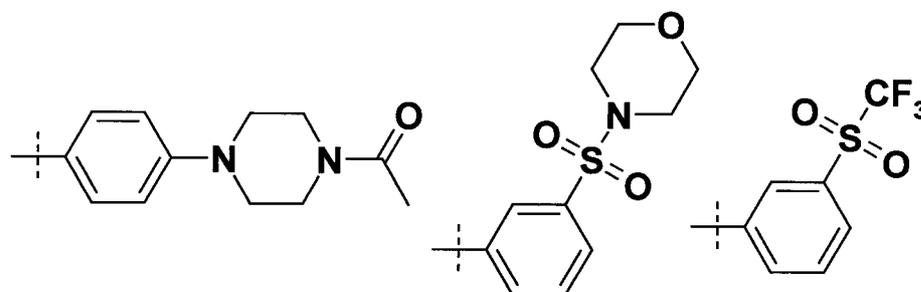
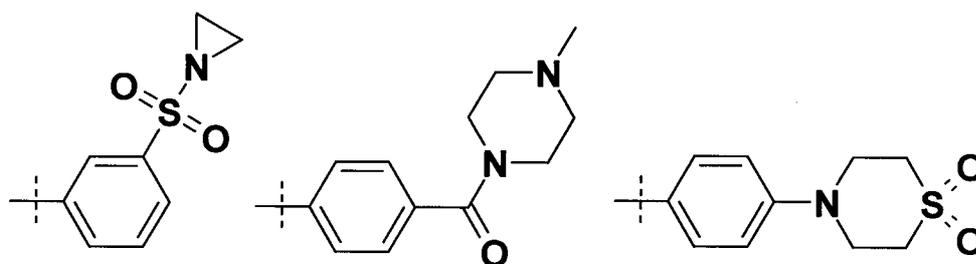
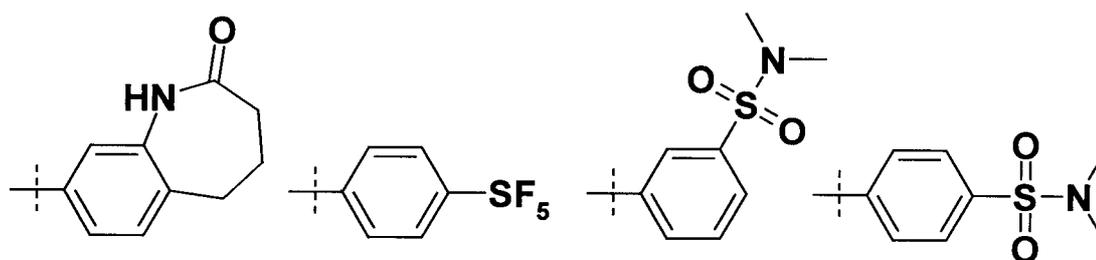


10

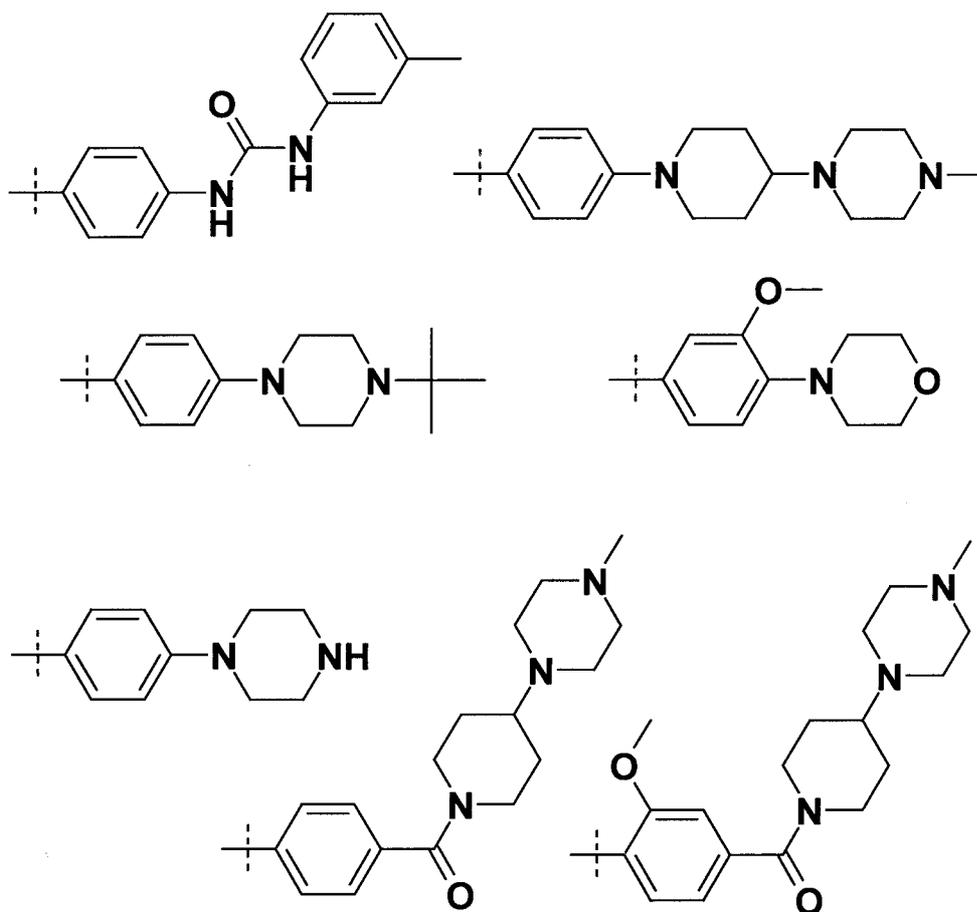




5



10



5

10. Соединение по любому из предыдущих пунктов, где Су означает необязательно замещенную фениленовую группу или необязательно замещенную гетероариленовую группу, содержащую 5 или 6 кольцевых атомов и 1, 2 или 3 гетероатома, выбранных из O, S и N.

10

11. Соединение по любому из предыдущих пунктов, где Су означает необязательно замещенную фениленовую группу или необязательно замещенную пиридиленовую группу, необязательно замещенную тиофениленовую группу или необязательно замещенную изотиазольную группу.

15

12. Соединение по пункту 1, которое представляет собой:

N-(*m*-толил)-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; N-(3-(трифторметил)фенил)-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; N-(3,4,5-триметоксифенил)-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; N-(1H-индазол-5-ил)-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; N-фенил-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; N-

20

(1H-индазол-6-ил)-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; N-(3-хлорфенил)-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; N-(7-метил-1H-индазол-5-ил)-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; N-(2-метоксиэтил)-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; 8-метокси-N-(7-метил-1H-индазол-5-ил)-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; N-5 (тиофен-2-илметил)-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; N-(6-метил-1H-индазол-5-ил)-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; 8-метокси-N-фенил-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; 8-метокси-N-(2-метоксиэтил)-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; N-(2H-индазол-6-ил)-8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; метил 4-((2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-ил)амино)бензоат; N-(1H-бензо[d]имидазол-5-ил)-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; N-(2H-индазол-7-ил)-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; 8-метокси-N-((1-метил-1H-пиррол-2-ил)метил)-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; N-(2H-индазол-7-ил)-8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; N-(бензо[d][1,3]диоксол-5-ил)-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; N-(пиридин-3-ил)-3H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; N-(1-метил-1H-индазол-6-ил)-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; N-(6-метоксипиридин-3-ил)-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; N-(4-(4-метил-1,4-дiazепан-1-ил)фенил)-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; N-(4-(4-метил-1,4-дiazепан-1-ил)фенил)-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; N-(пиридин-2-ил)-3H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; N-(5-бромпиридин-2-ил)-3H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; N-(изохиолин-3-ил)-3H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; N-(4-метилпиридин-2-ил)-3H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; N-(4,6-диметилпиридин-2-ил)-3H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; 8-бром-N-(1H-индазол-6-ил)-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; N-(1H-бензо[d]имидазол-5-ил)-8-бром-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; 8-бром-N-(1-метил-1H-индазол-6-ил)-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; 8-бром-N-(1H-индазол-7-ил)-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; 8-метокси-N-(м-толил)-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; N-(1H-индазол-5-ил)-8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; N-(1H-бензо[d]имидазол-5-ил)-8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; 8-метокси-N-(1-метил-1H-индазол-6-ил)-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; 8-бром-N-(7-метил-1H-индазол-5-ил)-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; 8-метокси-N-(4-(4-метилпиперазин-1-ил)фенил)-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; 8-бром-N-(4-(4-метилпиперазин-1-ил)фенил)-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; N1-(8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-ил)бензол-1,3-диамин; 8-бром-N-(1H-индазол-5-ил)-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; 6-((3H-

пиразоло[3,4-с]хиолин-4-ил)амино)-2Н-бензо[б][1,4]оксазин-3(4Н)-он; 6-((8-метокси-3Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-ил)амино)-2Н-бензо[б][1,4]оксазин-3(4Н)-он; N-(1Н-бензо[д][1,2,3]триазол-5-ил)-8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; 3-((8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-ил)амино)бензимидамид; 8-метокси-N-(4-(пиперидин-1-ил)фенил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; N1-(8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-ил)-N4,N4-диметилбензол-1,4-диамин; 3-((8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-ил)амино)бензамид; N-(3,4-диметоксифенил)-8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; 8-метокси-N-(4-морфолинофенил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; 8-метокси-N-(2-метил-1Н-бензо[д]имидазол-6-ил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; N-(1Н-индазол-5-ил)-8Н-пиразоло[3,4-с][1,5]нафтиридин-6-амин; 4-((8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-ил)амино)бензойную кислоту; 4-((8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-ил)амино)бензамид; 4-((8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-ил)амино)бензонитрил; 8-метокси-N-(3-метоксифенил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; 8-метокси-N-(4-метоксифенил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; 3-((8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-ил)амино)бензонитрил; N-(8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-ил)бензо[с][1,2,5]тиадиазол-5-амин; 3-((8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-ил)амино)пиридин-2(1Н)-он; N-(2-этоксифенил)-8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; 8-метокси-N-(1Н-пиразол-3-ил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; 8-метокси-N-(3,4,5-триметоксифенил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; 5-((8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-ил)амино)-1Н-пиразол-4-карбоксамид; 8-метокси-N-(2-феноксифенил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; 8-метокси-N-(3-феноксифенил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; 5-((8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-ил)амино)-1Н-бензо[д]имидазол-2(3Н)-он; N-(1Н-индол-5-ил)-8-метокси-3Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; N-(4-(аминометил)фенил)-8-метокси-3Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; N-(1Н-индазол-6-ил)-8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; N-(1Н-индол-6-ил)-8-метокси-3Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; N1-(8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-ил)-N3,N3-диметилбензол-1,3-диамин; 8-метокси-N-(3-фенил-1Н-пиразол-5-ил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; N1,N1-диэтил-N4-(8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-ил)бензол-1,4-диамин; 8-метокси-N-(4-(пирролидин-1-ил)фенил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; N3-(8-метокси-3Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-ил)-4Н-1,2,4-триазол-3,5-диамин; 8-

метокси-N-(3-морфолинофенил)-3H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(1H-индол-5-ил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 8-бром-N-(4-(пиперидин-1-ил)фенил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N1-(8-бром-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-N4,N4-диметилбензол-1,4-диамин; N-(3-циклобутил-1H-пиразол-5-ил)-8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(4-(4,5-дигидро-1H-имидазол-2-ил)фенил)-8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 4-(4-((8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)фенил)морфолин-3-он; N-(8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-2,2-диметил-3,4-дигидро-2H-бензо[b][1,4]тиазин-6-амин; N-(4-морфолинофенил)-8H-пиразоло[3,4-с][1,5]нафтиридин-6-амин; N-(1H-индазол-5-ил)-2-метокси-8H-пиразоло[3,4-с][1,5]нафтиридин-6-амин; N-(1H-индазол-6-ил)-2H-пиразоло[3,4-с][1,7]нафтиридин-4-амин; 7,8-диэтокси-N-(1H-индазол-6-ил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 7-((8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)-3,4-дигидрохинолин-2(1H)-он; 6-((8-метокси-3H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)-2H-бензо[b][1,4]тиазин-3(4H)-он; N-(5-(трет-бутил)-1H-пиразол-3-ил)-8-метокси-3H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 8-метокси-N-(3-метил-1H-пиразол-5-ил)-3H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(5-циклопропил-1H-пиразол-3-ил)-8-метокси-3H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(4-(1H-тетразол-5-ил)фенил)-8-метокси-3H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 8-бром-N-(1H-индол-5-ил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(бензо[d][1,3]диоксол-5-ил)-8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(2,3-дигидробензо[b][1,4]диоксин-6-ил)-8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 8-метокси-N-(4-(1-метилпиперидин-4-ил)фенил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 8-метокси-N-(6-морфолинопиридин-3-ил)-3H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 8-метокси-N-(4-(2-метоксиэтокси)фенил)-3H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(4-этокси-3-метоксифенил)-8-метокси-3H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 1-(4-((8-метокси-3H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)фенил)пирролидин-2-он; 8-метокси-N-(4-тиоморфолинофенил)-3H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 5-((8-метокси-3H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)бензо[d]оксазол-2(3H)-он; N-(8-метокси-3H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-3,4-дигидро-2H-бензо[b][1,4]оксазин-6-амин; 7-((8-метокси-3H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)хиназолин-4-ол; 1,1-диоксид 4-(4-((8-метокси-3H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)фенил)тиоморфолина; 2-(4-((8-метокси-3H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)фенил)ацетамид; 3-((8-метокси-3H-

пиразоло[3,4-с]хиолин-4-ил)амино)фенол; N-(3,4-диэтоксифенил)-8-метокси-3Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; 8-бром-N-(4-морфолинофенил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; 6-((8-бром-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-ил)амино)-2Н-бензо[*b*][1,4]оксазин-3(4Н)-он; 6-((8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-ил)амино)-1Н-бензо[*d*][1,3]оксазин-2,4-дион; 2-метокси-5-((8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-ил)амино)фенол; 8-бром-N-(1Н-пиразол-3-ил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; 8-метокси-N-(3-метоксифенил)-N-метил-3Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; N-(3-((8-метокси-3Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-ил)амино)фенил)ацетамид; 8-метокси-N-(1Н-пиразол-4-ил)-3Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; N-(3,4-диметоксифенил)-7,8-диметокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; N-(3,4-диметоксифенил)-8Н-пиразоло[3,4-с][1,5]нафтиридин-6-амин; N-(4-фтор-3-метоксифенил)-8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; N-(3-фтор-4-метоксифенил)-8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; 8-метокси-N-(1-метил-1Н-бензо[*d*]имидазол-5-ил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; 1-(3-((8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-ил)амино)фенил)этан-1-он; N-(4-((8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-ил)амино)фенил)ацетамид; 8-метокси-N-(пиридин-2-ил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; 8-метокси-N-(1Н-пирроло[2,3-*b*]пиридин-6-ил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; 3-((8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-ил)амино)бензолсульфонамид; 4-((8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-ил)амино)бензолсульфонамид; 7,8-диметокси-N-(4-морфолинофенил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; 7,8-диметокси-N-(4-(4-метилпиперазин-1-ил)фенил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; N1-(7,8-диметокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-ил)-N4,N4-диметилбензол-1,4-диамин; N-(1Н-индазол-6-ил)-7,8-диметокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; N2-(8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-ил)пиридин-2,6-диамин; 8-метокси-N-(1,2,3-триметил-1Н-индол-5-ил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; N2-(8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-ил)пиримидин-2,4-диамин; 8-метокси-N-(5-(метилтио)-4Н-1,2,4-триазол-3-ил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; N-(5-циклопропил-4Н-1,2,4-триазол-3-ил)-8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; N-(2-метокси-5-((8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-ил)амино)фенил)ацетамид; N-(1Н-бензо[*d*]имидазол-2-ил)-8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; N-(1Н-имидазол-2-ил)-8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; 1-(4-((8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-

ил)амино)фенил)этан-1-он; N-(4H-бензо[d][1,3]диоксин-6-ил)-8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(1,3-дигидроизобензофуран-5-ил)-8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 8-метокси-N-(1-метил-1H-бензо[d]имидазол-6-ил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-4,5-диметилтиазол-2-амин; N-(5-циклопропил-1H-пиразол-3-ил)-7,8-диметокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(7,8-диметокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-3,4-дигидро-2H-бензо[b][1,4]оксазин-6-амин; 5-((7,8-диметокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)-2-метоксифенол; 8-метокси-N-(2-метил-4-(4-метилпиперазин-1-ил)фенил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 8-метокси-N-(4-метилпиридин-2-ил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 8-метокси-N-(6-метилпиридин-2-ил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(4,6-диметилпиридин-2-ил)-8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-4-метилтиазол-2-амин; N-(8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-4,5,6,7-тетрагидробензо[d]тиазол-2-амин; 8-метокси-N-(4-феноксифенил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 8-метокси-N-(2-метил-1,2,3,4-тетрагидробензо[4,5]имидазо[1,2-а]пиперазин-8-ил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 8-метокси-N-(4-(пиридин-4-илметил)фенил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 4-((8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)бензол-1,2-диол; 8-метокси-N-(4-((1-метилпиперидин-4-ил)окси)фенил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 1-(4-(4-((8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)фенил)пиперазин-1-ил)этан-1-он; 8-метокси-N-(6-(4-метилпиперазин-1-ил)пиридин-3-ил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 6-метокси-N-(4-(4-метилпиперазин-1-ил)фенил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(3,4-диметоксифенил)-6-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(6-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-3,4-дигидро-2H-бензо[b][1,4]оксазин-6-амин; N-(5-циклопропил-1H-пиразол-3-ил)-6-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 6-метокси-N-(4-морфолинофенил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(1H-индазол-6-ил)-6-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(1H-индазол-6-ил)-7-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(7-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-3,4-дигидро-2H-бензо[b][1,4]оксазин-6-амин; N-(3,4-диметоксифенил)-7-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 7-метокси-N-(4-(4-метилпиперазин-1-ил)фенил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 7-метокси-N-(4-морфолинофенил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N4-(8-

метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-N1,N1,2-триметилбензол-1,4-диамин; N-(4-(4-циклопропилпиперазин-1-ил)фенил)-8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(3-фтор-4-морфолинофенил)-8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 7-((8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)хиноксалин-2(1Н)-он; 8-метокси-N-(3-метил-4-(4-метилпиперазин-1-ил)фенил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 8-метокси-N-(4-(пиперазин-1-ил)фенил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(4-((диметиламино)метил)фенил)-8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(2-фтор-4-морфолинофенил)-8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(4-(4-этилпиперазин-1-ил)фенил)-8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 8-((8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)-4,5-дигидро-1Н-бензо[b]азепин-2(3Н)-он; 5-((8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)-1,3-диметил-1Н-бензо[d]имидазол-2(3Н)-он; N-(4-бензилфенил)-8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 8-метокси-N-(2-метил-4-морфолинофенил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N1-(8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-N4-метил-N4-(1-метилпиперидин-4-ил)бензол-1,4-диамин; 8-метокси-N-(4-(2-морфолиноэтил)фенил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(3-хлор-4-(4-метилпиперазин-1-ил)фенил)-8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 8-метокси-N-(1,2,3,4-тетрагидрохинолин-7-ил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 4-((1Н-индазол-6-ил)амино)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-8-карбонитрил; N-(9-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-3,4-дигидро-2Н-бензо[b][1,4]оксазин-6-амин; N-(5-циклопропил-1Н-пиразол-3-ил)-9-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(3,4-диметоксифенил)-9-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 9-метокси-N-(4-(4-метилпиперазин-1-ил)фенил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 9-метокси-N-(4-морфолинофенил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(1Н-индазол-6-ил)-9-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N1-(8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)циклогексан-1,2-диамин; 8-метокси-N-(пиридин-4-ил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 8-метокси-N-(6-метоксипиридин-3-ил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(3,4-диметоксифенил)-1-метил-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 1-метил-N-(4-(4-метилпиперазин-1-ил)фенил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(1Н-индазол-6-ил)-1-метил-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(3,4-диметоксифенил)-1-(трифторметил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(4-(4-метилпиперазин-1-ил)фенил)-1-(трифторметил)-2Н-пиразоло[3,4-

с]хиолин-4-амин; N-(1H-индазол-6-ил)-1-(трифторметил)-2H-пиразоло[3,4-  
с]хиолин-4-амин; N-(3,4-диметоксифенил)-1-нитро-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-  
4-амин; N-(4-(4-метилпиперазин-1-ил)фенил)-1-нитро-2H-пиразоло[3,4-  
с]хиолин-4-амин; 2-(4-((8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-  
5 ил)амино)фенил)-N-(4-метоксифенетил)ацетамид; 4-((3,4-  
диметоксифенил)амино)-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-8-карбонитрил; 4-((4-  
морфолинофенил)амино)-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-8-карбонитрил; N-(3,4-  
диметоксифенил)-1-метил-7H-изотиазоло[5,4-b]пиразоло[4,3-d]пиридин-5-амин;  
N-(1H-индазол-6-ил)-1-метил-7H-изотиазоло[5,4-b]пиразоло[4,3-d]пиридин-5-  
10 амин; 1-метил-N-(4-(4-метилпиперазин-1-ил)фенил)-7H-изотиазоло[5,4-  
b]пиразоло[4,3-d]пиридин-5-амин; 8-метокси-N-(3-(пиперазин-1-ил)фенил)-2H-  
пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; N-(2-(диэтиламино)этил)-4-((8-метокси-2H-  
пиразоло[3,4-с]хиолин-4-ил)амино)бензамид; 8-метокси-N-(2-(4-  
метилпиперазин-1-ил)пиримидин-5-ил)-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; 7-  
15 ((8-метокси-3H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-ил)амино)-2H-бензо[b][1,4]оксазин-  
3(4H)-он; N-(8-метокси-3H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-ил)-3,4-дигидро-2H-  
бензо[b][1,4]оксазин-7-амин; 4-((3,4-диметоксифенил)амино)-1-метил-2H-  
пиразоло[3,4-с]хиолин-7-карбонитрил; 4-((1H-индазол-6-ил)амино)-1-метил-  
2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-7-карбонитрил; 8-метокси-N-(3-(4-метилпиперазин-  
20 1-ил)фенил)-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; 8-метокси-N-(3-(2-(пиперазин-  
1-ил)этокси)фенил)-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; 8-метокси-N-(6-метил-  
5,6,7,8-тетрагидро-1,6-нафтиридин-3-ил)-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; (4-  
((8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-ил)амино)фенил)(пирролидин-1-  
ил)метанон; (4-((8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-  
25 ил)амино)фенил)(морфолино)метанон; N-(4-((диметиламино)метил)фенил)-6-  
метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; 8-метокси-N-(4-(пирролидин-1-  
илметил)фенил)-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; (4-((8-метокси-2H-  
пиразоло[3,4-с]хиолин-4-ил)амино)фенил)(4-метилпиперазин-1-ил)метанон;  
N2-(2-(диметиламино)этил)-N5-(8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-  
30 ил)пиримидин-2,5-диамин; 8-метокси-N-(4-(морфолинометил)фенил)-2H-  
пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; 8-метокси-N-(4-((4-метилпиперазин-1-  
ил)метил)фенил)-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; N-(4-(4-этилпиперазин-1-  
ил)фенил)-6-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; N-(4-(4-  
этилпиперазин-1-ил)-3-фторфенил)-8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-

амин; N-(4-(2-(4-бензилпиперидин-1-ил)этил)фенил)-8-метокси-2Н-  
 пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(4-((4-бензилпиперидин-1-ил)метил)фенил)-  
 8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 8-((6-метокси-2Н-пиразоло[3,4-  
 с]хинолин-4-ил)амино)-4,5-дигидро-1Н-бензо[б]азепин-2(3Н)-он; N-(1Н-  
 5 бензо[д]имидазол-5-ил)-6-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(4-(4-  
 циклопропилпиперазин-1-ил)фенил)-9-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-  
 амин; 8-метокси-N-(п-толил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(6-(2-  
 (диметиламино)этокси)пиридин-3-ил)-8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-  
 амин; N-(3-фтор-4-морфолинофенил)-6-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-  
 10 амин; 6-метокси-N-(4-тиоморфолинофенил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин;  
 6-метокси-N-(2-метил-1Н-бензо[д]имидазол-5-ил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-  
 амин; N-(бензо[д][1,3]диоксол-5-ил)-6-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-  
 амин; 6-((6-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)-2Н-  
 бензо[б][1,4]оксазин-3(4Н)-он; N-(3,4-диметоксифенил)-6,8-диметокси-2Н-  
 15 пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(4-(4-циклопропилпиперазин-1-ил)фенил)-  
 6,8-диметокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N<sub>2</sub>-(3-  
 (диметиламино)пропил)-N<sub>5</sub>-(8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-  
 ил)пиридин-2,5-диамина; N<sub>2</sub>-(2-(диметиламино)этил)-N<sub>5</sub>-(8-метокси-2Н-  
 пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)пиридин-2,5-диамина; 8-метокси-N-(6-((1-  
 20 метилпиперидин-4-ил)окси)пиридин-3-ил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин;  
 N-(1Н-индазол-5-ил)-7-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 8-((7-  
 метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)-4,5-дигидро-1Н-  
 бензо[б]азепин-2(3Н)-он; N-(2,3-дигидробензо[б][1,4]диоксин-6-ил)-6-метокси-  
 2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(4-((диметиламино)метил)фенил)-7-  
 25 метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(4-(4-этилпиперазин-1-  
 ил)фенил)-7-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 6-метокси-N-фенил-  
 2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(4-(4-циклопропилпиперазин-1-  
 ил)фенил)-7-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(1Н-  
 бензо[д]имидазол-5-ил)-7-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 7-  
 30 метокси-N-(2-метил-1Н-бензо[д]имидазол-5-ил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-  
 амин; N-(2,3-дигидробензо[б][1,4]диоксин-6-ил)-7-метокси-2Н-пиразоло[3,4-  
 с]хинолин-4-амин; 6-((7-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)-2Н-  
 бензо[б][1,4]оксазин-3(4Н)-он; N-(бензо[д][1,3]диоксол-5-ил)-7-метокси-2Н-  
 пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(1Н-индазол-5-ил)-6-метокси-2Н-

пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; N-(4-(4-циклопентилпиперазин-1-ил)фенил)-8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; N-(4-(4-изобутилпиперазин-1-ил)фенил)-8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; N-(4-(4-изопропилпиперазин-1-ил)фенил)-8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин;

5 N-(4-(4-(циклопропилметил)пиперазин-1-ил)фенил)-8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; N-(4-(4-(трет-бутил)пиперазин-1-ил)фенил)-8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; 6-метокси-N-(п-толил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; метил 4-((3,4-диметоксифенил)амино)-2Н-пиразоло[4,3-d]тиено[3,4-b]пиридин-6-карбоксилат; метил 4-((4-(4-циклопропилпиперазин-1-ил)фенил)амино)-2Н-пиразоло[4,3-d]тиено[3,4-b]пиридин-6-карбоксилат; 2-(4-(4-((8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-ил)амино)фенил)пиперазин-1-ил)уксусную кислоту; 6-метокси-N-(4-((4-метилпиперазин-1-ил)метил)фенил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; 2-(2-метокси-4-((8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-ил)амино)фенокси)уксусную кислоту; 4-((8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-ил)амино)фенил)метанол; N-(4-(4-(2-(диметиламино)этил)пиперазин-1-ил)фенил)-8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; 6,8-диметокси-N-(4-((4-метилпиперазин-1-ил)метил)фенил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; (4-((6,8-диметокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-ил)амино)фенил)(4-метилпиперазин-1-ил)метанон; N-(4-((диметиламино)метил)фенил)-6,8-диметокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; 2-(4-((8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-ил)амино)фенил)уксусную кислоту; 6-((8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-ил)амино)-2-нафтойную кислоту; 3-((8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-ил)амино)бензойную кислоту; 4'-((8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-ил)амино)-[1,1'-бифенил]-4-карбоновую кислоту; 1-(4-((8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-ил)амино)фенил)-3-(м-толил)мочевину; 2-(4-((8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-ил)амино)фенокси)уксусную кислоту; 6-((8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-ил)амино)-2Н-бензо[b][1,4]оксазин-3(4Н)-он; 1,1-диоксид 4-(4-((8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-ил)амино)фенил)тиоморфолина; 8-метокси-N-(4-тиоморфолинофенил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; 8-метокси-N-(2-метилизоиндолин-5-ил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-амин; (3-метокси-4-((8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-ил)амино)фенил)(4-(4-метилпиперазин-1-ил)пиперидин-1-ил)метанон; 3-((8-гидрокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-4-ил)амино)бензойную

10  
15  
20  
25  
30

кислоту; 1-(4-((6,8-диметокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)фенил)-3-(м-толил)мочевину; 1-(4-((7-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)фенил)-3-(м-толил)мочевину; 1-(4-((7,8-диметокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)фенил)-3-(м-толил)мочевину; N-(2-(диметиламино)этил)-4-((8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)-N-метилбензамид; 4-((8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)фенил)(2-(метоксиметил)пирролидин-1-ил)метанон; азетидин-1-ил(4-((8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)фенил)метанон; 4-((8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)-N,N-диметилбензамид; 4-((8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)фенил)(4-метил-1,4-дiazепан-1-ил)метанон; 1-(4-((8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)бензоил)пиперидин-4-он; 4-((8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)фенил)(1,4-диокса-8-азаспиро[4.5]декан-8-ил)метанон; (3-(диметиламино)пирролидин-1-ил)(4-((8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)фенил)метанон; 8-метокси-N-(1-метил-1,2,3,4-тетрагидрохинолин-6-ил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 8-метокси-N-(3-(пентафторсульфанил)фенил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(4-фторфенил)-8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(3,4-дифторфенил)-8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 2,2,2-трифтор-N-(4-((8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)фенил)ацетамид; 3-((6-((8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)-2Н-бензо[b][1,4]оксазин-3-ил)амино)пропан-1-ол; N6-(8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)-N3-фенетил-2Н-бензо[b][1,4]оксазин-3,6-диамин; N-(3,5-дифторфенил)-8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(3-фтор-4-метилфенил)-8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 8-метокси-N-(3,4,5-трифторфенил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 8-метокси-N-(4-нитрофенил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 8-метокси-N-(3-метокси-4-морфолинофенил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 8-метокси-N-(3-(метилсульфонил)фенил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 1,1,1,3,3,3-гексафтор-2-(4-((8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)фенил)пропан-2-ол; 4-((8-фтор-3Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)фенил)(пирролидин-1-ил)метанон; 1-(4-(4-((8-фтор-3Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)фенил)пиперазин-1-ил)этан-1-он; 6-((8-фтор-3Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)-2Н-бензо[b][1,4]оксазин-3(4Н)-он; 8-фтор-N-(4-морфолинофенил)-3Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 8-фтор-N-(4-(4-метилпиперазин-1-ил)фенил)-3Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин;

N-(3,4-диметоксифенил)-8-фтор-3H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(4-  
 (дифторметокси)-3-метоксифенил)-8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-  
 амин; N-(3-фтор-4-(трифторметил)фенил)-8-метокси-2H-пиразоло[3,4-  
 с]хинолин-4-амин; N-(3-фтор-4-(трифторметокси)фенил)-8-метокси-2H-  
 5 пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(2,3-диметоксифенил)-8-метокси-2H-  
 пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(2,4-диметоксифенил)-8-метокси-2H-  
 пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 8-йод-N-(4-(4-метилпиперазин-1-ил)фенил)-3H-  
 пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 6-((7-фтор-3H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-  
 ил)амино)-2H-бензо[b][1,4]оксазин-3(4H)-он; 7-фтор-N-(4-морфолинофенил)-3H-  
 10 пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(3,4-диметоксифенил)-7-фтор-3H-  
 пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 7-фтор-N-(4-(4-метилпиперазин-1-ил)фенил)-  
 3H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 9-метокси-N-(3-(метилсульфонил)фенил)-  
 3H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 7-((9-метокси-3H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-  
 ил)амино)-3,4-дигидрохинолин-2(1H)-он; 1-(4-(4-((9-метокси-3H-пиразоло[3,4-  
 с]хинолин-4-ил)амино)фенил)пиперазин-1-ил)этан-1-он; N-(3,5-  
 15 диметоксифенил)-8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; (4-((7-фтор-3H-  
 пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)фенил)(пирролидин-1-ил)метанон; 4-((8-  
 метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)-N,N-  
 диметилбензолсульфонамид; N-циклопропил-3-((8-метокси-2H-пиразоло[3,4-  
 с]хинолин-4-ил)амино)бензолсульфонамид; N-(4-(2H-1,2,3-триазол-2-ил)фенил)-  
 8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 8-метокси-N-(3-  
 (метилсульфинил)фенил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(3-(2H-1,2,3-  
 триазол-2-ил)фенил)-8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 3-((8-  
 метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)-N-метилбензолсульфонамид;  
 25 8-метокси-N-(3-(морфолиносульфонил)фенил)-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-  
 амин; 8-метокси-N-(3-((трифторметил)сульфонил)фенил)-2H-пиразоло[3,4-  
 с]хинолин-4-амин; 2-((3-((8-метокси-2H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-  
 ил)амино)фенил)сульфонил)этан-1-ол; 9-метокси-N-(2-метилизоиндолин-5-ил)-  
 3H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(4-((диметиламино)метил)фенил)-9-  
 30 метокси-3H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(3,4-диметоксифенил)-8-йод-3H-  
 пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 8-йод-N-(4-морфолинофенил)-3H-пиразоло[3,4-  
 с]хинолин-4-амин; (4-((8-йод-3H-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-  
 ил)амино)фенил)(пирролидин-1-ил)метанон; 1-(4-(4-((8-йод-3H-пиразоло[3,4-  
 с]хинолин-4-ил)амино)фенил)пиперазин-1-ил)этан-1-он; 4-фтор-N-(4-((8-

метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-ил)амино)фенил)бензамид; 8-метокси-N-(4-морфолино-3-нитрофенил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(2,4-дифторфенил)-8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; N-(3,4-диметоксифенил)-9-фтор-3Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 9-фтор-N-(3-(метилсульфонил)фенил)-3Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 9-фтор-N-(4-(4-(4-метилпиперазин-1-ил)пиперидин-1-ил)фенил)-3Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин; 9-фтор-N-(3-фтор-4-морфолинофенил)-3Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-4-амин.

13. Фармацевтическая композиция, содержащая соединение по любому из предыдущих пунктов или его фармацевтически приемлемый сложный эфир, пролекарство, гидрат, сольват или соль, необязательно в комбинации с фармацевтически приемлемым носителем.

14. Применение соединения или фармацевтической композиции по любому из предыдущих пунктов для приготовления лекарственного средства для лечения заболеваний и нарушений дыхательных путей/обструктивных заболеваний и нарушений дыхательных путей, системных анафилактических реакций или реакций гиперчувствительности, лекарственных аллергий, заболеваний и нарушений костей и суставов, заболеваний и нарушений кожи и глаз, заболеваний и нарушений желудочно-кишечного тракта и абдоминальных заболеваний и нарушений, нарушений со стороны кроветворной системы, нарушений обмена веществ, нарушений функции мозжечка, расстройств обмена веществ в тканях головного мозга, состояний, связанных с отторжением трансплантата, состояний, связанных с мочеполовой системой, заболеваний и нарушений ЦНС, подобных болезни Паркинсона, воспалительных или иммунологических заболеваний или нарушений, сердечно-сосудистых заболеваний и нарушений, онкологических заболеваний и нарушений.

15. Соединение или фармацевтическая композиция по любому из пунктов 1 - 13 для применения для лечения заболеваний и нарушений дыхательных путей/обструктивных заболеваний и нарушений дыхательных путей, системных анафилактических реакций или реакций гиперчувствительности, лекарственных аллергий, заболеваний и нарушений костей и суставов, заболеваний и нарушений кожи и глаз, заболеваний и

нарушений желудочно-кишечного тракта и абдоминальных заболеваний и нарушений, нарушений со стороны кровеносной системы, нарушений обмена веществ, нарушений функции мозжечка, расстройств обмена веществ в тканях головного мозга, состояний, связанных с отторжением трансплантата, состояний, связанных с мочеполовой системой, заболеваний и нарушений ЦНС, подобных болезни Паркинсона, воспалительных или иммунологических заболеваний или нарушений, сердечно-сосудистых заболеваний и нарушений, онкологических заболеваний и нарушений.

10           16.       Способ лечения заболевания, опосредованного активностью киназы, включающий введение пациенту, нуждающемуся в этом, терапевтически эффективного количества соединения по любому из пунктов 1 - 12 или фармацевтической композиции по пункту 13.

15           17.       Способ по пункту 16, где киназу выбирают из SYK (селезеночная тирозинкиназа), LRRK2 (богатая лейцином повторная киназа 2) и/или киназы легких цепей миозина (MYLK или MLCK) или их мутантов.

18.       Способ по пункту 17, где указанное лечение является системным.

20           19.       Способ по пункту 18, где указанное введение является местным.

20           20.       Способ по пункту 17, где указанное заболевание выбирают из группы, состоящей из воспалительного заболевания, аутоиммунного заболевания, аллергического нарушения, и глазного нарушения.

21.       Способ по пункту 17, где заболевание выбирают из группы, состоящей из зуда, экземы, астмы, ринита, сухости глаз, воспаления глаз, аллергического конъюнктивита, весеннего конъюнктивита, весеннего кератоконъюнктивита, гигантского папиллярного конъюнктивита, кератита, вызванного грибковой инфекцией, и увеита.

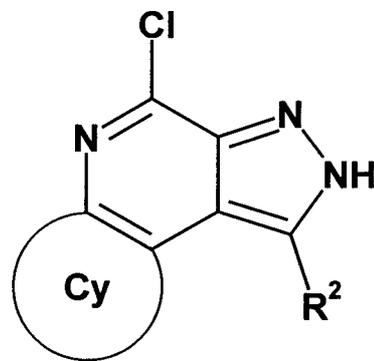
22.       Способ по пункту 19, где указанное местное введение осуществляют на кожу.

23. Способ по пункту 19, где указанное местное введение осуществляют в глаза.

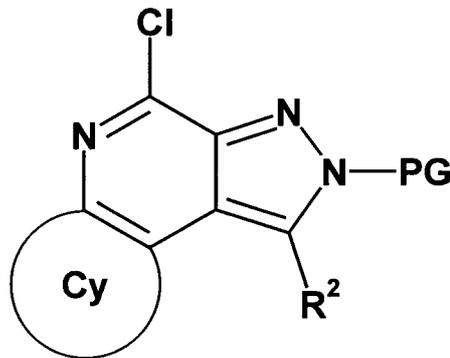
5 24. Способ по пункту 19, где указанное местное введение осуществляют интраназально или путем ингаляции.

25. Соединение формул (II), (IIIa) или (IIIb), где  $R^2$  и Cy определяют, как в любом из предыдущих пунктов, и PG означает защитную группу:

10

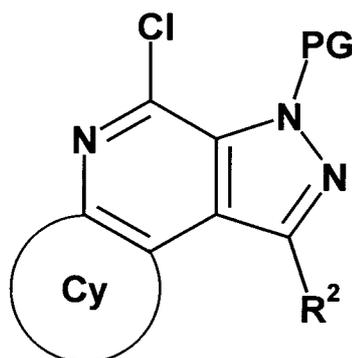


(II)



(IIIa)

15



(IIIb).

26. Соединение по пункту 25, где PG означает 4-метоксибензильную  
5 группу или карбоксибензильную группу.

27. Соединение по пункту 25, которое выбирают из следующих  
соединений:

4-хлор-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин; 4-хлор-8-метокси-2Н-пиразоло[3,4-  
10 с]хинолин; 8-бром-4-хлор-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин; 6-хлор-8Н-пиразоло[3,4-  
с][1,5]нафтиридин; 6-хлор-2-метокси-8Н-пиразоло[3,4-с][1,5]нафтиридин; 4-  
хлор-2Н-пиразоло[3,4-с][1,7]нафтиридин; 4-хлор-7,8-диэтокси-2Н-пиразоло[3,4-  
с]хинолин; 4-хлор-7,8-диметокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин; 4-хлор-6-метокси-  
2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин; 4-хлор-7-метокси-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин; 4-  
15 хлор-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-8-карбонитрил; 4-хлор-9-метокси-2Н-  
пиразоло[3,4-с]хинолин; 4-хлор-1-метил-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин; 4-хлор-1-  
(трифторметил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин; 4-хлор-1-нитро-2Н-пиразоло[3,4-  
с]хинолин; 5-хлор-1-метил-7Н-изотиазоло[5,4-б]пиразоло[4,3-д]пиридин; 4-  
хлор-1-метил-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-7-карбонитрил; 4-хлор-6,8-диметокси-  
20 2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин; метил 4-хлор-2Н-пиразоло[4,3-д]тиено[3,4-  
б]пиридин-6-карбоксилат; 4-хлор-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин-8-ол; 4-хлор-8-  
фтор-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин; 4-хлор-8-йод-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин; 4-  
хлор-7-фтор-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин; 4-хлор-9-фтор-2Н-пиразоло[3,4-  
с]хинолин; 4-хлор-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин; 4-хлор-8-  
25 метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин; 8-бром-4-хлор-2-(4-  
метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хинолин; 6-хлор-8-(4-метоксибензил)-8Н-  
пиразоло[3,4-с][1,5]нафтиридин; 6-хлор-2-метокси-8-(4-метоксибензил)-8Н-  
пиразоло[3,4-с][1,5]нафтиридин; 4-хлор-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-

с][1,7]нафтиридин; 4-хлор-7,8-диэтокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-  
с]хиолин; 4-хлор-7,8-диметокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-  
с]хиолин; 4-хлор-6-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин;  
4-хлор-7-метокси-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин; 4-хлор-2-(4-  
метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-8-карбонитрил; 4-хлор-9-метокси-2-  
5 (4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин; 4-хлор-2-(4-метоксибензил)-1-  
метил-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин; 4-хлор-2-(4-метоксибензил)-1-  
(трифторметил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин; 4-хлор-2-(4-метоксибензил)-1-  
нитро-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин; 5-хлор-7-(4-метоксибензил)-1-метил-7Н-  
10 изотиазоло[5,4-в]пиразоло[4,3-д]пиридин; 4-хлор-2-(4-метоксибензил)-1-метил-  
2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-7-карбонитрил; 4-хлор-6,8-диметокси-2-(4-  
метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин; метил 4-хлор-2-(4-метоксибензил)-  
2Н-пиразоло[4,3-д]тиено[3,4-в]пиридин-6-карбоксилат; 4-хлор-2-(4-  
метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин-8-ол; 4-хлор-8-фтор-2-(4-  
метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин; 4-хлор-8-йод-2-(4-метоксибензил)-  
15 2Н-пиразоло[3,4-с]хиолин; 4-хлор-7-фтор-2-(4-метоксибензил)-2Н-  
пиразоло[3,4-с]хиолин; 4-хлор-9-фтор-2-(4-метоксибензил)-2Н-пиразоло[3,4-  
с]хиолин.

