



УКРАЇНА

(19) UA (11) 95250 (13) C2

(51) МПК (2011.01)

C07D 213/76 (2006.01)

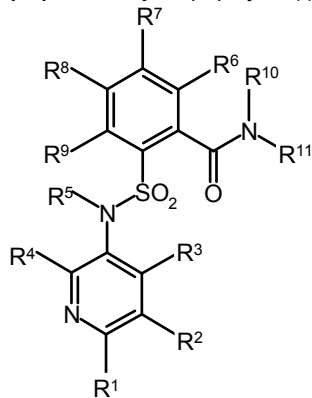
A61K 31/4406 (2006.01)

A61P 39/00

МІНІСТЕРСТВО ОСВІТИ
І НАУКИ УКРАЇНИДЕРЖАВНИЙ ДЕПАРТАМЕНТ
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІОПИС
ДО ПАТЕНТУ НА ВИНАХІД(54) ПІРИДИНАМІНОСУЛЬФОНІЛ-ЗАМІЩЕНІ БЕНЗАМІДИ ЯК ІНГІБІТОРИ ЦИТОХРОМ Р450 ЗА4
(СУР4503А4)

1

- (21) а200802207
(22) 11.09.2006
(24) 25.07.2011
(86) РСТ/ІВ2006/002639, 11.09.2006
(31) 60/720,151
(32) 23.09.2005
(33) US
(31) 60/723,115
(32) 03.10.2005
(33) US
(31) 60/725,469
(32) 11.10.2005
(33) US
(31) 60/762,256
(32) 25.01.2006
(33) US
(31) 60/821,664
(32) 07.08.2006
(33) US
(46) 25.07.2011, Бюл.№ 14, 2011 р.
(72) ПАТТЕРСОН БРАЙАН ДАГЛАС, US, САКАТА
СІЛЬВІ КІМ, US, НЕМБУ МІТЧЕЛ ДЕЙВІД, US,
ПЕЙТЕЛ ЛІНА БХАРАТ КУМАР, US, ТЕТЛОК
ДЖОН ГОВАРД, US
(73) ПФАЙЗЕР ПРОДАКТС ІНК., US
(56) US 2003166584 А; 04.09.2003
(57) 1. Сполука формули (I)



де:
R¹, R², R³, R⁴ є незалежно вибраними з наступно-
го: гідроген, C₁-C₆алкіл, (CR^{12a}R^{12b})_iгалоген,

2

(CR^{12a}R^{12b})_iCN, -(CR^{12a}R^{12b})_iOR^{12a}, -
(CR^{12a}R^{12b})_iN(R^{12a}R^{12b}), -(CR^{12a}R^{12b})_iCF₃ та -
(CR^{12a}R^{12b})_iC₆-C₁₀арил;
R⁵ - гідроген або C₁-C₆алкіл;
R⁶, R⁷, R⁸, та R⁹ є незалежно вибраними з наступ-
ного: гідроген, C₁-C₆алкіл, -(CR^{12a}R^{12b})_iгалоген, -
(CR^{12a}R^{12b})_iCN, -(CR^{12a}R^{12b})_iCF₃, -(CR^{12a}R^{12b})_iOR^{12a},
-(CR^{12a}R^{12b})_iN(R^{12a}R^{12b}), -(CR^{12a}R^{12b})_iR^{12a},
(CR^{12a}R^{12b})_iC₃-C₁₁циклоалкіл, -(CR^{12a}R^{12b})_iC₆-
C₁₀арил, -(CR^{12a}R^{12b})_iC₂-C₁₀гетероциклі, -
(CR^{12a}R^{12b})_iгетероарил, -O(CR^{12a}R^{12b})_iR^{12a}, -
O(CR^{12a}R^{12b})_iC₃-C₁₁циклоалкіл, -O(CR^{12a}R^{12b})_iC₆-
C₁₀арил, -O(CR^{12a}R^{12b})_iC₂-C₁₀гетероциклі, -
O(CR^{12a}R^{12b})_iгетероарил, -O(CR^{12a}R^{12b})_iOR^{12a} та -
O(CR^{12a}R^{12b})_iN(R^{12a}R^{12b}), де кожний з вказаних C₁-
C₆алкілу, C₃-C₁₁циклоалкілу, C₆-C₁₀арилу, C₂-
C₁₀гетероциклілу та гетероарилу, як варіант, є за-
міщеним одним або більше R¹⁴,
R¹⁰ та R¹¹ є незалежно вибраними з наступного:
гідроген, -(CR^{12a}R^{12b})_iC₁-C₆алкіл, -(CR^{12a}R^{12b})_iC₃-
C₁₁циклоалкіл, -(CR^{12a}R^{12b})_iC₆-C₁₀арил,
(CR^{12a}R^{12b})_iC₂-C₁₀гетероциклі та -
(CR^{12a}R^{12b})_iгетероарил, де кожний з вказаних C₁-
C₆алкілу, C₃-C₁₁циклоалкілу, C₆-C₁₀арилу, C₂-
C₁₀гетероциклілу та гетероарилу, як варіант, є за-
міщеним одним або більше R¹³, або
R¹⁰ та R¹¹, разом з атомом, до якого вони приєд-
нані, утворюють C₂-C₁₀гетероциклі, як варіант,
кожний R^{12a} та R^{12b} є незалежно вибраним з насту-
пного: гідроген та C₁-C₆ алкіл; або R^{12a} та R^{12b}, ра-
зом з атомом, до якого вони приєднані, утворюють
C₃-C₁₁циклоалкіл або C₂-C₁₀ гетероциклі;
кожний R¹³ є незалежно вибраним з наступного:
C₁-C₆алкіл, галоген, -(CR^{12a}R^{12b})_iCN, -
(CR^{12a}R^{12b})_iCF₃, -(CR^{12a}R^{12b})_iOCF₃, -(CR^{12a}R^{12b})_iC₃-
C₁₁циклоалкіл, -(CR^{12a}R^{12b})_iC₆-C₁₀арил, -
(CR^{12a}R^{12b})_iC₂-C₁₀гетероциклі, -
(CR^{12a}R^{12b})_iгетероарил, -O(CR^{12a}R^{12b})_iR^{12a}, -
O(CR^{12a}R^{12b})_iC₆-C₁₀арил, -O(CR^{12a}R^{12b})_iC₂-
C₁₀гетероциклі, -O(CR^{12a}R^{12b})_iгетероарил, -
(CR^{12a}R^{12b})_iCO₂(C₁-C₆алкіл),
(CR^{12a}R^{12b})_iN(R^{12a}R^{12b}), -(CR^{12a}R^{12b})_iC(O)NR^{12a}R^{12b}, -
(CR^{12a}R^{12b})_iOR^{12a}, -(CR^{12a}R^{12b})_iS(O)R^{12a} та -
(CR^{12a}R^{12b})_iS(O)₂R^{12a}, де кожний з вказаних C₁-

(13) C2

(11) 95250

(19) UA

C₆алкілу, C₃-C₁₁циклоалкілу, C₆-C₁₀арилу, C₂-C₁₀гетероциклілу та гетероарилу, як варіант, є заміщеним одним або більше R¹⁴;

кожний R¹⁴ є незалежно вибраним з наступного: C₁-C₆алкіл, галоген, -CN, -CF₃ та -OR^{12a}, та кожний t є незалежно вибраним з наступного: 0, 1, 2, 3, 4, 5 та 6;

або її сіль або сольват.

2. Сполука за п. 1, де:

R¹, R², R³, R⁴ є незалежно вибраними з наступного: гідроген, C₁-C₆алкіл, -(CR^{12a}R^{12b})_iгалоген, -(CR^{12a}R^{12b})_iCN, -(CR^{12a}R^{12b})_iOR^{12a}, -(CR^{12a}R^{12b})_iN(R^{12a}R^{12b}) та -(CR^{12a}R^{12b})_iCF₃; та R¹⁰ та R¹¹ є незалежно вибраними з наступного:

гідроген, -(CR^{12a}R^{12b})_iC₁-C₆алкіл, -(CR^{12a}R^{12b})_iC₃-C₁₁циклоалкіл, -(CR^{12a}R^{12b})_iC₆-C₁₀арил, -(CR^{12a}R^{12b})_iC₂-C₁₀гетероциклі та

-(CR^{12a}R^{12b})_iгетероарил, де кожний з вказаних C₁-C₆алкілу, C₃-C₁₁циклоалкілу, C₆-C₁₀арилу, C₂-C₁₀гетероциклілу та гетероарилу, як варіант, є заміщеним одним або більше R¹³;

або її фармацевтично прийнятна сіль або сольват.

3. Сполука за п. 2, де:

R¹, R², R³, R⁴ є незалежно вибраними з наступного: гідроген, C₁-C₆алкіл, галоген, -CN, -OR^{12a} та -CF₃; а R⁵ - гідроген;

або її фармацевтично прийнятна сіль або сольват.

4. Сполука за п. 3, де:

R¹⁰ - гідроген або C₁-C₆алкіл; а R¹¹ вибрано з групи: -(CR^{12a}R^{12b})_iC₁-C₆алкіл, -(CR^{12a}R^{12b})_iC₃-C₁₁циклоалкіл, -(CR^{12a}R^{12b})_iC₆-C₁₀арил, -(CR^{12a}R^{12b})_iC₂-C₁₀гетероциклі та -(CR^{12a}R^{12b})_iгетероарил, де кожний з вказаних C₁-C₆алкілу, C₃-C₁₁циклоалкілу, C₆-C₁₀арилу, C₂-C₁₀гетероциклілу та гетероарилу, як варіант, є заміщеним одним або більше R¹³;

або її фармацевтично прийнятна сіль або сольват.

5. Сполука за п. 4, де R⁶, R⁷, R⁸ та R⁹ - гідроген, або її фармацевтично прийнятна сіль або сольват.

6. Сполука за п. 5, де:

R¹¹ - -(CH₂)C₆-C₁₀арил або -(CH₂)₂C₆-C₁₀арил, де вказаний C₆-C₁₀арил, як варіант, є заміщеним одним або більше R¹³;

R^{12a} - гідроген або C₁-C₆алкіл; та

кожний R¹³ є незалежно вибраним з наступного: C₁-C₆алкіл, галоген, -CN, -CF₃ та -OCF₃;

або її фармацевтично прийнятна сіль або сольват.

7. Сполука за п. 6, де:

R¹, R² та R⁴ - гідроген;

R³ - C₁-C₆алкіл, -Cl, -F, -CN, -OCH₃, -OCH₂CH₃ або -CF₃; або R¹⁰ - гідроген або -CH₃; а

кожний R¹³ є незалежно вибраним з наступного: C₁-C₆алкіл, -Cl, -F, -CN, -CF₃ та -OCF₃;

або її фармацевтично прийнятна сіль або сольват.

8. Сполука за п. 1, де:

R¹, R² та R⁴ - гідроген;

R³ - -CH₃, -OCH₃ або -OCH₂CH₃;

R⁵ - гідроген;

R⁶, R⁷, R⁸ та R⁹ - гідроген;

R¹⁰ - гідроген або -CH₃;

R¹¹ - -(CH₂)C₆-C₁₀арил або -(CH₂)₂C₆-C₁₀арил, де вказаний C₆-C₁₀арил, як варіант, є заміщеним одним або більше R¹³; а

кожний R¹³ є незалежно вибраним з наступного: C₁-C₆алкіл, -Cl, -F, -CN, -CF₃ та -OCF₃;

або її фармацевтично прийнятна сіль або сольват.

9. Сполука за п. 1, де:

R¹, R² та R⁴ - гідроген;

R³ - -OCH₃ або -OCH₂CH₃;

R⁵ - гідроген;

R⁶, R⁷, R⁸ та R⁹ - гідроген;

R¹⁰ - гідроген або -CH₃; а

R¹¹ - -(CH₂)C₆-C₁₀арил або -(CH₂)₂C₆-C₁₀арил, де вказаний C₆-C₁₀арил, як варіант, є заміщеним одним або більше замісниками, незалежно вибраними з наступного: -Cl та -F;

або її фармацевтично прийнятна сіль або сольват.

10. Сполука за п. 1 вибрана з групи:

N-(3,4-дифлуорбензил)-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід;

N-[2-(2-метилфеніл)етил]-2-[[5-метилпіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід;

N-(3,4-дихлорбензил)-2-[[5-метилпіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід;

N-[4-флуор-3-(трифлуорметил)бензил]-2-[[5-метилпіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід;

N-[4-флуор-3-(трифлуорметил)бензил]-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід;

2-[[5-етоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]N-[2-(2-метилфеніл)етил]бензамід;

N-(3,4-дихлорбензил)-2-[[5-етоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід;

N-(3,4-дифлуорбензил)-2-[[5-етоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-метилбензамід;

2-[[4-етоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-[4-флуор-3-(трифлуорметил)бензил]бензамід;

2-[[5-етоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-[4-флуор-3-(трифлуорметил)бензил]бензамід;

N-(3,4-дифлуорбензил)-2-[[4-етоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-метилбензамід;

N-(4-хлор-2-метилбензил)-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід;

N-(3-хлор-2-метилбензил)-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід;

N-(3,5-дихлорбензил)-2-[[5-метилпіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід та

N-(3,4-дифлуорбензил)-2-[[4-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-метилбензамід;

або її фармацевтично прийнятна сіль або сольват.

11. Сполука за п. 1, вибрана з групи:

N-(3,4-дифлуорбензил)-2-[[4-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-метилбензамід;

N-(3,4-дифлуорбензил)-2-[[4-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід;

N-[2-(2-флуорфеніл)етил]-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід;

N-[4-флуор-3-(трифлуорметил)бензил]-2-[[4-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід; N-

(3,4-дифлуорбензил)-2-[[4-етоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід та

N-(3,4-дифлуорбензил)-2-[[4-етоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-метилбензамід;

або її фармацевтично прийнятна сіль або сольват.

12. Фармацевтична композиція, що містить ефективну кількість принаймні одної сполуки за будь-яким з пп. 1-11 та фармацевтично прийнятний носій.

13. Фармацевтична композиція за п. 12, що додатково містить інгібітор ВІЛ-протеази, вибраний з наступного: ампренавір, нелфінавір, ритонавір, саквінавір, інвіраз, лопінавір, атазанавір, палінавір, індинавір, типранавір, дарунавір, бреканавір, (4R)-N-аліл-3-((2S,3S)-2-гідрокси-3-((3-гідрокси-2-метилбензоїл)аміно)-4-фенілбутаноїл)-5,5-диметил-1,3-тіазолідин-4-карбоксамід та фозампренавір кальцію.

14. Застосування першої сполуки та другої сполуки у виготовленні медикаменту для лікування інфекції ВІЛ у ВІЛ-інфікованого ссавця, де вказану першу сполуку вибрано зі сполук за будь-яким з пп. 1-11, а вказаною другою сполукою є анти-ВІЛ сполука.

15. Застосування за п. 14, де вказаною другою сполукою є

(N-((1S)-3-[3-ізопропіл-5-метил-4H-1,2,4-триазол-4-іл]-екзо-8-азабіцикло[3.2.1]окт-8-ил)-1-фенілпропіл)-4,4-дифлуорциклогексанкарбоксамід, етил 1-ендо-{8-[(3S)-3-(ацетиламіно)-3-(3-флуорфеніл)пропіл]-8-азабіцикло[3.2.1]окт-3-ил}-2-метил-4,5,6,7-тетрагідро-1H-імідазо[4,5-с]піридин-5-карбоксилат або N-((1S)-3-[3-ендо-(5-ізобутирил-2-метил-4,5,6,7-тетрагідро-1H-імідазо[4,5-с]піридин-1-іл)-8-азабіцикло[3.2.1]окт-8-ил)-1-(3-флуорфеніл)пропіл]ацетамід.

16. Застосування за п. 14, де вказану другу сполуку вибрано з групи: ампренавір, CGP-73547, CGP-

61755, DMP-450, нелфінавір, ритонавір, саквінавір, інвіраз, лопінавір, TMC-126, атазанавір, палінавір, GS-3333, KN 1-413, KNI-272, LG-71350, CGP-61755, PD 173606, PD 177298, PD 178390, PD 178392, U-140690, ABT-378, DMP-450, AG-1776, MK-944, VX-478, індинавір, типранавір, дарунавір, бреканавір, DPC-681, DPC-684, (4R)-N-аліл-3-((2S,3S)-2-гідрокси-3-((3-гідрокси-2-метилбензоїл)аміно)-4-фенілбутаноїл)-5,5-диметил-1,3-тіазолідин-4-карбоксамід та фозампренавір кальцію.

17. Застосування першої сполуки та другої сполуки у виготовленні медикаменту для поліпшення фармакокінетики у ссавця, де вказаною першою сполукою є анти-ВІЛ сполука та вказану другу сполуку вибрано зі сполук за будь-яким з пп. 1-11.

18. Застосування за п. 17, де вказаною анти-ВІЛ сполукою є ампренавір, CGP-73547, CGP-61755, DMP-450, нелфінавір, ритонавір, саквінавір, інвіраз, лопінавір, TMC-126, атазанавір, палінавір, GS-3333, KN 1-413, KNI-272, LG-71350, CGP-61755, PD 173606, PD 177298, PD 178390, PD 178392, U-140690, ABT-378, DMP-450, AG-1776, MK-944, VX-478, індинавір, типранавір, дарунавір, бреканавір, DPC-681, DPC-684, (4R)-N-аліл-3-((2S,3S)-2-гідрокси-3-((3-гідрокси-2-метилбензоїл)аміно)-4-фенілбутаноїл)-5,5-диметил-1,3-тіазолідин-4-карбоксамід та фозампренавір кальцію.

19. Сполука за будь-яким з пп. 1-11 для лікування інфекції ВІЛ у ВІЛ-інфікованого ссавця.

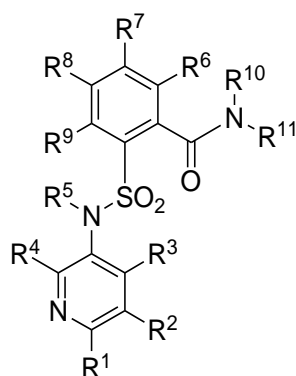
В даній заявці заявляється пріоритет відповідно до 35 U.S.C. § 119(e) заявки на патент США №60/720,151, поданої 23 вересня 2005р., №60/723,115, поданої 3 жовтня 2005р., №60/725,469, поданої 11 жовтня 2005р., №60/762,256, поданої 25 січня 2006р., та №60/821,664, поданої 7 серпня 2006р., всі ці заявки повністю включені в даний опис як посилання.

Ферментна система цитохрому P450 (CYP450) відповідає за біотрансформацію лікарських засобів із активних в неактивні метаболіти, які легко виводяться з організму. Крім того, швидкий метаболізм певних лікарських засобів ферментною системою CYP450 може суттєво змінювати їх фармакокінетичний (PK) профіль та в динаміці може приводити до субтерапевтичних концентрацій цих лікарських засобів в плазмі крові. При лікуванні інфекцій, такому як лікування вірусних інфекцій, таких як інфікування вірусом імунодефіциту людини (ВІЛ), такі субтерапевтичні концентрації лікарських засобів в плазмі можуть приводити до підвищення резистентності вірусу.

Ритонавір (RTV) є комерційно доступним інгібітором протеази (PI) ВІЛ, який, завдяки його здатності інгібувати фермент цитохром P450 3A4, та-

кож застосовується для "стимулювання" фармакокінетичного впливу для багатьох протиретровірусних лікарських засобів, які вводять сумісно. Однак застосування RTV супроводжується клінічно значимими шлунково-кишковими та метаболічними побічними діями, включаючи нудоту, блювоту, рею та дисліпідемію. Введення сполуки з потенційною протівірусною активністю в низьких дозах також може сприяти відбору штамів, резистентних до ВІЛ. Новий інгібітор CYP3A4, який здатний посилювати дію протівірусних засобів так ефективно, як і RTV, але без протівірусної активності та значних побічних дій, буде мати суттєві переваги та терапевтичну цінність при лікуванні пацієнтів, які страждають від інфікування вірусом ВІЛ. В даному винаході розкриті сполуки, які корисні для інгібування ферментної системи CYP450 та можуть застосовуватися для стимулювання фармакокінетичного впливу, який виявляють лікарські засоби при їх спільному введенні, включаючи протиретровірусні лікарські засоби. Також описані фармацевтичні препарати, які містять такі сполуки, способи їх одержання та способи їм використання.

В одному варіанті здійснення винаходу забезпечуються сполуки формули (I),



(I)

де:

R^1, R^2, R^3, R^4 незалежно вибирають із водню, C_1-C_6 алкілу, $-(CR^{12a}R^{12b})_i$ гало, $-(CR^{12a}R^{12b})_iCN$, $-(CR^{12a}R^{12b})_iOR^{12a}$, $-(CR^{12a}R^{12b})_iN(R^{12a}R^{12b})$, $-(CR^{12a}R^{12b})_iCF_3$, та $-(CR^{12a}R^{12b})_iC_6-C_{10}$ арилу;

R^5 представляє собою водень або C_1-C_6 алкіл;

R^6, R^7, R^8 , та R^9 незалежно вибирають із водню, C_1-C_6 алкілу, $-(CR^{12a}R^{12b})_i$ гало, $-(CR^{12a}R^{12b})_iCN$, $-(CR^{12a}R^{12b})_iCF_3$, $-(CR^{12a}R^{12b})_iOR^{12a}$, $-(CR^{12a}R^{12b})_iN(R^{12a}R^{12b})$, $-(CR^{12a}R^{12b})_iC_3-C_{11}$ циклоалкілу, $-(CR^{12a}R^{12b})_iC_6-C_{10}$ арилу, $-(CR^{12a}R^{12b})_iC_2-C_{10}$ гетероциклілу, $-(CR^{12a}R^{12b})_i$ гетероарилу, $-O(CR^{12a}R^{12b})_iR^{12a}$, $-O(CR^{12a}R^{12b})_iC_3-C_{11}$ циклоалкілу, $-O(CR^{12a}R^{12b})_iC_6-C_{10}$ арилу, $-O(CR^{12a}R^{12b})_iC_2-C_{10}$ гетероциклілу, $-O(CR^{12a}R^{12b})_i$ гетероарилу, $-O(CR^{12a}R^{12b})_iOR^{12a}$, та $-O(CR^{12a}R^{12b})_iN(R^{12a}R^{12b})$, де кожен із вказаних C_1-C_6 алкілу, C_3-C_{11} циклоалкілу, C_6-C_{10} арилу, C_2-C_{10} гетероциклілу, та гетероарилу необов'язково заміщений одним або декількома R^{14} ;

R^{10} та R^{11} незалежно вибирають із водню, $-(CR^{12a}R^{12b})_iC_1-C_6$ алкілу, $-(CR^{12a}R^{12b})_iC_3-C_{11}$ циклоалкілу, $-(CR^{12a}R^{12b})_iC_6-C_{10}$ арилу, $-(CR^{12a}R^{12b})_iC_2-C_{10}$ гетероциклілу, та $-(CR^{12a}R^{12b})_i$ гетероарилу, де кожен із вказаних C_1-C_6 алкілу, C_3-C_{11} циклоалкілу, C_6-C_{10} арилу, C_2-C_{10} гетероциклілу, та гетероарильні групи необов'язково заміщені одним або декількома R^{13} , або

R^{10} та R^{11} , разом із атомом, до якого вони приєднані, утворюють C_2-C_{10} гетероциклічну групу, необов'язково заміщену одним або декількома R^{13} ,

кожен R^{12a} та R^{12b} незалежно вибирають із водню та C_1-C_6 алкілу; або

R^{12a} та R^{12b} , разом із атомом, до якого вони приєднані, утворюють C_3-C_{11} циклоалкілну або C_2-C_{10} гетероциклілну групу;

кожен R^{13} незалежно вибирають із C_1-C_6 алкілу, галогену, $-(CR^{12a}R^{12b})_iCN$, $-(CR^{12a}R^{12b})_iCF_3$, $-(CR^{12a}R^{12b})_iOCF_3$, $-(CR^{12a}R^{12b})_iC_3-C_{11}$ циклоалкілу, $-(CR^{12a}R^{12b})_iC_6-C_{10}$ арилу, $-(CR^{12a}R^{12b})_iC_2-C_{10}$ гетероциклілу, $-(CR^{12a}R^{12b})_i$ гетероарилу, $-O(CR^{12a}R^{12b})_iR^{12a}$, $-O(CR^{12a}R^{12b})_iC_6-C_{10}$ арилу, $-O(CR^{12a}R^{12b})_iC_2-C_{10}$ гетероциклілу, $-O(CR^{12a}R^{12b})_i$ гетероарилу, $-(CR^{12a}R^{12b})_iCO_2(C_1-C_6)$ алкілу, $-(CR^{12a}R^{12b})_iN(R^{12a}R^{12b})$, $-(CR^{12a}R^{12b})_iC(O)NR^{12a}R^{12b}$, $-(CR^{12a}R^{12b})_iOR^{12a}$, $-(CR^{12a}R^{12b})_iS(O)R^{12a}$, та $-(CR^{12a}R^{12b})_iS(O)_2R^{12a}$, де кожен із вказаних C_1-C_6 алкілу, C_3-C_{11} циклоалкілу, C_6-C_{10} арилу, C_2-C_{10} гетероциклілу, та гетероарильні групи необов'язково заміщені одним або декількома R^{14} ;

лькома R^{14} ;

кожен R^{14} незалежно вибирають із C_1-C_6 алкілу, галогену, $-CN$, $-CF_3$, та $-OR^{12a}$; та

кожен t незалежно вибирають із 0, 1, 2, 3, 4, 5, та 6; або

її фармацевтично прийнятна сіль або сольват.

В іншому варіанті здійснення винаходу забезпечуються сполуки формули (I), де:

R^1, R^2, R^3, R^4 незалежно вибирають із водню, C_1-C_6 алкілу, $-(CR^{12a}R^{12b})_i$ гало, $-(CR^{12a}R^{12b})_iCN$, $-(CR^{12a}R^{12b})_iOR^{12a}$, $-(CR^{12a}R^{12b})_iN(R^{12a}R^{12b})$, та $-(CR^{12a}R^{12b})_iCF_3$;

R^5 представляє собою водень або C_1-C_6 алкіл;

R^6, R^7, R^8 , та R^9 незалежно вибирають із водню, C_1-C_6 алкілу, $-(CR^{12a}R^{12b})_i$ гало, $-(CR^{12a}R^{12b})_iCN$, $-(CR^{12a}R^{12b})_iCF_3$, $-(CR^{12a}R^{12b})_iOR^{12a}$, $-(CR^{12a}R^{12b})_iN(R^{12a}R^{12b})$, $-(CR^{12a}R^{12b})_iC_3-C_{11}$ циклоалкілу, $-(CR^{12a}R^{12b})_iC_6-C_{10}$ арилу, $-(CR^{12a}R^{12b})_iC_2-C_{10}$ гетероциклілу, $-(CR^{12a}R^{12b})_i$ гетероарилу, $-O(CR^{12a}R^{12b})_iR^{12a}$, $-O(CR^{12a}R^{12b})_iC_3-C_{11}$ циклоалкілу, $-O(CR^{12a}R^{12b})_iC_6-C_{10}$ арилу, $-O(CR^{12a}R^{12b})_iC_2-C_{10}$ гетероциклілу, $-O(CR^{12a}R^{12b})_i$ гетероарилу, $-O(CR^{12a}R^{12b})_iOR^{12a}$, та $-O(CR^{12a}R^{12b})_iN(R^{12a}R^{12b})$, де кожен із вказаних C_1-C_6 алкілу, C_3-C_{11} циклоалкілу, C_6-C_{10} арилу, C_2-C_{10} гетероциклілу, та гетероарилу необов'язково заміщений одним або декількома R^{14} ;

R^{10} та R^{11} незалежно вибирають із водню, $-(CR^{12a}R^{12b})_iC_1-C_6$ алкілу, $-(CR^{12a}R^{12b})_iC_3-C_{11}$ циклоалкілу, $-(CR^{12a}R^{12b})_iC_6-C_{10}$ арилу, $-(CR^{12a}R^{12b})_iC_2-C_{10}$ гетероциклілу, та $-(CR^{12a}R^{12b})_i$ гетероарилу, де кожен із вказаних C_1-C_6 алкілу, C_3-C_{11} циклоалкілу, C_6-C_{10} арилу, C_2-C_{10} гетероциклілу, та гетероарильні групи необов'язково заміщені одним або декількома R^{13} ;

кожен R^{12a} та R^{12b} незалежно вибирають із водню та C_1-C_6 алкілу; або

R^{12a} та R^{12b} , разом із атомом, до якого вони приєднані, утворюють C_3-C_{11} циклоалкілну або C_2-C_{10} гетероциклілну групу;

кожен R^{13} незалежно вибирають із C_1-C_6 алкілу, галогену, $-(CR^{12a}R^{12b})_iCN$, $-(CR^{12a}R^{12b})_iCF_3$, $-(CR^{12a}R^{12b})_iOCF_3$, $-(CR^{12a}R^{12b})_iC_3-C_{11}$ циклоалкілу, $-(CR^{12a}R^{12b})_iC_6-C_{10}$ арилу, $-(CR^{12a}R^{12b})_iC_2-C_{10}$ гетероциклілу, $-(CR^{12a}R^{12b})_i$ гетероарилу, $-O(CR^{12a}R^{12b})_iR^{12a}$, $-O(CR^{12a}R^{12b})_iC_6-C_{10}$ арилу, $-O(CR^{12a}R^{12b})_iC_2-C_{10}$ гетероциклілу, $-O(CR^{12a}R^{12b})_i$ гетероарилу, $-(CR^{12a}R^{12b})_iCO_2(C_1-C_6)$ алкілу, $-(CR^{12a}R^{12b})_iN(R^{12a}R^{12b})$, $-(CR^{12a}R^{12b})_iC(O)NR^{12a}R^{12b}$, $-(CR^{12a}R^{12b})_iOR^{12a}$, $-(CR^{12a}R^{12b})_iS(O)R^{12a}$, та $-(CR^{12a}R^{12b})_iS(O)_2R^{12a}$, де кожен із вказаних C_1-C_6 алкілу, C_3-C_{11} циклоалкілу, C_6-C_{10} арилу, C_2-C_{10} гетероциклілу, та гетероарильні групи необов'язково заміщені одним або декількома R^{14} ;

кожен R^{14} незалежно вибирають із C_1-C_6 алкілу, галогену, $-CN$, $-CF_3$, та $-OR^{12a}$; та

кожен t незалежно вибирають із 0, 1, 2, 3, 4, 5, та 6; або

її фармацевтично прийнятна сіль або сольват.

В іншому варіанті здійснення винаходу забезпечуються сполуки формули (I), де:

R^1, R^2, R^3, R^4 незалежно вибирають із водню, C_1-C_6 алкілу, галогену, $-CN$, $-OR^{12a}$, та $-CF_3$;

R^5 представляє собою водень;

$$-\text{O}(\text{CR}^{12a}\text{R}^{12b})_t\text{гетероарилу}, \quad -(\text{CR}^{12a}\text{R}^{12b})_t\text{CO}_2(\text{C}_1\text{-C}_6$$

алкілу), $-(CR^{12a}R^{12b})_iN(R^{12a}R^{12b})$, $-(CR^{12a}R^{12b})_iC(O)NR^{12a}R^{12b}$, $-(CR^{12a}R^{12b})_iOR^{12a}$, $-(CR^{12a}R^{12b})_iS(O)R^{12a}$, та $-(CR^{12a}R^{12b})_iS(O)_2R^{12a}$, де кожен із вказаних C_1 - C_6 алкілу, C_3 - C_{11} циклоалкілу, C_6 - C_{10} арилу, C_2 - C_{10} гетероциклілу, та гетероарильні групи необов'язково заміщені одним або декількома R^{14} ;

кожен R^{14} незалежно вибирають із C_1 - C_6 алкілу, галогену, -CN, -CF₃, та -OR^{12a}; та

кожен t незалежно вибирають із 0, 1, 2, 3, 4, 5, та 6; або

її фармацевтично прийнятна сіль або сольват.

В іще іншому варіанті здійснення винаходу забезпечуються сполуки формули (I), де:

R^1 , R^2 , R^3 , R^4 незалежно вибирають із водню, C_1 - C_6 алкілу, галогену, -CN, -OR^{12a}, та -CF₃;

R^5 представляє собою водень;

R^6 , R^7 , R^8 , та R^9 представляють собою водень;

R^{10} представляє собою водень або C_1 - C_6 алкіл;

R^{11} представляє собою $-(CR^{12a}R^{12b})_iC_6-C_{10}$ арил, де вказаний C_6 - C_{10} арил необов'язково заміщений одним або декількома R^{13} ;

кожен R^{12a} та R^{12b} незалежно вибирають із водню та C_1 - C_6 алкілу; або

R^{12a} та R^{12b} , разом із атомом, до якого вони приєднані, утворюють C_3 - C_{11} циклоалкілну або C_2 - C_{10} гетероциклілну групу;

кожен R^{13} незалежно вибирають із C_1 - C_6 алкілу, галогену, $-(CR^{12a}R^{12b})_iCN$, $-(CR^{12a}R^{12b})_iCF_3$, $-(CR^{12a}R^{12b})_iOCF_3$, $-(CR^{12a}R^{12b})_iC_3-C_{11}$ циклоалкілу, $-(CR^{12a}R^{12b})_iC_6-C_{10}$ арилу, $-(CR^{12a}R^{12b})_iC_2-C_{10}$ гетероциклілу, $-(CR^{12a}R^{12b})_i$ гетероарили, $-O(CR^{12a}R^{12b})_iR^{12a}$, $-O(CR^{12a}R^{12b})_iC_6-C_{10}$ арилу, $-O(CR^{12a}R^{12b})_iC_2-C_{10}$ гетероциклілу, $-O(CR^{12a}R^{12b})_i$ гетероарили, $-(CR^{12a}R^{12b})_iCO_2(C_1-C_6)$ алкілу), $-(CR^{12a}R^{12b})_iN(R^{12a}R^{12b})$, $-(CR^{12a}R^{12b})_iC(O)NR^{12a}R^{12b}$, $-(CR^{12a}R^{12b})_iOR^{12a}$, $-(CR^{12a}R^{12b})_iS(O)R^{12a}$, та $-(CR^{12a}R^{12b})_iS(O)_2R^{12a}$, де кожен із вказаних C_1 - C_6 алкілу, C_3 - C_{11} циклоалкілу, C_6 - C_{10} арилу, C_2 - C_{10} гетероциклілу, та гетероарильні групи необов'язково заміщені одним або декількома R^{14} ;

кожен R^{14} незалежно вибирають із C_1 - C_6 алкілу, галогену, -CN, -CF₃, та -OR^{12a}; та

кожен t незалежно вибирають із 0, 1, 2, 3, 4, 5, та 6; або

її фармацевтично прийнятна сіль або сольват.

В іще іншому варіанті здійснення винаходу забезпечуються сполуки формули (I), де:

R^1 , R^2 , R^3 , R^4 незалежно вибирають із водню, C_1 - C_6 алкілу, галогену, -CN, -OR^{12a}, та -CF₃;

R^5 представляє собою водень;

R^6 , R^7 , R^8 , та R^9 представляють собою водень;

R^{10} представляє собою водень або C_1 - C_6 алкіл;

R^{11} представляє собою $-(CR^{12a}R^{12b})_iC_6-C_{10}$ арил або $-(CR^{12a}R^{12b})_iC_6-C_{10}$ арил, де вказаний C_6 - C_{10} арил необов'язково заміщений одним або декількома R^{13} ;

кожен R^{12a} та R^{12b} незалежно вибирають із водню та C_1 - C_6 алкілу; або

R^{12a} та R^{12b} , разом із атомом, до якого вони приєднані, утворюють C_3 - C_{11} циклоалкілну або C_2 - C_{10} гетероциклілну групу;

кожен R^{13} незалежно вибирають із C_1 - C_6 алкілу, галогену, $-(CR^{12a}R^{12b})_iCN$, $-(CR^{12a}R^{12b})_iCF_3$, $-(CR^{12a}R^{12b})_iOCF_3$, $-(CR^{12a}R^{12b})_iC_3-C_{11}$ циклоалкілу, $-(CR^{12a}R^{12b})_iC_6-C_{10}$ арилу, $-(CR^{12a}R^{12b})_iC_2-C_{10}$ гетероциклілу, $-(CR^{12a}R^{12b})_i$ гетероарили, $-O(CR^{12a}R^{12b})_iR^{12a}$, $-O(CR^{12a}R^{12b})_iC_6-C_{10}$ арилу, $-O(CR^{12a}R^{12b})_iC_2-C_{10}$ гетероциклілу, $-O(CR^{12a}R^{12b})_i$ гетероарили, $-(CR^{12a}R^{12b})_iCO_2(C_1-C_6)$ алкілу), $-(CR^{12a}R^{12b})_iN(R^{12a}R^{12b})$, $-(CR^{12a}R^{12b})_iC(O)NR^{12a}R^{12b}$, $-(CR^{12a}R^{12b})_iOR^{12a}$, $-(CR^{12a}R^{12b})_iS(O)R^{12a}$, та $-(CR^{12a}R^{12b})_iS(O)_2R^{12a}$, де кожен із вказаних C_1 - C_6 алкілу, C_3 - C_{11} циклоалкілу, C_6 - C_{10} арилу, C_2 - C_{10} гетероциклілу, та гетероарильні групи необов'язково заміщені одним або декількома R^{14} ;

кожен R^{14} незалежно вибирають із C_1 - C_6 алкілу, галогену, -CN, -CF₃, та -OR^{12a}; та

кожен t незалежно вибирають із 0, 1, 2, 3, 4, 5, та 6; або

її фармацевтично прийнятна сіль або сольват.

В іще іншому варіанті здійснення винаходу забезпечуються сполуки формули (I), де:

R^1 , R^2 , R^3 , R^4 незалежно вибирають із водню, C_1 - C_6 алкілу, галогену, -CN, -OR^{12a}, та -CF₃;

R^5 представляє собою водень;

R^6 , R^7 , R^8 , та R^9 представляють собою водень;

R^{10} представляє собою водень або C_1 - C_6 алкіл;

R^{11} представляє собою $-(CH_2)_6-C_{10}$ арил або $-(CH_2)_2C_6-C_{10}$ арил, де вказаний C_6 - C_{10} арил необов'язково заміщений одним або декількома R^{13} ;

R^{12a} представляє собою водень або C_1 - C_6 алкіл; та

кожен R^{13} незалежно вибирають із C_1 - C_6 алкілу, галогену, -CN, -CF₃, та -OCF₃; або

її фармацевтично прийнятна сіль або сольват.

В подальшому варіанті здійснення винаходу забезпечуються сполуки формули (I), де:

R^1 , R^3 , та R^4 представляють собою водень;

R^2 представляє собою C_1 - C_6 алкіл, галоген, -CN, -OR^{12a}, або -CF₃;

R^5 представляє собою водень;

R^6 , R^7 , R^8 , та R^9 представляють собою водень;

R^{10} представляє собою водень або C_1 - C_6 алкіл;

R^{11} представляє собою $-(CH_2)_6-C_{10}$ арил або $-(CH_2)_2C_6-C_{10}$ арил, де вказаний C_6 - C_{10} арил необов'язково заміщений одним або декількома R^{13} ;

R^{12a} представляє собою водень або C_1 - C_6 алкіл; та

кожен R^{13} незалежно вибирають із C_1 - C_6 алкілу, галогену, -CN, -CF₃, та -OCF₃; або

її фармацевтично прийнятна сіль або сольват.

В іншому варіанті здійснення винаходу забезпечуються сполуки формули (I), де:

R^1 , R^3 , та R^4 представляють собою водень;

R^2 представляє собою C_1 - C_6 алкіл, -Cl, -F, -CN, -OCH₃, -OCH₂CH₃, або -CF₃;

R^5 представляє собою водень;

R^6 , R^7 , R^8 , та R^9 представляють собою водень;

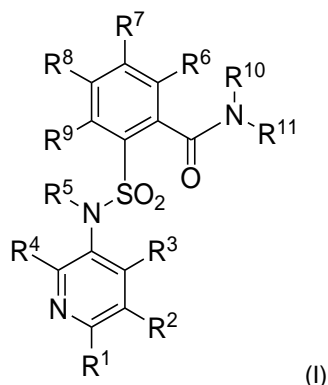
R^{10} представляє собою водень або -CH₃;

R^{11} представляє собою $-(CH_2)_6-C_{10}$ арил або $-(CH_2)_2C_6-C_{10}$ арил, де вказаний C_6 - C_{10} арил необов'язково заміщений одним або декількома R^{13} ; та

R¹⁴.

її фармацевтично прийнятна сіль або сольват.

В іншому варіанті здійснення винаходу забез-



(I)

в якій:

R^1, R^2, R^3, R^4 незалежно вибирають із водню, C_1-C_6 алкілу, $-(CR^{12a}R^{12b})_t$ гало, $-(CR^{12a}R^{12b})_tCN$, $-(CR^{12a}R^{12b})_tOR^{12a}$, та $-(CR^{12a}R^{12b})_tN(R^{12a}R^{12b})$;

R^5 представляє собою водень або C_1-C_6 алкіл; R^6, R^7, R^8 , та R^9 незалежно вибирають із водню, C_1-C_6 алкілу, $-(CR^{12a}R^{12b})_t$ гало, $-(CR^{12a}R^{12b})_tCN$, $-(CR^{12a}R^{12b})_tOR^{12a}$, та $-(CR^{12a}R^{12b})_tN(R^{12a}R^{12b})$;

R^{10} та R^{11} незалежно вибирають із водню, $-(CR^{12a}R^{12b})_t$, C_1-C_6 алкілу, $-(CR^{12a}R^{12b})_tC_3-C_{11}$ циклоалкілу, $-(CR^{12a}R^{12b})_tC_6-C_{10}$ арилу, $-(CR^{12a}R^{12b})_tC_2-C_{10}$ гетероциклілу, та $-(CR^{12a}R^{12b})_t$ гетероарилу, де кожен із вказаних C_1-C_6 алкілу, C_3-C_{11} циклоалкілу, C_6-C_{10} арилу, C_2-C_{10} гетероциклілу, та гетероарильні групи необов'язково заміщені принаймні одним R^{13} ; або

R^{10} та R^{11} , разом із атомом, до якого вони приєднані, утворюють C_2-C_{10} гетероциклічну групу, необов'язково заміщену принаймні одним R^{13} ;

кожен R^{12a} та R^{12b} незалежно вибирають із водню та C_1-C_6 алкілу; або

R^{12a} та R^{12b} , разом із атомом, до якого вони приєднані, утворюють C_3-C_{11} циклоалкілну групу;

кожен R^{13} незалежно вибирають із C_1-C_6 алкілу, галогену, $-O(CR^{12a}R^{12b})_tR^{12a}$, $-O(CR^{12a}R^{12b})_tC_6-C_{10}$ арилу, $-O(CR^{12a}R^{12b})_tC_2-C_{10}$ гетероциклілу, $-O(CR^{12a}R^{12b})_t$ гетероарилу, $-CO_2(C_1-C_6)$ алкілу, $-(CR^{12a}R^{12b})_tN(R^{12a}R^{12b})$, $-(C(O)NR^{12a}R^{12b})$, та $-(CR^{12a}R^{12b})_tOR^{12a}$, де кожен із вказаних C_1-C_6 алкілу, C_6-C_{10} арилу, C_2-C_{10} гетероциклілу, та гетероарильні групи необов'язково заміщені принаймні одним R^{14} ;

кожен R^{14} незалежно вибирають із C_1-C_6 алкілу, галогену, та $-OR^{12a}$; та

кожен t незалежно вибирають із 0, 1, 2, 3, 4, 5, та 6; або

її фармацевтично прийнятна сіль або сольват.

В інших варіантах здійснення забезпечуються сполуки формули (I), де:

R^1, R^2, R^3, R^4 незалежно вибирають із водню, C_1-C_6 алкілу, $-(CR^{12a}R^{12b})_t$ гало, $-(CR^{12a}R^{12b})_tCN$, $-(CR^{12a}R^{12b})_tOR^{12a}$, та $-(CR^{12a}R^{12b})_tN(R^{12a}R^{12b})$;

R^5 представляє собою водень або C_1-C_6 алкіл; R^6, R^7, R^8 , та R^9 незалежно вибирають із водню, C_1-C_6 алкілу, $-(CR^{12a}R^{12b})_t$ гало, $-(CR^{12a}R^{12b})_tCN$, $-(CR^{12a}R^{12b})_tOR^{12a}$, та $-(CR^{12a}R^{12b})_tN(R^{12a}R^{12b})$;

R^{10} та R^{11} незалежно вибирають із водню, $-(CR^{12a}R^{12b})_t$, C_1-C_6 алкілу, $-(CR^{12a}R^{12b})_tC_3-C_{11}$ циклоалкілу, $-(CR^{12a}R^{12b})_tC_6-C_{10}$ арилу, $-(CR^{12a}R^{12b})_tC_2-$

печуються сполуки формули (I), C_{10} гетероциклілу, та $-(CR^{12a}R^{12b})_t$ гетероарилу, де кожен із вказаних C_1-C_6 алкілу, C_3-C_{11} циклоалкілу, C_6-C_{10} арилу, C_2-C_{10} гетероциклілу, та гетероарильні групи необов'язково заміщені принаймні одним R^{13} ; або

R^{10} та R^{11} , разом із атомом, до якого вони приєднані, утворюють C_2-C_{10} гетероциклічну групу, необов'язково заміщену принаймні одним R^{13} ;

кожен R^{12a} та R^{12b} незалежно вибирають із водню та C_1-C_6 алкілу; або

R^{12a} та R^{12b} , разом із атомом, до якого вони приєднані, утворюють C_3-C_{11} циклоалкілну групу;

кожен R^{13} незалежно вибирають із C_1-C_6 алкілу, галогену, $-O(CR^{12a}R^{12b})_tR^{12a}$, $-O(CR^{12a}R^{12b})_tC_6-C_{10}$ арилу, $-O(CR^{12a}R^{12b})_tC_2-C_{10}$ гетероциклілу, $-O(CR^{12a}R^{12b})_t$ гетероарилу, $-CO_2(C_1-C_6)$ алкілу, та $-(CR^{12a}R^{12b})_tN(R^{12a}R^{12b})$, де кожен із вказаних C_1-C_6 алкілу, C_6-C_{10} арилу, C_2-C_{10} гетероциклілу, та гетероарильні групи необов'язково заміщені принаймні одним R^{14} ;

кожен R^{14} незалежно вибирають із C_1-C_6 алкілу, галогену, та $-OR^{12a}$; та

кожен t незалежно вибирають із 0, 1, 2, 3, 4, 5, та 6; або

її фармацевтично прийнятна сіль або сольват.

В інших варіантах здійснення забезпечуються сполуки формули (I), де R^1, R^2, R^3 , та R^4 представляють собою водень.

В інших варіантах здійснення забезпечуються сполуки формули (I), де R^6, R^7, R^8 , та R^9 представляють собою водень.

В інших варіантах здійснення забезпечуються сполуки формули (I), де $R^1, R^2, R^3, R^4, R^6, R^7, R^8$, та R^9 представляють собою водень.

В інших варіантах здійснення забезпечуються сполуки формули (I), де R^5 представляє собою водень.

В інших варіантах здійснення забезпечуються сполуки формули (I), де R^{10} представляє собою водень та R^{11} представляє собою $-(CR^{12a}R^{12b})_tC_1-C_6$ алкіл, $-(CR^{12a}R^{12b})_tC_3-C_{11}$ циклоалкіл, $-(CR^{12a}R^{12b})_tC_6-C_{10}$ арил, $-(CR^{12a}R^{12b})_tC_2-C_{10}$ гетероциклілу, та $-(CR^{12a}R^{12b})_t$ гетероарил, де кожен із вказаних C_1-C_6 алкілу, C_3-C_{11} циклоалкілу, C_6-C_{10} арилу, C_2-C_{10} гетероциклілу, та гетероарильні групи необов'язково заміщені принаймні одним R^{13} .

В інших варіантах здійснення забезпечуються сполуки формули (I), де:

R^{11} вибраний із $-(CR^{12a}R^{12b})_tC_1-C_6$ алкілу, $-(CR^{12a}R^{12b})_tC_3-C_{11}$ циклоалкілу, $-(CR^{12a}R^{12b})_tC_6-C_{10}$ арилу, $-(CR^{12a}R^{12b})_tC_2-C_{10}$ гетероциклілу, та $-(CR^{12a}R^{12b})_t$ гетероарилу, де кожен із вказаних C_1-C_6 алкілу, C_3-C_{11} циклоалкілу, C_6-C_{10} арилу, C_2-C_{10} гетероциклілу, та гетероарильні групи необов'язково заміщені принаймні одним R^{13} ; та t представляє собою 1 або 2.

В інших варіантах здійснення забезпечуються сполуки формули (I), де R^{11} представляє собою C_1-C_6 алкіл та $-(CH_2)C_6-C_{10}$ арил, де вказані C_1-C_6 та арильні групи необов'язково заміщені принаймні одним замісником, незалежно вибраним із C_1-C_6 алкілу, галогену, та $-OR^{12a}$.

В інших варіантах здійснення забезпечуються сполуки формули (I), де R^{11} представляє собою

C₁-C₆ алкіл.

В інших варіантах здійснення забезпечуються сполуки формули (I), де R¹⁰ та R¹¹, разом із атомом, до якого вони приєднані, утворюють C₂-C₁₀ гетероциклічну групу, необов'язково заміщену принаймні одним R¹³.

В інших варіантах здійснення забезпечуються сполуки формули (I), де вказана C₂-C₁₀ гетероциклічна група необов'язково заміщена принаймні одним замісником, незалежно вибраним із C₁-C₆ алкілу, C₆-C₁₀ арилу, -ОН, -ОСН₃, гетероарилу, та -СО₂(C₁-C₆ алкілу), де вказані C₆-C₁₀ арильні та гетероарильні групи необов'язково заміщені принаймні одним галогеном або C₁-C₆ алкільною групою.

В інших варіантах здійснення забезпечуються сполуки формули (I), в яких вказана C₂-C₁₀ гетероциклічна група вибрана із 2,7-діазаспіро[3,5]нон-7-ілу, 2,7-діазаспіро[3,5]нон-2-іл, піперазинілу, піперидинілу, морфолінілу, та піролідинілу.

В інших варіантах здійснення забезпечуються сполуки формули (I), вибрані із N-[1,1-диметил-2-(4-метилпіперидин-1-іл)етил]-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензаміду; N-(1,1-диметил-2-піперидин-1-ілетил)-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензаміду; N-(1,1-диметил-2-піролідин-1-ілетил)-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензаміду; N-(1-циклопропіл-1-метилетил)-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензаміду; N-(2-фторбензил)-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензаміду; 2-(2,7-діазаспіро[3,5]нон-7-ілкарбоніл)-N-піридин-3-ілбензолсульфонамід; 2-(2,7-діазаспіро[3,5]нон-2-ілкарбоніл)-N-піридин-3-ілбензолсульфонамід; N-циклогексил-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензаміду; N-(4-фторбензил)-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензаміду; трет-бутил 7-{2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензоїл}-2,7-діазаспіро[3,5]нон-2-карбоксилат; трет-бутил 2-{2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензоїл}-2,7-діазаспіро[3,5]нон-7-карбоксилат; N-бензил-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензаміду; 2-[[4-(4-фторфеніл)піперазин-1-іл]карбоніл]-N-піридин-3-ілбензолсульфонамід; N-(трет-бутил)-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензаміду; N-метил-2-(піперидин-1-ілкарбоніл)-N-піридин-3-ілбензолсульфонамід; N-(5-метоксипіридин-3-іл)-2-(піперидин-1-ілкарбоніл)бензолсульфонамід; N-бутил-2-[[5-метоксипіридин-3-іламіно)сульфоніл]бензаміду; N-(4-метоксипіридин-3-іл)-2-(піперидин-1-ілкарбоніл)бензолсульфонамід; N-бутил-2-[[4-метоксипіридин-3-іламіно)сульфоніл]бензаміду; N-піридин-3-іл-2-(піролідин-1-ілкарбоніл)бензолсульфонамід; 2-(морфолін-4-ілкарбоніл)-N-піридин-3-ілбензолсульфонамід; N-(5-ціанопіридин-3-іл)-2-(піперидин-1-ілкарбоніл)бензолсульфонамід; N-[1-(гідроксиметил)циклопентил]-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензаміду; N-бутил-2-[[5-ціанопіридин-3-іламіно)сульфоніл]бензаміду; 2-[[3,5-диметилпіперидин-1-іл]карбоніл]-N-піридин-3-ілбензолсульфонамід; 2-[[4-метоксипіперидин-1-іл]карбоніл]-N-піридин-3-ілбензолсульфонамід; 2-[[2(R,6S)-2,6-диметилморфолін-4-іл]карбоніл]-N-

піридин-3-ілбензолсульфонамід; 2-[[4-гідроксипіперидин-1-іл]карбоніл]-N-піридин-3-ілбензолсульфонамід; 2-[[3,3-диметилпіперидин-1-іл]карбоніл]-N-піридин-3-ілбензолсульфонамід; N-(5-метилпіридин-3-іл)-2-(піперидин-1-ілкарбоніл)бензолсульфонамід; N-бутил-2-[[5-метилпіридин-3-іламіно)сульфоніл]бензаміду; N-(2-метил-2-морфолін-4-ілпропіл)-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензаміду; N-(1,1-диметил-2-морфолін-4-ілетил)-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензаміду; N-[2-(бензилокси)-1,1-диметилетил]-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензаміду; 2-[[4-метилпіперазин-1-іл]карбоніл]-N-піридин-3-ілбензолсульфонамід; етил 4-{2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензоїл}піперазин-1-карбоксилат; N-[2-(диметиламіно)етил]-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензаміду; N-(1,1-диметилпропіл)-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензаміду; N-(2-гідрокси-1,1-диметилетил)-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензаміду; N-етил-N-[2-(1H-піразол-1-іл)етил]-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензаміду; 2-[[4-метилпіперидин-1-іл]карбоніл]-N-піридин-3-ілбензолсульфонамід; N-(3-метилбутил)-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензаміду; N-(3-фторбензил)-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензаміду; N-(2,2-диметилпропіл)-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензаміду; N-(2,6-диметоксибензил)-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензаміду; N-(3-метоксибензил)-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензаміду; N-метил-N-пентил-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензаміду; N-(циклопропілметил)-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензаміду; N-ізопропіл-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензаміду; N-пропіл-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензаміду; N-(3,5-диметоксибензил)-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензаміду; N-(1H-індол-4-ілметил)-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензаміду; N-(2,4-диметоксибензил)-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензаміду; N-(циклопропілметил)-N-пропіл-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензаміду; N-бензил-N-метил-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензаміду; N-(2-феноксіетил)-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензаміду; N-(4-метоксибензил)-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензаміду; N-(2,3-дигідро-1H-інден-2-іл)-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензаміду; N-(3-бутоксипропіл)-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензаміду; N-[2-(3-метоксифеніл)етил]-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензаміду; N-пентил-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензаміду; N-піридин-3-іл-2-[(4-піридин-2-ілпіперазин-1-іл)карбоніл]бензолсульфонамід; N-бутил-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензаміду; N-(циклопентилметил)-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензаміду; N-циклобутил-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензаміду; 2-

етоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл}-N-[4-фтор-3-
(трифторметил)бензил]бензаміду; N-(3,4-
дифторбензил)-N-метил-2-{{(5-метилпіридин-3-
іл)аміно]сульфоніл}бензаміду; N-(3,4-
дифторбензил)-2-{{(5-метоксипіридин-3-
іл)аміно]сульфоніл}-N-метилбензаміду; N-(4-
фторбензил)-2-{{(5-метоксипіридин-3-
іл)аміно]сульфоніл}-5-(2-морфолін-4-
ілетокси)бензаміду; N-(4-фторбензил)-2-{{(5-
метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл}-5-
(піперидин-4-ілокси)бензаміду; N-(3-хлор-4-
фторбензил)-2-{{(5-метоксипіридин-3-
іл)аміно]сульфоніл}бензаміду; N-(3,4-
дифторбензил)-2-{{(4-метоксипіридин-3-
іл)аміно]сульфоніл}-N-метилбензаміду; N-[4-фтор-
3-(трифторметил)бензил]-2-{{(4-метоксипіридин-3-
іл)аміно]сульфоніл}бензаміду; N-(3,4-
дифторбензил)-2-{{(4-етоксипіридин-3-
іл)аміно]сульфоніл}бензаміду; N-(3,4-
дифторбензил)-2-{{(4-етоксипіридин-3-
іл)аміно]сульфоніл}-N-метилбензаміду; 2-{{(4-
етоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл}-N-[4-фтор-3-
(трифторметил)бензил]бензаміду; N-(4-хлор-2-
метилбензил)-2-{{(5-метоксипіридин-3-
іл)аміно]сульфоніл}бензаміду; N-(2-хлор-6-
фторбензил)-2-{{(5-метоксипіридин-3-
іл)аміно]сульфоніл}бензаміду; N-(2,4-
дифторбензил)-2-{{(5-метоксипіридин-3-
іл)аміно]сульфоніл}бензаміду; N-(3-хлор-2-
метилбензил)-2-{{(5-метоксипіридин-3-
іл)аміно]сульфоніл}бензаміду; N-(2-фторбензил)-2-
{{(5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл}-N-
метилбензаміду; N-(3-хлорбензил)-2-{{(5-
метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл}бензаміду;
N-(2,3-дихлорбензил)-2-{{(5-метоксипіридин-3-
іл)аміно]сульфоніл}бензаміду; N-(2-хлор-4-
фторбензил)-2-{{(5-метоксипіридин-3-
іл)аміно]сульфоніл}бензаміду; N-[1-(4-
хлорфеніл)етил]-2-{{(5-метоксипіридин-3-
іл)аміно]сульфоніл}бензаміду; N-(3-хлор-2-
фторбензил)-2-{{(5-метоксипіридин-3-
іл)аміно]сульфоніл}бензаміду; N-(3-хлор-4-
фторбензил)-2-{{(5-метилпіридин-3-
іл)аміно]сульфоніл}бензаміду; N-(3-фтор-4-
метилбензил)-2-{{(5-метилпіридин-3-
іл)аміно]сульфоніл}бензаміду; N-(3,5-
дихлорбензил)-2-{{(5-метилпіридин-3-
іл)аміно]сульфоніл}бензаміду; N-[1-(3,4-
дифторфеніл)-1-метилетил]-2-{{(5-метоксипіридин-
3-іл)аміно]сульфоніл}бензаміду; N-метил-2-{{(5-
метилпіридин-3-іл)аміно]сульфоніл}-N-[4-
(трифторметил)бензил]бензаміду; N-(3-хлор-4-
метилбензил)-2-{{(5-метоксипіридин-3-
іл)аміно]сульфоніл}бензаміду; N-(4-хлор-3-
фторбензил)-2-{{(5-метоксипіридин-3-
іл)аміно]сульфоніл}бензаміду; 2-{{(4-
етоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл}-N-метил-N-[4-
(трифторметил)бензил]бензаміду; та N-(4-
фторбензил)-5-метокси-2-{{(5-метоксипіридин-3-
іл)аміно]сульфоніл}бензаміду; або його фармацевтично прийнятної солі або сольвати.

В подальшому варіанті здійснення винаходу забезпечується сполука, вибрана із N-(3,4-дифторбензил)-2-{{(4-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл}бензаміду; N-(3,4-

дифторбензил)-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензаміду; N-бутил-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-метилбензаміду; 2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-метил-N-пентилбензаміду; 2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-метил-N-(3-метилбутил)бензаміду; N-(циклопропілметил)-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-пропілбензаміду; N-(3,4-дихлорбензил)-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензаміду; N-[4-фтор-3-(трифторметил)бензил]-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензаміду; 2-[[5-етоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-(3-метилбутил)бензаміду; 2-[[5-етоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-[2-(2-метилфеніл)етил]бензаміду; N-(3,4-дихлорбензил)-2-[[5-етоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензаміду; N-(3,4-дифторбензил)-2-[[5-етоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензаміду; N-(3,4-дифторбензил)-2-[[5-етоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-метилбензаміду; 2-[[5-етоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-[4-фтор-3-(трифторметил)бензил]-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-метилбензаміду; N-(4-фторбензил)-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-5-(2-морфолін-4-ілетокси)бензаміду; N-(4-фторбензил)-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-5-(піперидин-4-ілокси)бензаміду; N-(3-хлор-4-фторбензил)-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензаміду; N-ізопропіл-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-метил-5-(2-морфолін-4-ілетокси)бензаміду; N-ізопропіл-N-(2-метоксіетил)-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензаміду; N-ізопропіл-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-метил-5-(піперидин-4-ілокси)бензаміду; N-[2-(2-хлорфеніл)етил]-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензаміду; N-[3-(2-метоксифеніл)пропіл]-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензаміду; N-(4-хлор-2-метилбензил)-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензаміду; N-(2-хлор-6-фторбензил)-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензаміду; N-(2,4-дифторбензил)-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензаміду; N-(1-ізопропіл-2-метилпропіл)-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензаміду; N-(2-циклопентилетил)-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензаміду; N-(3-хлор-2-метилбензил)-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензаміду; N-2-адамантил-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензаміду; N-(циклогексилметил)-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензаміду; N-[1-(4-хлорбензил)-2-гідроксіетил]-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензаміду; N-(2-фторбензил)-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-метилбензаміду; N-(1-етилпропіл)-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензаміду;

N-(3-хлорбензил)-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензаміду; N-[(1S)-2-циклогексил-1-(гідроксиметил)етил]-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензаміду; N-[(2-гідрокси-2-адамантил)метил]-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензаміду; N-(2,3-дихлорбензил)-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензаміду; N-(2-хлор-4-фторбензил)-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензаміду; N-[1-(4-хлорфеніл)етил]-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензаміду; N-(3-хлор-2-фторбензил)-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензаміду; N-[2-(3-хлорфеніл)етил]-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензаміду; N-[1-(3,4-дифторфеніл)-1-метилетил]-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензаміду; N-(3-хлор-4-метилбензил)-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензаміду; N-[2-(3,4-дифторфеніл)-1-метилетил]-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензаміду; N-(4-хлор-3-фторбензил)-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензаміду; та N-(4-фторбензил)-5-метокси-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензаміду; або його фармацевтично прийнятної солі або сольвату.

В іншому варіанті здійснення винаходу забезпечується сполука, вибрана із N-метил-N-(3-метилбутил)-2-[[5-метилпіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензаміду; N-(циклопентилметил)-N-метил-2-[[5-метилпіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензаміду; N-метил-2-[[5-метилпіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-пентилбензаміду; N-(3,4-дифторбензил)-2-[[5-метилпіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензаміду; N-[2-(2-метилфеніл)етил]-2-[[5-метилпіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензаміду; N-(3,4-дихлорбензил)-2-[[5-метилпіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензаміду; N-[4-фтор-3-(трифторметил)бензил]-2-[[5-метилпіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензаміду; N-(3,4-дифторбензил)-N-метил-2-[[5-метилпіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензаміду; N-[2-(2-хлорфеніл)етил]-2-[[5-метилпіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензаміду; 2-[[5-метилпіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-{2-[2-(трифторметокси)феніл]етил]бензаміду; N-(3-хлор-4-фторбензил)-2-[[5-метилпіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензаміду; N-(3-фтор-4-метилбензил)-2-[[5-метилпіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензаміду; N-(3,5-дихлорбензил)-2-[[5-метилпіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензаміду; N-метил-N-[2-(2-метилфеніл)етил]-2-[[5-метилпіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензаміду; N-метил-2-[[5-метилпіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-[4-(трифторметил)бензил]бензаміду; та N-(1-ізопропіл-2-метилпропіл)-2-[[5-метилпіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензаміду; або його фармацевтично прийнятної солі або сольвату.

В іншому варіанті здійснення винаходу забезпечується сполука, вибрана із N-метил-N-(2-фенілетил)-2-[[піридин-3-іламіно]сульфоніл]бензаміду; N-[2-(3-

В іншому варіанті здійснення винаходу забезпечується сполука, вибрана із N-(3,4-дифторбензил)-2-[(5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензаміду; N-[2-(2-

В іншому варіанті здійснення винаходу забезпечується сполука, вибрана із N-(3,4-дифторбензил)-2-[[4-(метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-метилбензаміду; N-(3,4-дифторбензил)-2-[[4-(метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензаміду; N-[2-(2-фторфеніл)етил]-2-[[5-(метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензаміду; N-[4-фтор-3-(трифторметил)бензил]-2-[[4-(метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензаміду; N-(3,4-дифторбензил)-2-[[4-(етоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензаміду; та N-(3,4-дифторбензил)-2-[[4-(етоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-метилбензаміду; або його фармацевтично прийнятної солі або сольовату.

В іншому варіанті здійснення винаходу забезпечується N-(3,4-дифторбензил)-2-{{(4-метоксипіридин-3-іл)аміно}сульфоніл}-N-метилбензамід, або його фармацевтично прийнятна сіль або сольват. В іншому варіанті здійснення винаходу забезпечується N-(3,4-дифторбензил)-2-{{(4-метоксипіридин-3-іл)аміно}сульфоніл}бензамід, або його фармацевтично прийнятна сіль або сольват. В іншому варіанті здійснення винаходу забезпечується N-[2-(2-фторфеніл)етил]-2-{{(5-метоксипіридин-3-іл)аміно}сульфоніл}бензамід, або його фармацевтично прийнятна сіль або сольват. В іншому варіанті здійснення винаходу забезпечується N-[4-фтор-3-(трифторметил)бензил]-2-{{(4-метоксипіридин-3-іл)аміно}сульфоніл}бензамід, або його фармацевтично прийнятна сіль або сольват. В іншому варіанті здійснення винаходу забезпечується N-(3,4-дифторбензил)-2-{{(4-етоксипіридин-3-іл)аміно}сульфоніл}бензамід, або його фармацевтично прийнятна сіль або сольват.

В іншому варіанті здійснення винаходу забезпечується N-(3,4-дифторбензил)-2-[[4-етоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-метилбензамід, або його фармацевтично прийнятна сіль або сольват.

В інших варіантах здійснення винаходу забезпечуються фармацевтичні композиції, які містять ефективну кількість принаймні однієї сполуки формули (I), та фармацевтично прийнятний носій. В інших варіантах здійснення забезпечуються фармацевтичні композиції, які додатково містять ефективну кількість принаймні однієї сполуки, яка метаболізується ферментом цитохром P4503A4. В інших варіантах здійснення забезпечуються фармацевтичні композиції, де вказана принаймні одна сполука, яка метаболізується ферментом цитохром P4503A4, представляє собою сполуку проти ВІЛ.

Крім того, в даному винаході забезпечуються фармацевтичні композиції, які містять ефективну кількість принаймні однієї сполуки, яка метаболізується ферментом цитохром P450, та ефективну кількість будь-яких сполук формули (I). В інших варіантах здійснення забезпечуються фармацевтичні композиції, де вказана принаймні одна сполука проти ВІЛ представляє собою інгібітор протеази ВІЛ. В інших варіантах здійснення забезпечуються такі фармацевтичні композиції, де вказаний інгібітор протеази ВІЛ вибраний із ампренавіру, CGP-73547, CGP-61755, DMP-450, нелфінавіру, ритонавіру, саквінавіру, інвірази, лопінавіру, TMC-126, атазанавіру, палінавіру, GS-3333, KN I-413, KNI-272, LG-71350, CGP-61755, PD 173606, PD 177298, PD 178390, PD 178392, U-140690, ABT-378, DMP-450, AG-1776, MK-944, VX-478, індинавіру, типранавіру, дарунавіру, брекканавіру, DPC-681, DPC-684, (4R)-N-аліл-3-((2S,3S)-2-гідрокси-3-[(3-гідрокси-2-метилбензоїл)аміно]-4-фенілбутаноїл)-5,5-диметил-1,3-тіазолідин-4-карбоксаміду, та фозампренавіру кальцію. В інших варіантах здійснення забезпечуються такі фармацевтичні композиції, де вказаний інгібітор протеази ВІЛ вибраний із ампренавіру, нелфінавіру, ритонавіру, саквінавіру, інвірази, лопінавіру, атазанавіру, палінавіру, індинавіру, типранавіру, дарунавіру, брекканавіру, брекканавіру, (4R)-N-аліл-3-((2S,3S)-2-гідрокси-3-[(3-гідрокси-2-метилбензоїл)аміно]-4-фенілбутаноїл)-5,5-диметил-1,3-тіазолідин-4-карбоксаміду, та фозампренавіру кальцію. В подальшому варіанті здійснення винаходу забезпечуються такі фармацевтичні композиції, де вказана принаймні одна додаткова сполука представляє собою (4R)-N-аліл-3-((2S,3S)-2-гідрокси-3-[(3-гідрокси-2-метилбензоїл)аміно]-4-фенілбутаноїл)-5,5-диметил-1,3-тіазолідин-4-карбоксамід.

В іншому варіанті здійснення винаходу забезпечується фармацевтичні композиції, які містять ефективну кількість N-((1S)-3-[3-ізопропіл-5-метил-4Н-1,2,4-триазол-4-іл]-екзо-8-азабіцикло[3,2,1]окт-8-ил)-1-фенілпропіл)-4,4-дифторциклогексанкарбоксаміду), етил 1-ендо-{8-[(3S)-3-(ацетиламіно)-3-(3-фторфеніл)пропіл]-8-азабіцикло[3,2,1]окт-3-ил)-2-метил-4,5,6,7-тетрагідро-1Н-імідазо[4,5-с]піридин-5-карбоксилату, або N-((1S)-3-[3-ендо-(5-ізобутирил-2-метил-4,5,6,7-тетрагідро-1Н-імідазо[4,5-

с]піридин-1-іл)-8-азабіцикло[3,2,1]окт-8-ил)-1-(3-фторфеніл)пропіл)ацетамід), принаймні одну сполуку формули (I), та фармацевтично прийнятний носій. Крім того, в даному винаході забезпечуються такі фармацевтичні композиції, які містять ефективну кількість N-((1S)-3-[3-ізопропіл-5-метил-4Н-1,2,4-триазол-4-іл]-екзо-8-азабіцикло[3,2,1]окт-8-ил)-1-фенілпропіл)-4,4-дифторциклогексанкарбоксаміду), принаймні сполуку формули (I), та фармацевтично прийнятний носій.

В інших варіантах здійснення забезпечуються фармацевтичні композиції, які містять принаймні одну сполуку формули (I), та сполуку проти ВІЛ у вигляді комбінованого препарату для одночасного, окремого або послідовного введення ВІЛ-інфікованому ссавцю для лікування ВІЛ у вказаного ссавця.

В інших варіантах здійснення забезпечуються способи інгібування метаболізму першої сполуки, яка метаболізується ферментною системою P4503A4, які включають введення вказаному ссавцю вказаної першої сполуки та ефективної кількості другої сполуки, де вказана друга сполука вибрана із сполук формули (I). Крім того, в даному винаході забезпечуються такі способи, де вказана перша сполука представляє собою 6-циклопентил-6-[2-(2,6-діетилпіридин-4-іл)етил]-3-[(5,7-диметил[1,2,4]тріазоло[1,5-а]піримідин-2-іл)метил]-4-гідрокси-5,6-дигідро-2Н-піран-2-он, або її фармацевтично прийнятну сіль. В іншому варіанті здійснення винаходу забезпечуються такі способи, де вказана перша сполука представляє собою N-((1S)-3-[3-ізопропіл-5-метил-4Н-1,2,4-триазол-4-іл]-екзо-8-азабіцикло[3,2,1]окт-8-ил)-1-фенілпропіл)-4,4-дифторциклогексанкарбоксамід), етил 1-ендо-{8-[(3S)-3-(ацетиламіно)-3-(3-фторфеніл)пропіл]-8-азабіцикло[3,2,1]окт-3-ил)-2-метил-4,5,6,7-тетрагідро-1Н-імідазо[4,5-с]піридин-5-карбоксилат, або N-((1S)-3-[3-ендо-(5-ізобутирил-2-метил-4,5,6,7-тетрагідро-1Н-імідазо[4,5-с]піридин-1-іл)-8-азабіцикло[3,2,1]окт-8-ил)-1-(3-фторфеніл)пропіл)ацетамід). Крім того, в даному винаході забезпечуються такі способи, де вказана перша сполука представляє собою N-((1S)-3-[3-ізопропіл-5-метил-4Н-1,2,4-триазол-4-іл]-екзо-8-азабіцикло[3,2,1]окт-8-ил)-1-фенілпропіл)-4,4-дифторциклогексанкарбоксамід). В інших варіантах здійснення забезпечуються такі способи, де вказана перша сполука представляє собою сполуку проти ВІЛ. В інших варіантах здійснення забезпечуються такі способи, де вказана сполука проти ВІЛ представляє собою інгібітор протеази ВІЛ. В інших варіантах здійснення забезпечуються такі способи, де вказаний інгібітор протеази ВІЛ вибраний із ампренавіру, CGP-73547, CGP-61755, DMP-450, нелфінавіру, ритонавіру, саквінавіру, інвірази, лопінавіру, TMC-126, атазанавіру, палінавіру, GS-3333, KN I-413, KNI-272, LG-71350, CGP-61755, PD 173606, PD 177298, PD 178390, PD 178392, U-140690, ABT-378, DMP-450, AG-1776, MK-944, VX-478, індинавіру, типранавіру, дарунавіру, брекканавіру, DPC-681, DPC-684, (4R)-N-аліл-3-((2S,3S)-2-гідрокси-3-[(3-гідрокси-2-метилбензоїл)аміно]-4-фенілбутаноїл)-5,5-

диметил-1,3-тіазолідин-4-карбоксаміду, та фозампренавіру кальцію. В інших варіантах здійснення забезпечуються такі способи, де вказаний інгібітор протеази ВІЛ вибраний із ампренавіру, нелфінавіру, ритонавіру, саквінавіру, інвірази, лопінавіру, атазанавіру, палінавіру, індинавіру, типранавіру, дарунавіру, брекенавіру, (4R)-N-аліл-3-((2S,3S)-2-гідрокси-3-[(3-гідрокси-2-метилбензоїл)аміно]-4-фенілбутаноїл)-5,5-диметил-1,3-тіазолідин-4-карбоксаміду та фозампренавіру кальцію. В іншому варіанті здійснення винаходу забезпечуються такі способи, де вказана перша сполука представляє собою (N-((1S)-3-[3-ізопропіл-5-метил-4Н-1,2,4-триазол-4-іл]-екзо-8-азабіцикло[3,2,1]окт-8-ил)-1-фенілпропіл)-4,4-дифторциклогексанкарбоксамід).

В інших варіантах здійснення забезпечуються способи покращення фармакокінетики у ссавця першої сполуки, які включають введення вказаному ссавцю вказаної першої сполуки та ефективної кількості другої сполуки, де вказану другу сполуку вибирають із сполук формули (I). В іншому варіанті здійснення винаходу забезпечуються такі способи, де вказана перша сполука представляє собою 6-циклопентил-6-[2-(2,6-діетилпіридин-4-іл)етил]-3-[(5,7-диметил[1,2,4]тріазоло[1,5-а]піримідин-2-іл)метил]-4-гідрокси-5,6-дигідро-2Н-піран-2-он, або її фармацевтично прийнятну сіль. Крім того, в даному винаході забезпечуються такі способи, де вказана перша сполука представляє собою (N-((1S)-3-[3-ізопропіл-5-метил-4Н-1,2,4-триазол-4-іл]-екзо-8-азабіцикло[3,2,1]окт-8-ил)-1-фенілпропіл)-4,4-дифторциклогексанкарбоксамід), етил 1-ендо-8-[(3S)-3-(ацетиламіно)-3-(3-фторфеніл)пропіл]-8-азабіцикло[3,2,1]окт-3-ил]-2-метил-4,5,6,7-тетрагідро-1Н-імідазо[4,5-с]піридин-5-карбоксилат, або N-((1S)-3-[3-ендо-(5-Ізобутирил-2-метил-4,5,6,7-тетрагідро-1Н-імідазо[4,5-с]піридин-1-іл)-8-азабіцикло[3,2,1]окт-8-ил)-1-(3-фторфеніл)пропіл]ацетамід). В подальшому варіанті здійснення винаходу забезпечуються такі способи, де вказана перша сполука представляє собою (N-((1S)-3-[3-ізопропіл-5-метил-4Н-1,2,4-триазол-4-іл]-екзо-8-азабіцикло[3,2,1]окт-8-ил)-1-фенілпропіл)-4,4-дифторциклогексанкарбоксамід). В інших варіантах здійснення забезпечуються такі способи, де вказана перша сполука представляє собою сполуку проти ВІЛ. В інших варіантах здійснення забезпечуються такі способи, де вказана перша сполука представляє собою інгібітор протеази ВІЛ. В інших варіантах здійснення забезпечуються такі способи, де вказаний інгібітор протеази ВІЛ вибраний із ампренавіру, CGP-73547, CGP-61755, DMP-450, нелфінавіру, ритонавіру, саквінавіру, інвірази, лопінавіру, TMC-126, атазанавіру, палінавіру, GS-3333, KN I-413, KNI-272, LG-71350, CGP-61755, PD 173606, PD 177298, PD 178390, PD 178392, U-140690, ABT-378, DMP-450, AG-1776, MK-944, VX-478, індинавіру, типранавіру, дарунавіру, брекенавіру, DPC-681, DPC-684, (4R)-N-аліл-3-((2S,3S)-2-гідрокси-3-[(3-гідрокси-2-метилбензоїл)аміно]-4-фенілбутаноїл)-5,5-диметил-1,3-тіазолідин-4-карбоксаміду, та фозампренавіру кальцію. В інших варіантах здійснення забезпечуються такі способи, де вказаний інгібітор протеази ВІЛ вибраний із ампренавіру, нелфінаві-

ру, ритонавіру, саквінавіру, інвірази, лопінавіру, атазанавіру, палінавіру, індинавіру, типранавіру, дарунавіру, брекенавіру, (4R)-N-аліл-3-((2S,3S)-2-гідрокси-3-[(3-гідрокси-2-метилбензоїл)аміно]-4-фенілбутаноїл)-5,5-диметил-1,3-тіазолідин-4-карбоксаміду та фозампренавіру кальцію. В іще іншому варіанті здійснення винаходу забезпечуються такі способи, де вказаний інгібітор протеази ВІЛ представляє собою (4R)-N-аліл-3-((2S,3S)-2-гідрокси-3-[(3-гідрокси-2-метилбензоїл)аміно]-4-фенілбутаноїл)-5,5-диметил-1,3-тіазолідин-4-карбоксамід.

В іншому варіанті здійснення винаходу забезпечується способи інгібування реплікації ВІЛ у ВІЛ-інфікованого ссавця, який передбачає введення вказаному ссавцю ефективної кількості першої сполуки та ефективної кількості другої сполуки, де вказана перша сполука представляє собою сполуку, яка інгібує реплікацію ВІЛ, а вказана друга сполука вибрана із сполук формули (I). В ще іншому варіанті здійснення винаходу забезпечуються такі способи, де вказана перша сполука представляє собою (N-((1S)-3-[3-ізопропіл-5-метил-4Н-1,2,4-триазол-4-іл]-екзо-8-азабіцикло[3,2,1]окт-8-ил)-1-фенілпропіл)-4,4-дифторциклогексанкарбоксамід), етил 1-ендо-8-[(3S)-3-(ацетиламіно)-3-(3-фторфеніл)пропіл]-8-азабіцикло[3,2,1]окт-3-ил]-2-метил-4,5,6,7-тетрагідро-1Н-імідазо[4,5-с]піридин-5-карбоксилат, або N-((1S)-3-[3-ендо-(5-Ізобутирил-2-метил-4,5,6,7-тетрагідро-1Н-імідазо[4,5-с]піридин-1-іл)-8-азабіцикло[3,2,1]окт-8-ил)-1-(3-фторфеніл)пропіл]ацетамід). В іще іншому варіанті здійснення винаходу забезпечуються такі способи, де вказана перша сполука представляє собою (N-((1S)-3-[3-ізопропіл-5-метил-4Н-1,2,4-триазол-4-іл]-екзо-8-азабіцикло[3,2,1]окт-8-ил)-1-фенілпропіл)-4,4-дифторциклогексанкарбоксамід). В іще іншому варіанті здійснення винаходу забезпечуються такі способи, де вказана сполука проти ВІЛ представляє собою інгібітор протеази ВІЛ. В подальшому варіанті здійснення винаходу забезпечуються такі способи, де вказаний інгібітор протеази ВІЛ вибраний із ампренавіру, CGP-73547, CGP-61755, DMP-450, нелфінавіру, ритонавіру, саквінавіру, інвірази, лопінавіру, TMC-126, атазанавіру, палінавіру, GS-3333, KN I-413, KNI-272, LG-71350, CGP-61755, PD 173606, PD 177298, PD 178390, PD 178392, U-140690, ABT-378, DMP-450, AG-1776, MK-944, VX-478, індинавіру, типранавіру, дарунавіру, брекенавіру, DPC-681, DPC-684, (4R)-N-аліл-3-((2S,3S)-2-гідрокси-3-[(3-гідрокси-2-метилбензоїл)аміно]-4-фенілбутаноїл)-5,5-диметил-1,3-тіазолідин-4-карбоксаміду, та фозампренавіру кальцію. В ще іншому варіанті здійснення винаходу забезпечуються такі способи, де вказаний інгібітор протеази ВІЛ вибраний із ампренавіру, нелфінавіру, ритонавіру, саквінавіру, інвірази, лопінавіру, атазанавіру, палінавіру, індинавіру, типранавіру, дарунавіру, брекенавіру, (4R)-N-аліл-3-((2S,3S)-2-гідрокси-3-[(3-гідрокси-2-метилбензоїл)аміно]-4-фенілбутаноїл)-5,5-диметил-1,3-тіазолідин-4-карбоксаміду, та фозампренавіру кальцію. В подальшому варіанті здійснення винаходу забезпечуються такі способи, де вказана перша сполука представляє собою (4R)-N-

аліл-3-((2S,3S)-2-гідрокси-3-[(3-гідрокси-2-метилбензоїл)аміно]-4-фенілбутаноїл)-5,5-диметил-1,3-тіазолідин-4-карбоксамід.

Також в даному винаході забезпечуються застосування першої сполуки та другої сполуки для приготування лікарського засобу для лікування ВІЛ-інфекції у ВІЛ-інфікованого ссавця, де вказану першу сполуку вибирають із сполук формули (I), та вказана друга сполука представляє собою сполуку проти ВІЛ. В подальшому в даному винаході забезпечуються такі застосування, де вказана друга сполука представляє собою (N-((1S)-3-[3-ізопропіл-5-метил-4Н-1,2,4-триазол-4-іл]-екзо-8-азабіцикло[3,2,1]окт-8-ил)-1-фенілпропіл)-4,4-дифторциклогексанкарбоксамід, етил 1-ендо-{8-[(3S)-3-(ацетиламіно)-3-(3-фторфеніл)пропіл]-8-азабіцикло[3,2,1]окт-3-ил}-2-метил-4,5,6,7-тетрагідро-1Н-імідазо[4,5-с]піридин-5-карбоксилат, або N-((1S)-3-[3-ендо-(5-ізобутирил-2-метил-4,5,6,7-тетрагідро-1Н-імідазо[4,5-с]піридин-1-іл)-8-азабіцикло[3,2,1]окт-8-ил]-1-(3-фторфеніл)пропіл)ацетамід). В подальшому варіанті здійснення винаходу забезпечуються такі способи, де вказана друга сполука представляє собою (N-((1S)-3-[3-ізопропіл-5-метил-4Н-1,2,4-триазол-4-іл]-екзо-8-азабіцикло[3,2,1]окт-8-ил)-1-фенілпропіл)-4,4-дифторциклогексанкарбоксамід). В іще іншому варіанті здійснення винаходу забезпечуються такі застосування, де вказана друга сполука представляє собою інгібітор протеази ВІЛ. В подальшому варіанті здійснення винаходу забезпечуються такі застосування, де вказана друга сполука вибрана із ампренавіру, CGP-73547, CGP-61755, DMP-450, нелфінавіру, ритонавіру, саквінавіру, інвірази, лопінавіру, TMC-126, атазанавіру, палінавіру, GS-3333, KN I-413, KNI-272, LG-71350, CGP-61755, PD 173606, PD 177298, PD 178390, PD 178392, U-140690, ABT-378, DMP-450, AG-1776, MK-944, VX-478, індинавіру, типранавіру, дарунавіру, бреканавіру, DPC-681, DPC-684, (4R)-N-аліл-3-((2S,3S)-2-гідрокси-3-[(3-гідрокси-2-метилбензоїл)аміно]-4-фенілбутаноїл)-5,5-диметил-1,3-тіазолідин-4-карбоксаміду, та фозампренавіру кальцію. В іншому варіанті здійснення винаходу забезпечується такі застосування, де вказана друга сполука вибрана із ампренавіру, нелфінавіру, ритонавіру, саквінавіру, інвірази, лопінавіру, атазанавіру, палінавіру, індинавіру, типранавіру, дарунавіру, бреканавіру, (4R)-N-аліл-3-((2S,3S)-2-гідрокси-3-[(3-гідрокси-2-метилбензоїл)аміно]-4-фенілбутаноїл)-5,5-диметил-1,3-тіазолідин-4-карбоксаміду, та фозампренавіру кальцію. В подальшому варіанті здійснення винаходу забезпечуються такі застосування, де вказана друга сполука представляє собою (4R)-N-аліл-3-((2S,3S)-2-гідрокси-3-[(3-гідрокси-2-метилбензоїл)аміно]-4-фенілбутаноїл)-5,5-диметил-1,3-тіазолідин-4-карбоксамід. В подальших варіантах здійснення забезпечуються такі застосування, де вказаний лікарський засіб є для одностороннього, окремого або послідовного введення вказаному ссавцю для лікування ВІЛ.

Застосування першої сполуки та другої сполуки для приготування лікарського засобу для поліпшення фармакокінетики вказаної другої сполуки

у ссавця, де вказану першу сполуку вибирають із сполук формули (I), та вказана друга сполука метаболізується цитохромом Р450. Додатково забезпечуються такі застосування, де вказана друга сполука представляє собою (N-((1S)-3-[3-ізопропіл-5-метил-4Н-1,2,4-триазол-4-іл]-екзо-8-азабіцикло[3,2,1]окт-8-ил)-1-фенілпропіл)-4,4-дифторциклогексанкарбоксамід, етил 1-ендо-{8-[(3S)-3-(ацетиламіно)-3-(3-фторфеніл)пропіл]-8-азабіцикло[3,2,1]окт-3-ил}-2-метил-4,5,6,7-тетрагідро-1Н-імідазо[4,5-с]піридин-5-карбоксилат, або N-((1S)-3-[3-ендо-(5-ізобутирил-2-метил-4,5,6,7-тетрагідро-1Н-імідазо[4,5-с]піридин-1-іл)-8-азабіцикло[3,2,1]окт-8-ил]-1-(3-фторфеніл)пропіл)ацетамід). Також забезпечуються такі застосування, де вказана друга сполука представляє собою (N-((1S)-3-[3-ізопропіл-5-метил-4Н-1,2,4-триазол-4-іл]-екзо-8-азабіцикло[3,2,1]окт-8-ил)-1-фенілпропіл)-4,4-дифторциклогексанкарбоксамід). Додатково забезпечуються такі застосування, де вказана друга сполука представляє собою інгібітор протеази ВІЛ. В інших варіантах здійснення забезпечуються такі застосування, де вказана друга сполука вибрана із ампренавіру, CGP-73547, CGP-61755, DMP-450, нелфінавіру, ритонавіру, саквінавіру, інвірази, лопінавіру, TMC-126, атазанавіру, палінавіру, GS-3333, KN I-413, KNI-272, LG-71350, CGP-61755, PD 173606, PD 177298, PD 178390, PD 178392, U-140690, ABT-378, DMP-450, AG-1776, MK-944, VX-478, індинавіру, типранавіру, дарунавіру, бреканавіру, DPC-681, DPC-684, (4R)-N-аліл-3-((2S,3S)-2-гідрокси-3-[(3-гідрокси-2-метилбензоїл)аміно]-4-фенілбутаноїл)-5,5-диметил-1,3-тіазолідин-4-карбоксаміду, та фозампренавіру кальцію. Також в даний винахід включені такі застосування, де вказана друга сполука вибрана із ампренавіру, нелфінавіру, ритонавіру, саквінавіру, інвірази, лопінавіру, атазанавіру, палінавіру, індинавіру, типранавіру, дарунавіру, бреканавіру, (4R)-N-аліл-3-((2S,3S)-2-гідрокси-3-[(3-гідрокси-2-метилбензоїл)аміно]-4-фенілбутаноїл)-5,5-диметил-1,3-тіазолідин-4-карбоксаміду, та фозампренавіру кальцію. В іншому варіанті здійснення винаходу забезпечується такі застосування, де вказана друга сполука представляє собою (4R)-N-аліл-3-((2S,3S)-2-гідрокси-3-[(3-гідрокси-2-метилбензоїл)аміно]-4-фенілбутаноїл)-5,5-диметил-1,3-тіазолідин-4-карбоксамід.

Також в дану заявку включено застосування першої сполуки для приготування лікарського засобу для поліпшення у ссавця фармакокінетики другої сполуки, де вказану першу сполуку вибирають із сполук відповідно до формули (I), та вказана друга сполука метаболізується цитохромом Р450. Додатково забезпечуються такі застосування, де вказана друга сполука представляє собою (N-((1S)-3-[3-ізопропіл-5-метил-4Н-1,2,4-триазол-4-іл]-екзо-8-азабіцикло[3,2,1]окт-8-ил)-1-фенілпропіл)-4,4-дифторциклогексанкарбоксамід, етил 1-ендо-{8-[(3S)-3-(ацетиламіно)-3-(3-фторфеніл)пропіл]-8-азабіцикло[3,2,1]окт-3-ил}-2-метил-4,5,6,7-тетрагідро-1Н-імідазо[4,5-с]піридин-5-карбоксилат, або N-((1S)-3-[3-ендо-(5-ізобутирил-2-метил-4,5,6,7-тетрагідро-1Н-імідазо[4,5-с]піридин-1-іл)-8-

азабіцикло[3,2,1]окт-8-ил]-1-(3-фторфеніл)пропіл]ацетамід). Також забезпечуються такі застосування, де вказана друга сполука представляє собою (N-((1S)-3-[3-ізопропіл-5-метил-4Н-1,2,4-триазол-4-іл]-екзо-8-азабіцикло[3,2,1]окт-8-ил]-1-фенілпропіл)-4,4-дифторциклогексанкарбоксамід). Додатково забезпечуються такі застосування, де вказана друга сполука представляє собою інгібітор протеази ВІЛ. В інших варіантах здійснення забезпечуються такі застосування, де вказана друга сполука вибрана із ампренавіру, CGP-73547, CGP-61755, DMP-450, нелфінавіру, ритонавіру, саквінавіру, інвірази, лопінавіру, TMC-126, атазанавіру, палінавіру, GS-3333, KN I-413, KNI-272, LG-71350, CGP-61755, PD 173606, PD 177298, PD 178390, PD 178392, U-140690, ABT-378, DMP-450, AG-1776, MK-944, VX-478, індинавіру, типранавіру, дарунавіру, бреканавіру, DPC-681, DPC-684, (4R)-N-аліл-3-((2S,3S)-2-гідрокси-3-((3-гідрокси-2-метилбензоїл)аміно)-4-фенілбутаноїл)-5,5-диметил-1,3-тіазолідин-4-карбоксаміду, та фозампренавіру кальцію. Також дана заявка охоплює такі застосування, де вказана друга сполука вибрана із ампренавіру, нелфінавіру, ритонавіру, саквінавіру, інвірази, лопінавіру, атазанавіру, палінавіру, індинавіру, типранавіру, дарунавіру, бреканавіру, (4R)-N-аліл-3-((2S,3S)-2-гідрокси-3-((3-гідрокси-2-метилбензоїл)аміно)-4-фенілбутаноїл)-5,5-диметил-1,3-тіазолідин-4-карбоксаміду, та фозампренавіру кальцію. В іншому варіанті здійснення винаходу забезпечується такі застосування, де вказана друга сполука представляє собою (4R)-N-аліл-3-((2S,3S)-2-гідрокси-3-((3-гідрокси-2-метилбензоїл)аміно)-4-фенілбутаноїл)-5,5-диметил-1,3-тіазолідин-4-карбоксамід.

В інших варіантах здійснення забезпечуються будь-які способи, описані в даній заявці, в яких введення вказаної першої та вказаної другої сполуки здійснюють послідовно.

В інших варіантах здійснення забезпечуються будь-які способи, описані в даній заявці, в яких введення вказаної першої та вказаної другої сполуки здійснюють одночасно.

В інших варіантах здійснення забезпечуються способи лікування ВІЛ у ВІЛ-інфікованого ссавця, які передбачають введення вказаному ссавцю ефективної кількості сполуки проти ВІЛ та ефективної кількості сполуки відповідно до формули (I). В інших варіантах здійснення забезпечуються такі способи, де вказана сполука проти ВІЛ представляє інгібітор протеази ВІЛ. В інших варіантах здійснення забезпечуються такі способи, де вказаний інгібітор протеази ВІЛ вибраний із ампренавіру, CGP-73547, CGP-61755, DMP-450, нелфінавіру, ритонавіру, саквінавіру, інвірази, лопінавіру, TMC-126, атазанавіру, палінавіру, GS-3333, KN I-413, KNI-272, LG-71350, CGP-61755, PD 173606, PD 177298, PD 178390, PD 178392, U-140690, ABT-378, DMP-450, AG-1776, MK-944, VX-478, індинавіру, типранавіру, дарунавіру, бреканавіру, DPC-681, DPC-684, (4R)-N-аліл-3-((2S,3S)-2-гідрокси-3-((3-гідрокси-2-метилбензоїл)аміно)-4-фенілбутаноїл)-5,5-диметил-1,3-тіазолідин-4-карбоксаміду, та фозампренавіру кальцію. В інших

варіантах здійснення забезпечуються такі способи, де вказаний інгібітор протеази ВІЛ вибраний із ампренавіру, нелфінавіру, ритонавіру, саквінавіру, інвірази, лопінавіру, атазанавіру, палінавіру, індинавіру, типранавіру, дарунавіру, бреканавіру, (4R)-N-аліл-3-((2S,3S)-2-гідрокси-3-((3-гідрокси-2-метилбензоїл)аміно)-4-фенілбутаноїл)-5,5-диметил-1,3-тіазолідин-4-карбоксаміду, та фозампренавіру кальцію. В інших варіантах здійснення забезпечуються такі способи, в яких інгібітор протеази ВІЛ представляє собою (4R)-N-аліл-3-((2S,3S)-2-гідрокси-3-((3-гідрокси-2-метилбензоїл)аміно)-4-фенілбутаноїл)-5,5-диметил-1,3-тіазолідин-4-карбоксамід. В інших варіантах здійснення забезпечуються такі способи, в яких сполука проти ВІЛ представляє собою (N-((1S)-3-[3-ізопропіл-5-метил-4Н-1,2,4-триазол-4-іл]-екзо-8-азабіцикло[3,2,1]окт-8-ил]-1-фенілпропіл)-4,4-дифторциклогексанкарбоксамід, етил 1-ендо-8-((3S)-3-(ацетиламіно)-3-(3-фторфеніл)пропіл)-8-азабіцикло[3,2,1]окт-3-ил]-2-метил-4,5,6,7-тетрагідро-1Н-імідазо[4,5-с]піридин-5-карбоксилат, або N-((1S)-3-[3-ендо-(5-ізобутирил-2-метил-4,5,6,7-тетрагідро-1Н-імідазо[4,5-с]піридин-1-іл)-8-азабіцикло[3,2,1]окт-8-ил]-1-(3-фторфеніл)пропіл]ацетамід). В інших варіантах здійснення забезпечуються такі способи, в яких сполука проти ВІЛ представляє собою (N-((1S)-3-[3-ізопропіл-5-метил-4Н-1,2,4-триазол-4-іл]-екзо-8-азабіцикло[3,2,1]окт-8-ил]-1-фенілпропіл)-4,4-дифторциклогексанкарбоксамід).

В інших варіантах здійснення забезпечуються такі способи, в яких перша сполука представляє собою 6-циклопентил-6-[2-(2,6-діетилпіридин-4-іл)етил]-3-[(5,7-диметил[1,2,4]тріазоло[1,5-а]піримідин-2-іл)метил]-4-гідрокси-5,6-дигідро-2Н-піран-2-он.

Як використовується в даному винаході, терміни "включає" та "містить" використовуються в їх загальноприйнятому, необмежувальному значенні.

Як використовується в даному винаході, термін "ВІЛ" означає вірус імунodefіциту людини. Термін "ВІЛ-інтеграза," як використовується в даному винаході, означає інтегразу, фермент вірусу імунodefіциту людини.

Термін "C₁-C₆ алкіл," як використовується в даному винаході, означає насичені одновалентні вуглеводневі радикали, які мають прямоланцюгові або розгалужені частини і містять від 1 до 6 атомів вуглецю. Прикладами таких груп є, але не обмежуючись лише ними, метил, етил, пропіл, ізопропіл, н-бутил, ізо-бутил, та трет-бутил.

Термін "C₃-C₁₁ циклоалкіл" означає насичену, моноциклічну, конденсовану, або спіро, поліциклічну кільцеву структуру, яка має загалом від 3 до 11 кільцевих атомів вуглецю. Прикладами таких груп є, але не обмежуючись лише ними, циклопропіл, циклобутил, циклопентил, циклопентеніл, циклогексил, циклогептил, та адамантил.

Термін "C₆-C₁₀ арил," як використовується в даному винаході, означає групи, похідну ароматичного вуглеводню, яка містить від 6 до 10 атомів вуглецю. Прикладами таких груп є, але не обмежуючись лише ними, феніл або нафтил. Терміни "Ph" та "феніл," як використовується в даному ви-

наході, означають $-C_6H_5$ групу. Термін "бензил," як використовується в даному винаході, означає $-CH_2C_6H_5$ групу.

Термін " C_2-C_{10} гетероциклі" як використовується в даному винаході, означає неароматичну, моноциклічну, біциклічну, трициклічну або тетрациклічну групу, яка має загалом від 4 до 10 атомів в своїй кільцевій системі, і містить від 2 до 10 атомів вуглецю та від одного до чотирьох гетероатомів, незалежно вибраних із O, S та N, та при умові, що кільце вказаної групи на містить двох суміжних атомів O або двох суміжних атомів S. Крім того, такі C_2-C_{10} гетероциклічні групи можуть містити поліциклічні, спіро-кільцеві системи. Додатково, такі групи необов'язково можуть бути сконденсованими із бензольними кільцями. Додатково, такі C_2-C_{10} гетероциклічні групи можуть містити оксо замісник на будь-якому доступному атомі, що приводить до утворення придатної сполуки. Наприклад, така група може містити оксо атом на доступному атомі вуглецю або азоту. Така група може містити більше одного оксо замісника, коли це хімічно можливо. Додатково, мається на увазі, що коли така C_2-C_{10} гетероциклічна група містить атом сірки, то вказаний атом сірки може бути окислений одним або двома атомами кисню, отримуючи або сульфоксид або сульфон. Прикладом 4-х членної гетероциклічної групи є азетидиніл (похідний азетидину). Прикладом 5-ти членної гетероциклічної групи є тiazоліл і прикладом 10-ти членної гетероциклічної групи є хінолініл. Подальшими прикладами таких C_2-C_{10} гетероциклічних груп, але не обмежуючись лише ними, є піролідиніл, тетрагідрофураніл, дигідрофураніл, тетрагідротієніл, тетрагідропіраніл, дигідропіраніл, тетрагідротіопіраніл, піперидино, морфоліно, тіоморфоліно, тіоксаніл, піперазиніл, азетидиніл, оксетаніл, тіетаніл, гомопіперидиніл, оксепаніл, тіепаніл, оксазепініл, діазепініл, тіазепініл, 1,2,3,6-тетрагідропіридиніл, 2-піролініл, 3-піролініл, індолініл, 2H-піраніл, 4H-піраніл, діоксаніл, 1,3-діоксоланіл, піразолініл, дитіаніл, дитіоланіл, дигідропіраніл, дигідротієніл, дигідрофураніл, піразолідиніл, імідазолініл, імідазолідиніл, 3-азабіцикло[3,1,0]гексаніл, 3-азабіцикло[4,1,0]гептаніл, 3H-індоліл та хінолізініл.

Термін "гетероарил," як використовується в даному винаході, означає ароматичну гетероциклічну групу, яка має загалом від 5 до 10 атомів у своєму кільці та містить від 2 до 9 атомів вуглецю та від одного до чотирьох гетероатомів, кожен незалежно вибраний із O, S та N, та за умови, що кільце вказаної групи на містить двох суміжних атомів O або двох суміжних атомів S. Гетероциклічні групи включають бензоконденсовані циклічні системи. Прикладами ароматичних гетероциклічних груп є піридиніл, імідазоліл, піримідиніл, піразоліл, триазоліл, піразиніл, тетразоліл, фурил, тієніл, ізоксазоліл, тiazоліл, оксазоліл, ізотiazоліл, піролін, хінолін, ізохінолін, індоліл, бензимидазоліл, бензофураніл, цинолін, індазоліл, індолізін, фталазін, піридазін, триазін, ізоіндоліл, птеридиніл, пуриніл, оксадіазоліл, тіадіазоліл, фуразаніл, бензофуразаніл, бензотіофеніл,

бензотiazоліл, бензоксазоліл, хіназолініл, хіноксалініл, нафтиридиніл, та фуропіридиніл. Гетероарильні групи можуть бути приєднані за допомогою атома C або N, коли таке можливо. Наприклад, група, яка є похідною піролу, може представляти собою пірол-1-іл (N-зв'язана) або пірол-3-іл (C-зв'язана). Крім того, група, яка є похідною імідазолу, може представляти собою імідазол-1-іл (N-зв'язана) або імідазол-3-іл (C-зв'язана).

Терміни "галоген" та "гало," як використовується в даному винаході, означають фтор, хлор, бром або йод.

Термін "заміщена" означає, що вказана група або частина несе один або декілька замісників. Термін "незаміщена" означає, що вказана група не має замісників. Термін "необов'язково замінена" означає, що вказана група незамінена або замінена одним або декількома замісниками. Мається на увазі, що у сполуках за даним винаходом, коли група визначена як "незамінена," або є "заміненою" меншою кількістю груп, ніж потрібно для заповнення валентностей всіх атомів в сполуці, то валентності, що залишилися в такій групі, заповнені воднем. Наприклад, якщо C_6 арильна група, яка також в даному винаході позначається як "феніл", замінена одним додатковим замісником, то для фахівця в даній галузі техніки буде зрозуміло, що така група має 4 відкритих положення, що залишилися на атомах вуглецю C_6 арильного кільця (6 початкових положень, мінус одне положення, за допомогою якого зв'язаний залишок сполуки відповідно до даного винаходу, мінус додатковий замісник, залишається 4). В таких випадках, 4 атоми вуглецю, що залишилися, кожен зв'язаний із одним атомом водню для заповнення їх валентностей. Аналогічно, якщо C_6 арильна група в сполуках за даним винаходом визначена як "дизамінена", то фахівцю в даній галузі техніки буде зрозуміло, що це означає, що C_6 арил має 3 атоми вуглецю, які залишилися незаміненими. Ці три незамінені атоми вуглецю кожен зв'язаний із одним атомом водню для заповнення їх валентностей.

Термін "сольват," як використовується в даному винаході, означає фармацевтично прийнятний сольват, що утворює сполука відповідно до даного винаходу, який зберігає біологічну ефективність такої сполуки. Прикладами сольватів є, але не обмежуючись лише ними, сполуки за винаходом в комбінації з водою, ізопропанолом, етанолом, метанолом, диметилсульфоксидом (ДМСО), етилацетатом, оцтовою кислотою, етаноламіном або їх сумішами. Слід особливо відзначити, що в даному винаході одна молекула розчинника може бути зв'язана із однією молекулою сполук за даним винаходом, так як в гідраті. Крім того, слід особливо відзначити, що в даному винаході більше однієї молекули розчинника може бути зв'язано із однією молекулою сполук за даним винаходом, так як в дигідраті. Додатково, слід особливо відзначити, що в даному винаході менше однієї молекули розчинника може бути зв'язано із однією молекулою сполук за даним винаходом, так як в напівгідраті. Крім того, сольвати за даним винаходом також розглядаються як сольвати сполук за даним винаходом,

які зберігають біологічну ефективність негідратної форми сполук.

Термін "фармацевтично прийнятна сіль," як використовується в даному винаході, означає сіль сполуки за даним винаходом, яка зберігає біологічну ефективність вільних кислот і основ конкретно-го похідного і яка не є біологічно чи іншим чином небажаною.

Терміни "кількість, яка інгібує цитохром P450," та "кількість, яка інгібує фермент цитохром P450," як використовується в даному винаході, стосуються кількості сполуки, яка необхідна для зниження активності ферментів цитохрому P450 або конкретної ізоформи ферменту цитохром P450 в присутності такої сполуки. В будь-якому випадку, визначити, чи переважна сполука знижує активність ферменту цитохром P450, та кількість такої сполуки, необхідну для здійснення такої дії, можна за допомогою способів, відомих фахівцю в даній галузі, а також методів, описаних в даній заявці.

Терміни "інгібувача" або "інгібування," як використовується в даному винаході, стосуються зниження активності ферменту або ферментів цитохром P450, за допомогою засобу, здатного знижувати таку активність, в умовах *in vitro* чи *in vivo* після введення ссавцю, такому як людина. Таке інгібування може здійснюватися сполукою, яка зв'язується безпосередньо із ферментом або ферментами цитохром P450. Додатково, активність таких ферментів цитохром P450 може знижуватися в присутності такої сполуки, коли безпосереднього зв'язування ферменту і сполуки не відбувається. Крім того, таке інгібування може бути конкурентним, неконкурентним або безконкурентним, як описано в T.F. Woolf, Handbook of Drug Metabolism, Marcel Dekker, Inc., New York, 1999. Таке інгібування може бути визначене за допомогою систем *in vitro* або *in vivo*, або комбінації обох систем, за допомогою методів, добре відомих фахівцю в даній галузі.

Як використовується в даному винаході, термін "біологічна доступність" стосується системної доступності даної кількості хімічної сполуки, введеної ссавцю. Біологічна доступність може бути визначена шляхом вимірювання площі під кривою (AUC) або максимальної концентрації в сироватці або плазмі (C_{\max}) незміненої форми сполуки після введення сполуки ссавцю. AUC представляє собою площу під кривою, яка графічно представляє собою графік залежності концентрації сполуки в сироватці або в плазмі, наведеної на осі ординат (Y вісь) відносно часу, наведеного на осі абсцис (X вісь). Як правило, AUC для конкретної сполуки може бути розраховано за допомогою методів, відомих фахівцю в даній галузі техніки та описаних в G.S. Banker, Modern Pharmaceuticals, Drugs and the Pharmaceutical Sciences, том 72, Marcel Dekker, New York, Inc., 1996. Значення C_{\max} визначається як максимальна концентрація сполуки, яка досягається в сироватці або плазмі ссавця після введення ссавцю сполуки. Значення C_{\max} конкретної сполуки може бути визначене за допомогою методів, відомих середньому фахівцю в даній галузі техніки. Вирази "підвищена біологічна доступність" або "поліпшення фармакокінетики," як використовується

в даному винаході, означають, що системна доступність першої сполуки, що вимірюється як AUC, C_{\max} , або C_{\min} у ссавця є більшою при спільному введенні із сполукою за даним винаходом, у порівнянні з відсутністю такого спільного введення.

Терміни "введення", "вводити", "доза" та "дозування," як використовується в даному винаході, стосуються доставки сполуки або її фармацевтично прийнятної солі або сольвату, або фармацевтичної композиції, яка містить сполуку, або її фармацевтично прийнятну сіль або сольват, ссавцю таким чином, щоб сполука абсорбувалася в сироватку або плазму ссавця.

Терміни "спільне введення" або "спільно вводять," як використовується в даному винаході, стосується введення комбінації першої сполуки та сполуки за даним винаходом або її фармацевтично прийнятної солі або сольвату. Таке спільне введення може здійснюватися таким чином, що перша сполука і сполука за даним винаходом є частиною тієї самої композиції або частиною тієї самої одиначної дозованої форми. Спільне введення також включає окреме введення першої сполуки та сполуки за даним винаходом, але як частини тієї самої схеми лікування. Два компоненти, якщо вони вводять окремо, необов'язково повинні вводитися по суті в той самий час, хоча можуть вводитися одночасно, якщо це є бажаним. Таке спільне введення включає, наприклад, введення першої сполуки та сполуки за даним винаходом в вигляді окремих доз або дозованих форм, але в один і той самий час. Спільне введення також включає окреме введення в різні часові проміжки та в будь-якій послідовності.

Терміни "фармацевтично прийнятний лікарський засіб" або "фармацевтична композиція," як використовується в даному винаході, означає комбінацію сполуки за винаходом, або її фармацевтично прийнятної солі або сольвату, та носія, розріджувача, та/або наповнювачів, які сумісні із сполукою за даним винаходом, та нешкідливі для її реципієнта. Лікарські засоби можуть бути приготовлені за допомогою методик, відомих фахівцю в даній галузі техніки. Наприклад, сполуки за даним винаходом можуть бути приготовлені у вигляді лікарських засобів із звичайно використовуваними наповнювачами, розріджувачами або носіями та перетворені у форми таблеток, капсул тощо. Прикладами наповнювачів, розріджувачів та носіїв, які придатні для таких лікарських засобів, є наступні: наповнювачі та сухі розріджувачі, такі як крохмаль, цукри, маніт та кремнієві похідні; сполучні, такі як карбоксиметилцелюлоза та інші похідні целюлози, альгінати, желатин, та полівінілпіролідон; зволожувальні засоби, такі як гліцерин; дезінтегратори, такі як повідон, натрійкрохмальгліколят, натріюкарбоксиметилцелюлоза, агар-агар, карбонат кальцію та бікарбонат натрію; засоби для сповільнення розчинення, такі як парафін; підсилювачі ресорбції, такий четвертинні амонієві сполуки; поверхнево-активні речовини, такі як цетиловий спирт, моностеарат гліцерину; адсорбційні носії, такі як каолін та бентоніт; та змащувальні речовини, такі як тальк, стеарат кальцію і магнію та тверді поліе-

тиленгліколі. Кінцевими фармацевтичними формами можуть бути пілюлі, таблетки, порошки, пастилки, саше, облатки або стерильні упаковані порошки, та ін., залежно від типу використовуваного наповнювача. Додатково, спеціально передбачається, що фармацевтично прийнятні лікарські засоби за даним винаходом можуть містити більше одного активного компонента. Наприклад, такі лікарські засоби можуть містити більше однієї сполуки за даним винаходом. Альтернативно, такі лікарські засоби можуть містити одну або декілька сполук за даним винаходом та один або декілька додаткових засобів проти ВІЛ.

Термін "інгібування реплікації ВІЛ" означає інгібування реплікації вірусу імунодефіциту людини (ВІЛ) в клітині. Така клітина може знаходитися *in vitro*, або вона може знаходитися *in vivo*, наприклад, у ссавця, такого як людина. Таке інгібування може здійснюватися шляхом введення в клітину однієї або декількох сполук проти ВІЛ, наприклад, у ссавця, у кількості, що інгібує ВІЛ. Кількісне визначення інгібування реплікації ВІЛ в клітині, наприклад, у ссавця, може здійснюватися за допомогою методів, відомих фахівцю в даній галузі техніки. Наприклад, сполуку проти ВІЛ можна вводити ссавцю, окремо або як частину фармацевтично прийнятного лікарського засобу. Потім у ссавця можна відбирати зразки крові і визначати кількість вірусу ВІЛ у зразку, використовуючи методи, відомі фахівцю в даній галузі техніки. Зменшення кількості вірусу ВІЛ в зразку в порівнянні із кількістю, виявленою в крові перед введенням однієї або декількох сполук проти ВІЛ, буде свідчити про інгібування реплікації вірусу ВІЛ у ссавця. Введення в клітину однієї або декількох сполук проти ВІЛ, наприклад, ссавця, може здійснюватися у вигляді однократної дози або ряду доз. У випадку більше однієї дози, дози можуть вводитися в один день або вони можуть вводитися впродовж більше одного дня.

Терміни "сполука проти ВІЛ" та "засіб, який інгібує ВІЛ," як використовується в даному винаході, означає сполуку або комбінацію сполук, здатних інгібувати реплікацію ВІЛ у клітині, такий як клітина ссавця. Такі сполуки можуть інгібувати реплікацію ВІЛ за допомогою будь-якого механізму, відомого фахівцю в даній галузі техніки.

Терміни "кількість, яка інгібує вірус імунодефіциту людини," "кількість, яка інгібує ВІЛ," та "кількість, яка інгібує реплікацію ВІЛ," як використовується в даному винаході, стосується кількості сполуки проти ВІЛ, або її фармацевтично прийнятної солі сольвату, потрібної для інгібування реплікації вірусу імунодефіциту людини (ВІЛ) *in vivo*, наприклад, у ссавця, або *in vitro*. Кількість таких сполук, яка необхідна для отримання такого інгібування, може бути визначена експериментальним шляхом, використовуючи методи, описані в даній заявці, а також методи, відомі фахівцю в даній галузі техніки.

Терміни "терапевтично ефективна кількість" або "ефективна кількість," як використовується в даному винаході, означає кількість сполуки, яка при введенні ссавцю, який потребує такого лікування, є достатньою для ефективного лікування,

як описано в даній заявці. Таким чином, терапевтично ефективна кількість або ефективна кількість сполуки представляє собою кількість, достатню для модуляції або інгібування активності конкретного цільового ферменту або біологічного процесу, такого як хворобливий стан, який опосередковується активністю такого цільового ферменту або біологічний процес зменшується або полегшується. Прикладами модуляції або інгібування конкретного цільового ферменту або біологічного процесу є, але не обмежуючись лише ними, інгібування ферменту протеази ВІЛ та інгібування ферментів CYP450, таких як фермент CYP3A4.

Терміни "лікувати", "обробка", та "лікування" стосується будь-якого лікування будь-якого захворювання або стану у ссавця, переважно людини, і включає: (i) запобігання виникненню захворювання або стану у суб'єкта, який може бути схильний до стану, таким чином лікування включає профілактичне лікування патологічного стану; (ii) модуляцію або інгібування захворювання або стану, тобто, зупинку його розвитку; (iii) послаблення захворювання або стану, тобто, обумовлення регресії захворювання або стану; або (iv) послаблення та/або полегшення захворювання або стану або симптомів, які розвиваються внаслідок захворювання або стану, наприклад, послаблення запальної реакції-відповіді без впливу на основне захворювання або стан.

Терміни "резистентний," "стійкість," та "стійкий ВІЛ," як використовується в даному винаході, стосується вірусу ВІЛ, який проявляє зменшену чутливість до конкретного лікарського засобу. У ссавця, інфікованого ВІЛ, який резистентний до конкретного засобу проти ВІЛ або комбінації засобів, зазвичай проявляється збільшення вірусного навантаження ВІЛ, незважаючи на продовження введення засобу або засобів. Резистентність може бути генотипічною, що означає, що мутація відбувається в генетичному матеріалі ВІЛ, або фенотипічною, що означає, що резистентність проявляється значним ростом лабораторних культур вірусу ВІЛ в присутності засобу проти ВІЛ або комбінації таких засобів.

Терміни "інгібітор протеази" та "інгібітор протеази ВІЛ," як використовується в даному винаході, стосується сполук або комбінації сполук, які перешкоджають правильному функціонуванню ферменту протеази ВІЛ, який відповідає за розщеплення довгих ланцюгів вірусного білка на окремі білки, що утворюють серцевину вірусу.



Терміни "вірусне навантаження" та "навантаження вірусом ВІЛ," як використовується в даному винаході, означає кількість ВІЛ в циркулюючій крові ссавця, такого як людина. Кількість вірусу ВІЛ в крові ссавця може бути проаналізована шляхом визначення кількості РНК ВІЛ в крові за допомогою методів, відомих фахівцю в даній галузі.

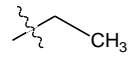
Термін, "сполука за даним винаходом" стосується будь-якої сполуки формули (I), включаючи сполуки, наведені в подальших прикладах, а також ті, які описані загально або ті, які описані конкретно. Термін також стосується фармацевтично прийнятних солей або сольватів цих сполук.

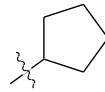
Докладний опис

Сполуки за даним винаходом можуть вводитися ссавцю, такому як людина, в комбінації із додатковою сполукою, таким чином, що посилюється вплив, або збільшується біологічна доступність додаткової сполуки, або поліпшується фармакокінетика додаткової сполуки у ссавця. Термін "вплив," як використовується в даному винаході, стосується концентрації додаткової або другої сполуки в плазмі ссавця, що вимірюється впродовж проміжку часу. Підвищення впливу додаткової або другої сполуки у ссавця можна визначити шляхом введення ссавцю спочатку додаткової або другої сполуки в підходящій формі та за відсутності введення сполуки за винаходом, відбору зразків плазми в заздалегідь визначені проміжки часу, та визначення кількості сполуки в плазмі, використовуючи підходящу аналітичну методику, таку як рідинна хроматографія або рідинну хроматографію в комбінації із мас-спектроскопією. Потім це ж дослідження повторюють, але при цьому сполуку за даним винаходом вводять спільно з додатковою або другою сполукою. Визначають кількість додаткової або другої сполуки, яка присутня в плазмі крові в певний період часу, та отримані дані концентрації залежно від часу для всіх зразків представляють графічно, отримуючи криву. Розраховують площу під кривою і оцінюють вплив сполуки на ссавця. Різниця в площях під кривою в присутності і за відсутності сполуки за даним винаходом дозволяє оцінити підвищення впливу додаткової або другої сполуки в плазмі ссавця. Терміни "вплив," "площа під кривою," та "площа під кривою концентрація/час" мають ідентичні значення і в даній заявці можуть застосовуватися взаємозамінювано.

Таке спільне введення ссавцю сполуки за даним винаходом і другої або додаткової сполуки, як описано вище, може здійснюватися так, що сполука або сполуки за даним винаходом були присутні в тому ж лікарському засобі, що і додаткові агенти, описані вище. Альтернативно, така комбінація може вводитися в такий спосіб, що сполука або сполуки за даним винаходом присутні в лікарському засобі, який відділений від лікарського засобу, в якому знаходиться додатковий агент. Якщо сполука або сполуки за даним винаходом вводяться окремо від додаткового агента, то таке введення може здійснюватися в один і той же проміжок часу або послідовно з підходящим періодом часу між ними. Прийняття рішення про включення сполуки або сполук за даним винаходом в один і той самий лікарський засіб, що й додатковий (і) агент або агенти, знаходиться в компетенції середнього фахівця в даній галузі техніки.

Відповідно до правил, які використовуються в даній галузі, символ  застосовується в структурних формулах в даному винаході для зображення зв'язку, який є точкою приєднання частини або замісника до ядра або структури основного ланцюга. Відповідно до іншого правила, в деяких структурних формулах в даному винаході атоми вуглецю та зв'язані з ними атоми водню докладно не зображені, наприклад,  означає мети-

льну групу,  означає етильну групу,

 означає цикlopентильну групу, тощо

Термін "стереоізомери" стосується сполук, які мають однаковий хімічний склад, але відрізняються розташуванням їх атомів або груп в просторі. Зокрема, термін "енантіомери" стосується двох стереоізомерів сполуки, які є дзеркальними зображеннями, які не накладаються одне на одне. Терміни "рацемічний" або "рацемічна суміш," як використовується в даному винаході, стосується суміші 1:1 енантіомерів конкретної сполуки. З іншої сторони, термін "діастереомери" стосується взаємозв'язку між парою стереоізомерів, яка містить два або більше асиметричних центрів і не є дзеркальними зображенням один одного.

Сполуки за даним винаходом можуть мати асиметричні атоми вуглецю. В даному винаході зв'язки в сполуках за даним винаходом можуть зображуватися за допомогою суцільної лінії (—), суцільного клину (▴), або пунктирного клину (⋯). Застосування суцільної лінії для зображення зв'язків від асиметричних атомів вуглецю вказує на те, що охоплюються всі можливі стереоізомери на цьому атомі вуглецю. Застосування або суцільного або пунктирного клину для зображення зв'язків від асиметричних атомів вуглецю означає, що охоплюється лише вказаний стереоізомер. Можливо, що сполуки за винаходом можуть містити більше одного асиметричного атома вуглецю. В цих сполуках, застосування суцільної лінії для зображення зв'язків від асиметричних атомів вуглецю вказує на те, що охоплюються всі можливі стереоізомери. Застосування суцільної лінії для зображення зв'язків від одного або декількох асиметричних атомів вуглецю в сполуці за винаходом та застосування суцільного або пунктирного клину для зображення зв'язків від інших асиметричних атомів вуглецю в цій же сполуці означає, що представлена суміш діастереомерів.

Якщо застосовуване похідне в способі за винаходом представляє собою основу, то бажана сіль може бути приготовлена за допомогою будь-якого способу, відомого в даній галузі, включаючи обробку вільної основи неорганічною кислотою, такою як соляна кислота; бромистоводнева кислота; сірчана кислота; азотна кислота; фосфорна кислота та інші, або з органічною кислотою, такою як оцтова кислота; малеїнова кислота; янтарна кислота; мигдалева кислота; фумарова кислота; малінова кислота; піровиноградна кислота; щавлева кислота; гліколева кислота; саліцилова кислота; піранозидильна кислота, така як глюкуронова або галактуринова кислота; альфа-гідрокси кислота, така як лимонна кислота або винна кислота; амінокислота, така як аспарагінова кислота або глутамінова кислота; ароматична кислота, така як бензойна кислота або корична кислота; сульфенова кислота, така як п-толуолсульфенова кислота або етансульфенова кислота; та ін.

Якщо застосовуване похідне в способі за винаходом представляє собою кислоту, то бажана

сіль може бути приготовлена за допомогою будь-якого способу, відомого в даній галузі, включаючи обробку вільної кислоти неорганічною або органічною основою, такою як амін (первинний, вторинний або третинний); гідроксид лужного металу або лужноземельного металу; або подібні. Прикладами придатних солей є органічні солі, похідні амінокислот, таких як гліцин та аргінін; аміаку; первинного, вторинного та третинного аміну; та циклічних амінів, таких як піперидин, морфолін, та піперазин; а також неорганічні солі, похідні натрію, кальцію, калію, магнію, марганцю, заліза, міді, цинку, алюмінію та літію.

"Сольват" означає фармацевтично прийнятний сольват, утворений конкретною сполукою, який зберігає біологічну ефективність такої сполуки. Прикладами сольватів є, але не обмежуючись лише ними, сполуки за винаходом в комбінації з водою, ізопропанолом, етанолом, метанолом, диметилсульфоксидом (ДМСО), N,N-диметилформамідом (ДМФА), етилацетатом, оцтовою кислотою, етаноламіном або їх сумішами.

"Фармацевтично прийнятна сіль" означає сіль, яка зберігає біологічну ефективність вільних кислот та основ конкретного похідного, що містить фармакологічно прийнятні аніони і не є біологічно чи іншим чином небажаним. Прикладами фармацевтично прийнятних солей є, але не обмежуючись лише ними, такі солі, як ацетат, акрилат, бензолсульфонат, бензоат (такий як хлорбензоат, метилбензоат, динітробензоат, гідроксibenзоат, та метоксibenзоат), бікарбонат, бісульфат, бісульфіт, бітарtrat, борат, бромід, бутин-1,4-діоат, едетат кальцію, камзилат, карбонат, хлорид, капроат, каприлат, клавуланат, цитрат, деканоат, дигідрохлорид, дигідрофосфат, едетат, едисліат, естолат, езилат, етилсукцинат, форміат, фумарат, глюцептат, глюконат, глуматат, гліколат, гліколіларсанілат, гептаноат, гексин-1,6-діоат, гексилрезорцинат, гідрабамін, гідробромід, гідрохлорид, γ-гідроксибутират, йодид, ізобутират, ізотіонат, лактат, лактобіонат, лаурат, малат, малеат, малонат, манделат, мезилат, метафосфат, метансульфонат, метилсульфат, моногідрофосфат, мукат, напсилат, нафталін-1-сульфонат, нафталін-2-сульфонат, нітрат, олеат, оксалат, памоат (ембонат), пальмітат, пантотенат, фенілацетати, фенілбутират, фенілпропіонат, фталат, фосфат/дифосфат, полігалатуронат, пропансульфонат, пропіонат, пропіолат, пірофосфат, піросульфат, саліцилат, стеарат, субацетат, суберат, сукцинат, сульфат, сульфонат, сульфід, танат, тарtrat, теоклат, тозилат, триетіодод та валерат.

Сполуки за даним винаходом, які за своєю природою є основними, здатні утворювати багато різноманітних солей з різними неорганічними та органічними кислотами. Хоча для введення тваринам такі солі повинні бути фармацевтично прийнятними, часто на практиці бажаним є спочатку виділення сполуки за даним винаходом із реакційної суміші у вигляді фармацевтично неприйнятної солі і потім легко перетворити її назад у вільну основу сполуки за винаходом шляхом обробки лужним реагентом і після цього перетворити її вільну ос-

нову в фармацевтично прийнятну сіль приєднання кислоти. Солі приєднання кислоти основних сполук за даним винаходом можуть бути отримані шляхом обробки основної сполуки із по суті еквівалентною кількістю вибраної мінеральної або органічної кислоти в середовищі водного розчинника або в підходящому органічному розчиннику, такому як метанол або етанол. Після упарювання розчинника отримують бажану тверду сіль. Бажану сіль кислоти також можна осадити з розчину вільної основи в органічному розчиннику шляхом додавання до розчину підходящої мінеральної або органічної кислоти.

Ті сполуки за даним винаходом, які за своєю природою є кислотними, здатні утворювати основні солі з різноманітними фармакологічно прийнятними катіонами. Прикладами таких солей є солі лужних металів або лужноземельних металів і переважно солі натрію та калію. Всі ці солі готують за допомогою загальноприйнятого методу. Хімічними основами, які застосовуються як реагенти для приготування фармацевтично прийнятних основних солей за даним винаходом, є ті основи, які утворюють нетоксичні солі основ із кислотними сполуками за даним винаходом. Такі нетоксичні основні солі включають солі, які є похідними таких фармакологічно прийнятних катіонів, як натрій, калій, кальцій та магній, тощо. Ці солі можуть бути отримані шляхом обробки відповідних кислотних сполук із водним розчином, який містить бажані фармакологічно прийнятні катіони, і потім упарювання насухо отриманого розчину, переважно при зниженому тиску. Альтернативно, вони також можуть бути приготовлені шляхом змішування разом нижчих алканольних розчинів кислотних сполук та бажаного алкоголяту лужного металу, і подальшого упарювання насухо отриманого розчину аналогічно до описаного вище. В будь-якому випадку, для забезпечення повного здійснення реакції та максимальних виходів бажаного кінцевого продукту переважно застосовують стехіометричні кількості реагентів.

Якщо сполука за винаходом є основою, то бажана фармацевтично прийнятна сіль може бути отримана за допомогою будь-якого прийнятного методу, доступного в даній галузі, наприклад, обробкою вільної основи неорганічною кислотою, такою як соляна кислота, бромистоводнева кислота, сірчана кислота, азотна кислота, фосфорна кислота та ін., або з органічною кислотою, такою як оцтова кислота, малеїнова кислота, янтарна кислота, мигдалева кислота, фумарова кислота, маленова кислота, піровиноградна кислота, щавлева кислота, гліколева кислота, саліцилова кислота, піранозидильна кислота, така як глюкуронова кислота або галактуринова кислота, альфа-гідрокси кислота, така як лимонна кислота або винна кислота, амінокислота, така як аспарагінова кислота або глутамінова кислота, ароматична кислота, така як бензойна кислота або корична кислота, сульфенова кислота, така як п-толуолсульфенова кислота або етансульфенова кислота, або подібні.

Якщо сполука за винаходом представляє собою кислоту, то бажана фармацевтично прийнятна

на сіль може бути отримана за допомогою будь-якого придатного методу, наприклад, шляхом обробки вільної кислоти неорганічною або органічною основою, такою як амін (первинний, вторинний або третинний), гідроксид лужного металу або лужноземельного металу, або подібні. Ілюстративні приклади підходящих солей включають органічні солі, похідні амінокислот, таких як гліцин та аргінін, аміаку, первинних, вторинних та третинних амінів, та циклічних амінів, таких як піперидин, морфолін та піперазин, та неорганічні солі, похідні натрію, кальцію, калію, магнію, марганцю, заліза, міді, цинку, алюмінію та літію.

У випадку агентів, як є твердими, для спеціаліста в даній галузі техніки є очевидним, що сполуки, агенти та солі за винаходом можуть існувати у різних кристалічних або поліморфних формах, всі ці форми підпадають під обсяг даного винаходу та охоплюються формулами.

Сполуки за даним винаходом можуть бути приготовлені у вигляді фармацевтичних композицій, як описано нижче, у будь-якій фармацевтичній формі, яку фахівець в даній галузі техніки буде вважати придатною. Фармацевтичні композиції за винаходом включають терапевтично ефективну кількість принаймні однієї сполуки за даним винаходом та інертний, фармацевтично прийнятний носій або розріджувач.

Застосовувані фармацевтичні носії можуть бути твердими або рідкими. Прикладами твердих носіїв є лактоза, сахароза, тальк, желатин, агар, пектин, гуміарабік, стеарат магнію, стеаринова кислота і подібні. Прикладами рідких носіїв є сироп, арахісова олія, оливкова олія, вода і інші. Аналогічно, композиції за винаходом можуть включати речовину для сповільнення вивільнення або затриманням вивільнення, відому в даній галузі, таку як гліцерилмоностеарат або гліцерилдистеарат окремо або з воском, етилцелюлозою, гідроксипропілметилцелюлозою, метилметакрилатом або подібними. Для отримання бажаних властивостей лікарських засобів можна додавати інші допоміжні речовини або наповнювачі. Наприклад, можна додавати посилювач біологічної доступності, такий як Labrasol®, Gelucire® або подібні, або формулятор, такий як СМС (карбоксиметилцелюлоза), РG (пропіленгліколь), або РEG (поліетиленгліколь). При приготуванні лікарського засобу у вигляді капсули можна додавати, наприклад, Gelucire®, напівтвердий наповнювач, який захищає активні компоненти від дії світла, вологи та окислення.

Якщо застосовується твердий носій, то склад може бути таблетовано, поміщено у тверду желатинову капсулу у вигляді порошку або пелети, або приготовлено у формі пілюлі або пастилки. Кількість твердого носія може змінюватися, але, як правило, знаходиться в інтервалі від приблизно 25 мг до приблизно 1 г. Якщо застосовується рідкий носій, то препарат може бути в формі сиропу, емульсії, твердої желатинової капсули, стерильного розчину для ін'єкції або суспензії в ампулі або флаконі або неводної рідкої суспензії. Якщо застосовують напівтвердий носій, то лікарський препарат може бути у формі твердої або м'якої желати-

нової капсули. Композиції за винаходом приготовляють у одиничній дозованій формі, підходящій для способу введення, наприклад, парентерально-го або перорального введення.

Для отримання придатної розчинної у воді дозованої форми, фармацевтично прийнятна сіль сполуки за даним винаходом може бути розчинена у водному розчині органічної або неорганічної кислоти, такому як 0,3 М розчин янтарної кислоти або лимонної кислоти. Якщо розчинна форма солі недоступна, то агент може бути розчинено в придатному співрозчиннику або комбінації співрозчинників. Прикладами придатних співрозчинників є спирт, пропіленгліколь, поліетиленгліколь 300, полісорбат 80, гліцерин та подібні в концентрації в діапазоні 0-60% загального об'єму. В типовому варіанті здійснення, сполуку формули I розчиняли в ДМСО та розводили водою. Композиція також може бути представлена у вигляді розчину сольової форми активного компонента в підходящому водному наповнювачі, такому як вода або ізотонічний сольовий розчин або розчин декстрози.

Підходящий лікарський препарат залежить від вибраного шляху введення. Для ін'єкції, агенти сполук за даним винаходом можуть бути приготовлені у водних розчинах, переважно в фізіологічно сумісних буферах, таких як розчин Хенка, розчин Рінгера, або фізіологічний сольовий розчин. Для трансмукозального введення, в препараті застосовують пенетранти, підходящі для проникнення через бар'єр. Такі пенетранти добре відомі в даній галузі техніки.

Для перорального введення, сполуки можуть бути приготовлені у вигляді лікарських засобів шляхом об'єднання активних сполук із фармацевтично прийнятними носіями, відомими в даній галузі. Такі носії забезпечують можливість приготування сполук за винаходом у вигляді лікарських засобів, таких як таблетки, пілюлі, драже, капсули, рідини, гелі, сиропи, зависі, суспензії і подібні, для перорального прийому всередину суб'єктом, якого лікують. Фармацевтичні препарати для перорального застосування можуть бути отримані при використанні твердого наповнювача в суміші із активним компонентом (агентом), необов'язково подрібнення отриманої суміші, та переробки суміші гранул після додавання придатних допоміжних речовин, якщо це бажано, для отримання таблеток або ядер драже. Придатними ексципієнтами є: наповнювачі, такі як цукри, включаючи лактозу, сахарозу, маніт або сорбіт; та препарати целюлози, наприклад, кукурудзяний крохмаль, пшеничний крохмаль, рисовий крохмаль, картопляний крохмаль, желатин, камедь, метил целюлоза, гідроксипропілметил-целюлоза, натрійкарбоксиметилцелюлоза, або полівінілпіролідон (PVP). Якщо це є бажаним, то можна добавляти дезінтеруючі засоби, такі як перехреснозв'язаний полівінілпіролідон, агар або альгінова кислота або її сіль, така як альгінат натрію.

Ядра драже забезпечуються придатними покриттями. Для цього можна застосовувати концентровані розчини цукрів, які необов'язково можуть містити аравійську камедь, полівінілпіролідон, гель Карбопол, поліетиленгліколь, та/або діоксид тита-

ну, лакові розчини та придатні органічні розчинники або суміші розчинників. До покриття таблеток або драже можна додавати барвники або пігменти для ідентифікації або характеристики різних комбінацій активних агентів.

Фармацевтичні препарати, які можуть застосовуватися перорально, включають вставні капсули, виготовлені із желатину, а також м'які, запечатані капсули, виготовлені із желатину і пластифікатора, такого як желатин або гліцерин. Вставні капсули можуть містити активні компоненти, змішані із наповнювачами, такі як лактоза, сполучними, такими як крохмалі, та/або змащувальними речовинами, такими як тальк або стеарат магнію, і, необов'язково, стабілізаторами. В м'яких капсулах, активні агенти можуть бути розчинені або суспендовані в підходящих рідинах, таких як жирні масла, рідкий парафін, або рідкі поліетиленгліколи. Додатково можна додавати стабілізатори. Всі лікарські препарати для перорального введення повинні бути представлені в дозованих формах, придатних для такого введення. Для букального введення, композиції можуть знаходитися в формі таблеток або пастилок, приготовлених загальноприйнятним способом.

Для інтраназального або інгаляційного введення, сполуки для застосування відповідно до даного винаходу легко можуть бути доставлені у формі аерозольного спрею, який розпилюється із упаковок, що знаходяться під тиском, або розпилювача, із застосуванням придатного пропеленту, наприклад, дихлордифторметану, трихлорфторметану, дихлортетрафторетану, вуглекислого газу або іншого придатного газу. У випадку аерозолію під тиском одиниця дозування може бути визначена за допомогою клапана, який доставляє дозовану кількість. Капсули та картриджі желатину для застосування в інгаляторі або інсуфляторі та подібних можуть бути приготовлені у вигляді лікарських засобів, які містять порошкову суміш сполуки та придатної порошкової основи, такої як лактоза або крохмаль.

Сполуки можуть бути приготовлені у вигляді лікарських засобів для парентерального введення шляхом ін'єкції, наприклад, болюсної ін'єкції або безперервної інфузії. Лікарські препарати для ін'єкції можуть знаходитися в одиничній дозованій формі, наприклад, в ампулах або в багатодозових контейнерах, і до них додають консервант. Композиції можуть бути приготовлені в таких формах, як суспензії, розчини або емульсії в масляних або водних наповнювачах, і можуть містити засоби для приготування рецептур, такі як суспендуєчі, стабілізуючі та/або диспергувальні агенти.

Фармацевтичні препарати для парентерального введення включають водні розчини активних сполук у водорозчинній формі. Додатково, суспензії активних компонентів можуть бути приготовлені у вигляді підходящих масляних суспензій для ін'єкцій. Підходящі ліпофільні розчинники або наповнювачі включають скрідні масла, такі як кунжутну олію, або синтетичні складні ефіри жирних кислот, такі як етилолеат або тригліцериди, або ліпосоми. Водні суспензії для ін'єкцій можуть містити речовини, які підвищують в'язкість суспензії,

такі як найтрійкарбоксиметилцелюлоза, сорбіт або декстран. Необов'язково, суспензія також може містити придатні стабілізатори або засоби, які підвищують розчинність сполук, для забезпечення утворення висококонцентрованих розчинів.

Альтернативно, активний компонент може знаходитися в порошковій формі для утворення препарату перед застосуванням із придатним наповнювачем, наприклад, стерильною апірогенною водою.

Додатково до лікарських засобів, описаних вище, сполуки за даним винаходом можуть бути приготовлені у вигляді депо-препаратів. Такі лікарські засоби тривалої дії можуть вводитися шляхом імплантації (наприклад, підшкірно або внутрішньом'язово) або шляхом внутрішньом'язової ін'єкції. Таким чином, наприклад, сполуки можуть бути приготовлені із придатними полімерними або гідрофобними речовинами (наприклад, у вигляді емульсії у прийнятному маслі) або іонообмінними смолами, або у вигляді важкорозчинних похідних, наприклад, у вигляді важкорозчинної солі.

Фармацевтичним носієм для гідрофобних сполук є система співрозчинників, яка містить бензиловий спирт, неполярну поверхнево-активну речовину, змішуваний з водою органічний полімер та водну фазу. Система співрозчинників може представляти собою VPD систему співрозчинників. VPD представляє собою розчин 3% мас./об. бензилового спирту, 8% мас./об. неполярної поверхнево-активної речовини полісорбат 80, та 65% мас./об. поліетиленгліколю 300, доведені до певного об'єму в абсолютному етанолі. Система співрозчинників VPD (VPD: 5W) містить VPD, розведений 1:1 5% декстозою у водному розчині. Ця система співрозчинників добре розчиняє гідрофобні сполуки, і сама ж низькотоксичною при системному введенні. Співвідношення системи співрозчинників підходяще може змінюватися без порушення властивостей її розчинності та токсичності. Крім того, компоненти системи співрозчинників можна змінювати на ідентичні: наприклад, замість полісорбату 80 можуть застосовуватися інші низькотоксичні неполярні поверхнево-активні речовини; розмір фракції поліетиленгліколю може змінюватися; замість поліетиленгліколю можна застосовувати інший біосумісний полімер, наприклад, полівінілпіролідон; та замість декстози можуть застосовуватися інші цукри або полісахариди.

Альтернативно, для гідрофобних фармацевтичних сполук можна застосовувати інші системи доставки. Ліпосоми та емульсії є відомими засобами доставки або носіями для гідрофобних лікарських засобів. Також можна застосовувати певні органічні розчинники, такі як диметилсульфоксид, хоча, як правило, це супроводжується підвищенням токсичності внаслідок токсичної природи ДМСО. Додатково, сполуки можуть доставлятися за допомогою системи із сповільненим вивільненням, такої як напівпроникні матриці твердих гідрофобних полімерів, що містять терапевтичний засіб. Випускаються різноманітні речовини для сповільненого вивільнення і вони відомі фахівцю в даній галузі. Капсули із сповіль-

ним вивільненням, залежно від їх хімічної природи, можуть вивільняти сполуки впродовж періоду часу від декількох тижнів аж до 100 днів. Залежно від хімічної природи та біологічної стабільності терапевтичного реагенту можна застосовувати додаткові стратегії для стабілізації білка.

Фармацевтичні композиції також можуть містити придатні носії або наповнювачі для твердої фази або гелевої фази. Такі носії та наповнювачі можуть забезпечити суттєве поліпшення біологічної доступності важкорозчинних лікарських засобів. Прикладами таких носіїв або наповнювачів є карбонат кальцію, фосфат кальцію, цукри, крохмалі, похідні целюлози, желатин і полімери, такі як поліетиленгліколі. Крім того, можна застосовувати допоміжні речовини, такі як Gelucire®, Capryol®, Labrafil®, Labrasol®, Lauroglycol®, Plurol®, Pcecol®, Transcutol® і подібні. Крім того, фармацевтична композиція може бути інкорпорована в трансдермальний пластр для доставки лікарського засобу безпосередньо через шкіру.

Також слід врахувати, що фактичні дози засобів за даним винаходом можуть суттєво змінюватися залежно від конкретного використовуваного засобу, конкретної приготовленої композиції, способу введення і переважної ділянки, господаря, та захворювання, яке піддається лікуванню. Фахівці в даній галузі техніки за допомогою загальноприйнятих тестів для визначення доз з урахуванням експериментальних даних для даної сполуки можуть встановити оптимальні дози для даного набору станів. Для перорального введення, типова добова доза, що звичайно застосовується, буде становити від приблизно 0,001 до приблизно 1000 мг/кг маси тіла, яка повторюється курсами лікування через підходящі інтервали.

Крім того, фармацевтично прийнятні лікарські засоби за даним винаходом можуть містити сполуку за даним винаходом, або її фармацевтично прийнятну сіль або сольват, в кількості від приблизно 10 мг до приблизно 2000 мг, або від приблизно 10 мг до приблизно 1500 мг, або від приблизно 10 мг до приблизно 1000 мг, або від приблизно 10 мг до приблизно 750 мг, або від приблизно 10 мг до приблизно 500 мг, або від приблизно 25 мг до приблизно 500 мг, або від приблизно 50 до приблизно 500 мг, або від приблизно 100 мг до приблизно 500 мг.

Додатково, фармацевтично прийнятні лікарські засоби за даним винаходом можуть містити сполуку за даним винаходом, або її фармацевтично прийнятну сіль або сольват, в кількості від приблизно 0,5 мас.% до приблизно 95 мас.%, або від приблизно 1 мас.% до приблизно 95 мас.%, або від приблизно 1 мас.% до приблизно 75 мас.%, або від приблизно 5 мас.% до приблизно 75 мас.%, або від приблизно 10 мас.% до приблизно 75 мас.%, або від приблизно 10 мас.% до приблизно 50 мас.%.

Для лікування або профілактики захворювань або станів, опосередковуваних ВІЛ, фармацевтичну композицію за винаходом у вигляді прийнятного лікарського засобу вводять в комбінації принаймні з одним засобом проти ВІЛ. Комбіновані препарати сполуки за даним винаходом та принаймні за-

собою проти ВІЛ можуть бути приготовлені шляхом об'єднання терапевтично ефективною кількістю (тобто кількістю, яка інгібує цитохром Р450) принаймні однієї сполуки за даним винаходом (як активного компонента) із одним або декількома засобами проти ВІЛ і принаймні одним фармацевтично прийнятним носієм, який може бути вибраний, наприклад, із розріджувачів, наповнювачів та допоміжних речовин, які полегшують процес переробки активних сполук в кінцеві фармацевтичні препарати.

Альтернативно, для лікування або профілактики захворювань або станів, які опосередковуються ВІЛ, фармацевтичну композицію за винаходом у вигляді прийнятного лікарського засобу вводять одночасно із принаймні одним засобом проти ВІЛ, який знаходиться в окремому, фармацевтично прийнятному препараті. Така схема дозування може бути створена таким чином, щоб сполука за даним винаходом вводилася ссавцю, інфікованому ВІЛ, перед, одночасно із, або після введення фармацевтичного препарату, який містить принаймні один засіб проти ВІЛ. Фармацевтично прийнятний препарат сполуки за даним винаходом може бути приготовлений шляхом об'єднання сполуки і принаймні одного фармацевтично прийнятного носія, який може бути вибраний, наприклад, із розріджувачів, наповнювачів та допоміжних речовин, які полегшують процес переробки активних сполук в кінцеві фармацевтичні препарати.

Сполуки за даним винаходом або їх фармацевтично прийнятна сіль або сольват можуть вводитися ссавцю, який страждає від інфекції, викликані ВІЛ, такому як людина, або окремо або як частина фармацевтично прийнятного препарату, один раз на добу, два рази на добу, або три рази на добу в комбінації із засобом проти ВІЛ.

Для фахівців в даній галузі техніки зрозуміло, що з урахуванням сполук за даним винаходом, переважний фармацевтичний препарат, дозування, та кількість доз на добу для ссавця, який потребує такого лікування, та вибір переважного (их) засобу (ів) проти ВІЛ всі вибирають на основі знань середнього фахівця в даній галузі і можуть бути здійснені без надмірних експериментів. Наприклад, див. "Guidelines for the Use of Antiretroviral Agents in HIV-1 Infected Adults and Adolescents", United States Department of Health and Human Services, доступна на <http://www.aidsinfo.nih.gov/guidelines/> від 16 квітня 2004 р.

Сполуки за даним винаходом можуть вводитися в комбінації із додатковим (ми) засобом (ами) для лікування ссавця, такого як людина, який страждає від інфекції, викликані вірусом ВІЛ, СНІДу, зв'язаного зі СНІДом комплексу (ARC), або будь-якого іншого захворювання або стану, яке (ий) зв'язане (ий) із інфікуванням вірусом ВІЛ. Засоби, які можуть використовуватися в комбінації зі сполуками за даним винаходом, включають, але не обмежуючись лише ними, засоби, корисні як інгібітори протеази ВІЛ, інгібітори зворотної транскриптази ВІЛ, нуклеозидні інгібітори зворотної транскриптази ВІЛ, інгібітори інтегрази ВІЛ, інгібі-

тори CCR5, інгібітори злиття ВІЛ, сполуки, корисні як імуномодулятори, сполуки, які інгібують вірус ВІЛ за невідомим механізмом, сполуки, корисні для лікування вірусу герпесу, сполуки, корисні як протимікробні засоби, та інші засоби, описані нижче.

Сполуки, корисні як інгібітори протеази ВІЛ, які можуть застосовуватися в комбінації зі сполуками за даним винаходом, включають, але не обмежуючись лише ними, 141 W94 (ампренавір), CGP-73547, CGP-61755, DMP-450, нелфінавір, ритонавір, саквінавір (інвіраза), лопінавір, TMC-126, атазанавір, палінавір, GS-3333, KNI-413, KNI-272, LG-71350, CGP-61755, PD 173606, PD 177298, PD 178390, PD 178392, U-140690, ABT-378, DMP-450, AG-1776, MK-944, VX-478, індинавір, типранавір, дарунавір, бреканавір, DPC-681, DPC-684, фозампренавір кальцію (Lexiva), похідні бензолсульфонамідів, описані в WO 03053435, R-944, Ro-03-34649, VX-385, GS-224338, OPT-TL3, PL-100, SM-309515, AG-148, DG-35-VIII, DMP-850, GW-5950X, KNI-1039, L-756423, LB-71262, LP-130, RS-344, SE-063, UIC-94-003, Vb-19038, A-77003, BMS-182193, BMS-186318, SM-309515, JE-2147, GS-9005, та (4R)-N-аліл-3-((2S,3S)-2-гідрокси-3-((3-гідрокси-2-метилбензоїл)аміно)-4-фенілбутаноїл)-5,5-диметил-1,3-тіазолідин-4-карбоксамід.

Сполуки, корисні як інгібітори ферменту зворотної транскриптази ВІЛ, які можуть застосовуватися в комбінації зі сполуками за даним винаходом, включають, але не обмежуючись лише ними, абакавір, FTC, GS-840, ламівудин, адефовір дипівоксил, бета-фтор-ddA, залцитабін, диданозин, ставудин, зидовудин, тенофовір, амдоксовір, SPD-754, SPD-756, рацивір, реверсет (DPC-817), MIV-210 (FLG), бета-L-Fd4C (ACH-126443), MIV-310 (аловудин, FLT), dOTC, DAPD, ентекавір, GS-7340, емтрицитабін та аволудин.

Сполуки, корисні як нуклеозидні інгібітори ферменту зворотної транскриптази ВІЛ, які можуть застосовуватися в комбінації зі сполуками за даним винаходом, включають, але не обмежуючись лише ними, ефавіренс, HBY-097, невірапін, TMC-120 (дапівірин), TMC-125, етравірин, делавірдин, DPC-083, DPC-961, TMC-120, каправірин, GW-678248, GW-695634, каланолід, та трициклічні похідні піримідину, описані в WO 03062238.

Сполуки, корисні як інгібітори CCR5, які можуть застосовуватися в комбінації зі сполуками за даним винаходом, включають, але не обмежуючись лише ними, TAK-779, SC-351125, SCH-D, (N-((1S)-3-[3-ізопропіл-5-метил-4H-1,2,4-триазол-4-іл]-екзо-8-азабіцикло[3,2,1]окт-8-ил)-1-фенілпропіл)-4,4-дифторциклогексанкарбоксамід), етил 1-ендо-8-((3S)-3-(ацетиламіно)-3-(3-фторфеніл)пропіл)-8-азабіцикло[3,2,1]окт-3-ил)-2-метил-4,5,6,7-тетрагідро-1H-імідазо[4,5-с]піридин-5-карбоксилат, N-((1S)-3-[3-ендо-(5-ізобутирил-2-метил-4,5,6,7-тетрагідро-1H-імідазо[4,5-с]піридин-1-іл)-8-азабіцикло[3,2,1]окт-8-ил]-1-(3-фторфеніл)пропіл)ацетамід), PRO-140, та GW-873140 (Ono-4128, AK-602).

Сполуки, корисні як інгібітори ферменту інтегрази ВІЛ, які можуть застосовуватися в комбінації зі сполуками за даним винаходом, включають, але

не обмежуючись лише ними, GW-810781, похідні 1,5-нафтиридин-3-карбоксаміду, описані в WO 03062204, сполуки, описані в WO 03047564, сполуки, описані в WO 03049690, та похідні 5-гідроксипіримідин-4-карбоксаміду, описані в WO 03035076.

Інгібітори злиття для лікування ВІЛ, які можуть застосовуватися в комбінації зі сполуками за даним винаходом, включають, але не обмежуючись лише ними, енфувіриділ (T-20), T-1249, AMD-3100, та конденсовані трициклічні сполуки, описані в JP 2003171381.

Інші сполуки, корисні як інгібітори ВІЛ, які можуть застосовуватися в комбінації зі сполуками за даним винаходом, включають, але не обмежуючись лише ними, розчинний CD4, TNX-355, PRO-542, BMS-806, тенофовір дизопроксил фумарат, та сполуки, описані в JP 2003119137.

Сполуки, корисні для лікування або терапії інфекції, викликані вірусами, які відрізняються від ВІЛ, що можуть застосовуватися в комбінації зі сполуками за даним винаходом, включають, але не обмежуючись лише ними, ацикловір, фомівірсен, пенцикловір, HPMPС, оксетаноцин G, AL-721, цидофовір, імуноглобін цитомегаловірусу, цитовен, фомівганцикловір, фамцикловір, фоскарнет натрію, Isis 2922, KNI-272, валацикловір, віразол рибавірин, валганцикловір, ME-609, PCL-016.

Сполуки, які діють як імуномодулятори і можуть застосовуватися в комбінації зі сполуками за даним винаходом, включають, але не обмежуючись лише ними, AD-439, AD-519, альфа-інтерферон, AS-101, бропіримін, ацеманан, CL246,738, EL10, FP-21399, гамма-інтерферон, фактор стимуляції колонії гранулоцитів-макрофагів, IL-2, внутрішньовенний імуноглобулін, IMREG-1, IMREG-2, імутиол діетилдитіокарбамат, альфа-2 інтерферон, метіонін-енкефалін, MTP-PE, фактор стимуляції колонії гранулоцитів, ремун, rCD4, рекомбінантний розчинний CD4 людини, інтерферон альфа-2, SK&F106528, розчинний T4 тимопентин, фактор некрозу пухлин (TNF), тукарезол, рекомбінантний бета-інтерферон людини, та інтерферон альфа n-3.

Протиінфекційні засоби, які можуть застосовуватися в комбінації зі сполуками за даним винаходом, включають, але не обмежуючись лише ними, атовакоїн, азитроміцин, кларитроміцин, триметоприм, тровафлоксацин, піриметамін, даунорубіцин, кліндаміцин з примахіном, флуконазол, пастил, орнідил, ефлорнітин пентамідин, рифабутин, спіраміцин, інтраконазол-R51211, триметрексат, даунорубіцин, рекомбінантний еритропоетин людини, рекомбінантний гормон росту людини, мегестрол ацетат, тестостерон, та повністю кишкове живлення.

Протигрибкові засоби, які можуть застосовуватися в комбінації зі сполуками за даним винаходом, включають, але не обмежуючись лише ними, анідулафунгін, C31G, каспофунгін, DB-289, флуконазол, ітраконазол, кетоназол, мікафунгін, позаконазол та воріконазол.

Інші сполуки, які можуть застосовуватися в комбінації зі сполуками за даним винаходом, включають, але не обмежуючись лише ними, ак-

манан, анзаміцин, LM 427, AR177, BMS-232623, BMS-234475, CI-1012, курдлан сульфат, декстран сульфат, STOCRINE EL10, гіперіцин, лобукавір, новапрен, послідовність пептид Т октапептид, тринатрій фосфоноформіат, пробукол, та RBC-CD4.

Додатково, сполуки за даним винаходом можуть застосовуватися в комбінації із антипроліферативними засобами для лікування таких станів, як саркома Капоши. Такі засоби включають, але не обмежуючись лише ними, інгібітори матриксних металопротеаз, A-007, бевацизумаб, BMS-275291, галофугінон, інтерлейкін-12, ритуксимаб, паклітаксел, порфімер натрію, ребімастат, та COL-3.

Конкретний вибір додаткового засобу або додаткових засобів буде залежати від багатьох факторів, таких як, але не обмежуючись лише ними, стан ссавця, який піддається лікуванню, конкретний стан або стани, що піддаються лікуванню, ідентичність сполуки або сполук за даним винаходом та додаткового засобу або додаткових засобів, та ідентичність будь-яких додаткових сполук, які застосовуються для лікування ссавця. Конкретний вибір сполуки або сполук за винаходу та додаткового засобу або додаткових засобів знаходиться в компетенції середнього фахівця в даній галузі техніки й може бути здійснений без надмірних експериментів.

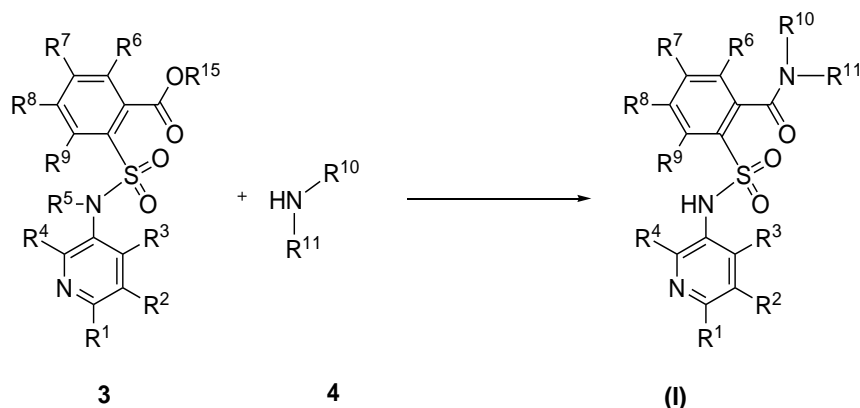
Сполуки за даним винаходом можуть вводитися в комбінації з будь-яким з перерахованих вище додаткових засобів для лікування ссавця, такого як людина, що страждає від інфекції, викликаной вірусом ВІЛ, СНІДу, зв'язаного зі СНІДом комплексу (ARC), або будь-якого іншого захворювання або стану, що зв'язаний із інфекцією, викликану вірусом ВІЛ. Така комбінація може бути введена ссавцю таким чином, що сполука або сполуки за даним винаходом знаходяться в тому ж лікарському засобі, що і додаткові агенти, описані вище. Альтернативно, така комбінація може вводитися ссавцю, який страждає від інфекції, викликаной вірусом ВІЛ, таким чином, що сполука або сполуки за даним винаходом заходяться в препараті, який відділений від препарату, в якому розташовані додаткові агенти. Якщо сполука або сполуки за даним винаходом вводяться окремо від додаткового засобу, то таке введення може здійснюватися супутньо або послідовно з підходящим проміжком часу між ними. Прийняття рішення про включення сполуки або сполук за даним винаходом в один і той самий лікарський засіб, що й додатковий (і) агент або агенти, знаходиться в компетенції середнього фа-

хівця в даній галузі техніки.

Засоби за винаходом можуть бути приготовлені за допомогою шляхів реакцій та схем синтезу, як описано нижче, застосовуючи методики, доступні в даній галузі, з використанням вихідних речовин, які легко доступні. Приготування певних варіантів здійснення за даним винаходом докладно описано в наступних прикладах, але для фахівця в даній галузі техніки буде очевидним, що описані приготування легко можуть бути адаптовані для одержання інших варіантів здійснення за даним винаходом. Наприклад, синтез сполук відповідно до винаходу, які не описані в прикладах, можна здійснити шляхом модифікацій, які є очевидними для фахівців в даній галузі техніки, наприклад, шляхом підходящого захисту інтерферуючих груп, шляхом заміни на інші придатні реагенти, відомі в даній галузі, або здійснення типових модифікацій умов реакцій. Альтернативно, інші реакції, описані в даній заявці або відомі в даній галузі, слід розглядати як такі, що можуть бути адаптовані для приготування інших сполук за винаходом.

Сполуки формули (I) можуть бути отримані зі сполук формул 3 та 4, як показано нижче на Схемі 1. Як правило, сполуки формули 3, в яких R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , та R^9 мають значення, вказані в даній заявці вище, та R^{15} представляє собою C_1 - C_{10} алкіл, можна піддавати взаємодії зі сполуками формули 4, в яких R^{10} та R^{11} мають значення, вказані в даній заявці вище. Такі реакції можна здійснювати в апротонному розчиннику, такому як ацетонітрил, наприклад, при температурі в діапазоні від приблизно 50 °C до приблизно 150 °C, наприклад приблизно при 110 °C, та необов'язково в присутності енергії мікрохвиль. Наприклад, сполуки формули (I) можуть бути приготовлені, використовуючи метил 2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензоат шляхом приготування суміші метил 2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензоату (1 екв) та відповідної сполуки формули 4 (1,5 екв) в CH_3CN (0,35 M) та нагрівання отриманої суміші до приблизно 110 °C протягом 30 хвилин під впливом мікрохвиль. Після цього реакційній суміші дозволяли охолоджуватися до приблизно кімнатної температури та розчинники видаляли шляхом упарювання. Отримані неочищені продукти додатково можуть бути очищені за допомогою методів, відомих фахівцю в даній галузі техніки, таких як застосування хроматографії на силікагелі із використанням відповідного розчинника або суміші розчинників як елюенту.

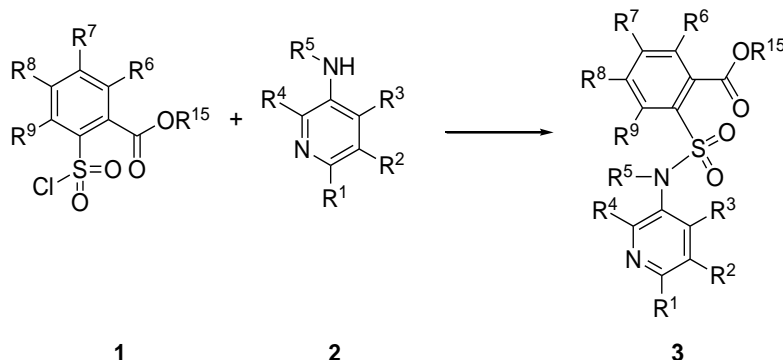
Схема 1



Сполуки формули 3 можуть бути отримані зі сполук формул 1 та 2, в яких R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , та R^9 мають значення, вказані в даній заявці вище, та R^{15} представляє собою C_1 - C_{10} алкіл, як показано нижче на Схемі 2. Як правило, ці реакції можна здійснювати в апротонному розчиннику, такому як ацетонітрил, наприклад, при температурі в діапазоні від приблизно 0°C до приблизно 75°C , наприклад приблизно при 25°C , та в присутності основи. Підходящими основами є, але не обмежуючись лише ними, неорганічні основи, такі

як карбонат калію або карбонат натрію наприклад, або органічні основи, такі як, наприклад, триетиламін або N,N-4,4-диметиламінопіридин. Альтернативно, як придатну основу можна застосовувати другий еквівалент сполуки формули 2. Прийняття рішення про застосування додаткової основи або додаткового еквівалента сполуки 2 як основи знаходиться в компетенції середнього спеціаліста в даній галузі та може бути здійснено без надмірних експериментів.

Схема 2



Сполуки формули 1 є комерційно доступними або можуть бути отримані середнім фахівцем в даній галузі техніки без надмірних експериментів за допомогою методів, описаних в літературі, таких як розкриті в Kim та ін., *Synthesis* (1992), (12), 1203-4; Bastide та ін., *Pesticide Science* (1994), 40(4), 293-7; та Diehr та ін., патент US №4,743,294.

Сполуки формули 2 є комерційно доступними, або можуть бути отримані середнім фахівцем в даній галузі техніки без надмірних експериментів за допомогою методів, описаних в літературі, або можуть бути приготовлені за допомогою методів, описаних в даній заявці.

Інгібування системи ферментів цитохром P450 сполукою за даним винаходом можна визначити за допомогою методів, відомих фахівцю в даній галузі техніки, і методів, описаних в даній заявці. Наприклад, див. Morrison, J.F., *Biochim Biophys Acta*, 1969, 185: 269-86; та Szedlascek, S.E., Ostafe, V., Serban, M., та Vlad, M.O., *Biochem. J.*, 1988, 254:311-312.

Приклади

Нижченаведені приклади призначені виключно для ілюстрації переважних варіантів за даним винаходом та не повинні тлумачитися як такі, що якимось чином обмежують обсяг даного винаходу.

В прикладах, описаних нижче, якщо спеціально не вказано інакше, всі температури в нижче наведених описах вказані в градусах Цельсія ($^\circ\text{C}$) та всі частини та відсотки вказані за масою, якщо спеціально не вказано інакше.

Різноманітні вихідні матеріали та інші реагенти отримували з комерційно доступних джерел, таких як Aldrich Chemical Company або Lancaster Synthesis Ltd., та використовували без додаткового очищення, якщо спеціально не вказано інакше.

Реакції, викладені нижче, здійснювали під позитивним тиском азоту, аргону або в сушильній трубці, при температурі навколишнього середовища (якщо спеціально не вказано інакше), в безводних розчинниках. Аналітичну тонкошарову хроматографію здійснювали на силікагелевих 60°F 254

пластинах з основою із склотканини (Analtech (0,25 мм)) і елюювали розчинниками з відповідним співвідношенням (об./об.). Реакції досліджували за допомогою рідинної хроматографії високого тиску (ВЕРХ) або тонкошарової хроматографії (ТШХ) та закінчення реакцій визначали за витрачанням вихідної речовини. Планшети ТШХ візуалізували за допомогою УФ, фарбували фосфомолібденовою кислотою або фарбували йодом.

Якщо спеціально не вказано інакше, спектри ^1H -ЯМР записували на приладі Bruker, який працює при 300 МГц, і спектри ^{13}C -ЯМР записували при 75 МГц. Спектри ЯМР отримували у вигляді DMCO-d_6 або CDCl_3 розчинів (представляли у вигляді част. на млн), використовуючи хлороформ як порівняльний стандарт (7,25 част. на млн. та 77,00 част. на млн) або DMCO-d_6 ((2,50 част. на млн. та 39,52 част. на млн.)). За необхідності, використовували інші ЯМР розчинники. При наведенні піків мультиплетності, використовували такі скорочення: s = синглет, d = дублет, t = триплет, m = мультиплет, br = широкий, dd = дублет дублетів, dt = дублет триплетів. Константи взаємодії, якщо вони наведені, виражали в Герцах.

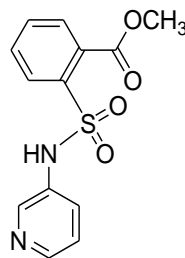
Інфрачервоні спектри записували на спектрометрі Perkin-Elmer FT-IR у вигляді чистих масел, у вигляді пелет KBr, або розчинів CDCl_3 , та при зазначенні виражали в хвильових числах (cm^{-1}). Отримували мас-спектри за допомогою РХ/МС або АРСІ. Всі точки плавлення є нескоректованими.

Всі кінцеві продукти масли чистоту більше 95% (згідно із ВЕРХ при довжинах хвиль 220 нм та 254 нм).

Всі елементні аналізи для сполук, розкритих в даній заявці, якщо спеціально не вказано інакше, забезпечували значення для С, Н, та N аналізу, які знаходилися в інтервалі 0,4% теоретичного значення, і виражали у вигляді "С, Н, N."

В наступних прикладах і приготуваннях, "LDA" означає діізопропіламід літію, "Et" означає етил, "Ac" означає ацетил, "Me" означає метил, "Ph" означає феніл, $(\text{PhO})_2\text{POCl}$ означає хлордифенілфосфат, "HCl" означає соляну кислоту, "EtOAc" означає етилацетат, " Na_2CO_3 " означає карбонат натрію, "NaOH" означає гідроксид натрію, "NaCl" означає хлорид натрію, " NEt_3 " означає триетиламін, "ТГФ" означає тетрагідрофуран, "DIC" означає діізопропілкарбодіімід, "HOBT" означає гідроксибензотриазол, " H_2O " означає воду, " NaHCO_3 " означає гідрокарбонат натрію, " K_2CO_3 " означає карбонат калію, "MeOH" означає метанол, "i-PrOAc" означає ізопропіл ацетат, " MgSO_4 " означає сульфат магнію, "DMCO" означає диметилсульфоксид, " AcCl " означає ацетилхлорид, " CH_2Cl_2 " означає метиленхлорид, "MTBE" означає трет-бутил метиловий ефір, "DMFA" означає диметилформамід, " SOCl_2 " означає тіонілхлорид, " H_3PO_4 " означає фосфорну кислоту, " $\text{CH}_3\text{SO}_3\text{H}$ " означає метансульфонову кислоту, " As_2O " означає оцтовий ангідрид, " CH_3CN " означає ацетонітрил, та "KOH" означає гідроксид калію.

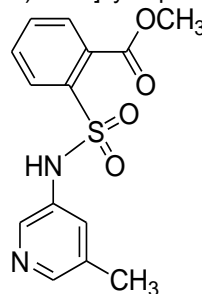
Приклад А: Метил 2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензоат



Метил 2-(хлорсульфоніл)бензоат (14,1 г, 60,0 ммоль) додавали до перемішаного розчину 3-піридинаміну (15,0 г, 159,4 ммоль) в CH_3CN (0,4 М). Температуру підвищували до 25 °С та відділяли невелику кількість червонуватої солі. Для повернення всіх речовин у розчин додавали CHCl_3 (2,0 М, захищений аміленами). Через 1 годину розчинники упарювали та масло, яке залишилося, розподіляли між EtOAc та водою. Органічний шар промивали водою та упарювали, отримуючи неочищений продукт. Неочищений продукт розчиняли в невеликій кількості гарячого EtOAc та розводили простим ефіром. Продукт швидко викристалізовувався і через 1 годину його відфільтровували та промивали простим ефіром, отримуючи вказану в заголовку сполуку. ^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 8,38 (d, 1 H) 8,31 (d, 2 H) 7,93 (d, 2 H) 7,80 (d, 2 H) 7,76 (t, 1 H) 7,64 (t, 1 H) 7,53 (t, 1 H) 7,25 (m, 1H) 4,12 (s, 3H).

Сполуку формули (I) отримували, використовуючи метил 2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензоат, шляхом приготування суміші метил 2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензоату (1 екв) та відповідного аміну (1,5 екв) в CH_3CN (0,35 М) та нагрівання до приблизно 110°C протягом 30 хвилин під впливом мікрохвиль. Розчинам дозволяли охолоджуватися до кімнатної температури та розчинник упарювали. Неочищені продукти очищали за допомогою колонкової хроматографії на SiO_2 .

Приклад В: Метил 2-[(5-метилпіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензоат



До розчину 5-метилпіридин-3-аміну (0,5 г, 4,62 ммоль) в CH_2Cl_2 (50 мл) додавали триетиламін (0,64 мл, 4,62 ммоль) та метил 2-(хлорсульфоніл)бензоат (1,08 г, 4,62 ммоль). Отриману суміш перемішували при кімнатній температурі протягом 1 години. Після цього суміш розводили насиченим водним NaHCO_3 та екстрагували за допомогою CH_2Cl_2 . Органічний шар висушували над Na_2SO_4 , фільтрували та концентрували. Неочищений залишок очищали шляхом флеш-хроматографії (0-8% MeOH/ CH_2Cl_2), отримуючи вказану в заголовку сполуку (0,476 г, 34 %). ^1H ЯМР (400 МГц, DMCO-D_6) δ част. на млн. 10,25-

10,62 (m, 1 H) 8,6 (s, 2 H) 7,81-7,93 (m, 1 H) 7,64-7,76 (m, 2 H) 7,54-7,64 (m, 1 H) 7,28 (s, 1 H) 3,80 (s, 3 H) 2,18 (s, 3 H).

Сполуки формули (I) отримували, використовуючи метил 2-[[5-метилпіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензоат, шляхом приготування суміші метил 2-[[5-метилпіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензоату (1 екв) та відповідного аміну (1,5 екв) в CH_3CN (0,35 M) та нагрівання до приблизно 110 °C протягом 30 хвилин під впливом мікрохвиль. Розчинам дозволяли охолоджуватися до кімнатної температури та розчинник упарювали. Неочищені продукти очищали за допомогою колонкової хроматографії на SiO_2 .

Приклад C: Одержання метил 2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензоату

Стадія 1: 3-бром-5-метоксипіридин

Rr

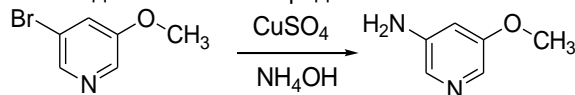
До розчину 3,5-дибромпіридину (10,0 г, 42,2 ммоль) в ДМФА (10 мл) в колбу з насадкою для дистиляції додавали розчин NaOMe 25 мас.% (10 мл) та суміш нагрівали до 100 °C протягом 3 годин. Через 3 години збирали ~8 мл MeOH . Розчин ДМФА охолоджували до кімнатної температури та розводили H_2O (25 мл) та екстрагували за допомо-

До розчину 5-метоксипіридин-3-аміну (1 екв) в піридині (0,4 M) додавали метил 2-(хлорсульфоніл)бензоат (1 екв) та суміш перемішували протягом ночі при кімнатній температурі. Суміш розводили насиченим водним NaHCO_3 та екстрагували за допомогою CH_2Cl_2 . Органічний шар висушували над Na_2SO_4 , фільтрували та концентрували. Неочищений залишок очищали шляхом флеш-хроматографії (0-8% $\text{MeOH}/\text{CH}_2\text{Cl}_2$), отримуючи вказану в заголовку сполуку. ^1H ЯМР (400 МГц, DMSO-D_6) δ част. на млн. 10,56-10,66 (m, 1 H) 8,55-8,61 (m, 1 H) 7,95-8,01 (m, 1 H) 7,86-7,94 (m, 1 H) 7,67-7,73 (m, 2 H) 7,34-7,40 (m, 1 H) 7,02 (s, 1 H) 3,83 (s, 3 H) 3,73 (s, 3 H).

Сполуки формули (I) отримували, використовуючи метил 2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензоат, шляхом приготування суміші метил 2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензоату (1 екв) та відповідного аміну (1,5 екв) в CH_3CN (0,35 M) та нагрівання до приблизно 110 °C протягом 30 хвилин під впливом мікрохвиль. Розчинам дозволяли охолоджуватися до кімнатної температури та розчинник упарювали. Неочищені продукти очищали за допомогою колонкової хроматографії на SiO_2 .

гою MTBE (2×25 мл). Об'єднані органічні шари промивали H_2O (2×25 мл), висушували над Na_2SO_4 , фільтрували та концентрували. Після цього залишок висушували в високому вакуумі протягом 10 годин, отримуючи вказану в заголовку сполуку (5,2 г, 66%). ^1H ЯМР (400 МГц, DMSO-D_6) δ 8,26-8,31 (m, 2 H) 7,69-7,72 (m, 1 H) 3,84 (s, 3 H).

Стадія 2: 5-метоксипіридин-3-амін

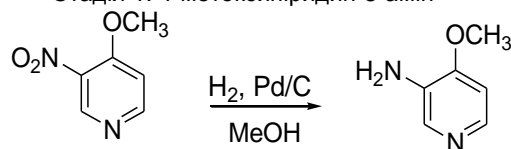


Розчин 3-бром-5-метоксипіридину (5,2 г, 27,5 ммоль) та $\text{CuSO}_4 \cdot \text{H}_2\text{O}$ (1,37 г, 5,5 ммоль) в NH_4OH (5 мл) поміщали в запаяну трубку та нагрівали до 120 °C протягом 10 годин. Після цього реакційну суміш охолоджували до кімнатної температури, розводили H_2O (40 мл), та екстрагували EtOAc (3×30 мл). Об'єднані органічні шари висушували над Na_2SO_4 , фільтрували і концентрували, отримуючи вказану в заголовку сполуку, яку використовували на наступній стадії без додаткового очищення.

Стадія 3: метил 2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензоат

Приклад D: Одержання метил 2-[[4-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензоату

Стадія 1: 4-метоксипіридин-3-амін



До розчину 4-метокси-3-нітропіридину (2,5 г, 16,2 ммоль) в MeOH (50 мл) додавали Pd/C 10 мас.% (0,5 г) та суміш перемішували при 1 атмосфері H_2 протягом 10 годин при кімнатній температурі. Реакційну суміш фільтрували через целіт та фільтрат концентрували. Неочищений залишок очищали шляхом флеш-хроматографії (0-10% $\text{MeOH}/\text{CH}_2\text{Cl}_2$), отримуючи сполуку 16 (0,875 г, 44 %). ^1H ЯМР (400 МГц, DMSO-D_6) δ 7,83 (s, 1 H) 7,70 (d, 1 H) 6,79 (d, 1 H) 4,79 (s, 2 H) 3,79 (s, 3 H).

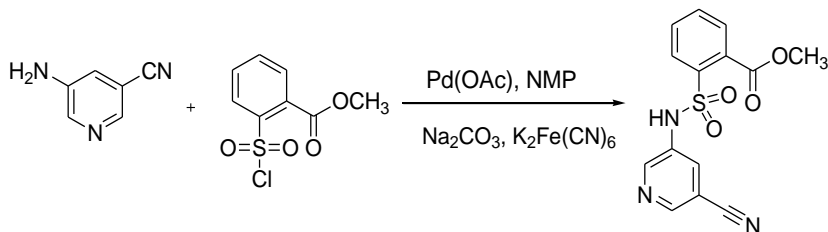
Стадія 2: метил 2-[[4-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензоат

До розчину 5-метоксипіридин-3-аміну (1 екв) в піридині (0,4 М) додавали метил 2-(хлорсульфоніл)бензоат (1 екв) та суміш перемішували протягом ночі при кімнатній температурі. Суміш розводили насиченим водним NaHCO_3 та екстрагували за допомогою CH_2Cl_2 . Органічний шар висушували над Na_2SO_4 , фільтрували та концентрували. Неочищений залишок очищали шляхом флеш-хроматографії, отримуючи вказану в заголовку сполуку. ^1H ЯМР (400 МГц, $\text{DMSO}-d_6$) δ 9,35-9,57 (m, 1 H) 8,54-8,61 (m, 1 H) 8,17-8,23 (m, 1 H) 7,74-7,85 (m, 2 H) 7,61-7,73 (m, 1 H) 7,32-7,42 (m, 1 H) 6,91-7,00 (m, 1 H) 3,73 (s, 3 H) 3,51 (s, 3 H).

Сполуки формули (I) отримували, використовуючи метил 2-[[4-метоксипіридин-3-

іл)аміно]сульфоніл]бензоат, шляхом приготування суміші метил 2-[[4-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензоату (1 екв) та відповідного аміну (1,5 екв) в CH_3CN (0,35 М) та нагрівання до приблизно 110°C протягом 30 хвилин під впливом мікрохвиль. Розчином дозволяли охолоджуватися до кімнатної температури та розчинник упарювали. Неочищені продукти очищали за допомогою колонкової хроматографії на SiO_2 .

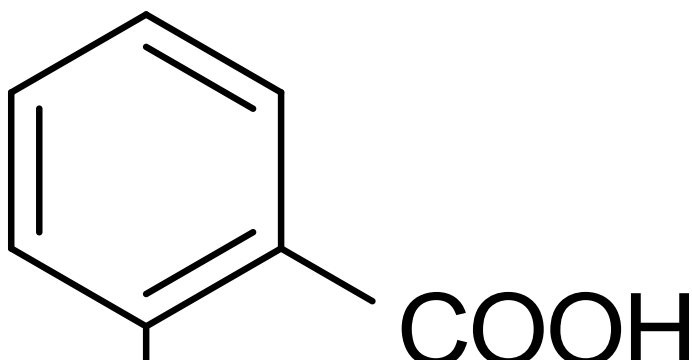
Приклад Е: Одержання метил 2-[[5-ціанопіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензоату
Метил 2-[[5-ціанопіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензоат готували відповідно до методики, опублікованої Schareina, Т. та ін., J. Organometallic Chemistry 2004, 689, 4576.



Сполуки формули (I) отримували, використовуючи метил 2-[[5-ціанопіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензоат, шляхом приготування суміші метил 2-[[5-ціанопіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензоату (1 екв) та відповідного аміну (1,5 екв) в CH_3CN (0,35 М) та нагрівання до приблизно 110°C протягом 30 хвилин під впли-

вом мікрохвиль. Розчином дозволяли охолоджуватися до кімнатної температури та розчинник упарювали. Неочищені продукти очищали за допомогою колонкової хроматографії на SiO_2 .

Приклад F: Синтез N-(1,1-диметил-2-морфолін-4-ілетил)-2-[(піридин-3-ілметил)сульфініл]бензаміду



Стадія 1: Метил 2-меркаптобензоат (2): Кислоту 1 (170,0 г, 1,1 моль), H_2SO_4 (20 мл, 0,37 моль) та безводний MeOH (300 мл) нагрівали в колбі зі зворотнім холодильником протягом 2 днів. Розчинник упарювали при зниженому тиску. Додавали воду та суміш екстрагували CH_2Cl_2 (3×1000 мл). Органічні шари об'єднували, промивали водн. NaHCO_3 (2×300 мл), водою (2×250 мл), соляним розчином (500 мл) та висушували над Na_2SO_4 , отримуючи неочищену сполуку 2 (165,0 г, 89,6 %). Її використовували без додаткового очищення.

Стадія 2: Метил 2-(піридин-3-ілметилтіо)бензоат (3): Суміш сполуки 2 (70,0 г, 0,4167 моль), 1-(бромметил)бензолу (82,8 г, 0,5 моль), K_2CO_3 (350 г, 2,49 моль) та CH_3CN (500 мл) нагрівали в колбі зі зворотнім холодильником протягом ночі. Суміші дозволяли охолоджуватися до кімнатної температури та фільтрували. Фільтрат концентрували при зниженому тиску. Після додавання води, суміш екстрагували CH_2Cl_2 (3×500 мл). Органічні шари об'єднували, промивали водн. Na_2CO_3 (2×200 мл), водою (2×300 мл), соляним розчином (300 мл) та висушували над Na_2SO_4 . Після упарювання отримували неочищену сполуку 3 (64,0 г, 59,4%). Її використовували без додаткового очищення.

Стадія 3: 2-(піридин-3-ілметилтіо)бензойна кислота (4): До розчину сполуки 3 (55,0 г, 0,212 моль) в $\text{MeOH}/\text{H}_2\text{O}$ (300 мл / 50 мл) додавали $\text{LiOH} \cdot \text{H}_2\text{O}$ (17,8 г, 0,425 моль) порціями при 0°C . Реакційну суміш перемішували при кімнатній температурі протягом ночі та ТШХ вказувала на витрачання вихідної речовини. Розчинник видаляли при зниженому тиску. Залишок розводили водою, та екстрагували Et_2O (2×1 л) для видалення нейтральних домішок. Значення рН водного шару доводили до 3-4 за допомогою 1 н. водн. HCl (50 мл) та екстрагували EtOAc (2×1 л). Об'єднані органічні фази промивали водою (2×200 мл), соляним розчином (300 мл), висушували над Na_2SO_4 і концентрували, отримуючи сполуку 4 (35,0 г, 67 %). Її використовували без додаткового очищення.

Стадія 4: N-(2-метил-1-морфолінопропан-2-іл)-2-(піридин-3-ілметилтіо)бензамід (5):

До розчину кислоти 4 (2,75 г, 11,2 ммоль) та 2-метил-1-морфолінопропан-2-аміну (1,12 мл, 7,4 ммоль) в безводному ДМФА/ДМСО додавали

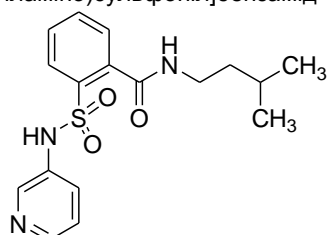
EDCI (2,58 г, 13,32 ммоль), HOBT (0,182 г, 13,32 ммоль) та NMM (3,35 мл, 29,6 ммоль) та суміш перемішували при кімнатній температурі протягом ночі. Розчинник видаляли у вакуумі. Після додавання води (10 мл), суміш екстрагували CH_2Cl_2 . Органічні шари об'єднували, промивали 1 н. водн. NaOH (15 мл), водою (3×10 мл), соляним розчином (50 мл) та висушували над MgSO_4 . Розчинник видаляли при зниженому тиску; залишок очищали за допомогою колонкової хроматографії (сілікагель, EtOAc /петролейний ефір 1:5), отримуючи 5 (2,0 г, 50%). ^1H ЯМР (400 МГц, XClOPOFORM-D) δ част. на млн. 8,46 (d, 1 H) 8,43 (dd, 1 H) 7,52-7,56 (m, 1 H) 7,45-7,50 (m, 1 H) 7,20-7,24 (m, 2 H) 7,13-7,19 (m, 1 H) 6,66 (s, 1 H) 4,08 (s, 2 H) 3,63 (t, 4 H) 2,57-2,62 (m, 6 H) 1,44 (s, 6 H).

Стадія 5: N-(2-метил-1-морфолінопропан-2-іл)-2-(піридин-3-ілметилсульфініл)бензамід (6): До розчину проміжної сполуки 5 (0,143, 0,370 ммоль) в CHCl_3 (6 мл) додавали Et_4NBr (0,004 г, 0,018 ммоль) та IBX (0,142 г, 0,507 ммоль) та реакційну суміш перемішували при кімнатній температурі протягом 1 години. Суміш розводили насиченим водним NaHCO_3 та екстрагували за допомогою CH_2Cl_2 . Органічний шар висушували над Na_2SO_4 , фільтрували та концентрували. Неочищений залишок очищали шляхом флеш-хроматографії (0-5% $\text{MeOH}/\text{CH}_2\text{Cl}_2$), отримуючи сполуку 17 (0,026 г, 18%). ^1H ЯМР (400 МГц, XClOPOFORM-D) δ част. на млн. 8,45 (d, 1 H) 8,07-8,11 (m, 1 H) 7,39-7,53 (m, 5 H) 7,13-7,20 (m, 1 H) 7,05 (s, 1 H) 4,40 (d, 1 H) 4,19 (d, 1 H) 3,61-3,70 (m, 4 H) 2,48-2,65 (m, 6 H) 1,46 (d, 6 H).

Приклад G: Загальний спосіб для зняття захисту ВОС

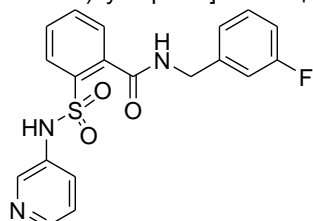
До розчину відповідного ВОС-захищеного аміну (1 екв) в MeOH (0,1 М) додавали DOWEX 50WX2-400 іонообмінну смолу (10 екв) та суміш нагрівали до 40°C протягом 3 годин. Після цього суміші дозволяли охолоджуватися до кімнатної температури та фільтрували. Смола промивали 3 порціями MeOH . Потім продукт вивільняли від смоли за допомогою обробки розчином 20 % $\text{NH}_4\text{OH}/\text{MeOH}$, який застосовували 3 порціями. Основні спиртові промивки концентрували у вакуумі, отримуючи бажаний амін, з якого знято захист.

Приклад 42: N-(3-метилбутил)-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензамід



Вказану в заголовку сполуку отримували відповідно до методик, описаних вище, використовуючи метил 2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензоат та 3-метилбутиламін. Вказану в заголовку сполуку додатково очищали шляхом розчинення 2,0 г в етилацетаті (20 мл) та нагрівання в колбі зі зворотним холодильником. Коли сполука повністю розчинялася, то отриманий розчин залишали для дуже повільного охолодження до кімнатної температури. Отримані кристали залишали відстоюватися при кімнатній температурі протягом 30 хв, після цього їх фільтрували, використовуючи лійку, промивали холодним етилацетатом (20 мл), та висушували в високому вакуумі впродовж 16 годин, отримуючи вказану в заголовку сполуку у вигляді білої кристалічної твердої речовини (1,67 г, 84%). ^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 8,64 (s, 1 H) 8,26-8,43 (m, 2 H) 7,60-7,68 (m, 2 H) 7,45-7,59 (m, 2 H) 7,39 (t, 1 H) 7,12 - 7,21 (m, 1 H) 6,08-6,17 (m, 1 H) 3,52 (q, 2 H) 1,67-1,79 (m, 1 H) 1,57 (q, 2 H) 0,98 (d, 6 H).

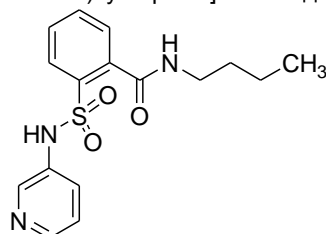
Приклад 43: N-(3-фторбензил)-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензамід



Вказану в заголовку сполуку отримували відповідно до методик, описаних вище, використовуючи метил 2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензоат та 3-фторбензиламін. Вказану в заголовку сполуку додатково очищали шляхом розчинення 25 г в EtOH (300 мл) та обережного нагрівання, використовуючи водяну баню до 80 °C. Після цього отримані тверді речовини повільно розчинялися і для повного розчинення всіх твердих речовин додавали додаткову кількість EtOH (50 мл). Розчин залишали при кімнатній тем-

пературі для кристалізації протягом 1 год. Отримані кристали збирали і висушували в високому вакуумі впродовж 16 годин, отримуючи вказану в заголовку сполуку у вигляді кристалічної твердої речовини (21 г, 84 %). ^1H ЯМР (400 МГц, DMSO-D_6) δ 9,76 (s, 1 H) 9,32 (t, 1 H) 8,31 (d, 1 H) 8,25 (d, 1 H) 7,66-7,78 (m, 2 H) 7,50-7,65 (m, 3 H) 7,39 (q, 1 H) 7,23-7,29 (m, 3 H) 7,09 (t, 1 H) 4,54 (d, 2 H).

Приклад 63: N-бутил-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензамід

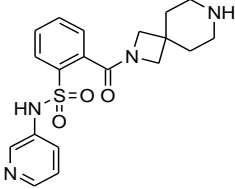
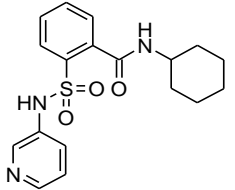
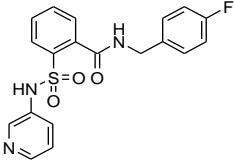
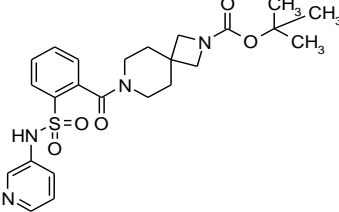
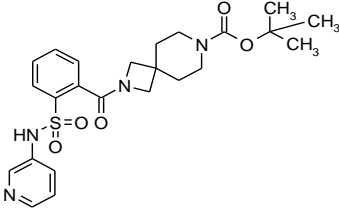
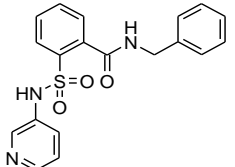


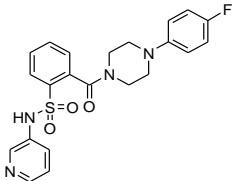
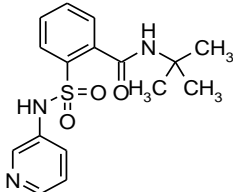
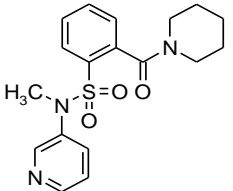
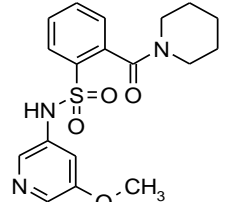
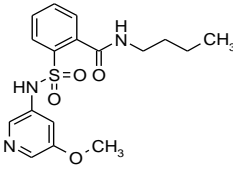
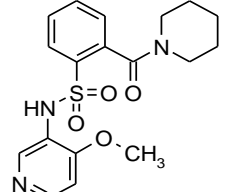
Вказану в заголовку сполуку отримували відповідно до методик, описаних вище, використовуючи метил 2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензоат та н-бутиламін. Вказану в заголовку сполуку додатково очищали шляхом розчинення 2,0 г в етилацетаті (10 мл). Після цього до розчину по краплях додавали гексан, до того часу, поки він не ставав каламутним. Потім додавали декілька крапель етилацетату для отримання прозорого розчину. Отриманий розчин залишали при кімнатній температурі приблизно протягом 48 годин. Тверді речовини збирали, промивали 20% етилацетатом/гексаном (3×150 мл), та висушували в високому вакуумі протягом ночі при кімнатній температурі, отримуючи вказану в заголовку сполуку у вигляді кристалічної твердої речовини (1,64 г, 82%). ^1H ЯМР (400 МГц, DMSO-D_6) δ 9,90-10,00 (m, 1 H) 8,73 (t, 1 H) 8,28-8,37 (m, 2 H) 7,71-7,76 (m, 1 H) 7,61-7,70 (m, 2 H) 7,49-7,57 (m, 2 H) 7,35-7,44 (m, 1 H) 3,25 (q, 2 H) 1,51-1,54 (m, 2 H) 1,29-1,40 (m, 2 H) 0,90 (t, 3 H).

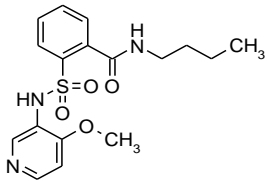
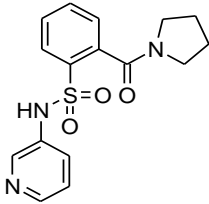
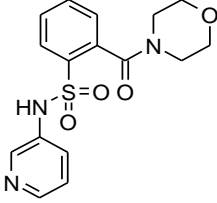
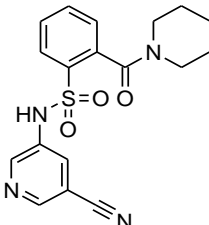
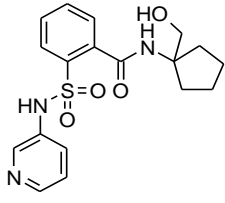
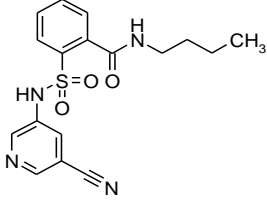
Приклади 1 - 393:

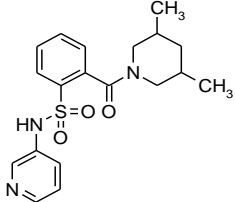
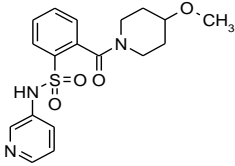
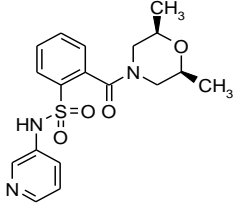
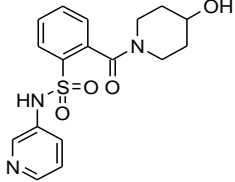
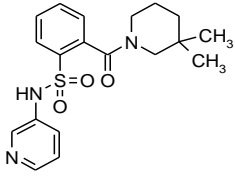
Наступні Приклади отримували згідно із Прикладом 2, використовуючи відповідну сполуку формул 3 та 4 (як зображено на схемах 1 та 2). Сполуки формули 3 отримували, як описано вище, а сполуки формули 4 є комерційно доступними або їх отримували, використовуючи методи, відомі фахівцю в даній галузі техніки.

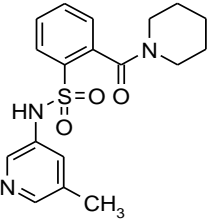
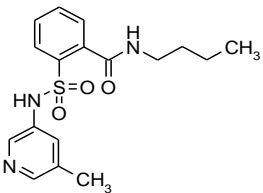
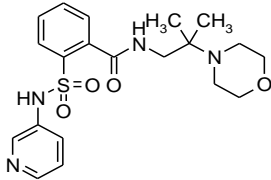
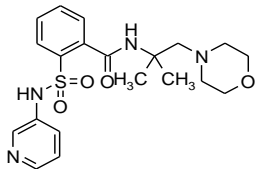
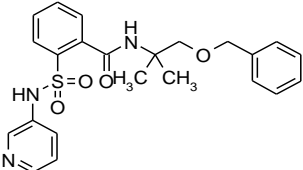
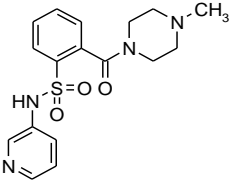
№ прикладу	Структура	Назва	¹ H ЯМР
1		N-[1,1-диметил-2-(4-метилпіперидин-1-іл)етил]-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-D) d част. на млн. 8,33 - 8,38 (m, 1 H) 8,25 - 8,30 (m, 1 H) 7,72 (d, 1 H) 7,59 (d, 1 H) 7,52 (d, 2 H) 7,42 - 7,47 (m, 1 H) 7,32 - 7,40 (m, 1 H) 7,08 - 7,17 (m, 1 H) 2,95 - 3,05 (m, 2 H) 2,71 (s, 2 H) 2,33 (t, 2 H) 1,56 - 1,63 (m, 1 H) 1,54 (s, 6 H) 1,29 - 1,42 (m, 1 H) 1,14 - 1,27 (m, 3 H) 0,85 (d, 3 H)
2		N-(1,1-диметил-2-піперидин-1-ілетил)-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ДМСО-D6) d част. на млн. 8,53 - 8,64 (m, 1 H) 8,19 - 8,23 (m, 1 H) 8,07 - 8,14 (m, 1 H) 7,71 (d, 1 H) 7,60 (t, 1 H) 7,47 - 7,53 (m, 2 H) 7,41 - 7,47 (m, 1 H) 7,15 - 7,22 (m, 1 H) 2,90 - 2,97 (m, 2 H) 2,70 - 2,80 (m, 4 H) 1,53 - 1,63 (m, 4 H) 1,41 (s, 8 H)
3		N-(1,1-диметил-2-піролідин-1-ілетил)-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ДМСО-D6) d част. на млн. 8,35 - 8,43 (m, 1 H) 8,11 - 8,16 (m, 1 H) 7,92 - 7,99 (m, 1 H) 7,74 (d, 1 H) 7,46 - 7,53 (m, 1 H) 7,39 - 7,45 (m, 2 H) 7,31 - 7,37 (m, 1 H) 7,02 - 7,10 (m, 1 H) 3,51 - 3,57 (m, 2 H) 3,16 - 3,24 (m, 4 H) 1,79 - 1,86 (m, 4 H) 1,45 (s, 6 H)
4		N-(1-циклопропіл-1-метилетил)-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-D) d част. на млн. 8,55 - 8,63 (m, 1 H) 8,30 - 8,42 (m, 2 H) 7,57 - 7,71 (m, 2 H) 7,46 - 7,57 (m, 2 H) 7,31 - 7,43 (m, 1 H) 7,08 - 7,20 (m, 1 H) 6,08 (s, 1 H) 1,42 (s, 6 H) 1,26 - 1,38 (m, 1 H) 0,43 - 0,56 (m, 4 H)
5		N-(2-фторбензил)-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ДМСО-D6) d част. на млн. 9,74 (s, 1 H) 9,24 - 9,39 (m, 1 H) 8,24 (d, 2 H) 7,63 - 7,80 (m, 2 H) 7,46 - 7,65 (m, 4 H) 7,21 - 7,36 (m, 2 H) 7,14 - 7,22 (m, 2 H) 4,54 (d, 2 H)
6		2-(2,7-діазспіро[3,5]нон-7-ілкарбоніл)-N-піридин-3-ілбензолсульфонамід	(400 МГц, ДМСО-D6) d част. на млн. 8,01 (s, 1 H) 7,61 - 7,77 (m, 2 H) 7,28 - 7,46 (m, 2 H) 7,05 - 7,23 (m, 2 H) 6,84 - 6,93 (m, 1 H) 3,57 - 3,81 (m, 5 H) 3,39 - 3,46 (m, 1 H) 2,93 - 3,03 (m, 2 H)

			1,77 - 1,93 (m, 2 H) 1,63 - 1,77 (m, 1 H) 1,41 - 1,57 (m, 1 H)
7		2-(2,7-діазаспіро[3,5]нон-2-ілкарбоніл)-N-піридин-3-ілбензолсульфонамід	(400 МГц, ДМСО-D6) d част. на млн. 8,03 (s, 1 H) 7,70 - 7,85 (m, 2 H) 7,36 - 7,49 (m, 2 H) 7,17 - 7,27 (m, 2 H) 6,90 - 6,99 (m, 1 H) 3,72 (s, 2 H) 3,56 (s, 2 H) 2,86 - 2,99 (m, 2 H) 2,71 - 2,84 (m, 2 H) 1,68 - 1,86 (m, 4 H)
8		N-циклогексил-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ДМСО-D6) d част. на млн. 9,67 (s, 1 H) 8,62 - 8,79 (m, 1 H) 8,18 - 8,36 (m, 2 H) 7,57 - 7,79 (m, 2 H) 7,42 - 7,57 (m, 3 H) 7,18 - 7,36 (m, 1 H) 3,71 - 3,91 (m, 1 H) 1,85 - 1,97 (m, 2 H) 1,69 - 1,84 (m, 2 H) 1,51 - 1,64 (m, 1 H) 1,22 - 1,39 (m, 4 H) 1,03 - 1,20 (m, 1 H)
9		N-(4-фторбензил)-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ДМСО-D6) d част. на млн. 9,75 (s, 1 H) 9,24 - 9,37 (m, 1 H) 8,26 (d, 2 H) 7,64 - 7,78 (m, 2 H) 7,50 - 7,64 (m, 3 H) 7,40 - 7,49 (m, 2 H) 7,23 - 7,32 (m, 1 H) 7,11 - 7,21 (m, 2 H) 4,50 (d, 2 H)
10		трет-бутил 7-{2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензоїл}-2,7-діазаспіро[3,5]нонан-2-карбоксилат	(400 МГц, ДМСО-D6) d част. на млн. 10,16 (s, 1 H) 8,24 - 8,29 (m, 1 H) 8,18 - 8,23 (m, 1 H) 7,79 (d, 1 H) 7,64 (t, 1 H) 7,50 - 7,58 (m, 1 H) 7,43 - 7,50 (m, 1 H) 7,33 - 7,42 (m, 1 H) 7,18 - 7,28 (m, 1 H) 3,48 - 3,66 (m, 6 H) 2,88 - 3,02 (m, 2 H) 1,69 - 1,77 (m, 2 H) 1,48 - 1,65 (m, 2 H) 1,36 (s, 9 H)
11		трет-бутил 2-{2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензоїл}-2,7-діазаспіро[3,5]нонан-7-карбоксилат	(400 МГц, ДМСО-D6) d част. на млн. 8,28 - 8,32 (m, 1 H) 8,23 (d, 1 H) 7,81 (d, 1 H) 7,66 (t, 1 H) 7,54 - 7,61 (m, 1 H) 7,46 - 7,52 (m, 2 H) 7,23 - 7,30 (m, 1 H) 3,77 (s, 2 H) 3,46 (s, 2 H) 3,25 - 3,31 (m, 2 H) 3,07 - 3,18 (m, 2 H) 1,56 - 1,64 (m, 4 H) 1,38 (s, 9 H)
12		N-бензил-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ДМСО-D6) d част. на млн. 9,75 (s, 1 H) 9,26 - 9,37 (m, 1 H) 8,22 - 8,34 (m, 2 H) 7,65 - 7,79 (m, 2 H) 7,49 - 7,65 (m, 3 H) 7,40 - 7,48 (m, 2 H) 7,32 - 7,39 (m,

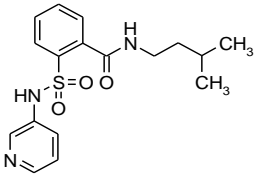
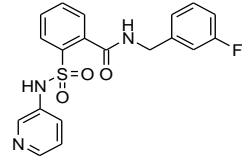
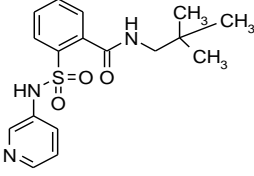
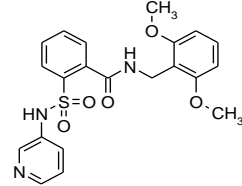
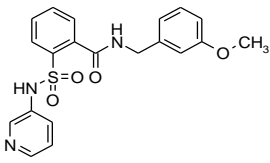
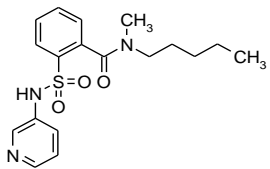
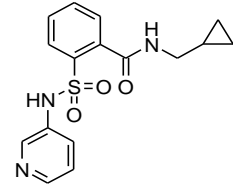
			2 H) 7,23 - 7,33 (m, 2 H) 4,54 (d, 2 H)
13		2-([4-(4-фторфеніл)піперазин-1-іл]карбоніл)-N-піридин-3-ілбензолсульфонамід	(400 МГц, ДМСО-D6) d част. на млн. 10,27 (s, 1 H) 8,18 - 8,32 (m, 2 H) 7,81 - 7,91 (m, 1 H) 7,65 - 7,75 (m, 1 H) 7,54 - 7,62 (m, 1 H) 7,41 - 7,55 (m, 2 H) 7,22 - 7,31 (m, 1 H) 7,01 - 7,10 (m, 2 H) 6,90 - 7,00 (m, 2 H) 3,66 - 3,88 (m, 2 H) 2,92 - 3,25 (m, 6 H)
14		N-(трет-бутил)-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ДМСО-D6) d част. на млн. 9,56 (s, 1 H) 8,33 - 8,40 (m, 1 H) 8,22 - 8,30 (m, 2 H) 7,58 - 7,68 (m, 2 H) 7,44 - 7,55 (m, 3 H) 7,20 - 7,32 (m, 1 H) 1,39 (s, 9 H)
15		N-метил-2-(піперидин-1-ілкарбоніл)-N-піридин-3-ілбензолсульфонамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-D) d част. на млн. 8,46 - 8,55 (m, 2 H) 7,50 - 7,69 (m, 2 H) 7,29 - 7,41 (m, 3 H) 7,20 - 7,27 (m, 1 H) 3,80 - 3,96 (m, 1 H) 3,45 - 3,58 (m, 1 H) 3,29 (s, 3 H) 3,02 - 3,18 (m, 2 H) 1,52 - 1,70 (m, 5 H) 1,29 - 1,43 (m, 1 H)
16		N-(5-метоксипіридин-3-іл)-2-(піперидин-1-ілкарбоніл)бензолсульфонамід	(400 МГц, ДМСО-D6) d част. на млн. 8,09 (d, 1 H) 7,99 (d, 1 H) 7,88 (d, 1 H) 7,68 (t, 1 H) 7,58 (t, 1 H) 7,39 (d, 1 H) 7,28 - 7,32 (m, 1 H) 3,80 (s, 3 H) 3,62 - 3,70 (m, 1 H) 3,42 - 3,56 (m, 1 H) 2,93 - 3,08 (m, 2 H) 1,41 - 1,66 (m, 5 H) 1,29 - 1,41 (m, 1 H)
17		N-бутил-2-[(5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл}бензамід	(400 МГц, ДМСО-D6) d част. на млн. 10,16 - 10,37 (m, 1 H) 8,65 - 8,77 (m, 1 H) 8,12 (d, 1 H) 7,98 - 8,04 (m, 1 H) 7,83 (d, 1 H) 7,69 (t, 1 H) 7,59 (t, 1 H) 7,50 (d, 1 H) 7,30 - 7,35 (m, 1 H) 3,80 (s, 3 H) 3,24 (q, 2 H) 1,46 - 1,57 (m, 2 H) 1,29 - 1,42 (m, 2 H) 0,90 (t, 3 H)
18		N-(4-метоксипіридин-3-іл)-2-(піперидин-1-ілкарбоніл)бензолсульфонамід	(400 МГц, ДМСО-D6) d част. на млн. 9,07 - 9,23 (m, 1 H) 8,19 - 8,29 (m, 2 H) 7,71 - 7,77 (m, 1 H) 7,63 - 7,71 (m, 1 H) 7,50 - 7,59 (m, 1 H) 7,41 (d, 1 H) 6,99 (d, 1 H) 3,57 - 3,67 (m, 2 H) 3,54 (s, 3 H) 2,88 - 3,10 (m, 2 H) 1,26 - 1,65 (m, 6 H)

19		N-бутил-2-[[4-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ДМСО-D6) d част. на млн. 8,84 (t, 1 H) 8,67 (s, 1 H) 8,60 (d, 1 H) 7,82 (d, 1 H) 7,69 - 7,78 (m, 1 H) 7,56 - 7,65 (m, 2 H) 7,50 (d, 1 H) 3,80 (s, 3 H) 3,23 (q, 2 H) 1,46 - 1,57 (m, 2 H) 1,28 - 1,42 (m, 2 H) 0,90 (t, 3 H)
20		N-піридин-3-іл-2-(піролідин-1-ілкарбоніл)бензолсульфонамід	(400 МГц, ДМСО-D6) d част. на млн. 10,10 (s, 1 H) 8,31 (d, 1 H) 8,24 (d, 1 H) 7,77 - 7,84 (m, 1 H) 7,64 - 7,72 (m, 1 H) 7,52 - 7,60 (m, 1 H) 7,41 - 7,53 (m, 2 H) 7,21 - 7,31 (m, 1 H) 3,43 - 3,52 (m, 2 H) 2,88 - 3,01 (m, 2 H) 1,82 - 1,88 (m, 2 H) 1,66 - 1,81 (m, 2 H)
21		2-(морфолін-4-ілкарбоніл)-N-піридин-3-ілбензолсульфонамід	
22		N-(5-ціанопіридин-3-іл)-2-(піперидин-1-ілкарбоніл)бензолсульфонамід	(400 МГц, ДМСО-D6) d част. на млн. 10,56 - 11,12 (m, 1 H) 8,65 (d, 1 H) 8,52 (d, 1 H) 7,86 - 8,00 (m, 2 H) 7,69 (t, 1 H) 7,58 (t, 1 H) 7,40 (d, 1 H) 3,61 - 3,70 (m, 1 H) 3,48 - 3,57 (m, 1 H) 2,95 - 3,09 (m, 2 H) 1,31 - 1,64 (m, 6 H)
23		N-[1-(гідроксиметил)циклопентил]-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ДМСО-D6) d част. на млн. 9,52 - 10,02 (m, 1 H) 8,18 - 8,38 (m, 3 H) 7,61 - 7,72 (m, 2 H) 7,41 - 7,62 (m, 3 H) 7,16 - 7,37 (m, 1 H) 3,70 (s, 2 H) 1,98 - 2,11 (m, 2 H) 1,62 - 1,78 (m, 4 H) 1,45 - 1,61 (m, 2 H)
24		N-бутил-2-[[5-ціанопіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ДМСО-D6) d част. на млн. 10,33 - 10,49 (m, 1 H) 8,72 (t, 1 H) 8,65 - 8,68 (m, 1 H) 8,52 (d, 1 H) 7,91 - 7,95 (m, 1 H) 7,85 (d, 1 H) 7,69 (t, 1 H) 7,59 (t, 1 H) 7,47 - 7,54 (m, 1 H) 3,23 (q, 2 H) 1,44 - 1,59 (m, 2 H) 1,29 - 1,43 (m, 2 H) 0,90 (t, 3 H)

25		2-[(3,5-диметилпіперидин-1-іл)карбоніл]-N-піридин-3-ілбензолсульфонамід	(400 МГц, ДМСО-D6) d част. на млн. 8,11 - 8,21 (m, 1 H) 7,98 - 8,08 (m, 1 H) 7,77 (dd, 1 H) 7,51 - 7,60 (m, 1 H) 7,41 - 7,51 (m, 1 H) 7,32 - 7,41 (m, 1 H) 7,24 - 7,31 (m, 1 H) 7,05 - 7,15 (m, 1 H) 4,38 - 4,57 (m, 1 H) 3,07 - 3,18 (m, 1 H) 2,86 - 2,97 (m, 1 H) 1,85 - 1,96 (m, 1 H) 1,66 - 1,79 (m, 1 H) 0,93 - 0,95 (m, 1 H) 0,87 - 0,93 (m, 3 H) 0,80 - 0,87 (m, 1 H) 0,72 - 0,79 (m, 1 H) 0,55 - 0,65 (m, 3 H)
26		2-[(4-метоксипіперидин-1-іл)карбоніл]-N-піридин-3-ілбензолсульфонамід	
27		2-[(2R,6S)-2,6-диметилморфолін-4-іл]карбоніл]-N-піридин-3-ілбензолсульфонамід	
28		2-[(4-гідроксипіперидин-1-іл)карбоніл]-N-піридин-3-ілбензолсульфонамід	(400 МГц, ДМСО-D6) d част. на млн. 10,13-10,16 (m, 1H) 8,27 - 8,34 (m, 1 H) 8,21 (d, 1 H) 7,73 - 7,84 (m, 1 H) 7,63 - 7,71 (m, 1 H) 7,42 - 7,60 (m, 2 H) 7,34 - 7,44 (m, 1 H) 7,22 - 7,28 (m, 1 H) 4,78 (dd, 1 H) 3,86 - 4,08 (m, 1 H) 3,67 - 3,78 (m, 1 H) 3,09 - 3,25 (m, 1 H) 2,82 - 2,98 (m, 1 H) 1,71 - 1,88 (m, 1 H) 1,51 - 1,68 (m, 1 H) 1,34 - 1,50 (m, 2 H) 1,19 - 1,31 (m, 1 H)
29		2-[(3,3-диметилпіперидин-1-іл)карбоніл]-N-піридин-3-ілбензолсульфонамід	(400 МГц, ДМСО-D6) d част. на млн. 10,06 - 10,26 (m, 1 H) 8,28 (s, 1 H) 8,13 - 8,25 (m, 1 H) 7,75 - 7,86 (m, 1 H) 7,61 - 7,71 (m, 1 H) 7,51 - 7,60 (m, 1 H) 7,43 - 7,51 (m, 1 H) 7,26 - 7,43 (m, 1 H) 7,18 - 7,29 (m, 1 H) 3,46 - 3,58 (m, 1 H) 3,07 - 3,19 (m, 1 H) 2,79 - 3,02 (m, 2 H) 1,51 - 1,64 (m, 1 H) 1,32 - 1,48 (m, 3 H) 0,93 - 1,03 (m, 4 H) 0,76 - 0,83 (m, 1 H) 0,62 - 0,72 (m, 1 H)

30		N-(5-метилпіридин-3-іл)-2-(піперидин-1-іл)карбоніл)бензолсульфонамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-D) δ част. на млн. 8,06 - 8,14 (m, 2 H) 7,95 - 8,05 (m, 1 H) 7,41 - 7,58 (m, 2 H) 7,24 - 7,35 (m, 3 H) 3,82 - 3,95 (m, 1 H) 3,45 - 3,57 (m, 2 H) 2,17 (s, 3 H) 1,37 - 1,80 (m, 7 H)
31		N-бутил-2-[[5-метилпіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-D) δ част. на млн. 8,49 - 8,78 (m, 1 H) 8,04 - 8,15 (m, 2 H) 7,44 - 7,59 (m, 3 H) 7,28 - 7,41 (m, 2 H) 6,68 - 6,80 (m, 1 H) 3,46 (q, 2 H) 2,21 (s, 3 H) 1,57 - 1,70 (m, 2 H) 1,34 - 1,50 (m, 2 H) 0,98 (t, 3 H)
32		N-(2-метил-2-морфолін-4-ілпропіл)-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ДМСО-D6) δ част. на млн. 8,45 - 8,57 (m, 1 H) 8,17 - 8,30 (m, 2 H) 7,64 - 7,75 (m, 2 H) 7,45 - 7,60 (m, 3 H) 7,19 - 7,29 (m, 1 H) 3,54 - 3,60 (m, 4 H) 3,34 - 3,37 (m, 2 H) 2,54 - 2,62 (m, 4 H) 1,06 (s, 6 H)
33		N-(1,1-диметил-2-морфолін-4-ілетил)-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-D) δ част. на млн. 8,26 - 8,34 (m, 2 H) 7,53 - 7,63 (m, 2 H) 7,43 - 7,52 (m, 2 H) 7,29 - 7,37 (m, 1 H) 7,09 - 7,16 (m, 1 H) 6,86 (s, 1 H) 3,59 - 3,63 (m, 4 H) 2,61 - 2,63 (m, 2 H) 2,56 - 2,61 (m, 4 H) 1,47 (s, 6 H)
34		N-[2-(бензилокси)-1,1-диметилетил]-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ДМСО-D6) δ част. на млн. 8,22 - 8,27 (m, 1 H) 8,18 - 8,23 (m, 1 H) 7,93 - 7,96 (m, 1 H) 7,84 - 7,89 (m, 1 H) 7,59 - 7,65 (m, 2 H) 7,42 - 7,50 (m, 2 H) 7,34 - 7,42 (m, 6 H) 5,59 (s, 2 H) 3,57 (d, 2 H) 1,24 (s, 6 H)
35		2-[(4-метилпіперазин-1-іл)карбоніл]-N-піридин-3-ілбензолсульфонамід	(400 МГц, ДМСО-D6) δ част. на млн. 10,15 - 10,31 (m, 1 H) 8,26 - 8,30 (m, 1 H) 8,19 - 8,24 (m, 1 H) 7,81 (d, 1 H) 7,66 (t, 1 H) 7,56 (t, 1 H) 7,46 - 7,51 (m, 1 H) 7,37 - 7,41 (m, 1 H) 7,20 - 7,28 (m, 1 H) 3,66 - 3,74 (m, 1 H) 3,48 - 3,59 (m, 1 H) 2,86 - 3,07 (m, 2 H) 2,40 - 2,46 (m, 1 H) 2,24 - 2,36 (m, 2 H) 2,19 (s, 3 H) 2,09 - 2,15 (m, 1 H)

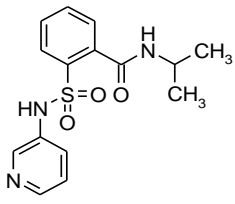
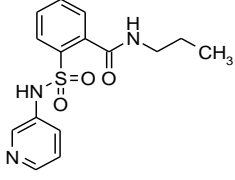
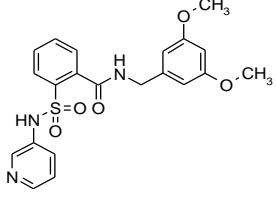
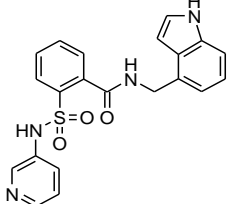
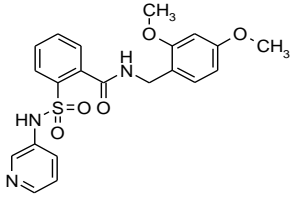
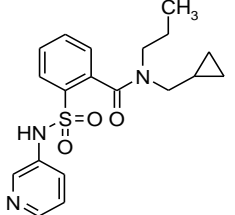
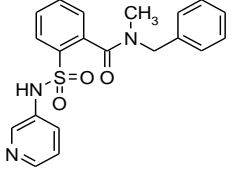
36		етил 4-{2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензоїл}піперазин-1-карбоксилат	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-D) δ част. на млн. 8,29 - 8,37 (m, 2 H) 7,51 - 7,63 (m, 3 H) 7,29 - 7,38 (m, 2 H) 7,09 - 7,18 (m, 1 H) 4,17 - 4,25 (m, 1 H) 4,11 (q, 2 H) 3,74 - 3,85 (m, 1 H) 3,53 - 3,69 (m, 1 H) 3,24 - 3,50 (m, 5 H) 1,21 - 1,30 (m, 3 H)
37		N-[2-(диметиламіно)етил]-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-D) δ част. на млн. 8,37 - 8,41 (m, 1 H) 8,21 - 8,26 (m, 1 H) 7,86 - 7,92 (m, 1 H) 7,60 - 7,65 (m, 1 H) 7,35 - 7,54 (m, 4 H) 7,02 - 7,11 (m, 1 H) 3,62 - 3,72 (m, 2 H) 2,81 (t, 2 H) 2,38 (s, 6 H)
38		N-(1,1-диметилпропіл)-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-D) δ част. на млн. 8,54 - 8,65 (m, 1 H) 8,26 - 8,36 (m, 2 H) 7,55 - 7,63 (m, 2 H) 7,46 - 7,56 (m, 2 H) 7,30 - 7,39 (m, 1 H) 7,08 - 7,20 (m, 1 H) 1,88 (q, 2 H) 1,46 (s, 6 H) 0,99 (t, 3 H)
39		N-(2-гідрокси-1,1-диметилетил)-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ДМСО-D6) δ част. на млн. 9,69 - 9,86 (m, 1 H) 8,19 - 8,32 (m, 2 H) 8,05 - 8,12 (m, 1 H) 7,60 - 7,74 (m, 2 H) 7,49-7,53 (m, 3 H) 7,20 - 7,34 (m, 1 H) 4,70 - 5,05 (m, 1 H) 3,58 (s, 2 H) 1,31 (s, 6 H)
40		N-етил-N-[2-(1H-піразол-1-іл)етил]-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-D) δ част. на млн. 8,29 - 8,36 (m, 2 H) 8,08 - 8,22 (m, 1 H) 7,60 - 7,65 (m, 1 H) 7,47 - 7,60 (m, 4 H) 7,28 - 7,37 (m, 2 H) 7,09 - 7,18 (m, 1 H) 6,22 (t, 1 H) 4,53 (t, 2 H) 3,87 - 4,04 (m, 2 H) 2,86 - 2,98 (m, 1 H) 2,55 - 2,70 (m, 1 H) 0,93 (t, 3 H)
41		2-[(4-метилпіперидин-1-іл) карбоніл]-N-піридин-3-ілбензолсульфонамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-D) δ част. на млн. 8,27 - 8,36 (m, 2 H) 7,44 - 7,63 (m, 3 H) 7,27 - 7,37 (m, 2 H) 7,04 - 7,19 (m, 1 H) 4,47 - 4,79 (m, 1 H) 3,37 - 3,59 (m, 1 H) 2,69 - 3,16 (m, 2 H) 1,78 - 1,97 (m, 1 H) 1,55 - 1,78 (m, 2 H) 1,32 - 1,51 (m, 1 H) 1,04 - 1,30 (m, 1 H) 0,88 - 1,03 (m, 3 H)

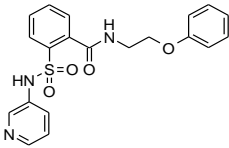
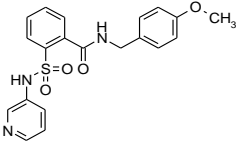
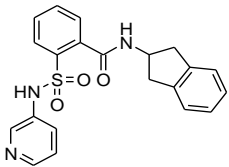
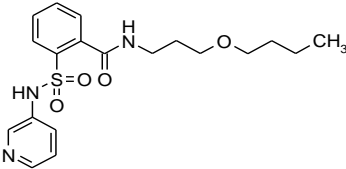
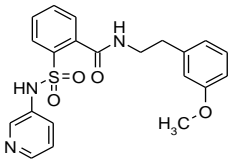
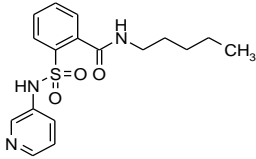
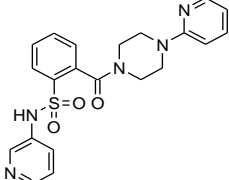
42		N-(3-метилбутил)-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-D) d част. на млн. 8,64 (s, 1 H) 8,26 - 8,43 (m, 2 H) 7,60 - 7,68 (m, 2 H) 7,45 - 7,59 (m, 2 H) 7,39 (t, 1 H) 7,12 - 7,21 (m, 1 H) 6,08 - 6,17 (m, 1 H) 3,52 (q, 2 H) 1,67 - 1,79 (m, 1 H) 1,57 (q, 2 H) 0,98 (d, 6 H)
43		N-(3-фторбензил)-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ДМСО-D6) d част. на млн. 9,76 (s, 1 H) 9,32 (t, 1 H) 8,31 (d, 1 H) 8,25 (d, 1 H) 7,66 - 7,78 (m, 2 H) 7,50 - 7,65 (m, 3 H) 7,39 (q, 1 H) 7,23 - 7,29 (m, 3 H) 7,09 (t, 1 H) 4,54 (d, 2 H)
44		N-(2,2-диметилпропіл)-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ДМСО-D6) d част. на млн. 9,68 (s, 1 H) 8,72 - 8,83 (m, 1 H) 8,22 - 8,33 (m, 2 H) 7,63 - 7,74 (m, 2 H) 7,46 - 7,61 (m, 3 H) 7,24 - 7,32 (m, 1 H) 3,14 (d, 2 H) 0,96 (s, 9 H)
45		N-(2,6-диметоксибензил)-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ДМСО-D6) d част. на млн. 9,69 (s, 1 H) 8,59 - 8,73 (m, 1 H) 8,21 - 8,36 (m, 2 H) 7,57 - 7,70 (m, 2 H) 7,45 - 7,56 (m, 2 H) 7,37 - 7,45 (m, 1 H) 7,22 - 7,33 (m, 2 H) 6,68 (d, 2 H) 4,50 (d, 2 H) 3,79 (s, 6 H)
46		N-(3-метоксибензил)-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ДМСО-D6) d част. на млн. 9,71 - 9,83 (m, 1 H) 9,18 - 9,44 (m, 1 H) 8,16 - 8,39 (m, 2 H) 7,64 - 7,81 (m, 2 H) 7,45 - 7,63 (m, 3 H) 7,20 - 7,31 (m, 2 H) 6,92 - 7,11 (m, 2 H) 6,73 - 6,89 (m, 1 H) 4,49 (d, 2 H) 3,74 (s, 3 H)
47		N-метил-N-пентил-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензамід	
48		N-(циклопропілметил)-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ДМСО-D6) d част. на млн. 9,70 (s, 1 H) 8,83 - 8,94 (m, 1 H) 8,20 - 8,32 (m, 2 H) 7,62 - 7,75 (m, 2 H) 7,47 - 7,59 (m, 3 H) 7,20 - 7,33 (m, 1 H) 3,18 (d, 2 H) 0,98 - 1,10 (m, 1 H) 0,41 - 0,48 (m, 2 H) 0,23 - 0,31 (m, 2 H)

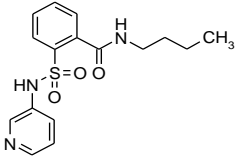
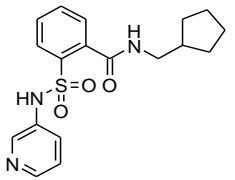
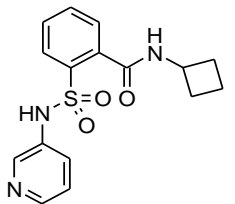
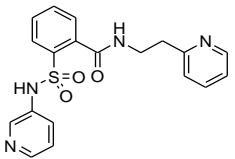
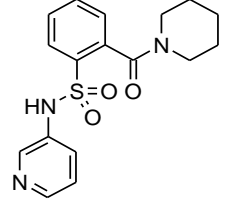
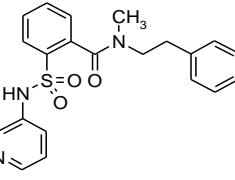
85

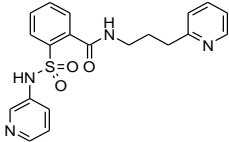
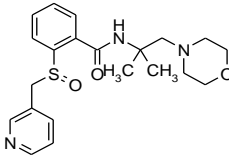
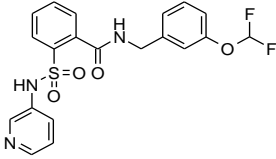
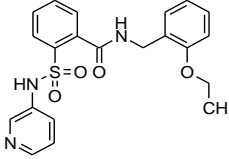
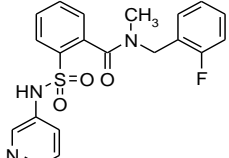
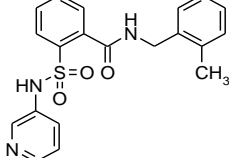
95250

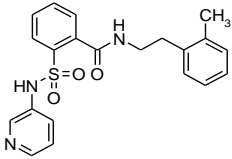
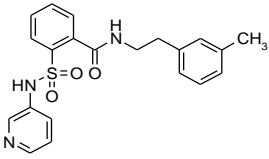
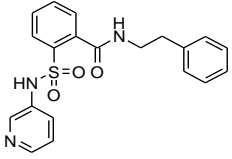
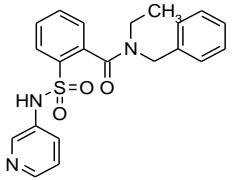
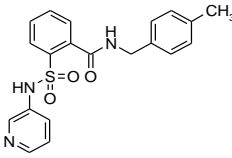
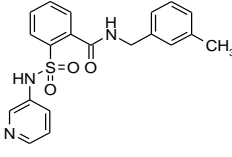
86

49		N-ізопропіл-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ДМСО-D6) d част. на млн. 9,71 (s, 1 H) 8,61 - 8,81 (m, 1 H) 8,13 - 8,39 (m, 2 H) 7,60 - 7,77 (m, 2 H) 7,43 - 7,61 (m, 3 H) 7,19 - 7,36 (m, 1 H) 3,95-4,20 (m, 1 H) 1,19 (s, 6 H)
50		N-пропіл-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензамід	
51		N-(3,5-диметоксибензил)-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ДМСО-D6) d част. на млн. 7,83 - 7,96 (m, 2 H) 7,63 - 7,74 (m, 2 H) 7,39 - 7,50 (m, 2 H) 7,12 - 7,24 (m, 1 H) 6,83 - 6,96 (m, 1 H) 6,63 - 6,72 (m, 2 H) 6,49 - 6,63 (m, 1 H) 6,26 - 6,43 (m, 1 H) 4,43 (d, 2 H) 3,72 (s, 6 H)
52		N-(1H-індол-4-ілметил)-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ДМСО-D6) d част. на млн. 11,15 (s, 1 H) 9,61 - 9,84 (m, 1 H) 9,13 - 9,44 (m, 1 H) 8,16 - 8,44 (m, 2 H) 7,63 - 7,86 (m, 2 H) 7,46 - 7,63 (m, 3 H) 7,27 - 7,42 (m, 3 H) 6,99 - 7,13 (m, 2 H) 6,65 (s, 1 H) 4,75 (d, 2 H)
53		N-(2,4-диметоксибензил)-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ДМСО-D6) d част. на млн. 9,72 (s, 1 H) 9,01 - 9,15 (m, 1 H) 8,22 - 8,36 (m, 2 H) 7,64 - 7,78 (m, 2 H) 7,45 - 7,61 (m, 3 H) 7,17 - 7,35 (m, 2 H) 6,55 (s, 1 H) 6,45 - 6,54 (m, 1 H) 4,40 (d, 2 H) 3,80 (s, 3 H) 3,74 (s, 3 H)
54		N-(циклопропілметил)-N-пропіл-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензамід	
55		N-бензил-N-метил-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензамід	

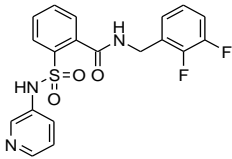
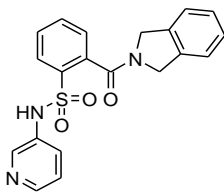
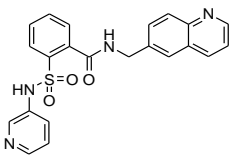
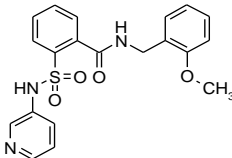
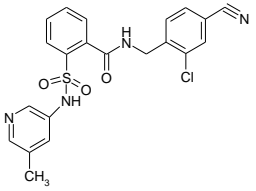
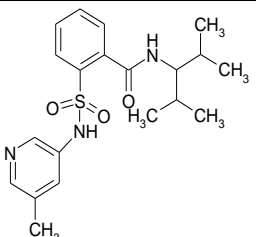
56		N-(2-феноксіетил)-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ДМСО-D6) d част. на млн. 9,72 (s, 1 H) 8,93 - 9,07 (m, 1 H) 8,15 - 8,34 (m, 2 H) 7,59 - 7,81 (m, 2 H) 7,44 - 7,60 (m, 3 H) 7,19 - 7,35 (m, 3 H) 6,83 - 7,05 (m, 3 H) 4,09 (t, 2 H) 3,66 (q, 2 H)
57		N-(4-метоксибензил)-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ДМСО-D6) d част. на млн. 9,75 (s, 1 H) 9,24 (t, 1 H) 8,32 (d, 1 H) 8,26 (d, 1 H) 7,64 - 7,76 (m, 2 H) 7,52 - 7,59 (m, 3 H) 7,25 - 7,36 (m, 3 H) 6,90 (d, 2 H) 4,46 (d, 2 H) 3,73 (s, 3 H)
58		N-(2,3-дигідро-1Н-інден-2-іл)-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ДМСО-D6) d част. на млн. 9,72 (s, 1 H) 9,00 - 9,13 (m, 1 H) 8,22 - 8,37 (m, 2 H) 7,60 - 7,75 (m, 2 H) 7,47 - 7,58 (m, 3 H) 7,19 - 7,29 (m, 3 H) 7,11 - 7,18 (m, 2 H) 4,60 - 4,75 (m, 1 H) 3,26 (t, 2 H) 2,99 (dd, 2 H)
59		N-(3-бутоксипропіл)-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-D) d част. на млн. 8,74 - 8,93 (m, 1 H) 8,25 - 8,37 (m, 2 H) 7,57 - 7,69 (m, 2 H) 7,48 - 7,54 (m, 2 H) 7,31 - 7,40 (m, 1 H) 7,19 - 7,25 (m, 1 H) 7,09 - 7,18 (m, 1 H) 3,56 - 3,66 (m, 4 H) 3,40 (t, 2 H) 1,87 - 1,98 (m, 2 H) 1,36 - 1,47 (m, 2 H) 1,11 - 1,29 (m, 2 H) 0,77 (t, 3 H)
60		N-[2-(3-метоксифеніл)етил]-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ДМСО-D6) d част. на млн. 9,75 (s, 1 H) 8,87 (t, 1 H) 8,31 (d, 1 H) 8,25 (d, 1 H) 7,62 - 7,73 (m, 2 H) 7,49 - 7,58 (m, 2 H) 7,40 - 7,48 (m, 1 H) 7,16 - 7,31 (m, 2 H) 6,81 - 6,91 (m, 2 H) 6,74 - 6,81 (m, 1 H) 3,74 (s, 3 H) 3,50 (q, 2 H) 2,84 (t, 2 H)
61		N-пентил-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензамід	
62		N-піридин-3-іл-2-[(4-піридин-2-ілпіперазин-1-іл)карбоніл]бензолсульфонамід	(400 МГц, ДМСО-D6) d част. на млн. 10,23 (s, 1 H) 8,31 (s, 1 H) 8,20 - 8,26 (m, 1 H) 8,06 - 8,16 (m, 1 H) 7,80 - 7,89 (m, 1 H) 7,65 - 7,73 (m, 1 H) 7,40 - 7,64 (m, 4 H) 7,21

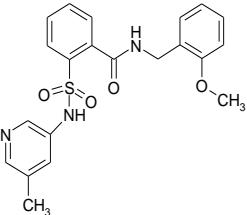
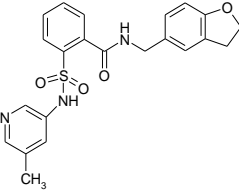
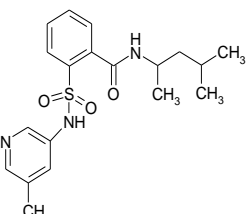
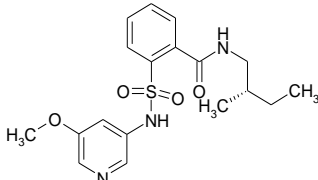
			- 7,30 (m, 1 H) 6,84 (d, 1 H) 6,58 - 6,70 (m, 1 H) 3,54 - 3,84 (m, 4 H) 3,34 - 3,56 (m, 2 H) 3,00 - 3,24 (m, 2 H)
63		N-бутил-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ДМСО-D6) d част. на млн. 9,90 - 10,00 (m, 1 H) 8,73 (t, 1 H) 8,28 - 8,37 (m, 2 H) 7,71 - 7,76 (m, 1 H) 7,61 - 7,70 (m, 2 H) 7,49 - 7,57 (m, 2 H) 7,35 - 7,44 (m, 1 H) 3,25 (q, 2 H) 1,51-1,54 (m, 2 H) 1,29 - 1,40 (m, 2 H) 0,90 (t, 3 H)
64		N-(циклопентилметил)-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ДМСО-D6) d част. на млн. 9,68 (s, 1 H) 8,75 - 8,91 (m, 1 H) 8,21 - 8,36 (m, 2 H) 7,64 - 7,73 (m, 2 H) 7,45 - 7,60 (m, 3 H) 7,19 - 7,32 (m, 1 H) 3,14 - 3,27 (m, 2 H) 2,10 - 2,24 (m, 1 H) 1,67 - 1,80 (m, 2 H) 1,43 - 1,66 (m, 4 H) 1,19 - 1,36 (m, 2 H)
65		N-циклобутил-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-D6) d част. на млн. 8,62 (s, 1 H) 8,31-8,42 (m, 2 H) 7,62-7,69 (m, 2 H) 7,7,53-7,59 (m, 2H) 7,35-7,39 (m, 1 H) 7,15-7,22 (m, 1H) 6,29-6,41 (m, 1 H) 4,48-4,52 (m, 1 H) 2,43-2,59 (m, 2 H) 2,02-2,15 (m, 2 H) 1,81-1,92 (m, 2 H)
66		2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]-N-(2-піридин-2-ілетил)бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-D) d част. на млн. 8,51-8,59 (m, 1 H) 8,28-8,35 (m, 2 H) 7,73-7,80 (m, 1 H) 7,51-7,72 (m, 5 H) 7,43-7,49 (m, 1 H) 7,20-7,27 (m, 2 H) 7,11-7,19 (m, 2 H) 3,88-3,92 (m, 2 H) 3,12-3,21 (m, 2 H)
67		2-(піперидин-1-ілкарбоніл)-N-піридин-3-ілбензолсульфонамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-D6) d част. на млн. 8,42 (s, 2 H) 7,61-7,69 (m, 3 H) 7,31-7,42 (m, 2 H) 7,15-7,21 (m, 1H) 3,92-4,12 (m, 1 H) 3,61-3,65 (m, 1 H) 3,21-3,49 (m, 2 H) 1,35 - 1,76 (m, 6 H)
68		N-метил-N-(2-фенілетил)-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-D) d част. на млн. 8,31-8,42 (m, 3 H) 7,88-8,03 (m, 1 H) 7,51-7,60 (m, 3 H) 7,14-7,42 (m, 4 H) 6,95-7,04 (m, 2 H) 6,62-6,74 (m, 1 H) 3,72-3,94 (m, 2 H) 3,31-

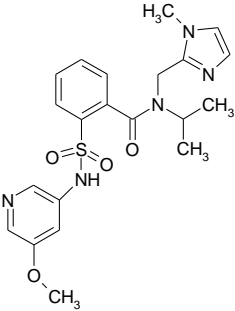
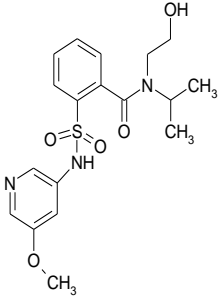
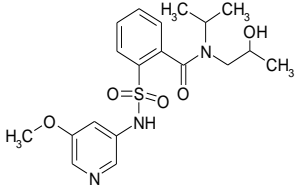
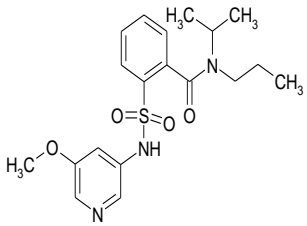
			3,51 (m, 2 H) 2,81 (s, 3 H)
69		2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]-N-(3-піридин-2-ілпропіл)бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-D) δ част. на млн. 8,28 - 8,39 (m, 3 H) 8,03 - 8,11 (m, 1 H) 7,65 - 7,72 (m, 1 H) 7,58 - 7,65 (m, 2 H) 7,48 - 7,57 (m, 2 H) 7,32 - 7,43 (m, 1 H) 7,19 - 7,26 (m, 1 H) 7,05 - 7,18 (m, 2 H) 3,54 (q, 2 H) 2,95 - 3,02 (m, 2 H) 2,06 - 2,16 (m, 2 H)
70		N-(1,1-диметил-2-морфолін-4-ілетил)-2-[(піридин-3-ілметил)сульфініл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-D) δ част. на млн. 8,45 (d, 1 H) 8,07 - 8,11 (m, 1 H) 7,39 - 7,53 (m, 5 H) 7,13 - 7,20 (m, 1 H) 7,05 (s, 1 H) 4,40 (d, 1 H) 4,19 (d, 1 H) 3,61 - 3,70 (m, 4 H) 2,48 - 2,65 (m, 6 H) 1,46 (d, 6 H)
71		N-[3-(дифторметокси)бензил]-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензамід	¹ H ЯМР (400 МГц, ХЛОРОФОРМ-D) δ част. на млн. 8,30 - 8,43 (m, 2 H) 7,62 - 7,77 (m, 2 H) 7,54 - 7,61 (m, 2 H) 7,40 - 7,50 (m, 2 H) 7,25 - 7,34 (m, 1 H) 7,13 - 7,22 (m, 3 H) 7,07 (d, 1 H) 6,46 - 6,56 (m, 1 H) 4,73 (d, 2 H) 1,6-1,66 (m, 1H)
72		N-(2-етоксибензил)-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензамід	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО-D6) δ част. на млн. 9,72 (s, 1 H) 9,20 (br.s, 1 H) 8,24 (d, 2 H) 7,62 - 7,78 (m, 3 H) 7,47 - 7,59 (m, 2 H) 7,40 (d, 1 H) 7,18 - 7,32 (m, 2 H) 6,81 - 7,07 (m, 2 H) 4,50 (d, 2 H) 4,07 (q, 2 H) 1,37 (t, 3 H)
73		N-(2-фторбензил)-N-метил-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензамід	¹ H ЯМР (400 МГц, ХЛОРОФОРМ-D) основ-ного обертового ізомеру: δ част. на млн. 8,30 - 8,40 (m, 2 H) 7,52 - 7,67 (m, 3 H) 7,28 - 7,43 (m, 4 H) 6,96 - 7,23 (m, 4 H) 4,99 - 5,12 (m, 1 H) 4,68 - 4,81 (m, 1 H) 2,89 (s, 3 H)
74		N-(2-метилбензил)-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензамід	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО-D6) δ част. на млн. 9,43 - 9,62 (m, 1 H) 8,14 (d, 2 H) 7,78 (d, 1 H) 7,58 - 7,67 (m, 2 H) 7,49 - 7,57 (m, 1 H) 7,32 - 7,47 (m, 2 H) 7,11 - 7,29 (m, 5 H) 4,48 (d, 2 H) 2,35 (s, 3 H)

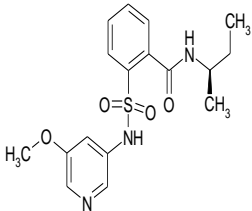
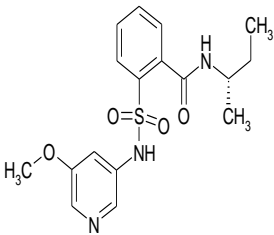
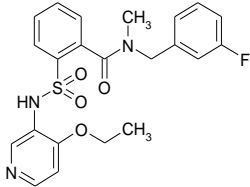
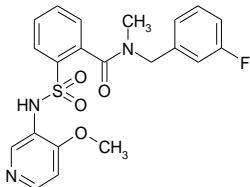
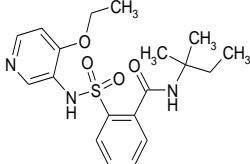
75		N-[2-(2-метилфеніл)етил]-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензамід	1H ЯМР (400 МГц, ДМСО-D6) d част. на млн. 9,78 (br.s, 1 H) 8,87 (br.s, 1 H) 8,21 - 8,32 (m, 2 H) 7,62 - 7,77 (m, 2 H) 7,41 - 7,59 (m, 3 H) 7,24 - 7,30 (m, 1 H) 7,18 - 7,24 (m, 1 H) 7,08-7,20 (m, 1 H) 3,46 (q, 2 H) 2,87 (t, 2 H) 2,32 - 2,35 (m, 3 H)
76		N-[2-(3-метилфеніл)етил]-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензамід	1H ЯМР (400 МГц, ДМСО-D6) d част. на млн. 9,75 (br.s, 1 H) 8,90 (br.s, 1 H) 8,13 - 8,37 (m, 2 H) 7,61 - 7,76 (m, 2 H) 7,40 - 7,56 (m, 3 H) 7,14 - 7,30 (m, 2 H) 6,92 - 7,13 (m, 3 H) 3,47 (q, 2 H) 2,82 (t, 2 H) 2,30 (s, 3 H)
77		N-(2-фенілетил)-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензамід	1H ЯМР (400 МГц, ДМСО-D6) d част. на млн. 9,75 (s, 1 H) 8,95 (s, 1 H) 8,19 - 8,35 (m, 2 H) 7,62 - 7,76 (m, 2 H) 7,47 - 7,58 (m, 2 H) 7,42 - 7,47 (m, 1 H) 7,19 - 7,36 (m, 6 H) 3,50 (q, 2 H) 2,88 (t, 2 H)
78		N-бензил-N-етил-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензамід	1H ЯМР (400 МГц, ДМСО-D6) основного обертового ізомеру: d част. на млн. 8,16 - 8,22 (m, 1 H) 8,00 - 8,08 (m, 1 H) 7,73 - 7,83 (m, 1 H) 7,45 - 7,54 (m, 2 H) 7,32 - 7,41 (m, 5 H) 7,24 - 7,33 (m, 2 H) 7,17-7,23 (m, 1 H) 7,04 - 7,16 (m, 1 H) 2,86-3,06 (m, 2 H) 2,66 (q, 2 H) 1,09 (t, 3 H)
79		N-(4-метилбензил)-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензамід	1H ЯМР (400 МГц, ДМСО-D6) d част. на млн. 9,76 (br.s, 1 H) 9,32 (br.s, 1 H) 8,24 (d, 2 H) 7,63 - 7,78 (m, 2 H) 7,44 - 7,60 (m, 3 H) 7,22 - 7,33 (m, 3 H) 7,11 - 7,18 (m, 2 H) 4,47 (d, 2 H) 2,29 (s, 3 H)
80		N-(3-метилбензил)-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензамід	1H ЯМР (400 МГц, ДМСО-D6) d част. на млн. 9,75 (br.s, 1 H) 9,39 (br.s, 1 H) 8,16 - 8,32 (m, 2 H) 7,64 - 7,79 (m, 2 H) 7,44 - 7,64 (m, 3 H) 7,17 - 7,29 (m, 4 H) 7,06 (d, 1 H) 4,48 (d, 2 H) 2,29 (s, 3 H)

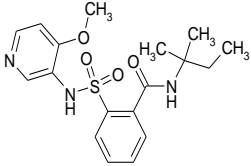
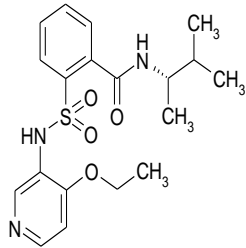
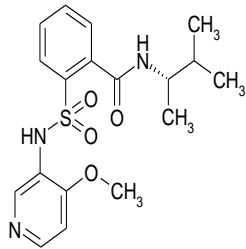
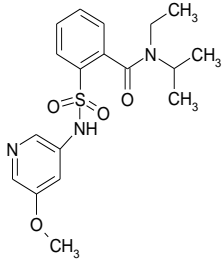
81		N-{4-[(метиламіно)карбоніл]бензил}-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензамід	1H ЯМР (400 МГц, ДМСО-D6) d част. на млн. 9,75 (br.s, 1 H) 9,36 (br.s, 1 H) 8,41 (d, 1 H) 8,28 - 8,33 (m, 1 H) 8,24 (d, 1 H) 7,83 (d, 2 H) 7,65 - 7,78 (m, 2 H) 7,51 - 7,64 (m, 3 H) 7,47 (d, 2 H) 7,19 - 7,30 (m, 1 H) 4,55 (d, 2 H) 2,78 (d, 3 H)
82		N-(2,3-дигідро-1-бензофуран-5-ілметил)-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензамід	1H ЯМР (400 МГц, ДМСО-D6) d част. на млн. 9,72 (br.s, 1 H) 9,23 (br.s, 1 H) 8,21 - 8,31 (m, 2 H) 7,64 - 7,75 (m, 2 H) 7,48 - 7,58 (m, 3 H) 7,23 - 7,30 (m, 2 H) 7,08 - 7,14 (m, 1 H) 6,64 - 6,74 (m, 1 H) 4,46 - 4,53 (m, 2 H) 4,43 (d, 2 H) 3,11 - 3,19 (m, 2 H)
83		2-(3,4-дигідроізохінолін-2(1H)-ілкарбоніл)-N-піридин-3-ілбензолсульфонамід	1H ЯМР (400 МГц, ДМСО-D6) d част. на млн. 10,28 (br.s, 1 H) 8,25 - 8,33 (m, 1 H) 8,13 - 8,24 (m, 1 H) 7,78 - 7,89 (m, 1 H) 7,65 - 7,73 (m, 1 H) 7,55 - 7,64 (m, 1 H) 7,45 - 7,54 (m, 1 H) 7,36 - 7,44 (m, 1 H) 7,08 - 7,28 (m, 5 H) 4,51 - 4,94 (br.m, 1 H) 4,05 - 4,35 (br.m, 1 H) 3,69 - 4,03 (br.m, 1 H) 3,16 - 3,29 (m, 1 H) 2,81 - 3,01 (m, 1 H) 2,70 - 2,78 (m, 1 H)
84		N-{4-[(диметиламіно)метил]бензил}-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензамід	1H ЯМР (400 МГц, ДМСО-D6) d част. на млн. 9,58 (br.s, 1 H) 8,20 (d, 2 H) 7,77 (d, 1 H) 7,58 - 7,68 (m, 2 H) 7,48 - 7,58 (m, 1 H) 7,45 (d, 1 H) 7,38 (d, 2 H) 7,27 (d, 2 H) 7,12 - 7,22 (m, 1 H) 4,50 (d, 2 H) 2,21 (s, 6 H) 1,89 (s, 2 H)
85		N-(3,4-дифторбензил)-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензамід	1H ЯМР (400 МГц, ДМСО-D6) d част. на млн. 9,77 (br.s, 1 H) 9,34 (br.s, 1 H) 8,21 - 8,34 (m, 2 H) 7,66 - 7,79 (m, 2 H) 7,34 - 7,65 (m, 5 H) 7,22 - 7,30 (m, 2 H) 4,51 (d, 2 H)
86		N-[4-(1-гідрокси-1-метилетил)бензил]-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензамід	1H ЯМР (400 МГц, ДМСО-D6) d част. на млн. 9,72 (br.s, 1 H) 9,31 (br.s, 1 H) 8,20 - 8,35 (m, 2 H) 7,65 - 7,77 (m, 2 H) 7,47 - 7,61 (m, 3 H) 7,40 - 7,45 (m, 3 H) 7,25-7,37 (m, 3 H) 4,50

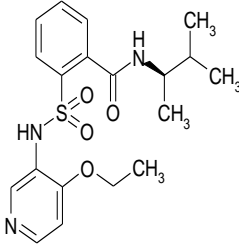
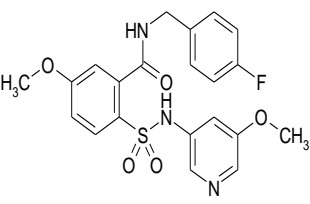
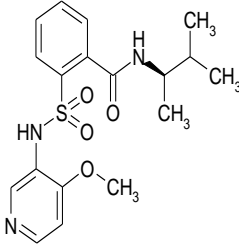
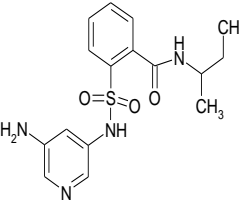
			(d, 2 H) 1,38 (s, 6 H)
87		N-(2,3-дифторбензил)-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензамід	1H ЯМР (400 МГц, ДМСО-D6) δ част. на млн. 9,81 (br.s, 1 H) 9,41 (br.s, 1 H) 8,01 - 8,37 (m, 2 H) 7,65 - 7,80 (m, 2 H) 7,46 - 7,62 (m, 3 H) 7,30 - 7,40 (m, 2 H) 7,12 - 7,29 (m, 2 H) 3,31 (s, 2 H)
88		2-(1,3-дигідро-2H-ізоіндол-2-ілкарбоніл)-N-піридин-3-ілбензолсульфонамід	1H ЯМР (400 МГц, ДМСО-D6) δ част. на млн. 10,29 (br.s, 1 H) 8,15 - 8,33 (m, 2 H) 7,88 (d, 1 H) 7,68 - 7,79 (m, 1 H) 7,56 - 7,66 (m, 2 H) 7,45 - 7,54 (m, 1 H) 7,37 - 7,47 (m, 1 H) 7,13 - 7,35 (m, 5 H) 4,79 - 4,94 (m, 2 H) 4,25 - 4,52 (m, 2 H)
89		2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]-N-(хінолін-6-ілметил)бензамід	1H ЯМР (400 МГц, ДМСО-D6) δ част. на млн. 9,88 (br.s, 1 H) 9,37 - 9,53 (m, 1 H) 8,91 - 9,09 (m, 1 H) 8,54 - 8,67 (m, 1 H) 8,24 - 8,40 (m, 2 H) 8,09 (d, 2 H) 7,93 (d, 1 H) 7,78 (d, 1 H) 7,64 - 7,75 (m, 3 H) 7,51 - 7,64 (m, 2 H) 7,25 - 7,37 (m, 1 H) 4,73 (d, 2 H)
90		N-(2-метоксибензил)-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензамід	1H ЯМР (400 МГц, ДМСО-D6) δ част. на млн. 9,56-9,82 (br.s 1 H) 8,99 (br.s, 1 H) 8,16 - 8,34 (m, 2 H) 7,66 - 7,81 (m, 2 H) 7,59 - 7,65 (m, 1 H) 7,44 - 7,59 (m, 2 H) 7,38 (d, 1 H) 7,18 - 7,30 (m, 2 H) 7,00 (d, 1 H) 6,93 (t, 1 H) 4,49 (d, 2 H) 3,83 (s, 3 H)
91		N-(2-хлор-4-ціанобензил)-2-[(5-метилпіридин-3-іл)аміно]сульфоніл}бензамід	(400 МГц, ДМСО-d6) δ част. на млн. 9,69 (s, 1 H), 9,44 (s, 1 H), 8,06 - 8,15 (m, 3 H), 7,79 - 7,89 (m, 2 H), 7,68 - 7,79 (m, 3 H), 7,61 (t, J=6,95 Гц, 1 H), 7,37 (s, 1 H), 4,63 (d, J=5,05 Гц, 2 H), 2,19 (s, 3 H)
92		N-(1-ізопропіл-2-метилпропіл)-2-[(5-метилпіридин-3-іл)аміно]сульфоніл}бензамід	(400 МГц, ДМСО-d6) δ част. на млн. 9,51 (s, 1 H), 8,53 (d, J=9,60 Гц, 1 H), 8,11 (d, J=8,08 Гц, 1 H), 8,10 (s, 1 H), 7,68 - 7,74 (m, 2 H), 7,52 - 7,62 (m, 2 H), 7,36 (s, 1 H), 3,66 (dt, J=9,60,

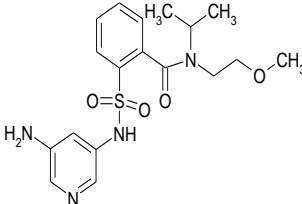
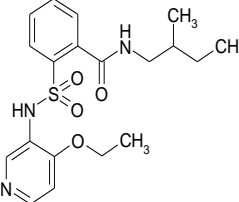
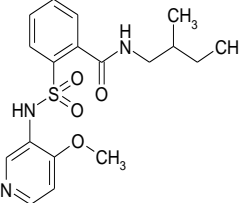
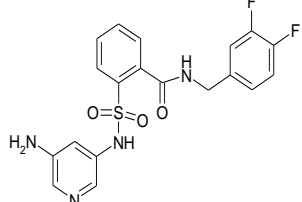
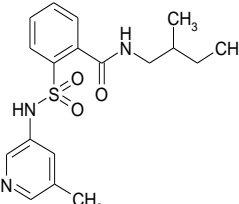
			6,57 Гц, 1 H), 2,21 (s, 3 H), 1,84 - 1,95 (m, J=13,39, 6,82, 6,69, 6,69 Гц, 2 H), 0,94 (dd, J=14,40, 6,82 Гц, 12 H)
93		N-(2-метоксибензил)-2-[[5-метилпіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ДМСО-d6) d част. на млн. 9,64 (s, 1 H), 9,22 (s, 1 H), 8,10 (s, 2 H), 7,68 - 7,77 (m, 2 H), 7,63 - 7,68 (m, 1 H), 7,57 (td, J=7,64, 1,39 Гц, 1 H), 7,40 (d, J=6,06 Гц, 1 H), 7,39 (s, 1 H), 7,36 (s, 1 H), 7,27 (td, J=7,77, 1,64 Гц, 1 H), 7,01 (d, J=7,58 Гц, 1 H), 6,95 (t, J=7,33 Гц, 1 H), 4,49 (d, J=5,31 Гц, 2 H), 3,82 - 3,86 (m, 3 H), 2,20 (s, 3 H)
94		N-(2,3-дигідро-1-бензофуран-5-ілметил)-2-[[5-метилпіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ДМСО-d6) d част. на млн. 9,64 (s, 1 H), 9,22 (s, 1 H), 8,10 (s, 1 H), 7,68 - 7,77 (m, 1 H), 7,62 - 7,67 (m, 1 H), 7,57 (td, J=7,58, 1,52 Гц, 1 H), 7,40 (d, J=5,81 Гц, 1 H), 7,39 (s, 1 H), 7,36 (s, 1 H), 7,27 (td, J=7,77, 1,64 Гц, 1 H), 7,01 (d, J=7,58 Гц, 1 H), 6,95 (t, J=7,45 Гц, 1 H), 4,49 (d, J=5,56 Гц, 2 H), 3,84 (s, 3 H), 2,20 (s, 3 H), 2,07(m,1H)
95		N-(1,3-диметилбутил)-2-[[5-метилпіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ДМСО-d6) d част. на млн. 9,60 (s, 1 H), 8,63 (s, 1 H), 8,10 (d, J=4,55 Гц, 1 H), 8,09 (s, 1 H), 7,68 (t, J=7,58 Гц, 2 H), 7,49 - 7,56 (m, 2 H), 7,35 (s, 1 H), 4,05 - 4,15 (m, 1 H), 2,21 (s, 3 H), 1,69 - 1,79 (m, 1 H), 1,46 - 1,55 (m, 1 H), 1,24 (ddd, J=13,58, 8,40, 5,56 Гц, 1 H), 1,15 (d, J=6,57 Гц, 3 H), 0,91 (dd, J=9,60, 6,57 Гц, 6 H)
96		2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-[(2S)-2-метилбутил]бензамід	(400 МГц, ХЛОРОФОРМ-d) d част. на млн. 0,97 (s, 1 H) 0,98 - 1,05 (m, 5 H) 1,28 (m, 1 H) 1,30 (m, 1H) 1,52 (m, 1 H) 1,79 (m, 1 H) 3,29 - 3,39 (m, 1 H) 3,43 - 3,54 (m, 1 H) 3,83 (s, 3 H)

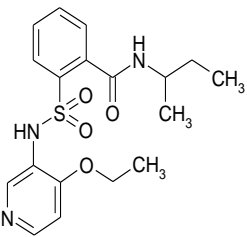
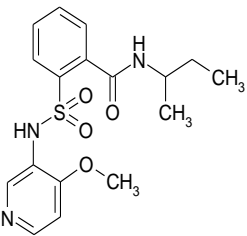
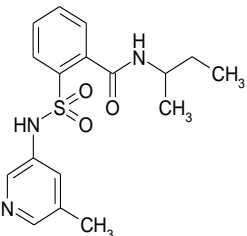
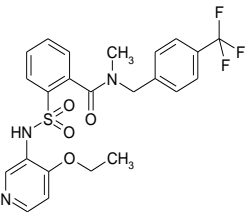
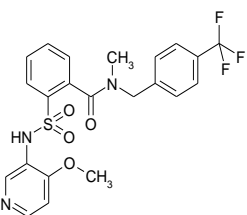
			6,16 (s, 1 H) 7,44 (td, J=7,71, 1,52 Гц, 1 H) 7,51 - 7,61 (m, 2 H) 7,73 (d, J=7,83 Гц, 1 H) 7,97 (s, 1 H) 8,06 (s, 1 H) 8,70 (s, 1 H)
97		N-ізопропіл-2-[[[(5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-[(1-метил-1H-імідазол-2-іл)метил]бензамід	(400 МГц, ДМСО-d6) d част. на млн. 8,05 (d, J=7,33 Гц, 1 H), 7,87 - 7,95 (m, 1 H), 7,78 - 7,84 (m, 1 H), 7,65 - 7,76 (m, 2 H), 7,54 (d, J=7,33 Гц, 1 H), 7,52 (dd, J=3,92, 2,65 Гц, 1 H), 7,32 (s, 1 H), 7,17 (s, 1 H), 6,90 (s, 1 H), 4,91 (d, J=16,67 Гц, 1 H), 4,62 (d, J=16,67 Гц, 1 H), 3,74 - 3,81 (m, 3 H), 3,63 - 3,73 (m, 3 H), 1,02 - 1,12 (m, 6 H)
98		N-(2-гідроксіетил)-N-ізопропіл-2-[[[(5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ДМСО-d6) d част. на млн. 10,25 (s, 1 H), 7,90 - 8,01 (m, 2 H), 7,81 (t, J=8,72 Гц, 1 H), 7,63 - 7,73 (m, 1 H), 7,54 - 7,63 (m, 1 H), 7,43 (t, J=7,45 Гц, 1 H), 7,10 - 7,20 (m, 1 H), 4,77 (s, 1 H), 3,71 - 3,82 (m, 4 H), 3,52 - 3,59 (m, 1 H), 3,43 - 3,49 (m, 1 H), 3,32 - 3,41 (m, 2 H), 1,08 (dd, J=14,65, 6,57 Гц, 6H)
99		N-(2-гідроксипропіл)-N-ізопропіл-2-[[[(5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРОФОРМ-d) d част. на млн. 1,18 - 1,26 (m, 7 H) 1,28 - 1,32 (m, 3 H) 3,32 (m, 1 H) 3,41 (m, 1 H) 3,53 - 3,65 (m, 1 H) 3,76 - 3,84 (m, 4 H) 3,87 - 3,92 (m, 1 H) 4,38-4,26 (m, 1 H) 7,14 (m, 1 H) 7,33 - 7,43 (m, 2 H) 7,55 - 7,65 (m, 2 H) 7,91 (bs, 1 H) 8,08 (bs, 1 H)
100		N-ізопропіл-2-[[[(5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-пропілбензамід	(400 МГц, ХЛОРОФОРМ-d) d част. на млн. 0,68 (t, J=7,45 Гц, 0,6 H) 1,02 (t, J=7,45 Гц, 2,5 H) 1,22 (dd, J=6,57, 3,28 Гц, 5 H) 1,40 (d, J=6,82 Гц, 1,4 H) 1,77 - 1,86 (m, 2 H) 2,96-3,09 (m, 0,4 H) 3,24 (m, 1 H) 3,47 (m, 1 H) 3,80 (s, 3 H) 7,22 (s, 1 H) 7,32 - 7,39 (m, 2 H) 7,56 (td, J=7,58, 1,26 Гц, 1 H) 7,61 - 7,65 (m, 1 H)

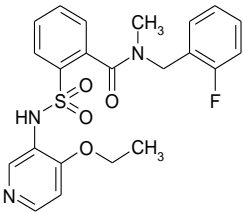
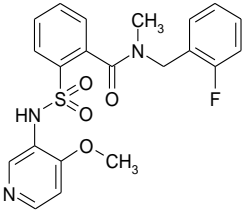
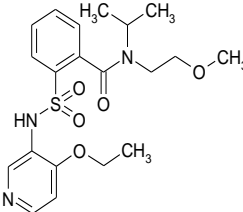
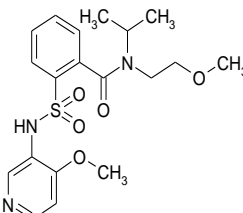
			7,96 (bs, 1 H) 8,07 (bs, 1 H) 8,14 b(s, 1 H)
101		2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-[(1R)-1-метилпропіл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) d част. на млн. 1,04 (m, 3 H) 1,31 (m, 3 H) 1,64 (m, 2 H) 3,82 (s, 3 H) 4,10 - 4,20 (m, 1 H) 5,91 (m, 1 H) 7,21 - 7,26 (m, 1 H) 7,43 (m, 1 H) 7,54 (m, 2 H) 7,72 (m, 1 H) 7,97 (s, 1 H) 8,05 (s, 1 H) 8,68 (bs, 1 H)
102		2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-[(1S)-1-метилпропіл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) d част. на млн. 1,05 (m, 3 H) 1,32 (m, 1 H) 1,33 (m, 2H) 1,61 - 1,73 (m, 3 H) 3,83 (s, 3 H) 4,11 - 4,21 (m, 1 H) 5,90 m, 1H) 7,41 - 7,47 (m, 1 H) 7,51 - 7,61 (m, 2 H) 7,74 (m, 1 H) 7,99 (s, 1 H) 8,07 (s, 1 H) 8,72 (bs, 1 H)
103		2-[[4-етоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-(3-фторбензил)-N-метилбензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) d част. на млн. 0,88 - 1,34 (m, 3 H) 2,85 (s, 2 H) 3,10 (s, 1 H) 3,64 - 4,04 (m, 2 H) 4,28 - 4,99 (m, 2 H) 6,65 (d, J=5,79 Гц, 1 H) 6,79 - 7,10 (m, 2 H) 7,13 - 7,28 (m, 1 H) 7,32 - 7,45 (m, 3 H) 7,47 - 7,64 (m, 1 H) 7,74 (t, J=8,94 Гц, 1 H) 7,85 - 8,05 (m, 1 H) 8,27 (dd, J=5,54, 3,02 Гц, 1 H) 8,49 - 8,75 (m, 1 H)
104		N-(3-фторбензил)-2-[[4-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-метилбензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) d част. на млн. 2,83 (s, 2 H) 3,10 (s, 1 H) 3,36 - 3,74 (m, 3 H) 4,11 - 4,98 (m, 2 H) 6,68 (d, J=5,54 Гц, 1 H) 6,92 - 7,09 (m, 2 H) 7,13 - 7,25 (m, 2 H) 7,30 - 7,47 (m, 2 H) 7,47 - 7,65 (m, 1 H) 7,75 (t, J=7,81 Гц, 1 H) 7,89 (d, J=3,02 Гц, 1 H) 8,29 (d, J=5,54 Гц, 1 H) 8,50 - 8,82 (m, 1 H)
105		N-(1,1-диметилпропіл)-2-[[4-етоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) d част. на млн. 0,99 (t, J=7,43 Гц, 3 H) 1,16 (t, J=6,92 Гц, 3 H) 1,47 (s, 6 H) 1,89 (q, J=7,55 Гц, 2 H) 3,83 (q, J=6,97 Гц, 2 H)

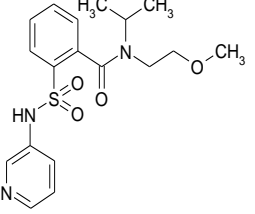
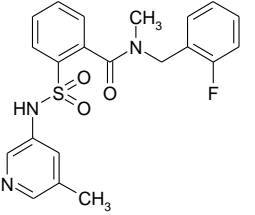
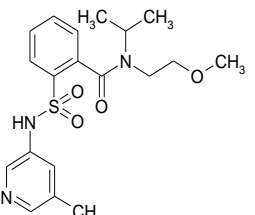
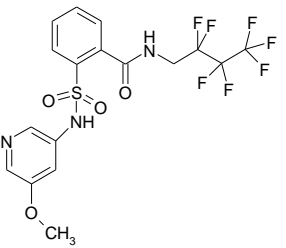
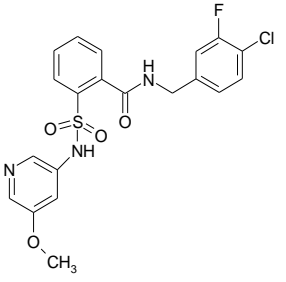
			5,75 (s, 1 H) 6,62 (d, J=5,54 Гц, 1 H) 7,33 - 7,47 (m, 1 H) 7,48 - 7,64 (m, 2 H) 7,76 (d, J=7,81 Гц, 1 H) 8,23 (d, J=5,54 Гц, 1 H) 8,62 (s, 1 H) 8,73 (s, 1 H)
106		N-(1,1-диметилпропіл)-2-[[4-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРОФОРМ-d) δ част. на млн. 0,99 (t, J=7,43 Гц, 3 H) 1,48 (s, 6 H) 1,89 (q, J=7,55 Гц, 2 H) 3,50 - 3,65 (m, 3 H) 5,77 (s, 1 H) 6,66 (d, J=5,54 Гц, 1 H) 7,42 (t, J=7,43 Гц, 1 H) 7,48 - 7,59 (m, 2 H) 7,75 (d, J=7,81 Гц, 1 H) 8,27 (d, J=5,54 Гц, 1 H) 8,47 - 8,54 (m, 1 H) 8,56 (s, 1 H)
107		N-[(1S)-12-диметилпропіл]-2-[[4-етоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРОФОРМ-d) δ част. на млн. 1,02 (t, J=6,67 Гц, 6 H) 1,14 (t, J=7,05 Гц, 3 H) 1,21 - 1,31 (m, 3 H) 1,79 - 1,97 (m, 1 H) 3,61 - 3,92 (m, 2 H) 4,00 - 4,22 (m, 1 H) 5,89 (d, J=8,56 Гц, 1 H) 6,62 (d, J=5,54 Гц, 1 H) 7,44 (t, J=7,68 Гц, 1 H) 7,48 - 7,60 (m, 2 H) 7,77 (d, J=7,81 Гц, 1 H) 8,23 (d, J=5,54 Гц, 1 H) 8,63 (s, 1 H) 8,68 (s, 1 H)
108		N-[(1S)-12-диметилпропіл]-2-[[4-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРОФОРМ-d) δ част. на млн. 1,02 (t, J=7,05 Гц, 6 H) 1,15 - 1,38 (m, 3 H) 1,75 - 2,00 (m, 1 H) 3,60 (s, 3 H) 3,86 - 4,18 (m, 1 H) 5,91 (d, J=8,81 Гц, 1 H) 6,66 (d, J=5,54 Гц, 1 H) 7,37 - 7,49 (m, 1 H) 7,50 - 7,62 (m, 2 H) 7,78 (d, J=7,81 Гц, 1 H) 8,26 (d, J=5,54 Гц, 1 H) 8,53 (s, 1 H) 8,62 (s, 1 H)
109		N-етил-N-ізопропіл-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ДМСО-d6) δ част. на млн. 10,19 (s, 1 H), 7,90 - 7,94 (m, 1 H), 7,80 (d, J=7,83 Гц, 1 H), 7,64 - 7,71 (m, 1 H), 7,54 - 7,61 (m, 1 H), 7,42 (s, 1 H), 7,38 - 7,42 (m, 1 H), 7,13 (t, J=2,40 Гц, 1 H), 3,74 - 3,80 (m, 3 H), 3,49 (dt, J=13,20,

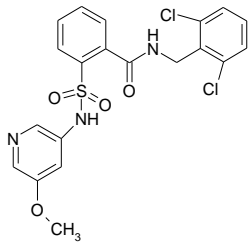
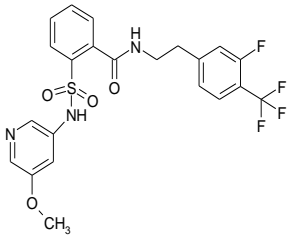
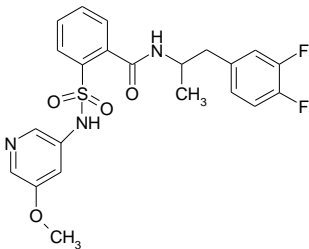
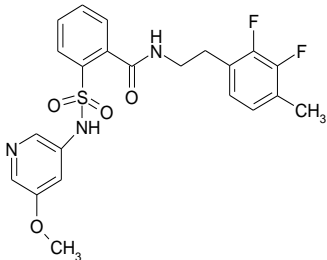
			6,66 Гц, 1 H), 3,34 - 3,43 (m, 2 H), 3,34 (s, 1 H), 1,24 (ddd, J=17,56, 7,20, 7,07 Гц, 4 H), 1,06 - 1,16 (m, 5H)
110		N-[(1R)-12-диметилпропіл]-2-[[4-етоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 1,02 (t, J=6,67 Гц, 6 H) 1,14 (t, J=7,05 Гц, 3 H) 1,21 - 1,31 (m, 3 H) 1,79 - 1,97 (m, 1 H) 3,61 - 3,92 (m, 2 H) 4,00 - 4,22 (m, 1 H) 5,89 (d, J=8,56 Гц, 1 H) 6,62 (d, J=5,54 Гц, 1 H) 7,44 (t, J=7,68 Гц, 1 H) 7,48 - 7,60 (m, 2 H) 7,77 (d, J=7,81 Гц, 1 H) 8,23 (d, J=5,54 Гц, 1 H) 8,63 (s, 1 H) 8,68 (s, 1 H)
111		N-(4-фторбензил)-5-метокси-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 3,84 (d, J=1,26 Гц, 6 H) 4,67 (d, J=5,81 Гц, 2 H) 6,45 (s, 1 H) 6,82 (dd, J=8,84, 2,53 Гц, 1 H) 7,01 (d, J=2,53 Гц, 1 H) 7,04 - 7,14 (m, 2 H) 7,41 (d, J=5,31 Гц, 1 H) 7,42 - 7,51 (m, 1 H) 7,66 (d, J=8,59 Гц, 1 H) 7,98 (s, 1 H) 8,06 (s, 1 H) 8,42 (s, 1 H)
112		N-[(1R)-12-диметилпропіл]-2-[[4-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 1,02 (t, J=7,05 Гц, 6 H) 1,15 - 1,38 (m, 3 H) 1,75 - 2,00 (m, 1 H) 3,60 (s, 3 H) 3,86 - 4,18 (m, 1 H) 5,91 (d, J=8,81 Гц, 1 H) 6,66 (d, J=5,54 Гц, 1 H) 7,37 - 7,49 (m, 1 H) 7,50 - 7,62 (m, 2 H) 7,78 (d, J=7,81 Гц, 1 H) 8,26 (d, J=5,54 Гц, 1 H) 8,53 (s, 1 H) 8,62 (s, 1 H)
113		2-[[5-амінопіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-(втор-бутил)бензамід	(400 МГц, ДМСО-d6) δ част. на млн. 0,93 (t, J=7,45 Гц, 3 H) 1,16 (d, J=6,57 Гц, 3 H) 1,47 - 1,58 (m, 2 H) 3,88 - 3,97 (m, 1 H) 6,81 m, 1 H) 7,51 (m, 1 H) 7,53 - 7,59 (m, 3 H) 7,63 (m, 1 H) 7,70 (m, 2 H) 8,65 (d, J=8,08 Гц, 1 H)

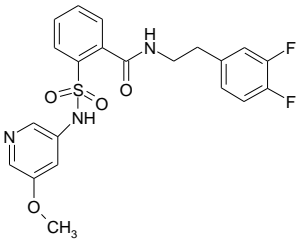
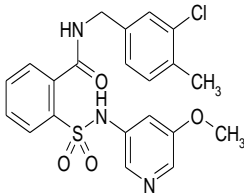
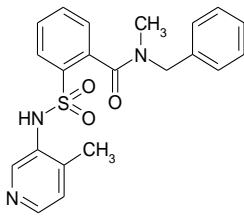
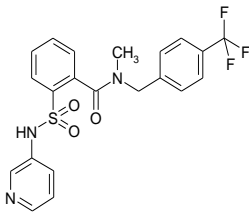
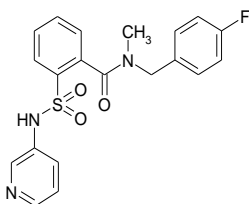
114		2-((5-амінопіридин-3-іл)аміно)сульфоніл)-N-ізопропіл-N-(2-метоксіетил)бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 1,18 - 1,27 (m, 6 H) 1,42 (m, 1 H) 2,00 - 2,09 (m, 1 H) 3,43 (s, 3 H) 3,53 - 3,61 (m, 1H) 3,61 - 3,71 (m, 2 H) 3,78 (s, 1 H) 3,81 (m, 2 H) 7,00 (s, 1 H) 7,32 - 7,43 (m, 2 H) 7,51 - 7,61 (m, 1 H) 7,68(m, 1 H) 7,75(s, 1 H) 7,90 (s, 1 H)
115		2-((4-етоксипіридин-3-іл)аміно)сульфоніл)-N-(2-метилбутил)бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 1,02 (t, J=6,67 Гц, 6 H) 1,14 (t, J=7,05 Гц, 3 H) 1,21 - 1,31 (m, 3 H) 1,79 - 1,97 (m, 1 H) 3,61 - 3,92 (m, 2 H) 4,00 - 4,22 (m, 1 H) 5,89 (d, J=8,56 Гц, 1 H) 6,62 (d, J=5,54 Гц, 1 H) 7,44 (t, J=7,68 Гц, 1 H) 7,48 - 7,60 (m, 2 H) 7,77 (d, J=7,81 Гц, 1 H) 8,23 (d, J=5,54 Гц, 1 H) 8,63 (s, 1 H) 8,68 (s, 1 H)
116		2-((4-метоксипіридин-3-іл)аміно)сульфоніл)-N-(2-метилбутил)бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 0,69 - 1,19 (m, 5 H) 1,10 - 1,58 (m, 2 H) 1,62 - 1,85 (m, 2 H) 2,27 (s, 3 H) 3,19 - 3,40 (m, 1 H) 3,38 - 3,54 (m, 1 H) 6,28 (s, 1 H) 7,33 - 7,49 (m, 2 H) 7,47 - 7,61 (m, 2 H) 7,67 (d, J=7,81 Гц, 1 H) 8,17 (s, 2 H) 8,58 (s, 1 H)
117		2-((5-амінопіридин-3-іл)аміно)сульфоніл)-N-(3,4-дифторбензил)бензамід	(400 МГц, ДМСО-d6) δ част. на млн. 4,51 (d, J=5,81 Гц, 2 H) 5,50 (bs, 1 H) 6,78 (s, 1 H) 7,25 (7,43 (s, 1 H) 7,45 - 7,53 (m, 2 H) 7,57 - 7,66 (m, 4 H) 7,68 - 7,77 (m, 3 H) 9,35 (s, 2 H)
118		N-(2-метилбутил)-2-((5-метилпіридин-3-іл)аміно)сульфоніл)бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 0,69 - 1,19 (m, 5 H) 1,10 - 1,58 (m, 2 H) 1,62 - 1,85 (m, 2 H) 2,27 (s, 3 H) 3,19 - 3,40 (m, 1 H) 3,38 - 3,54 (m, 1 H) 6,28 (s, 1 H) 7,33 - 7,49 (m, 2 H) 7,47 - 7,61 (m, 2 H) 7,67 (d, J=7,81 Гц, 1 H) 8,17 (s, 2 H) 8,58 (s, 1 H)

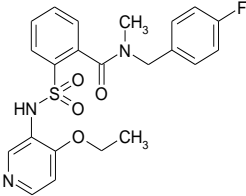
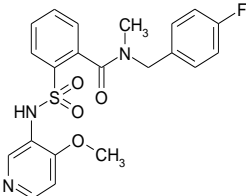
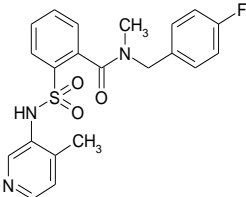
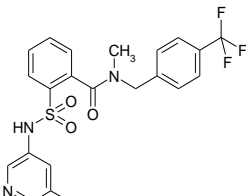
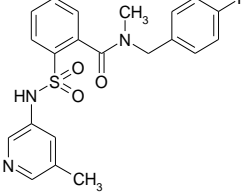
119		N-(<i>втор</i> -бутил)-2-[[4-етоксипіридин-3-іл]аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 0,96 - 1,08 (m, 3 H) 1,12 (t, J=6,92 Гц, 3 H) 1,26 - 1,39 (m, 3 H) 1,50 - 1,78 (m, 2 H) 3,68 - 3,91 (m, 2 H) 4,06 - 4,23 (m, 1 H) 6,17 (d, J=7,81 Гц, 1 H) 6,62 (d, J=5,54 Гц, 1 H) 7,34 - 7,45 (m, 1 H) 7,47 - 7,60 (m, 2 H) 7,70 (d, J=7,81 Гц, 1 H) 8,19 (d, J=5,54 Гц, 1 H) 8,59 (s, 1 H) 8,69 - 8,87 (m, 1 H)
120		N-(<i>втор</i> -бутил)-2-[[4-метоксипіридин-3-іл]аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 1,04 (t, J=7,55 Гц, 3 H) 1,20 - 1,37 (m, 3 H) 1,51 - 1,82 (m, 2 H) 3,54 - 3,68 (m, 3 H) 4,09 - 4,40 (m, 1 H) 5,89 (d, J=8,06 Гц, 1 H) 6,67 (d, J=5,29 Гц, 1 H) 7,35 - 7,66 (m, 3 H) 7,78 (d, J=7,81 Гц, 1 H) 8,26 (s, 1 H) 8,54 (s, 2 H)
121		N-(<i>втор</i> -бутил)-2-[[5-метилпіридин-3-іл]аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 0,74 - 1,13 (m, 3 H) 1,16 - 1,43 (m, 2 H) 1,54 - 1,80 (m, 3 H) 2,27 (s, 3 H) 3,97 - 4,29 (m, 1 H) 5,98 (d, J=8,06 Гц, 1 H) 7,31 - 7,46 (m, 2 H) 7,46 - 7,59 (m, 2 H) 7,68 (d, J=7,81 Гц, 1 H) 8,17 (s, 2 H) 8,57 (s, 1 H)
122		2-[[4-етоксипіридин-3-іл]аміно]сульфоніл]-N-метил-N-[4-(трифторметил)бензил]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 0,79 - 1,27 (m, 3 H) 2,47 - 2,97 (m, 2 H) 3,09 (s, 1 H) 3,87 (d, J=59,17 Гц, 2 H) 4,19 - 5,13 (m, 2 H) 6,34 - 6,82 (m, 1 H) 6,85 - 7,23 (m, 2 H) 7,29 - 7,46 (m, 3 H) 7,47 - 7,67 (m, 2 H) 7,74 (t, J=8,56 Гц, 1 H) 8,03 (s, 1 H) 8,25 (s, 1 H) 8,66 (s, 1 H)
123		2-[[4-метоксипіридин-3-іл]аміно]сульфоніл]-N-метил-N-[4-(трифторметил)бензил]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 2,84 (s, 2 H) 3,10 (s, 1 H) 3,37 - 3,71 (m, 3 H) 4,36 - 5,14 (m, 2 H) 6,68 (d, J=5,29 Гц, 1 H) 7,31 - 7,54 (m, 4 H) 7,58 - 7,95 (m, 5 H) 8,30 (s,

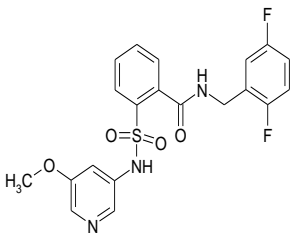
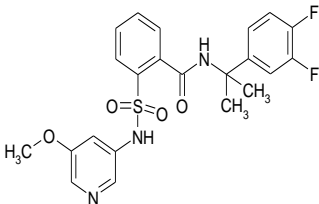
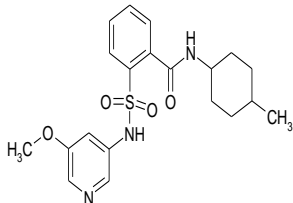
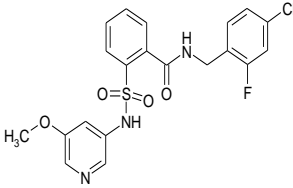
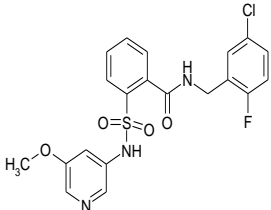
			1 H) 8,47 - 8,69 (m, 1 H)
124		2-[[4-етоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-(2-фторбензил)-N-метилбензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 0,79 - 1,27 (m, 3 H) 2,47 - 2,97 (m, 2 H) 3,09 (s, 1 H) 3,87 (d, J=59,17 Гц, 2 H) 4,19 - 5,13 (m, 2 H) 6,34 - 6,82 (m, 1 H) 6,85 - 7,23 (m, 2 H) 7,29 - 7,46 (m, 3 H) 7,47 - 7,67 (m, 2 H) 7,74 (t, J=8,56 Гц, 1 H) 8,03 (s, 1 H) 8,25 (s, 1 H) 8,66 (s, 1 H)
125		N-(2-фторбензил)-2-[[4-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-метилбензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 2,80 (s, 2 H) 3,06 (s, 1 H) 3,48 - 3,69 (m, 3 H) 4,31 - 4,96 (m, 2 H) 6,68 (d, J=5,29 Гц, 1 H) 6,92 - 7,16 (m, 2 H) 7,18 - 7,33 (m, 1 H) 7,20 - 7,31 (m, 1 H) 7,32 - 7,48 (m, 2 H) 7,48 - 7,65 (m, 1 H) 7,74 (d, J=7,55 Гц, 1 H) 7,94 (s, 1 H) 8,29 (s, 1 H) 8,64 (s, 1 H)
126		2-[[4-етоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-ізопропіл-N-(2-метоксіетил)бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 0,98 - 1,30 (m, 8 H) 1,40 (d, J=7,05 Гц, 1 H) 3,36 - 3,98 (m, 10 H) 6,63 (d, J=5,29 Гц, 1 H) 7,35 - 7,47 (m, 2 H) 7,48 - 7,62 (m, 1 H) 7,69 (t, J=8,44 Гц, 1 H) 8,01 (s, 1 H) 8,25 (s, 1 H) 8,60 (s, 1 H)
127		N-ізопропіл-N-(2-метоксіетил)-2-[[4-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 1,21 (d, J=6,80 Гц, 6 H) 1,40 (d, J=6,80 Гц, 1 H) 3,38 - 3,48 (m, 3 H) 3,46 - 3,72 (m, 5 H) 3,73 - 3,91 (m, 2 H) 6,66 (d, J=5,54 Гц, 1 H) 7,31 - 7,46 (m, 2 H) 7,49 - 7,61 (m, 1 H) 7,69 (t, J=8,81 Гц, 1 H) 7,92 (s, 1 H) 8,28 (d, J=5,04 Гц, 1 H) 8,57 (s, 1 H)

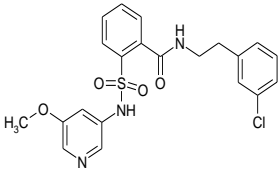
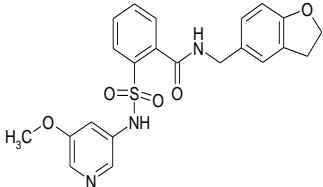
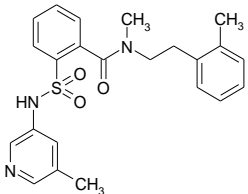
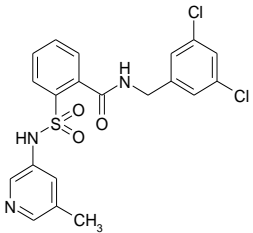
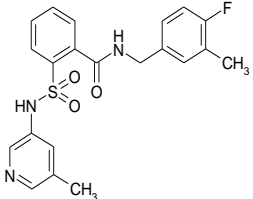
128		N-ізопропіл-N-(2-метоксіетил)-2-[[піридин-3-іламіно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРОФОРМ-d) δ част. на млн. 1,08 - 1,34 (m, 6 H) 3,35 - 3,56 (m, 6 H) 3,60 - 3,88 (m, 4 H) 7,22 (s, 1 H) 7,33 - 7,41 (m, 1 H) 7,50 - 7,73 (m, 2 H) 7,92 - 8,12 (m, 1 H) 8,37 (s, 2 H)
129		N-(2-фторбензил)-N-метил-2-[[5-метилпіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРОФОРМ-d) δ част. на млн. 2,27 (s, 3 H) 2,89 (s, 2 H) 3,11 (s, 1 H) 4,23 - 5,14 (m, 2 H) 6,84 - 7,16 (m, 1 H) 7,15 - 7,27 (m, 1 H) 7,30 - 7,49 (m, 4 H) 7,48 - 7,70 (m, 3 H) 7,90 (s, 1 H) 8,20 (s, 2 H)
130		N-ізопропіл-N-(2-метоксіетил)-2-[[5-метилпіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРОФОРМ-d) δ част. на млн. 1,09 - 1,48 (m, 5 H) 2,26 (s, 3 H) 3,35 - 3,49 (m, 4 H) 3,53 - 3,73 (m, 3 H) 3,75 - 3,89 (m, 2 H) 7,30 - 7,46 (m, 3 H) 7,51 - 7,70 (m, 2 H) 7,80 - 8,00 (m, 1 H) 8,18 (d, J=15,86 Гц, 2 H)
131		N-(2,2,3,3,4,4,4-гептафторбутил)-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРОФОРМ-d) δ част. на млн. 9,32 (s, 1 H), 8,23 (d, J=1,01 Гц, 1 H), 8,06 (s, 1 H), 7,82 - 7,89 (m, 1 H), 7,79 (s, 1 H), 7,73 (t, J=7,45 Гц, 1 H), 7,59 - 7,69 (m, 2 H), 6,92 (t, J=5,94 Гц, 1 H), 4,28 (td, J=15,16, 6,06 Гц, 2 H), 3,98 (s, 3 H)
132		N-(4-хлор-3-фторбензил)-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ДМСО-d6) δ част. на млн. 10,35 (s, 1 H), 7,87 - 7,91 (m, 1 H), 7,64 - 7,68 (m, 2 H), 7,62 (s, 1 H), 7,58 - 7,61 (m, 1 H), 7,46 - 7,57 (m, 3 H), 7,29 (ddd, J=15,22, 8,27, 1,52 Гц, 1 H), 7,01 (s, 1 H), 6,90 (t, J=2,40 Гц, 1 H), 4,51 (d, J=5,81 Гц, 1 H), 3,94 (s, 1 H), 3,67 (s, 3H)

133		N-(2,6-дихлорбензил)-2-[[[(5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ДМСО-d6) d част. на млн. 9,85 (s, 1 H), 9,08 (s, 1 H), 7,98 (d, J=2,53 Гц, 1 H), 7,93 (d, J=2,02 Гц, 1 H), 7,79 (d, J=6,82 Гц, 1 H), 7,78 (s, 1 H), 7,66 (td, J=7,52, 1,14 Гц, 1 H), 7,56 (td, J=7,71, 1,26 Гц, 1 H), 7,49 - 7,53 (m, 2 H), 7,46 (dd, J=7,45, 1,14 Гц, 1 H), 7,35 - 7,41 (m, 1 H), 7,14 (t, J=2,40 Гц, 1 H), 4,75 (d, J=4,55 Гц, 2 H), 3,76 (s, 3 H)
134		N-{2-[3-фтор-4-(трифторметил)феніл]етил}-2-[[[(5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ДМСО-d6) d част. на млн. 8,98 (t, J=5,18 Гц, 1 H), 7,95 (d, J=2,53 Гц, 1 H), 7,90 (d, J=1,77 Гц, 1 H), 7,79 (d, J=7,83 Гц, 1 H), 7,71 (t, J=7,96 Гц, 1 H), 7,62 - 7,68 (m, 1 H), 7,53 - 7,59 (m, 1 H), 7,42 - 7,50 (m, 2 H), 7,35 (d, J=8,08 Гц, 1 H), 7,10 (t, J=2,27 Гц, 1 H), 3,75 (s, 3 H), 3,57 (q, J=6,40 Гц, 2 H), 2,99 (t, J=6,82 Гц, 2 H)
135		N-[2-(3,4-дифторфеніл)-1-метилетил]-2-[[[(5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ДМСО-d6) d част. на млн. 9,79 (s, 1 H), 8,75 (d, J=7,83 Гц, 1 H), 7,98 (d, J=2,53 Гц, 1 H), 7,90 (d, J=2,02 Гц, 1 H), 7,76 (d, J=7,83 Гц, 1 H), 7,67 (t, J=7,33 Гц, 1 H), 7,52 - 7,58 (m, 1 H), 7,30 - 7,40 (m, 3 H), 7,08 - 7,16 (m, 2 H), 4,22 (ddd, J=14,02, 7,20, 7,07 Гц, 1 H), 3,75 (s, 3 H), 2,76 - 2,88 (m, 2 H), 1,17 (d, J=6,57 Гц, 3 H)
136		N-[2-(2,3-дифтор-4-метилфеніл)етил]-2-[[[(5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ДМСО-d6) d част. на млн. 9,73 (s, 1 H), 8,97 (s, 1 H), 7,95 (d, J=2,53 Гц, 1 H), 7,88 (d, J=2,02 Гц, 1 H), 7,78 (d, J=7,83 Гц, 1 H), 7,65 (d, J=7,33 Гц, 1 H), 7,56 (t, J=7,71 Гц, 1 H), 7,45 (d, J=7,58 Гц, 1 H), 7,00 - 7,11 (m, 3 H), 3,75 (s, 3 H), 3,45 - 3,54 (m, 2 H), 2,91 (t, J=6,95 Гц, 2 H), 2,25 (d, J=1,26 Гц, 3 H)

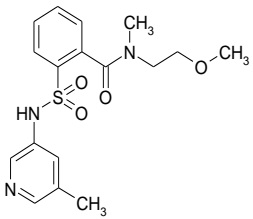
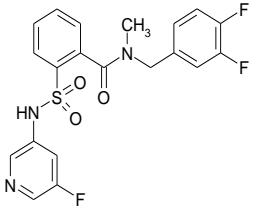
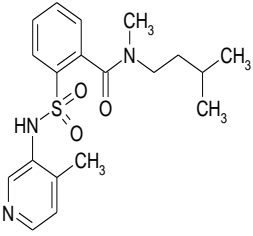
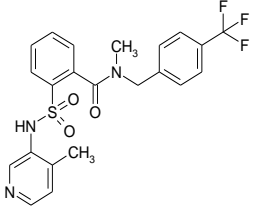
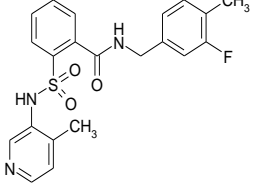
			H)
137		N-[2-(3,4-дифторфеніл)етил]-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ДМСО-d6) d част. на млн. 9,86 (s, 1 H), 8,86 (t, J=5,05 Гц, 1 H), 7,98 (d, J=2,53 Гц, 1 H), 7,91 (d, J=2,02 Гц, 1 H), 7,79 (s, 1 H), 7,77 (d, J=1,01 Гц, 1 H), 7,67 (td, J=7,52, 1,14 Гц, 1 H), 7,56 (td, J=7,71, 1,26 Гц, 1 H), 7,34 - 7,44 (m, 2 H), 7,09 - 7,16 (m, 2 H), 3,75 (s, 3 H), 3,46 - 3,55 (m, 2 H), 2,87 (t, J=6,95 Гц, 2 H)
138		N-(3-хлор-4-метилбензил)-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ДМСО-d6) d част. на млн. 2,34 (s, 3 H) 3,75 (s, 3 H) 4,48 (d, J=6,06 Гц, 2 H) 7,14 (t, J=2,27 Гц, 1 H) 7,26 (dd, J=7,83, 1,77 Гц, 1 H) 7,38 (d, J=8,08 Гц, 1 H) 7,42 (s, 1 H) 7,55 - 7,63 (m, 2 H) 7,71 (t, J=7,07 Гц, 1 H) 7,81 (d, J=7,58 Гц, 1 H) 7,94 (s, 1 H) 8,01 (s, 1 H) 9,28 (t, J=5,94 Гц, 1 H) 9,88 (s, 1 H)
139		N-бензил-N-метил-2-[[4-метилпіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) d част. на млн. 1,07 (s, 3 H) 1,65 (s, 2 H) 1,90 (s, 1 H) 3,10 - 3,95 (m, 2 H) 5,89 (s, 1 H) 6,01 - 6,31 (m, 7 H) 6,31 - 6,48 (m, 2 H) 6,63 (s, 1 H) 7,03 (d, J=42,05 Гц, 2 H)
140		N-метил-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]-N-[4-(трифторметил)бензил]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) d част. на млн. 2,88 (s, 2 H) 3,11 (s, 1 H) 4,28 - 5,11 (m, 2 H) 7,05 - 7,23 (m, 1 H) 7,30 - 7,49 (m, 3 H) 7,54 - 7,75 (m, 6 H) 7,96 (s, 1 H) 8,40 (s, 2 H)
141		N-(4-фторбензил)-N-метил-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) d част. на млн. 2,84 (s, 2 H) 3,07 (s, 1 H) 3,99 - 4,94 (m, 2 H) 6,99 - 7,14 (m, 2 H) 7,19 (dd, J=7,68, 4,66 Гц, 1 H) 7,23 - 7,30 (m, 1 H) 7,30 - 7,48 (m, 3 H) 7,49 - 7,69 (m, 3 H) 8,01 (s, 1 H) 8,39 (s, 2 H)

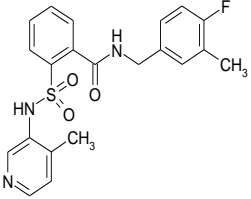
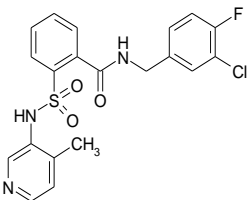
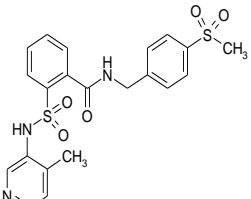
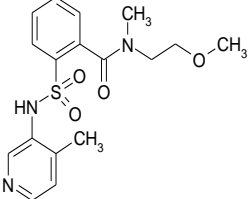
142		2-[[[4-(4-етоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-(4-фторбензил)-N-метилбензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 1,10 - 1,29 (m, 3 H) 2,81 (s, 2 H) 3,05 (s, 1 H) 3,58 - 4,09 (m, 2 H) 4,40 (s, 1 H) 4,64 - 4,94 (m, 1 H) 6,65 (d, J=5,29 Гц, 1 H) 6,97 - 7,15 (m, 2 H) 7,20 - 7,33 (m, 1 H) 7,30 - 7,51 (m, 3 H) 7,48 - 7,65 (m, 1 H) 7,73 (dd, J=7,68, 3,65 Гц, 1 H) 8,01 (s, 1 H) 8,26 (s, 1 H) 8,66 (s, 1 H)
143		N-(4-фторбензил)-2-[[[4-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-метилбензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 2,80 (s, 2 H) 3,06 (s, 1 H) 3,48 - 3,69 (m, 3 H) 4,31 - 4,96 (m, 2 H) 6,68 (d, J=5,29 Гц, 1 H) 6,92 - 7,16 (m, 2 H) 7,18 - 7,33 (m, 1 H) 7,20 - 7,31 (m, 1 H) 7,32 - 7,48 (m, 2 H) 7,48 - 7,65 (m, 1 H) 7,74 (d, J=7,55 Гц, 1 H) 7,94 (s, 1 H) 8,29 (s, 1 H) 8,64 (s, 1 H)
144		N-(4-фторбензил)-N-метил-2-[[[4-метилпіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 2,27 (s, 3 H) 2,85 (s, 2 H) 3,07 (s, 1 H) 4,24 - 4,95 (m, 2 H) 6,92 - 7,17 (m, 3 H) 7,24 - 7,33 (m, 1 H) 7,36 - 7,50 (m, 3 H) 7,54 - 7,68 (m, 2 H) 7,81 (s, 1 H) 8,17 (s, 1 H) 8,29 (s, 1 H)
145		N-метил-2-[[[5-(4-(трифторметил)бензил)аміно]сульфоніл]-N-[4-(трифторметил)бензил]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 2,28 (s, 3 H) 2,74 - 3,19 (m, 3 H) 4,90 (d, J=43,06 Гц, 1 H) 7,32 - 7,50 (m, 4 H) 7,51 - 7,74 (m, 6 H) 7,88 (s, 1 H) 8,22 (s, 2 H)
146		N-(4-фторбензил)-N-метил-2-[[[5-метилпіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 2,28 (s, 3 H) 2,74 - 3,19 (m, 3 H) 4,90 (d, J=43,06 Гц, 1 H) 7,32 - 7,50 (m, 4 H) 7,51 - 7,74 (m, 6 H) 7,88 (s, 1 H) 8,22 (s, 2 H)

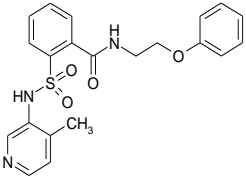
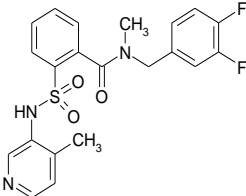
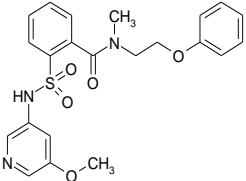
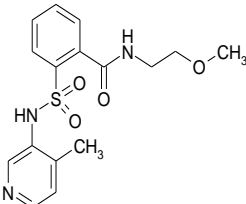
147		N-(2,5-дифторбензил)-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 3,81 (s, 3 H) 4,73 (d, J=5,81 Гц, 2 H) 6,52 (m, 1 H) 7,18 - 7,28 (m, 3 H) 7,45 (m, 1 H) 7,49 - 7,58 (m, 3 H) 7,73 (m, 1 H) 7,93 (m, 1 H) 8,06 (m, 1 H)
148		N-[1-(3,4-дифторфеніл)-1-метилетил]-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-D) δ част. на млн. 8,16 (s, 1 H) 8,04 (d, J=2,53 Гц, 1 H) 7,87 (d, J=2,02 Гц, 1 H) 7,70 (d, J=7,58 Гц, 1 H) 7,57 - 7,63 (m, 2 H) 7,45 (m, 1 H) 7,35 (s, 1 H) 7,13 - 7,23 (m, 2 H) 6,31 (s, 1 H) 3,79 (s, 3 H) 1,83 (s, 6 H)
149		2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-(4-метилциклогексил)бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 0,94 (t, J=5,56 Гц, 3 H) 1,15 (m, 2 H) 1,27 (m, 2 H) 1,68 (m, 1 H) 1,71 - 1,83 (m, 2 H) 2,18 (m, 1 H) 3,81 (s, 3 H) 3,90 - 4,00 (m, 1 H) 4,27 (m, 1 H) 5,91-6,16 (m, 1 H) 7,23 (d, J=2,02 Гц, 1 H) 7,39 - 7,47 (m, 1 H) 7,49 - 7,60 (m, 2 H) 7,72 (m, 1 H) 7,96 (s, 1 H) 8,06 (s, 1 H) 8,60 (m, 1 H)
150		N-(4-хлор-2-фторбензил)-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 3,82 (s, 3 H) 4,73 (d, J=5,81 Гц, 2 H) 6,54 (m, 1 H) 7,14 (dd, J=9,73, 1,89 Гц, 1 H) 7,20 (dd, J=8,08, 2,02 Гц, 1 H) 7,46 (m, 1 H) 7,48 - 7,54 (m, 2 H) 7,57 (m, 1 H) 7,74 (d, J=7,83 Гц, 1 H) 7,95 (bs, 1 H) 8,05 (bs, 1 H)
151		N-(5-хлор-2-фторбензил)-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 3,81 (s, 3 H) 4,73 (d, J=6,06 Гц, 2 H) 6,54 (m, 1 H) 7,05 (t, J=9,09 Гц, 1 H) 7,21 - 7,31 (m, 2 H) 7,44 (td, J=7,58, 1,52 Гц, 1 H) 7,51 - 7,60 (m, 2 H) 7,73 (d, J=7,83 Гц, 1 H) 7,94 (d, J=2,27 Гц, 1 H) 8,06 (d, J=2,78 Гц, 1 H)

152		N-[2-(3-хлорфеніл)етил]-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл}бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 3,00 (t, J=6,82 Гц, 2 H) 3,74 (m, 2 H) 3,81 (s, 3H) 6,20 (t, J=5,68 Гц, 1 H) 7,19 - 7,30 (m, 3 H) 7,38 - 7,45 (m, 2 H) 7,49 - 7,57 (m, 1 H) 7,67 - 7,74 (m, 1 H) 7,95 (d, J=2,02 Гц, 1 H) 8,05 (d, J=2,78 Гц, 1 H) 8,56 (s, 1 H)
153		N-(2,3-дигідро-1-бензофуран-5-ілметил)-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл}бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн) 3,22 (t, J=8,72 Гц, 2 H) 3,82 (s, 3 H) 4,58 m, 2 H) 4,62 (m, 2 H) 6,37 (s, 1 H) 6,77 (d, J=8,08 Гц, 1 H) 7,14 (d, J=8,34 Гц, 1 H) 7,23 - 7,31 (m, 2 H) 7,39 - 7,47 (m, 1 H) 7,51 - 7,58 (m, 2 H) 7,73 (d, J=7,83 Гц, 1 H) 7,97 (d, J=1,52 Гц, 1 H) 8,04 - 8,09 (m, 1 H)
154		N-метил-N-[2-(2-метилфеніл)етил]-2-[[5-метилпіридин-3-іл)аміно]сульфоніл}бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 1,84 - 2,06 (m, 1 H) 2,01 - 2,38 (m, 3 H) 2,37 - 2,53 (m, 2 H) 2,74 - 3,21 (m, 3 H) 3,29 - 3,55 (m, 1 H) 3,60 - 3,88 (m, 1 H) 6,64 - 6,99 (m, 1 H) 7,05 - 7,23 (m, 4 H) 7,27 - 7,45 (m, 4 H) 7,49 - 7,66 (m, 2 H) 7,87 (d, J=49,35 Гц, 1 H) 8,05 - 8,26 (m, 2 H)
155		N-(3,5-дихлорбензил)-2-[[5-метилпіридин-3-іл)аміно]сульфоніл}бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 2,28 (s, 3 H) 4,67 (d, J=5,79 Гц, 2 H) 6,62 (t, J=5,92 Гц, 1 H) 7,29 - 7,38 (m, 3 H) 7,40 - 7,47 (m, 2 H) 7,51 - 7,64 (m, 2 H) 7,70 (d, J=7,81 Гц, 1 H) 8,17 (s, 2 H) 8,36 (s, 1 H)
156		N-(4-фтор-3-метилбензил)-2-[[5-метилпіридин-3-іл)аміно]сульфоніл}бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 2,28 (s, 6 H) 4,66 (d, J=6,04 Гц, 2 H) 6,42 - 6,54 (m, 1 H) 7,04 - 7,15 (m, 2 H) 7,16 - 7,29 (m, 1 H) 7,37 - 7,53 (m, 2 H) 7,50 - 7,61 (m, 2 H) 7,70 (d, J=7,55 Гц, 1 H) 8,17 (s, 2 H) 8,48 (s, 1 H)

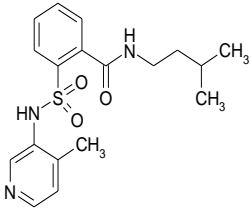
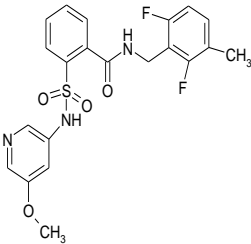
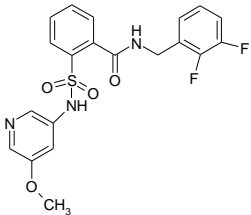
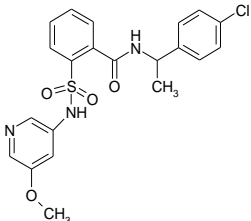
157		N-(3-фтор-4-метилбензил)-2-[[5-метилпіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 2,18 - 2,46 (m, 6 H) 4,65 (d, J=5,79 Гц, 2 H) 6,40 (s, 1 H) 7,01 (t, J=8,81 Гц, 1 H) 7,16 - 7,25 (m, 1 H) 7,29 (s, 1 H) 7,35 - 7,49 (m, 2 H) 7,50 - 7,60 (m, 2 H) 7,72 (d, J=7,55 Гц, 1 H) 8,18 (s, 2 H) 8,51 (s, 1 H)
158		N-(3-хлор-4-фторбензил)-2-[[5-метилпіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 2,28 (s, 3 H) 4,66 (d, J=6,04 Гц, 2 H) 6,61 (t, J=5,67 Гц, 1 H) 7,16 (t, J=8,56 Гц, 1 H) 7,29 - 7,38 (m, 1 H) 7,39 - 7,46 (m, 2 H) 7,49 (dd, J=6,80, 2,27 Гц, 1 H) 7,52 - 7,60 (m, 2 H) 7,69 (d, J=7,55 Гц, 1 H) 8,17 (s, 2 H) 8,42 (s, 1 H)
159		2-[[5-метилпіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-[4-(метилсульфоніл)бензил]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 2,27 (s, 3 H) 3,02 (s, 3 H) 4,81 (d, J=6,04 Гц, 2 H) 7,00 (t, J=5,79 Гц, 1 H) 7,33 - 7,51 (m, 2 H) 7,52 - 7,72 (m, 5 H) 7,87 (d, J=8,31 Гц, 2 H) 8,17 (s, 2 H) 8,42 (s, 1 H)
160		2-[[4-етоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-(2-метоксіетил)-N-метилбензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 8,61 (d, J=6,04 Гц, 1 H) 8,25 (d, J=5,29 Гц, 1 H) 7,99 (s, 1 H) 7,64 - 7,77 (m, 1 H) 7,51 - 7,63 (m, 1 H) 7,33 - 7,50 (m, 2 H) 6,64 (d, J=5,54 Гц, 1 H) 3,50 - 4,00 (m, 6 H) 3,39 - 3,47 (m, 2 H) 3,28 - 3,37 (m, 2 H) 3,20 (s, 1 H) 2,99 (s, 2 H) 1,15 (t, J=6,92 Гц, 2 H)
161		N-(2-метоксіетил)-2-[[4-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-метилбензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 8,27 (d, J=4,78 Гц, 1 H) 8,15 (s, 1 H) 7,76 (s, 1 H) 7,53 - 7,66 (m, 2 H) 7,32 - 7,54 (m, 2 H) 7,07 (d, J=5,04 Гц, 1 H) 3,56 - 3,86 (m, 3 H) 3,29 - 3,54 (m, 4 H) 3,22 (s, 1 H) 3,03 (s, 2 H) 2,24 (d, J=2,01 Гц, 3 H) PXMC ESI: 364,20

			МН+
162		N-(2-метоксіетил)-N-метил-2-[[5-метилпіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 8,27 (d, J=4,78 Гц, 1 H) 8,15 (s, 1 H) 7,76 (s, 1 H) 7,53 - 7,66 (m, 2 H) 7,32 - 7,54 (m, 2 H) 7,07 (d, J=5,04 Гц, 1 H) 3,56 - 3,86 (m, 3 H) 3,29 - 3,54 (m, 4 H) 3,22 (s, 1 H) 3,03 (s, 2 H) 2,24 (d, J=2,01 Гц, 3 H) РХМС ESI: 364,20 МН+
163		N-(3,4-дифторбензил)-2-[[5-фторпіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-метилбензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 8,25 (s, 1 H) 8,20 (s, 1 H) 8,13 (s, 1 H) 7,70 (d, J=7,81 Гц, 1 H) 7,51 - 7,65 (m, 1 H) 7,35 - 7,51 (m, 3 H) 6,97 - 7,33 (m, 3 H) 4,27 - 4,95 (m, 2 H) 3,08 (s, 1 H) 2,87 (s, 2 H) РХМС ESI: 436,20 МН+
164		N-метил-N-(3-метилбутил)-2-[[4-метилпіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 8,27 (d, J=5,04 Гц, 1 H) 8,13 (s, 1 H) 7,81 (d, J=14,86 Гц, 1 H) 7,56 - 7,65 (m, 2 H) 7,35 - 7,45 (m, 2 H) 7,07 (d, J=4,78 Гц, 1 H) 3,62 (s, 1 H) 3,17 - 3,24 (m, 2 H) 3,16 (s, 1 H) 2,92 (s, 2 H) 2,25 (d, J=3,78 Гц, 3 H) 1,65 - 1,79 (m, 1 H) 1,38 - 1,52 (m, 1 H) 1,01 (d, J=6,04 Гц, 3 H) 0,78 (dd, J=14,35, 6,04 Гц, 3 H) РХМС ESI: 376,20 МН+
165		N-метил-2-[[4-метилпіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-[4-(трифторметил)бензил]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 8,29 (d, J=5,04 Гц, 1 H) 8,10 - 8,20 (m, 1 H) 7,75 (s, 1 H) 7,50 - 7,72 (m, 5 H) 7,38 - 7,49 (m, 3 H) 7,10 (d, J=4,78 Гц, 1 H) 4,47 - 5,08 (m, 2 H) 3,11 (s, 1 H) 2,89 (s, 2 H) 2,28 (s, 3 H) РХМС ESI: 464,20 МН+
166		N-(3-фтор-4-метилбензил)-2-[[4-метилпіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 7,08 (s, 1 H) 7,00 (d, J=4,78 Гц, 1 H) 6,92 (s, 1 H) 6,44 (d, J=7,55 Гц, 1 H) 6,29 - 6,38 (m, 2 H) 6,15 - 6,26 (m, 1 H)

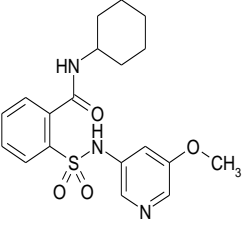
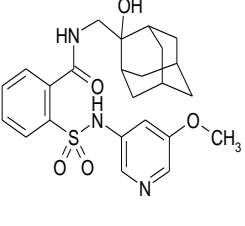
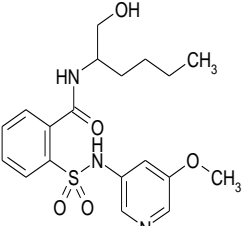
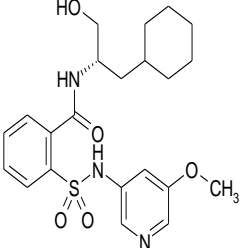
			5,94 (t, J=7,68 Гц, 1 H) 5,77 - 5,90 (m, 3 H) 5,17 - 5,31 (m, 1 H) 3,41 (d, J=5,79 Гц, 2 H) 1,04 (s, 3 H) 1,01 (s, 3 H) PXMC ESI: 414,20 МН+
167		N-(4-фтор-3-метилбензил)-2-[[4-метилпіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 8,37 (s, 1 H) 8,27 (d, J=4,78 Гц, 1 H) 8,18 (s, 1 H) 7,70 (d, J=7,81 Гц, 1 H) 7,53 - 7,65 (m, 2 H) 7,42 - 7,49 (m, 1 H) 7,24 - 7,31 (m, 1 H) 7,17 - 7,25 (m, 1 H) 7,10 (d, J=5,04 Гц, 1 H) 6,95 - 7,05 (m, 1 H) 6,42 (t, J=5,41 Гц, 1 H) 4,65 (d, J=5,79 Гц, 2 H) 2,31 (s, 3 H) 2,30 (d, J=1,76 Гц, 3 H) PXMC ESI: 414,20 МН+
168		N-(3-хлор-4-фторбензил)-2-[[4-метилпіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 8,27 (d, J=4,78 Гц, 2 H) 8,18 (s, 1 H) 7,70 (d, J=7,81 Гц, 1 H) 7,55 - 7,66 (m, 2 H) 7,45 - 7,52 (m, 2 H) 7,32 - 7,40 (m, 1 H) 7,17 (t, J=8,69 Гц, 1 H) 7,10 (d, J=4,78 Гц, 1 H) 6,52 (s, 1 H) 4,68 (d, J=5,79 Гц, 2 H) 2,30 (s, 3 H) PXMC ESI: 434,15 МН+
169		2-[[4-метилпіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-[4-(метилсульфоніл)бензил]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 8,26 (d, J=5,04 Гц, 2 H) 8,16 (s, 1 H) 7,90 (d, J=8,31 Гц, 2 H) 7,60 - 7,70 (m, 5 H) 7,44 - 7,54 (m, 1 H) 7,09 (d, J=5,04 Гц, 1 H) 6,89 (t, J=6,17 Гц, 1 H) 4,82 (d, J=6,04 Гц, 2 H) 3,03 (s, 3 H) 2,28 (s, 3 H) PXMC ESI: 460,20 МН+
170		N-(2-метоксіетил)-N-метил-2-[[4-метилпіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 8,27 (d, J=4,78 Гц, 1 H) 8,15 (s, 1 H) 7,76 (s, 1 H) 7,53 - 7,66 (m, 2 H) 7,32 - 7,54 (m, 2 H) 7,07 (d, J=5,04 Гц, 1 H) 3,56 - 3,86 (m, 3 H) 3,29 - 3,54 (m, 4 H) 3,22 (s, 1 H) 3,03 (s, 2 H) 2,24 (d, J=2,01 Гц, 3 H) PXMC ESI: 364,20

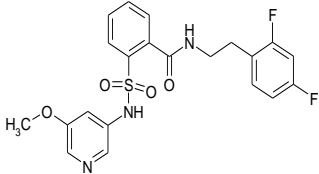
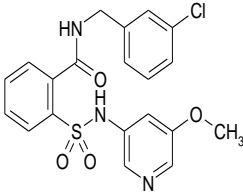
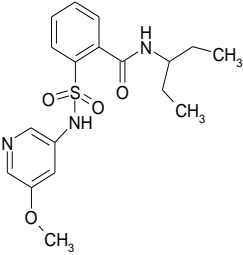
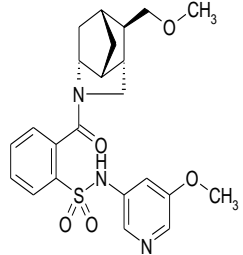
			MH+
171		2-((4-метилпіридин-3-іл)аміно)сульфоніл)-N-(2-феноксіетил)бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 8,34 (s, 1 H) 8,28 (d, J=4,78 Гц, 1 H) 8,20 (s, 1 H) 7,71 (d, J=7,81 Гц, 1 H) 7,54 - 7,66 (m, 2 H) 7,43 - 7,53 (m, 1 H) 7,28 - 7,35 (m, 2 H) 7,10 (d, J=4,78 Гц, 1 H) 7,00 (t, J=7,43 Гц, 1 H) 6,90 - 6,97 (m, 2 H) 6,62 (s, 1 H) 4,23 (t, J=5,04 Гц, 2 H) 3,96 (q, J=5,46 Гц, 2 H) 2,30 (s, 3 H) PXMC ESI: 412,20 MH+
172		N-(3,4-дифторбензил)-N-метил-2-((4-метилпіридин-3-іл)аміно)сульфоніл)бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 8,30 (s, 1 H) 8,18 (s, 1 H) 7,71 - 7,81 (m, 1 H) 7,53 - 7,67 (m, 2 H) 7,37 - 7,49 (m, 2 H) 7,01 - 7,36 (m, 4 H) 4,31 - 4,98 (m, 2 H) 3,08 (s, 1 H) 2,88 (s, 2 H) 2,27 (s, 3 H) PXMC ESI: 432,20 MH+
173		2-((5-метоксипіридин-3-іл)аміно)сульфоніл)-N-метил-N-(2-феноксіетил)бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 8,07 (d, J=2,27 Гц, 1 H) 7,92 - 7,99 (m, 1 H) 7,83 - 7,92 (m, 1 H) 7,64 (d, J=8,06 Гц, 1 H) 7,48 - 7,59 (m, 2 H) 7,28 - 7,40 (m, 3 H) 7,18 (t, J=2,27 Гц, 1 H) 6,93 - 7,03 (m, 2 H) 6,87 (d, J=8,56 Гц, 1 H) 3,82 - 4,44 (m, 3 H) 3,77 - 3,81 (m, 3 H) 3,51 - 3,76 (m, 1 H) 3,28 (s, 1 H) 3,08 (s, 2 H) PXMC ESI: 442,20 MH+
174		N-(2-метоксіетил)-2-((4-метилпіридин-3-іл)аміно)сульфоніл)бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 8,42 (s, 1 H) 8,27 (d, J=4,78 Гц, 1 H) 8,18 (s, 1 H) 7,71 (d, J=7,81 Гц, 1 H) 7,57 - 7,65 (m, 2 H) 7,42 - 7,51 (m, 1 H) 7,08 (d, J=4,78 Гц, 1 H) 6,61 (s, 1 H) 3,67 - 3,76 (m, 2 H) 3,64 (t, J=5,04 Гц, 2 H) 3,35 - 3,43 (m, 3 H) 2,29 (s, 3 H) PXMC ESI: 350,15 MH+

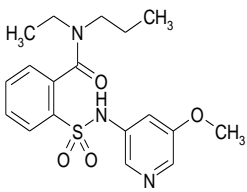
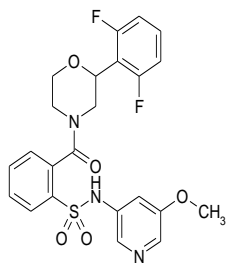
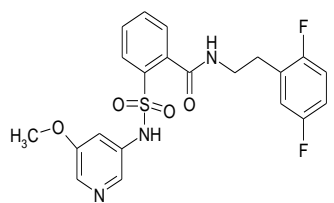
175		N-(3-хлор-2-фторбензил)-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл}бензамід	(400 МГц, ДМСО-d6) d част. на млн. 9,87 (s, 1 H), 9,31 (s, 1 H), 7,98 (d, J=2,53 Гц, 1 H), 7,92 (d, J=2,02 Гц, 1 H), 7,78 - 7,83 (m, 1 H), 7,67 - 7,74 (m, 1 H), 7,60 (t, J=7,20 Гц, 2 H), 7,52 (t, J=7,45 Гц, 2 H), 7,24 (t, J=7,83 Гц, 1 H), 7,11 (t, J=2,27 Гц, 1 H), 4,57 (d, J=5,56 Гц, 2 H), 3,74 (s, 3 H)
176		N-(2-гідроксіетил)-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл}бензамід	(400 МГц, ДМСО-d6) d част. на млн. 9,89 (s, 1 H) 8,70 (t, J=5,54 Гц, 1 H) 7,99 (d, J=2,52 Гц, 1 H) 7,91 (d, J=2,01 Гц, 1 H) 7,76 - 7,83 (m, 1 H) 7,65 - 7,73 (m, 1 H) 7,53 - 7,62 (m, 2 H) 7,11 (t, J=2,39 Гц, 1 H) 4,87 (s, 1 H) 3,76 (s, 3 H) 3,57 (t, J=6,29 Гц, 2 H) 3,32 - 3,41 (m, 2 H) PXMC ESI: 352,20 MH+
177		N-[2-(2-метилфеніл)етил]-2-[[4-метилпіридин-3-іл)аміно]сульфоніл}бензамід	(400 МГц, ХЛОРОФОРМ-d) d част. на млн. 8,43 (s, 1 H) 8,26 (d, J=5,04 Гц, 1 H) 8,17 (s, 1 H) 7,67 (d, J=7,81 Гц, 1 H) 7,52 - 7,61 (m, 1 H) 7,38 - 7,49 (m, 2 H) 7,22 - 7,29 (m, 1 H) 7,12 - 7,22 (m, 3 H) 7,09 (d, J=5,04 Гц, 1 H) 6,23 (s, 1 H) 3,76 (q, J=7,05 Гц, 2 H) 3,03 (t, J=7,05 Гц, 2 H) 2,39 (s, 3 H) 2,30 (s, 3 H) PXMC ESI: 410,20 MH+
178		N-(трет-бутил)-2-[[4-метилпіридин-3-іл)аміно]сульфоніл}бензамід	(400 МГц, ХЛОРОФОРМ-d) d част. на млн. 8,37 (s, 1 H) 8,27 (d, J=4,78 Гц, 1 H) 8,12 (s, 1 H) 7,65 (d, J=7,81 Гц, 1 H) 7,50 - 7,63 (m, 2 H) 7,37 - 7,47 (m, 1 H) 7,09 (d, J=4,78 Гц, 1 H) 5,91 (s, 1 H) 2,30 (s, 3 H) 1,48 - 1,57 (m, 9 H) PXMC ESI: 348,20 MH+

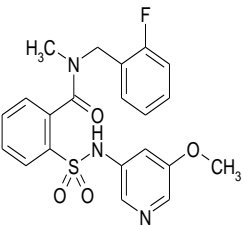
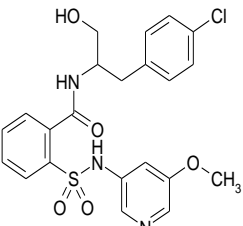
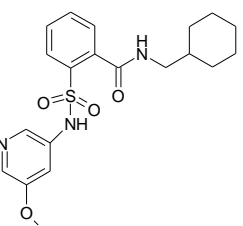
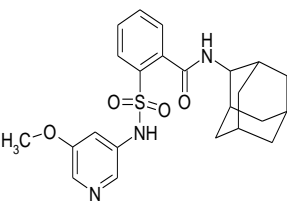
179		N-(3-метилбутил)-2-[[4-метилпіридин-3-іл]аміно]сульфонілбензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 8,43 (s, 1 H) 8,27 (d, J=5,04 Гц, 1 H) 8,18 (s, 1 H) 7,69 (d, J=8,06 Гц, 1 H) 7,58 - 7,64 (m, 1 H) 7,52 - 7,57 (m, 1 H) 7,41 - 7,50 (m, 1 H) 7,09 (d, J=5,04 Гц, 1 H) 6,08 (s, 1 H) 3,51 - 3,59 (m, 2 H) 2,30 (s, 3 H) 1,68 - 1,81 (m, 1 H) 1,50 - 1,68 (m, 2 H) 0,99 (d, J=6,55 Гц, 6 H) PXMC ESI: 362,20 MH+
180		N-(2,6-дифтор-3-метилбензил)-2-[[5-метоксипіридин-3-іл]аміно]сульфонілбензамід	(400 МГц, ДМСО-d6) δ част. на млн. 9,84 (s, 1 H), 9,16 (t, J=4,42 Гц, 1 H), 7,98 (d, J=2,78 Гц, 1 H), 7,90 (d, J=2,02 Гц, 1 H), 7,76 (d, J=7,83 Гц, 1 H), 7,66 (td, J=7,58, 1,26 Гц, 1 H), 7,56 (td, J=7,71, 1,52 Гц, 1 H), 7,43 (dd, J=7,58, 1,01 Гц, 1 H), 7,24 - 7,32 (m, 1 H), 7,12 (t, J=2,27 Гц, 1 H), 7,01 (t, J=8,84 Гц, 1 H), 4,54 (d, J=5,05 Гц, 2 H), 3,76 (s, 3 H), 2,22 (s, 3 H)
181		N-(2,3-дифторбензил)-2-[[5-метоксипіридин-3-іл]аміно]сульфонілбензамід	(400 МГц, ДМСО-d6) δ част. на млн. 9,85 (s, 1 H), 9,32 (t, J=4,80 Гц, 1 H), 7,98 (d, J=2,53 Гц, 1 H), 7,91 (d, J=2,02 Гц, 1 H), 7,81 (d, J=7,83 Гц, 1 H), 7,66 - 7,73 (m, 1 H), 7,56 - 7,62 (m, 2 H), 7,31 - 7,39 (m, 2 H), 7,17 - 7,24 (m, 1 H), 7,11 (t, J=2,40 Гц, 1 H), 4,58 (d, J=5,81 Гц, 2 H), 3,72 - 3,76 (m, 3 H)
182		N-[1-(4-хлорфеніл)етил]-2-[[5-метоксипіридин-3-іл]аміно]сульфонілбензамід	(400 МГц, ДМСО-d6) δ част. на млн. 9,82 (s, 1 H), 9,22 (d, J=8,08 Гц, 1 H), 7,98 (d, J=2,53 Гц, 1 H), 7,91 (d, J=2,27 Гц, 1 H), 7,80 (s, 1 H), 7,78 (d, J=1,01 Гц, 1 H), 7,70 (td, J=7,45, 1,26 Гц, 1 H), 7,52 - 7,61 (m, 2 H), 7,39 - 7,49 (m, 4 H), 7,11 (t, J=2,40 Гц, 1 H), 5,18 (qd, J=7,24, 7,07 Гц, 1 H), 3,74 (s, 3 H), 1,44

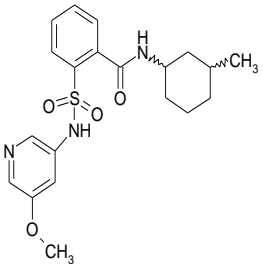
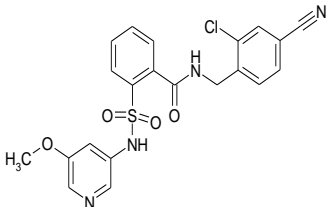
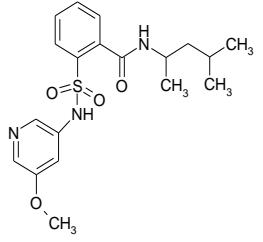
			(d, J=6,82 Гц, 3 H) (400 МГц, ДМСО-d6) d част. на млн. 9,84 (s, 1 H), 9,27 - 9,36 (m, 1 H), 7,98 (d, J=2,53 Гц, 1 H), 7,92 (d, J=2,02 Гц, 1 H), 7,83 (d, J=6,82 Гц, 1 H), 7,81 (s, 1 H), 7,72 (td, J=7,45, 1,26 Гц, 1 H), 7,58 - 7,66 (m, 2 H), 7,48 (dd, J=8,84, 2,53 Гц, 1 H), 7,25 (td, J=8,53, 2,65 Гц, 1 H), 7,12 (t, J=2,40 Гц, 1 H), 4,54 (d, J=5,56 Гц, 2 H), 3,75 (s, 3 H)
183		N-(2-хлор-4-фторбензил)-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	
184		N-(3,5-дифторбензил)-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ДМСО-d6) d част. на млн. 9,88 (s, 1 H), 9,33 (t, J=5,81 Гц, 1 H), 7,99 (d, J=2,53 Гц, 1 H), 7,93 (d, J=2,02 Гц, 1 H), 7,82 (d, J=7,83Hz, 1 H), 7,72 (td, J=7,45, 1,01 Гц, 1 H), 7,63 (dd, J=7,71, 6,19 Гц, 2 H), 7,59 (d, J=1,52 Гц, 1 H), 7,09 - 7,19 (m, 3 H), 4,55 (d, J=5,81 Гц, 2 H), 3,74 (s, 3 H)
185		N-(2,3-дихлорбензил)-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ДМСО-d6) d част. на млн. 10,03 (s, 1 H), 9,34 (t, J=5,81 Гц, 1 H), 8,04 (s, 1 H), 7,97 (s, 1 H), 7,86 (d, J=7,83 Гц, 1 H), 7,74 (td, J=7,45, 1,26 Гц, 1 H), 7,62 - 7,68 (m, 2 H), 7,54 - 7,61 (m, 2 H), 7,39 (t, J=7,83 Гц, 1 H), 7,21 (d, J=2,02 Гц, 1 H), 4,60 (d, J=5,56 Гц, 2 H), 4,58(s, 1 H), 3,73 - 3,78 (m, 3 H)
186		N-(2-метоксибензил)-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО- ФОРМ-d) d част. на млн. 9,49 (s, 1 H), 8,13 (d, J=1,77 Гц, 1 H), 8,04 (d, J=2,53 Гц, 1 H), 7,80 (d, J=7,58 Гц, 1 H), 7,79 (s, 1 H), 7,64 (d, J=1,26 Гц, 1 H), 7,58 - 7,63 (m, 2 H), 7,55 (s, 1 H), 7,51 (qd, J=7,62, 1,14 Гц, 1 H), 7,40 (dd, J=7,45, 1,64 Гц, 1 H), 7,34 (td, J=7,83, 1,77 Гц, 1 H), 6,97 - 7,02 (m, 1 H), 6,95 (d, J=8,08 Гц, 1 H), 6,80 (t, J=5,68 Гц, 1 H), 4,71 (d, J=5,81

			Гц, 2 H), 3,87 - 3,92 (m, 6 H)
187		N-циклогексил-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) d част. на млн. 1,17 - 1,28 (m, 3 H) 1,33 - 1,45 (m, 2 H) 1,59 (d, J=4,04 Гц, 1 H) 1,67 - 1,77 (m, 2 H) 2,04 (s, 2 H) 3,75 (s, 3 H) 3,90 - 3,99 (m, 1 H) 5,91 (s, 1 H) 7,21 (t, J=2,27 Гц, 1 H) 7,36 (td, J=7,58, 1,52 Гц, 1 H) 7,41 - 7,47 (m, 1 H) 7,50 (td, J=7,45, 1,26 Гц, 1 H) 7,65 (d, J=7,83 Гц, 1 H) 7,91 (s, 1 H) 7,98 (d, J=2,27 Гц, 1 H) 8,67 (s, 1 H)
188		N-[(2-гідрокси-2-адамантил)метил]-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ДМСО-d6) d част. на млн. 1,45 (d, J=11,62 Гц, 2 H) 1,62 - 1,71 (m, 4 H) 1,74 - 1,83 (m, 4 H) 1,95 (d, J=12,63 Гц, 2 H) 2,21 (d, J=11,12 Гц, 2 H) 3,61 (d, J=5,81 Гц, 2 H) 3,76 (s, 3 H) 4,39 (s, 1 H) 5,76 (s, 1 H) 7,11 (s, 1 H) 7,55 - 7,62 (m, 2 H) 7,70 (t, J=7,20 Гц, 1 H) 7,79 (d, J=7,83 Гц, 1 H) 7,91 (s, 1 H) 7,99 (s, 1 H) 8,41 (s, 1 H) 9,87 (s, 1 H)
189		N-[1-(гідроксиметил)пентил]-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ДМСО-d6) d част. на млн. 0,76 (t, J=6,95 Гц, 3 H) 1,16 - 1,25 (m, 3 H) 1,28 (d, J=6,32 Гц, 1 H) 1,45 - 1,55 (m, 1 H) 3,24 - 3,32 (m, 1 H) 3,34 - 3,45 (m, 1 H) 3,63 (s, 3 H) 3,81 (d, J=4,55 Гц, 1 H) 4,74 (s, 1 H) 6,97 (s, 1 H) 7,44 (t, J=7,20 Гц, 2 H) 7,56 (d, J=7,33 Гц, 1 H) 7,65 (d, J=7,33 Гц, 1 H) 7,77 (s, 1 H) 7,86 (s, 1 H) 8,36 (s, 1 H) 9,72 (s, 1 H)
190		N-[(1S)-2-циклогексил-1-(гідроксиметил)етил]-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) d част. на млн. 0,92 - 1,04 (m, 2 H) 1,22 - 1,31 (m, 3 H) 1,42 - 1,53 (m, 3 H) 1,66 - 1,78 (m, 5 H) 1,89 (d, J=12,38 Гц, 1 H) 3,69 (dd, J=11,37, 6,06 Гц, 1 H) 3,83 (s, 3 H) 4,00 (dd, J=11,37, 3,54 Гц, 1 H)

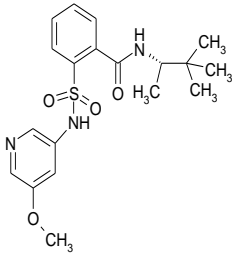
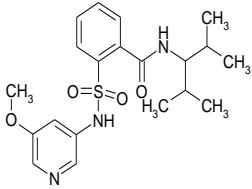
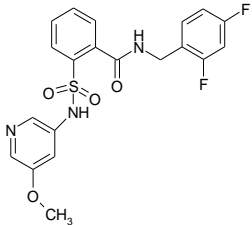
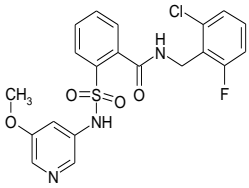
			4,38 (s, 1 H) 6,37 (d, J=8,59 Гц, 1 H) 7,45 - 7,53 (m, 1 H) 7,55 - 7,65 (m, 2 H) 7,81 (d, J=7,83 Гц, 1 H) 8,01 (dd, J=12,00, 2,15 Гц, 2 H)
191		N-[2-(2,4-дифторфеніл)етил]-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл}бензамід	(400 МГц, ХЛОРОФОРМ-D) d част. на млн. 8,59 (bs, 1 H) 8,02 (d, J=2,78 Гц, 1 H) 7,92 (d, J=2,27 Гц, 1 H) 7,68 (d, J=7,83 Гц, 1 H) 7,50 - 7,57 (m, 1 H) 7,37 - 7,45 (m, 2 H) 7,28 - 7,35 (m, 1 H) 7,18 - 7,22 (m, 1 H) 6,79 - 6,87 (m, 2 H) 6,40 (m, 1 H) 3,81 (s, 3 H) 3,74 (q, J=6,65 Гц, 2 H) 3,02 (t, J=6,69 Гц, 2 H)
192		N-(3-хлорбензил)-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл}бензамід	(400 МГц, ХЛОРОФОРМ-d) d част. на млн. 3,84 (s, 3 H) 4,71 (d, J=5,81 Гц, 2 H) 6,48 (s, 1 H) 7,28 - 7,31 (m, 1 H) 7,31 - 7,37 (m, 3 H) 7,43 (s, 1 H) 7,44 - 7,51 (m, 1 H) 7,53 - 7,63 (m, 2 H) 7,76 (d, J=7,58 Гц, 1 H) 7,98 (d, J=1,77 Гц, 1 H) 8,07 (d, J=2,27 Гц, 1 H) 8,61 (s, 1 H)
193		N-(1-етилпропіл)-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл}бензамід	(400 МГц, ХЛОРОФОРМ-d) d част. на млн. 9,45 (s, 1 H), 8,10 (s, 1 H), 8,03 (d, J=2,53 Гц, 1 H), 7,73 - 7,82 (m, 1 H), 7,55 - 7,65 (m, 3 H), 7,47 - 7,53 (m, 1 H), 6,08 (d, J=8,84 Гц, 1 H), 4,00 - 4,09 (m, 1 H), 3,91 (s, 3 H), 1,68 - 1,79 (m, 2 H), 1,53 - 1,64 (m, 2 H), 1,03 - 1,08 (m, 6 H)
194		2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]-N-[(3R,3aR,5R,6aR,7R)-7-(метоксиметил)гексагідро-3,5-метаноциклопента[b]пірол-1(2H)-іл]карбоніл}-N-(5-метоксипіридин-3-іл)бензолсульфонамід	(400 МГц, ХЛОРОФОРМ-d) d част. на млн. 1,17 (d, J=11,62 Гц, 1 H), 1,35 (d, J=10,61 Гц, 1 H), 1,56 - 1,70 (m, 2 H), 1,80 (s, 1 H), 2,01 (s, 1 H), 2,05 - 2,14 (m, 1 H), 2,61 - 2,67 (m, 1 H), 3,02 - 3,11 (m, 1 H), 3,19 - 3,23 (m, 2 H), 3,23 - 3,28 (m, 1 H), 3,30 (s, 1 H), 3,35 (d, J=7,58 Гц, 1 H), 3,42 (s, 1 H), 3,71 - 3,76 (m, 2 H), 4,30 (s, 1 H),

			7,15 - 7,18 (m, 1 H), 7,27 - 7,33 (m, 1 H), 7,33 - 7,38 (m, 1 H), 7,44 - 7,53 (m, 1 H), 7,59 (d, J=8,08 Гц, 1 H), 7,88 - 7,96 (m, 1 H), 7,99 (d, J=2,27 Гц, 1 H), 8,29 (s, 1 H)
195		N-етил-2-([(5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл)-N-пропілбензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 0,81 (t, J=7,45 Гц, 1 H), 1,06 (t, J=7,45 Гц, 1 H), 1,18 (t, J=7,20 Гц, 1 H), 1,35 (t, J=7,07 Гц, 1 H), 1,52 - 1,65 (m, 1 H), 1,66 - 1,92 (m, 2 H), 3,02 - 3,12 (m, 1 H), 3,14 - 3,27 (m, 1 H), 3,28 - 3,39 (m, 1 H), 3,47 - 3,60 (m, 1 H), 3,68 - 3,77 (m, 1 H), 3,83 (s, 2 H), 7,26 (t, J=2,15 Гц, 1 H), 7,36 - 7,45 (m, 2 H), 7,59 (t, J=7,58 Гц, 1 H), 7,64 - 7,69 (m, 1 H), 8,00 (s, 1 H), 8,09 (s, 1 H), 8,15 (d, J=10,36 Гц, 1 H)
196		2-([2-(2,6-дифторфеніл)морфолін-4-іл]карбоніл)-N-(5-метоксипіридин-3-іл)бензолсульфонамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 3,24 - 3,36 (m, 1 H), 3,38 - 3,51 (m, 1 H), 3,53 - 3,64 (m, 1 H), 3,84 (d, J=1,26 Гц, 1 H), 3,85 (s, 1 H), 3,89 - 3,94 (m, 1 H), 3,96 - 4,01 (m, 1 H), 4,02 - 4,07 (m, 1 H), 4,15 (dd, J=11,37, 3,54 Гц, 1 H), 4,29 (dd, J=12,13, 3,03 Гц, 1 H), 4,52 - 4,63 (m, 1 H), 4,81 (dd, J=12,88, 2,02 Гц, 1 H), 4,93 - 5,06 (m, 1 H), 5,09 - 5,19 (m, 1 H), 6,87 (q, J=8,25 Гц, 1 H), 6,94 - 7,01 (m, 1 H), 7,30 - 7,37 (m, 1 H), 7,38 - 7,52 (m, 1 H), 7,54 - 7,61 (m, 1 H), 7,61 - 7,66 (m, 1 H), 7,68 - 7,74 (m, 1 H), 7,97 - 8,03 (m, 1 H), 8,08 - 8,15 (m, 1 H)
197		N-[2-(2,5-дифторфеніл)етил]-2-([(5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл)бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-D) δ част. на млн. 8,57 (bs, 1 H) 8,02 (d, J=2,53 Гц, 1 H) 7,91 (d, J=2,27 Гц, 1 H) 7,67 (dd, J=7,83, 1,01 Гц, 1 H) 7,54 (td, J=7,58, 1,26 Гц, 1 H)

			7,43 (m, 1 H) 7,40 (m, 1 H) 7,15 - 7,22 (m, 1 H) 7,06 (m, 1 H) 6,98 - 7,03 (m, 1 H) 6,87 - 6,96 (m, 1 H) 6,48 (m, 1 H) 3,80 (s, 3 H) 3,76 (q, J=6,74 Гц, 2 H) 3,03 (t, J=6,69 Гц, 2 H)
198		N-(2-фторбензил)-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-метилбензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) d част. на млн. 2,91 (s, 2,1 H), 3,13 (s, 1 H), 3,84 (s, 3 H), 4,40 - 4,50 (m, 0,4 H), 4,56 - 4,65 (m, 0,3 H), 4,72 - 4,82 (m, 0,7 H), 5,03 - 5,16 (m, 0,6 H), 7,04 - 7,18 (m, 1,2 H), 7,20 - 7,27 (m, 1,3 H), 7,31 - 7,48 (m, 3,5 H), 7,52 - 7,65 (m, 1,9 H), 7,67 - 7,73 (m, 1 H), 7,97 - 8,06 (m, 1,3 H), 8,10 (d, J=2,27 Гц, 1,6 H)
199		N-[1-(4-хлорбензил)-2-гідроксіетил]-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ДМСО-d6) d част. на млн. 2,71 (s, 1 H) 2,93 (s, 1 H) 3,39 (s, 1 H) 3,51 (s, 1 H) 3,70 (s, 3 H) 4,10 (s, 1 H) 4,99 (s, 1 H) 7,04 (s, 1 H) 7,25 - 7,35 (m, 5 H) 7,48 - 7,56 (m, 1 H) 7,63 (t, J=7,45 Гц, 1 H) 7,74 (d, J=7,83 Гц, 1 H) 7,85 (s, 1 H) 7,93 (s, 1 H) 8,59 (s, 1 H) 9,81 (s, 1 H)
200		N-(циклогексилметил)-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) d част. на млн. 9,79 (s, 1 H), 8,09 - 8,20 (m, 1 H), 8,03 (d, J=2,27 Гц, 1 H), 7,75 - 7,83 (m, 1 H), 7,58 - 7,68 (m, 2 H), 7,49 - 7,55 (m, 1 H), 6,50 (d, J=4,80 Гц, 1 H), 3,96 (s, 3 H), 3,32 - 3,40 (m, 2 H), 1,76 - 1,87 (m, 4 H), 1,67 - 1,74 (m, J=10,80, 7,33, 3,69, 3,69 Гц, 2 H), 1,22 - 1,33 (m, 3 H), 1,00 - 1,11 (m, 2 H)
201		N-2-адамантил-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) d част. на млн. 1,23 - 1,29 (m, 1 H) 1,61 (s, 1 H) 1,73 - 1,81 (m, 4 H) 1,84 (s, 3 H) 2,04 (s, 1 H) 2,18 (s, 2 H) 3,80 (s, 3 H) 4,28 (s, 1 H) 6,38 (m, 1 H) 7,21 - 7,24 (m, 1

			H) 7,42 (s, 1 H) 7,44 (d, J=7,83 Гц, 1 H) 7,56 (d, J=1,52 Гц, 1 H) 7,57 (dd, J=7,07, 1,26 Гц, 1H) 7,71 (d, J=7,83 Гц, 1 H) 7,95 (d, J=2,02 Гц, 1 H) 8,05 (d, J=2,53 Гц, 1 H) 8,61 (s, 1 H)
202		2-(((5-метоксипіридин-3-іл)аміно)сульфоніл)-N-(3-метилциклогексил)бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 9,71 (s, 1 H), 8,11 - 8,20 (m, 1 H), 8,04 (d, J=2,27 Гц, 1 H), 7,81 (dd, J=5,81, 2,78 Гц, 1 H), 7,79 (s, 1 H), 7,71 (d, J=2,27 Гц, 1 H), 7,56 - 7,68 (m, 2 H), 7,49 - 7,54 (m, 1 H), 6,23 (t, J=6,69 Гц, 1 H), 3,91 - 4,02 (m, 3 H), 2,16 (d, J=2,02 Гц, 1 H), 2,14 (d, J=4,04 Гц, 1 H), 1,79 - 1,90 (m, 1 H), 1,71 (s, 1 H), 1,60 (s, 1 H), 1,58 (d, J=2,02 Гц, 1 H), 1,40 - 1,52 (m, 1 H), 0,94 - 1,01 (m, 3 H), 0,83 - 0,94 (m, 1 H)
203		N-(2-хлор-4-ціанобензил)-2-(((5-метоксипіридин-3-іл)аміно)сульфоніл)бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 3,80 (s, 3 H) 4,83 (d, J=6,06 Гц, 2 H) 7,00 - 7,08 (m, 1 H) 7,18 (m, 1 H) 7,39 - 7,46 (m, 1 H) 7,55 - 7,64 (m, 3 H) 7,67 - 7,73 (m, 2 H) 7,77 (m, 1 H) 7,86 (d, J=2,02 Гц, 1 H) 8,01 (d, J=2,53 Гц, 1 H)
204		N-(1,3-диметилбутил)-2-(((5-метоксипіридин-3-іл)аміно)сульфоніл)бензамід	(400 МГц, ДМСО-d6) δ част. на млн. 9,75 (s, 1 H), 8,59 (d, J=8,08 Гц, 1 H), 8,00 (d, J=2,53 Гц, 1 H), 7,91 (d, J=2,02 Гц, 1 H), 7,74 (d, J=7,83Hz, 1 H), 7,69 (t, J=7,07 Гц, 1 H), 7,56 (t, J=7,20 Гц, 1 H), 7,49 (d, J=7,33 Гц, 1 H), 7,12 (t, J=2,40 Гц, 1 H), 4,05 - 4,15 (m, 1 H), 3,76 (s, 3 H) 1,68 - 1,79 (m, 1 H), 1,45 - 1,55 (m, 1 H), 1,23 (ddd, J=13,58, 8,40, 5,56 Гц, 1 H), 1,15 (d, J=6,57 Гц, 3 H), 0,91 (dd, J=9,60, 6,57 Гц, 6 H)

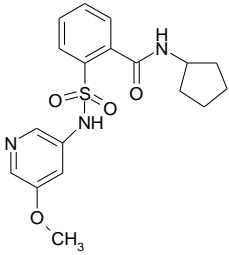
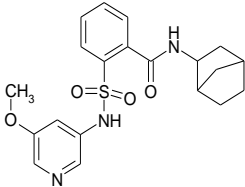
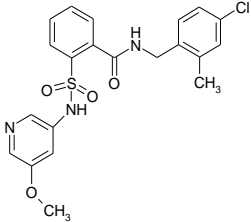
205		N-(2-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл}бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) d част. на млн. 1,04 m, 3 H) 1,31 (m, 3 H) 1,66 (m, 2 H) 3,80 (s, 3 H) 4,08 - 4,19 (m, 1 H) 6,02 (m, 1 H) 7,21 m, 1 H) 7,38 - 7,46 (m, 1 H) 7,49 - 7,58 (m, 2 H) 7,70 (m, 1 H) 7,94 (m, 1 H) 8,04 (m, 1 H) 8,64 (s, 1 H)
206		N-(3-хлор-2-метилбензил)-2-{{(5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл}бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) d част. на млн. 7,98 (s, 2 H), 7,75 (d, J=8,08 Гц, 1 H), 7,56 - 7,63 (m, 2 H), 7,44 - 7,50 (m, 1 H), 7,41 (s, 1 H), 7,33 (dd, J=11,62, 7,83 Гц, 2 H), 7,16 (t, J=7,71 Гц, 1 H), 6,73 (s, 1 H), 4,73 (d, J=5,56 Гц, 2 H), 3,86 (s, 3 H), 2,47 (s, 3 H)
207		N-(2,6-дифторбензил)-2-{{(5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл}бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) d част. на млн. 3,81 (s, 3 H) 4,74 (d, J=6,06 Гц, 2 H) 6,5 (m, 1 H) 6,98 - 7,10 (m, 2 H) 7,16 - 7,23 (m, 1 H) 7,45 (m, 1 H) 7,52 - 7,61 (m, 3 H) 7,74 (d, J=7,83 Гц, 1 H) 7,94 (d, J=2,27 Гц, 1 H) 8,06 (d, J=2,78 Гц, 1 H)
208		2-{{(5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл}-N-(2-метилбутил)бензамід	(400 МГц, ДМСО-d6) d част. на млн. 9,77 (s, 1 H), 8,76 (t, J=5,56 Гц, 1 H), 8,00 (d, J=2,53 Гц, 1 H), 7,91 (d, J=2,02 Гц, 1 H), 7,76 (d, J=7,83 Hz, 1 H), 7,69 (t, J=7,45 Гц, 1 H), 7,51 - 7,59 (m, 2 H), 7,12 (t, J=2,27 Гц, 1 H), 3,76 (s, 3 H), 3,21 (ddd, J=12,88, 6,32, 6,06 Гц, 1 H), 3,08 (dt, J=13,14, 6,57 Гц, 1 H), 1,68 (dt, J=19,39, 6,73 Гц, 1 H), 1,41 - 1,52 (m, 1 H), 1,16 (ddd, J=13,89, 7,33, 7,07 Гц, 1 H), 0,89 - 0,93 (m, 6 H)
209		N-(2-циклопентилетил)-2-{{(5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл}бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) d част. на млн. 1,18 (dd, J=11,62, 7,58 Гц, 2 H) 1,26 (t, J=7,07 Гц, 1 H) 1,54 - 1,60 (m, 1 H) 1,62 - 1,73 (m, 4

			H)1,81 - 1,92 (m, 3 H) 3,52 (td, J=7,33, 6,06 Гц, 2 H) 3,80 (s, 3 H) 6,28 (m, 1 H) 7,20 (t, J=2,40 Гц, 1 H) 7,40 (td, J=7,52, 1,64 Гц, 1 H) 7,53 (qd, J=7,37, 1,39 Гц, 2 H) 7,68 (d, J=7,07 Гц, 1 H) 7,94 (d, J=2,02 Гц, 1 H) 8,04 (d, J=2,78 Гц, 1 H) 8,66 (s, 1 H)
210		2-([(5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл)-N-[(1S)-122-триметилпропіл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) d част. на млн. 8,16 (d, J=2,02 Гц, 1 H), 8,05 (d, J=2,53 Гц, 1 H), 7,81 (s, 1 H), 7,79 (d, J=1,01 Гц, 1 H), 7,70 (s, 1 H), 7,67 (td, J=7,77, 1,64 Гц, 2 H), 7,49 - 7,59 (m, 1 H), 6,13 (d, J=9,85 Гц, 1 H), 4,10 - 4,17 (m, 1 H), 3,94 (s, 3 H), 1,23 - 1,28 (m, 3 H), 1,00 - 1,06 (m, 9 H)
211		N-(1-ізопропіл-2-метилпропіл)-2-([(5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл)бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) d част. на млн. 0,99 - 1,09 (m, 12H) 1,90 - 2,00 (m, 2 H) 3,81 (s, 3 H) 3,82 - 3,87 (m, 1 H) 5,85 (m, 1H) 7,20 - 7,25 (m, 1 H) 7,26 (s, 1 H) 7,40 - 7,49 (m, 1 H) 7,54 - 7,61 (m, 2 H) 7,76 (d, J=8,08 Гц, 1 H) 7,96 (d, J=2,02 Гц, 1 H) 8,04 (d, J=2,53 Гц, 1 H) 8,76 (s, 1 H)
212		N-(2,4-дифторбензил)-2-([(5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл)бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) d част. на млн. 8,00 (s, 2 H), 7,74 (d, J=7,83 Гц, 1 H), 7,56 - 7,63 (m, 2 H), 7,51 - 7,54 (m, 1 H), 7,45 - 7,50 (m, 1H), 7,42 (t, J=2,27 Гц, 1 H), 6,89 - 6,95 (m, 2 H), 6,83 - 6,89 (m, 1 H), 4,72 (d, J=6,06 Гц, 2 H), 3,87 (s, 3 H)
213		N-(2-хлор-6-фторбензил)-2-([(5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл)бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) d част. на млн. 3,80 (s, 3 H) 4,90 (d, J=5,56 Гц, 2 H) 6,52 (m, 1 H) 7,03 - 7,12 (m, 1 H) 7,21 (m, 1H) 7,25 - 7,33 (m, 1 H) 7,41 (td, J=7,58, 1,52 Гц, 1 H) 7,48 - 7,56 (m, 2 H) 7,70 (d, J=7,83 Гц, 1 H) 7,94

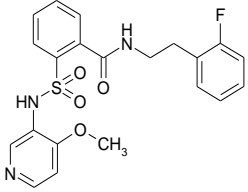
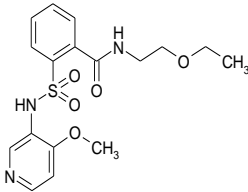
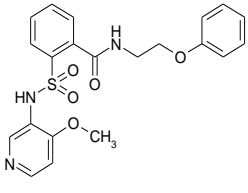
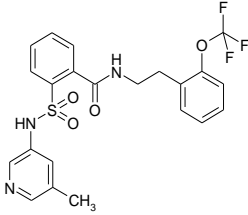
155

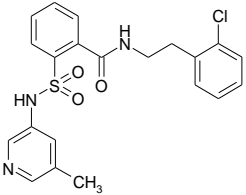
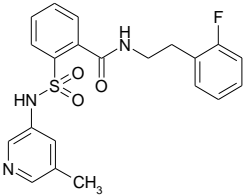
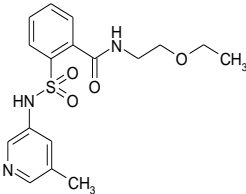
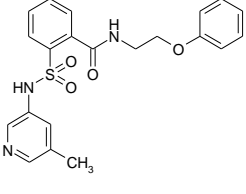
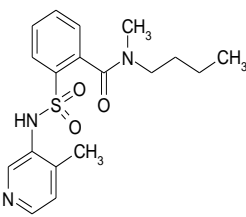
95250

156

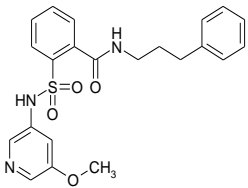
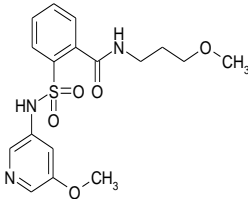
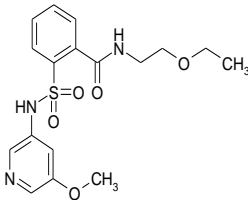
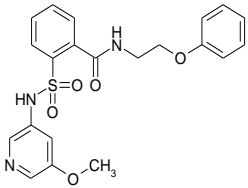
			(d, J=2,02 Гц, 1 H) 8,04 (d, J=2,53 Гц, 1 H)
214		N-циклопентил-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРОФОРМ-d) d част. на млн. 8,03 - 8,09 (m, 1 H), 7,96 (t, J=1,89 Гц, 1 H), 7,70 (d, J=7,83 Гц, 1 H), 7,48 - 7,59 (m, 2 H), 7,38 - 7,45 (m, 1 H), 7,22 (q, J=2,27 Гц, 1 H), 6,13 (d, J=6,57 Гц, 1 H), 4,43 (td, J=12,69, 5,68 Гц, 1 H), 3,81 (d, J=2,02 Гц, 3 H), 3,58 - 3,65 (m, 1 H), 2,10 - 2,19 (m, 2 H), 1,96 - 2,06 (m, 2 H), 1,83 - 1,94 (m, 1 H), 1,69 - 1,78 (m, 2 H), 1,61 - 1,67 (m, 2 H)
215		N-біцикло[2.2.1]гепт-2-ил-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРОФОРМ-d) d част. на млн. 1,00 - 1,12 (m, 3 H) 1,16 - 1,26 (m, 1 H) 1,27 - 1,36 (m, 1 H) 1,37 - 1,48 (m, 3 H) 1,53 (m, 1 H) 1,58 - 1,67 (m, 1 H) 1,90 - 1,97 (m, 1 H) 2,21 (bs, 1 H) 2,36 (bs, 1 H) 2,47 (m, 1 H) 2,80 (m, 1 H) 3,31 (s, 1 H) 3,80 (s, 3 H) 3,94 m, 1 H) 6,10 (m, 1H) 7,20 (t, J=2,40 Гц, 1 H) 7,37 - 7,42 (m, 1 H) 7,47 - 7,51 (m, 1 H) 7,55 (t, J=7,45 Гц, 1 H) 7,68 (d, J=7,83 Гц, 1 H) 7,95 (d, J=2,02 Гц, 1 H) 8,04 (d, J=2,78 Гц, 1 H)
216		N-(4-хлор-2-метилбензил)-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРОФОРМ-d) d част. на млн. 7,96 (s, 2 H), 7,73 (d, J=7,58 Гц, 1 H), 7,57 - 7,63 (m, 2 H), 7,47 (td, J=5,43, 2,78 Гц, 1 H), 7,40 (d, J=2,02 Гц, 1 H), 7,33 (d, J=8,08 Гц, 1 H), 7,20 (s, 1 H), 7,15 - 7,19 (m, 1 H), 6,77 (t, J=5,31 Гц, 1 H), 4,66 (d, J=5,56 Гц, 2 H), 3,84 - 3,89 (m, 3 H), 2,41 (s, 3 H)

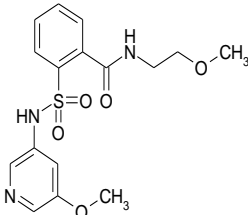
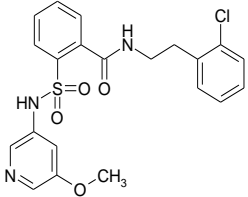
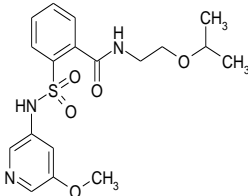
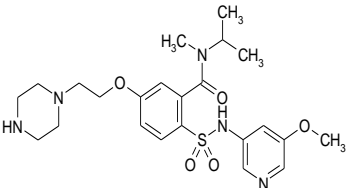
217		2-[[4-(2-етоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-(2-метоксіетил)бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) d част. на млн. 8,64 (s, 2 H) 8,25 (d, J=5,54 Гц, 1 H) 7,77 (d, J=7,81 Гц, 1 H) 7,51 - 7,67 (m, 2 H) 7,37 - 7,51 (m, 1 H) 6,54 - 6,87 (m, 2 H) 3,88 (q, J=6,88 Гц, 2 H) 3,59 - 3,76 (m, 4 H) 3,29 - 3,44 (m, 3 H) 1,09 - 1,22 (m, 3 H)
218		N-(2-етоксіетил)-2-[[4-(2-етоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) d част. на млн. 8,65 (s, 2 H) 8,26 (d, J=5,54 Гц, 1 H) 7,76 (d, J=8,31 Гц, 1 H) 7,50 - 7,65 (m, 2 H) 7,30 - 7,49 (m, 1 H) 6,36 - 6,80 (m, 2 H) 3,87 (q, J=6,88 Гц, 2 H) 3,64 - 3,76 (m, 4 H) 3,58 (q, J=6,97 Гц, 2 H) 1,04 - 1,26 (m, 6 H)
219		2-[[4-(2-етоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-(2-феноксіетил)бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) d част. на млн. 8,65 (s, 1 H) 8,60 - 8,60 (m, 1 H) 8,25 (d, J=5,79 Гц, 1 H) 7,77 (d, J=8,06 Гц, 1 H) 7,51 - 7,62 (m, 2 H) 7,38 - 7,49 (m, 1 H) 7,20 - 7,34 (m, 2 H) 6,88 - 7,03 (m, 3 H) 6,64 (d, J=5,54 Гц, 2 H) 4,23 (t, J=5,04 Гц, 2 H) 3,72 - 4,03 (m, 4 H) 0,89 - 1,25 (m, 3 H)
220		N-[2-(2-хлорфеніл)етил]-2-[[4-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) d част. на млн. 8,42 (dd, J=4,66, 1,38 Гц, 1 H) 8,36 (d, J=1,76 Гц, 1 H) 7,42 - 7,52 (m, 1 H) 7,11 - 7,24 (m, 2 H) 6,75 (dd, J=7,43, 5,92 Гц, 2 H) 5,85 (s, 1 H) 4,44 - 4,66 (m, 1 H) 4,03 (q, J=7,05 Гц, 2 H) 2,87 - 3,00 (m, 4 H) 2,34 - 2,49 (m, 2 H) 1,80 - 1,92 (m, 2 H) 1,71 - 1,81 (m, 2 H) 1,31 - 1,44 (m, 3 H) RXMS ESI: 446,10 МН+
221		2-[[4-(2-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-[2-[2-(трифторметокси)феніл]етил]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) d част. на млн. 8,63 (s, 1 H) 8,48 - 8,58 (m, 1 H) 8,26 (d, J=5,54 Гц, 1 H) 7,72 - 7,82 (m, 1 H) 7,50 - 7,59 (m, 1 H) 7,39 - 7,47 (m, 3 H) 7,19 - 7,31 (m, 3 H) 6,67 (d, J=5,79 Гц, 1

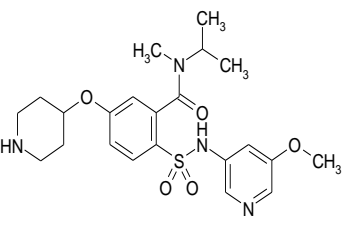
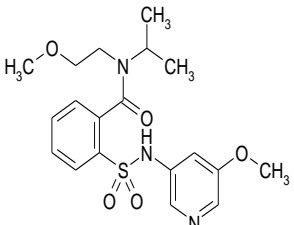
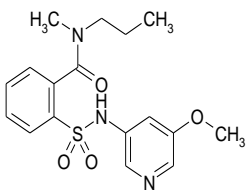
			H) 6,07 - 6,25 (m, 1 H) 3,77 (q, J=6,80 Гц, 2 H) 3,47 - 3,67 (m, 3 H) 3,09 (t, J=6,92 Гц, 2 H)
222		N-[2-(2-фторфеніл)етил]-2-[[4-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 8,63 (s, 1 H) 8,49 - 8,59 (m, 1 H) 8,26 (d, J=5,79 Гц, 1 H) 7,75 - 7,81 (m, 1 H) 7,49 - 7,59 (m, 1 H) 7,39 - 7,46 (m, 2 H) 7,30 - 7,38 (m, 1 H) 7,18 - 7,28 (m, 3 H) 6,98 - 7,14 (m, 2 H) 3,78 (q, J=6,55 Гц, 2 H) 3,54 - 3,63 (m, 3 H) 3,06 (t, J=6,67 Гц, 2 H)
223		N-(2-етоксіетил)-2-[[4-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 8,64 (s, 2 H) 8,28 (d, J=5,54 Гц, 1 H) 7,79 (d, J=7,81 Гц, 1 H) 7,51 - 7,69 (m, 2 H) 7,37 - 7,50 (m, 1 H) 6,86 (s, 1 H) 6,67 (d, J=5,54 Гц, 1 H) 3,67 - 3,75 (m, 4 H) 3,52 - 3,63 (m, 5 H) 1,06 - 1,24 (m, 3 H)
224		2-[[4-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-(2-феноксіетил)бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 8,63 (s, 1 H) 8,48 (s, 1 H) 8,26 (d, J=5,54 Гц, 1 H) 7,79 (d, J=7,55 Гц, 1 H) 7,53 - 7,63 (m, 2 H) 7,40 - 7,49 (m, 1 H) 7,23 - 7,34 (m, 2 H) 6,88 - 7,01 (m, 3 H) 6,72 - 6,81 (m, 1 H) 6,65 (d, J=5,54 Гц, 1 H) 4,09 - 4,28 (m, 2 H) 3,94 (q, J=5,46 Гц, 2 H) 3,25 - 3,71 (m, 3 H)
225		2-[[5-метилпіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-[2-[2-(трифторметокси)феніл]етил]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 8,54 (s, 1 H) 8,17 (dd, J=5,29, 1,76 Гц, 2 H) 7,69 (d, J=7,81 Гц, 1 H) 7,49 - 7,57 (m, 1 H) 7,37 - 7,47 (m, 4 H) 7,23 - 7,33 (m, 3 H) 6,22 (t, J=5,92 Гц, 1 H) 3,78 (q, J=6,80 Гц, 2 H) 3,10 (t, J=6,92 Гц, 2 H) 2,28 (s, 3 H)

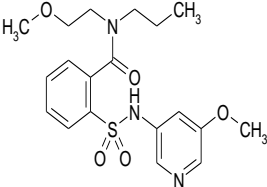
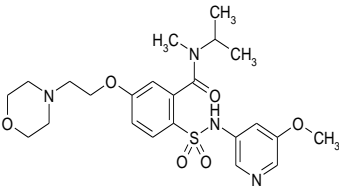
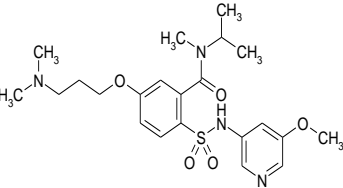
226		N-[2-(2-хлорфеніл)етил]-2-[[5-метилпіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 8,57 (s, 1 H) 8,16 (d, J=4,28 Гц, 2 H) 7,69 (d, J=7,81 Гц, 1 H) 7,53 (t, J=7,43 Гц, 1 H) 7,36 - 7,47 (m, 5 H) 7,11 - 7,26 (m, 2 H) 6,14 - 6,32 (m, 1 H) 3,81 (q, J=6,55 Гц, 2 H) 3,16 (t, J=6,67 Гц, 2 H) 2,28 (s, 3 H)
227		N-[2-(2-фторфеніл)етил]-2-[[5-метилпіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 8,55 (s, 1 H) 8,17 (dd, J=4,91, 1,89 Гц, 2 H) 7,69 (d, J=7,81 Гц, 1 H) 7,52 - 7,55 (m, 1 H) 7,46 (s, 1 H) 7,30 - 7,43 (m, 3 H) 7,21 - 7,29 (m, 1 H) 7,04 - 7,15 (m, 2 H) 6,21 (s, 1 H) 3,79 (q, J=6,55 Гц, 2 H) 3,07 (t, J=6,67 Гц, 2 H) 2,28 (s, 3 H)
228		N-(2-етоксіетил)-2-[[5-метилпіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 8,75 (s, 1 H) 8,17 (s, 2 H) 7,77 (d, J=7,55 Гц, 1 H) 7,53 - 7,61 (m, 2 H) 7,37 - 7,47 (m, 2 H) 6,72 (s, 1 H) 3,66 - 3,80 (m, 4 H) 3,59 (q, J=7,05 Гц, 2 H) 2,26 (s, 3 H) 1,13 - 1,35 (m, 3 H)
229		2-[[5-метилпіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-(2-феноксіетил)бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 8,52 (s, 1 H) 8,05 - 8,27 (m, 2 H) 7,72 (d, J=7,55 Гц, 1 H) 7,51 - 7,65 (m, 2 H) 7,40 - 7,47 (m, 2 H) 7,28 - 7,35 (m, 2 H) 6,89 - 7,03 (m, 3 H) 6,63 (s, 1 H) 4,24 (t, J=5,04 Гц, 2 H) 3,95 (q, J=5,20 Гц, 2 H) 2,12 - 2,40 (m, 3 H)
230		N-бутил-N-метил-2-[[4-метилпіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 8,27 (d, J=4,78 Гц, 1 H) 8,14 (s, 1 H) 7,81 (d, J=10,07 Гц, 1 H) 7,57 - 7,66 (m, 2 H) 7,36 - 7,45 (m, 2 H) 7,07 (d, J=5,04 Гц, 1 H) 3,53 - 3,67 (m, 1 H) 3,17 - 3,24 (m, 1 H) 3,16 (s, 1 H) 2,93 (s, 2 H) 2,25 (d, J=3,27 Гц, 3 H) 1,37 - 1,86 (m, 3 H) 1,14 - 1,30 (m, 1 H)

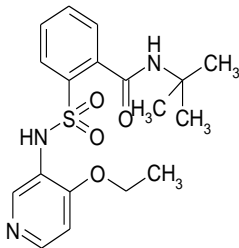
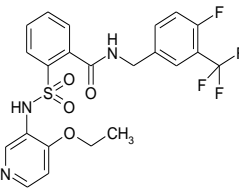
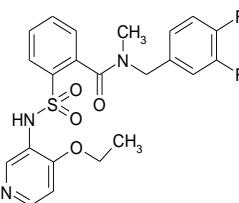
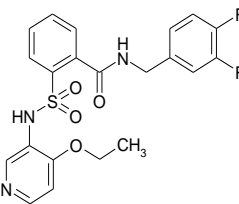
			1,02 (t, J=7,30 Гц, 3 H) PXMC ESI: 362,20 МН+
231		N-(5-метоксипіридин-3-іл)-2-[(4-фенілпіперидин-1-іл)карбоніл]бензолсульфонамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 8,19 (s, 1 H) 8,08 (d, J=2,52 Гц, 1 H) 7,97 (d, J=2,01 Гц, 1 H) 7,62 - 7,71 (m, 1 H) 7,52 - 7,62 (m, 1 H) 7,28 - 7,47 (m, 4 H) 7,17 - 7,29 (m, 4 H) 4,71 - 5,04 (m, 1 H) 3,76 - 3,85 (m, 3 H) 3,57 - 3,75 (m, 1 H) 3,12 - 3,34 (m, 1 H) 2,89 - 3,08 (m, 1 H) 2,68 - 2,90 (m, 1 H) 1,51 - 2,19 (m, 4 H) PXMC ESI: 452,20 МН+
232		2-[(5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл-N-[(1S,2R)-2-фенілциклопропіл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 8,46 (s, 1 H) 8,06 (d, J=2,77 Гц, 1 H) 7,97 (d, J=2,01 Гц, 1 H) 7,70 (d, J=7,81 Гц, 1 H) 7,54 - 7,60 (m, 1 H) 7,50 - 7,54 (m, 1 H) 7,39 - 7,46 (m, 1 H) 7,32 (t, J=7,43 Гц, 2 H) 7,18 - 7,28 (m, 4 H) 6,40 (s, 1 H) 3,81 (s, 3 H) 3,08 - 3,16 (m, 1 H) 2,26 - 2,36 (m, 1 H) 1,35 - 1,45 (m, 2 H) PXMC ESI: 424,20 МН+
233		2-[(5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл-N-[4-(метилсульфоніл)бензил]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 8,49 (s, 1 H) 8,05 (d, J=2,52 Гц, 1 H) 7,84 - 7,96 (m, 3 H) 7,72 (d, J=7,81 Гц, 1 H) 7,56 - 7,66 (m, 4 H) 7,42 - 7,50 (m, 1 H) 7,19 - 7,22 (m, 1 H) 6,90 (t, J=6,04 Гц, 1 H) 4,81 (d, J=6,04 Гц, 2 H) 3,81 (s, 3 H) 3,03 (s, 3 H) PXMC ESI: 476,20 МН+
234		N-[3-(2-метоксифеніл)пропіл]-2-[(5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфонілбензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 8,73 (s, 1 H) 8,05 (d, J=2,52 Гц, 1 H) 7,95 (d, J=2,01 Гц, 1 H) 7,72 (d, J=7,81 Гц, 1 H) 7,50 - 7,59 (m, 1 H) 7,37 - 7,47 (m, 2 H) 7,15 - 7,24 (m, 3 H) 6,89 - 6,99 (m, 1 H) 6,87 (d, J=8,06 Гц, 1 H) 6,46 (t, J=5,54 Гц, 1 H)

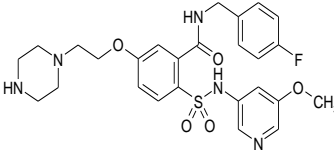
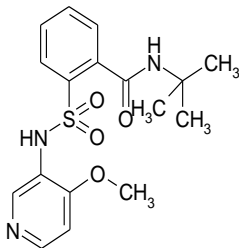
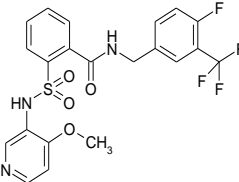
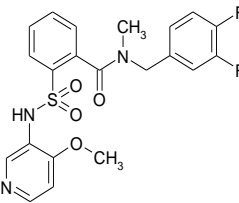
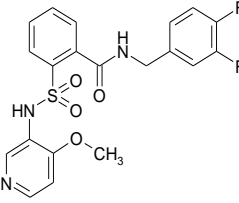
			3,80 (s, 3 H) 3,78 (s, 3 H) 3,49 (q, J=6,55 Гц, 2 H) 2,79 (t, J=7,18 Гц, 2 H) 1,93 - 2,06 (m, 2 H) PXMC ESI: 456,20 MH+
235		2-((5-метоксипіридин-3-іл)аміно)сульфоніл)-N-(3-фенілпропіл)бензамід	(400 МГц, ХЛОРОФОРМ-d) δ част. на млн. 8,63 (s, 1 H) 8,05 (d, J=2,52 Гц, 1 H) 7,94 (d, J=1,76 Гц, 1 H) 7,69 (d, J=7,81 Гц, 1 H) 7,52 (t, J=7,55 Гц, 1 H) 7,27 - 7,45 (m, 4 H) 7,16 - 7,28 (m, 4 H) 6,09 - 6,23 (m, 1 H) 3,80 (s, 3 H) 3,55 (q, J=6,63 Гц, 2 H) 2,78 (t, J=7,43 Гц, 2 H) 1,96 - 2,10 (m, 2 H) PXMC ESI: 426,20 MH+
236		N-(3-метоксипропіл)-2-((5-метоксипіридин-3-іл)аміно)сульфоніл)бензамід	(400 МГц, ХЛОРОФОРМ-d) δ част. на млн. 8,81 (s, 1 H) 8,05 (d, J=1,76 Гц, 1 H) 7,95 (s, 1 H) 7,73 (d, J=8,06 Гц, 1 H) 7,49 - 7,61 (m, 2 H) 7,34 - 7,47 (m, 1 H) 7,22 (t, J=2,27 Гц, 1 H) 6,90 (s, 1 H) 3,81 (s, 3 H) 3,65 (q, J=5,96 Гц, 2 H) 3,60 (t, J=5,54 Гц, 2 H) 3,35 (s, 3 H) 1,90 - 2,01 (m, 2 H) PXMC ESI: 380,20 MH+
237		N-(2-етоксіетил)-2-((5-метоксипіридин-3-іл)аміно)сульфоніл)бензамід	(400 МГц, ХЛОРОФОРМ-d) δ част. на млн. 8,84 (s, 1 H) 8,05 (d, J=2,52 Гц, 1 H) 7,96 (d, J=2,01 Гц, 1 H) 7,81 (d, J=7,81 Гц, 1 H) 7,59 (d, J=4,03 Гц, 2 H) 7,41 - 7,49 (m, 1 H) 7,19 (t, J=2,39 Гц, 1 H) 6,67 (s, 1 H) 3,80 (s, 3 H) 3,68 - 3,76 (m, 4 H) 3,60 (q, J=7,05 Гц, 2 H) 1,23 (t, J=7,05 Гц, 3 H) PXMC ESI: 380,20 MH+
238		2-((5-метоксипіридин-3-іл)аміно)сульфоніл)-N-(2-феноксіетил)бензамід	(400 МГц, ХЛОРОФОРМ-d) δ част. на млн. 8,57 (s, 1 H) 8,06 (d, J=2,77 Гц, 1 H) 7,94 (d, J=2,01 Гц, 1 H) 7,74 (d, J=8,06 Гц, 1 H) 7,49 - 7,62 (m, 2 H) 7,36 - 7,49 (m, 1 H) 7,31 (t, J=8,06 Гц, 2 H) 7,22 (t, J=2,27 Гц, 1 H)

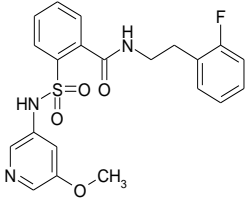
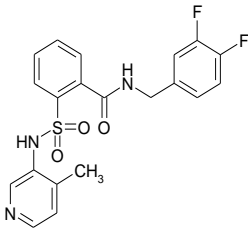
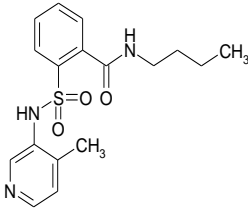
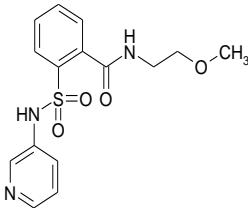
			6,91 - 7,04 (m, 3 H) 6,65 (s, 1 H) 4,23 (t, J=5,04 Гц, 2 H) 3,95 (q, J=5,46 Гц, 2 H) 3,81 (s, 3 H) РХМС ESI: 428,20 МН+
239		N-(2-метоксіетил)-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 8,82 (s, 1 H) 8,05 (d, J=2,52 Гц, 1 H) 7,96 (d, J=2,01 Гц, 1 H) 7,80 (d, J=7,81 Гц, 1 H) 7,55 - 7,61 (m, 2 H) 7,39 - 7,49 (m, 1 H) 7,20 (t, J=2,27 Гц, 1 H) 6,63 (s, 1 H) 3,80 (s, 3 H) 3,70 - 3,77 (m, 2 H) 3,63 - 3,70 (m, 2 H) 3,43 (s, 3 H) РХМС ESI: 366,20 МН+
240		N-[2-(2-хлорфеніл)етил]-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 8,42 (dd, J=4,66, 1,38 Гц, 1 H) 8,36 (d, J=1,76 Гц, 1 H) 7,42 - 7,52 (m, 1 H) 7,11 - 7,24 (m, 2 H) 6,75 (dd, J=7,43, 5,92 Гц, 2 H) 5,85 (s, 1 H) 4,44 - 4,66 (m, 1 H) 4,03 (q, J=7,05 Гц, 2 H) 2,87 - 3,00 (m, 4 H) 2,34 - 2,49 (m, 2 H) 1,80 - 1,92 (m, 2 H) 1,71 - 1,81 (m, 2 H) 1,31 - 1,44 (m, 3 H) РХМС ESI: 446,10 МН+
241		N-(2-ізопропоксиетил)-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 8,83 (s, 1 H) 8,05 (d, J=2,52 Гц, 1 H) 7,97 (d, J=2,01 Гц, 1 H) 7,80 (d, J=7,55 Гц, 1 H) 7,54 - 7,62 (m, 2 H) 7,41 - 7,50 (m, 1 H) 7,16 - 7,23 (m, 1 H) 6,66 (s, 1 H) 3,80 (s, 3 H) 3,65 - 3,74 (m, 5 H) 1,19 (d, J=6,29 Гц, 6 H) РХМС ESI: 394,20 МН+
242		N-ізопропіл-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-метил-5-(2-піперазин-1-ілетокси)бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 1,23 (dd, J=6,69, 2,40 Гц, 3,5 H), 1,29 (d, J=6,82 Гц, 2,9 H), 2,77 (s, 1,6 H), 2,82 - 2,86 (m, 3,5 H), 2,89 (t, J=5,18 Гц, 2 H), 3,01 (s, 1,9 H), 3,16 - 3,25 (m, 3,7 H), 3,50 (s, 1,2 H), 3,79 - 3,95 (m, 3,6 H), 4,02 - 4,22 (m, 2 H), 4,84 - 5,03

			(m, 0,4 H), 6,71 - 6,78 (m, 1 H), 6,81 (d, J=2,53 Гц, 1 H), 7,20 - 7,25 (m, 1,2 H), 7,50 - 7,60 (m, 1 H), 7,88 - 7,99 (m, 1,7 H), 8,07 (s, 1,1 H)
243		N-ізопропіл-2-{{{5-метоксипіридин-3-іл)аміно}сульфоніл}-N-метил-5-(піперидин-4-ілокси)бензамід	(400 МГц, ХЛОРОФОРМ-d) δ част. на млн. 1,24 (dd, J=6,57, 3,28 Гц, 4 H), 1,27 - 1,34 (m, 2,4 H), 1,95 - 2,14 (m, 3 H), 2,15 - 2,32 (m, 1,6 H), 2,78 (s, 1,3 H), 3,02 (s, 1,6 H), 3,13 - 3,23 (m, 1,9 H), 3,31 (t, J=11,24 Гц, 1,7 H), 3,80 - 3,89 (m, 3,5 H), 4,63 - 4,71 (m, 1 H), 4,88 - 4,98 (m, 0,6 H), 6,73 - 6,80 (m, 1 H), 6,82 (t, J=2,15 Гц, 1 H), 7,23 - 7,26 (m, 1 H), 7,58 (dd, J=8,72, 3,41 Гц, 1 H), 7,91 - 8,00 (m, 1 H), 8,07 (d, J=2,02 Гц, 1 H)
244		N-ізопропіл-N-(2-метоксіетил)-2-{{{5-метоксипіридин-3-іл)аміно}сульфоніл}бензамід	(400 МГц, ХЛОРОФОРМ-d) δ част. на млн. 1,22 (dd, J=6,69, 2,91 Гц, 4 H), 1,36 - 1,48 (m, 1 H), 3,23 - 3,26 (m, 1 H), 3,32 - 3,41 (m, 1 H), 3,44 (s, 2 H), 3,45 - 3,52 (m, 1 H), 3,52 - 3,62 (m, 1 H), 3,62 - 3,72 (m, 1 H), 3,76 - 3,91 (m, 3 H), 4,47 - 4,63 (m, 1 H), 7,13 - 7,20 (m, 1 H), 7,30 - 7,40 (m, 1 H), 7,40 - 7,45 (m, 1 H), 7,52 - 7,60 (m, 1 H), 7,64 (d, J=7,83 Гц, 1 H), 7,87 - 7,95 (m, 1 H), 8,00 (s, 1 H), 8,07 (d, J=2,53 Гц, 1 H)
245		2-{{{5-метоксипіридин-3-іл)аміно}сульфоніл}-N-метил-N-пропілбензамід	(400 МГц, ХЛОРОФОРМ-d) δ част. на млн. 0,81 (t, J=7,33 Гц, 1 H), 1,05 (t, J=7,45 Гц, 1 H), 1,64 - 1,97 (m, 1 H), 2,92 (s, 1 H), 3,10 - 3,25 (m, 2 H), 3,50 - 3,62 (m, 1 H), 3,79 (s, 2 H), 7,11 - 7,21 (m, 1 H), 7,32 - 7,43 (m, 2 H), 7,52 - 7,60 (m, 1 H), 7,60 - 7,72 (m, 1 H), 7,95 (dd, J=5,05, 2,02 Гц, 1 H), 7,99 (s, 1 H), 8,07 (d, J=2,53 Гц, 1 H)

246		N-(2-метоксіетил)-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-пропілбензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 0,77 (t, J=7,33 Гц, 1 H), 1,03 (t, J=7,45 Гц, 1 H), 1,49 - 1,57 (m, 1 H), 1,64 - 1,92 (m, 1 H), 3,03 - 3,19 (m, 1 H), 3,23 - 3,31 (m, 1 H), 3,32 (s, 1 H), 3,36 - 3,49 (m, 2 H), 3,53 - 3,68 (m, 1 H), 3,72 - 3,77 (m, 1 H), 3,79 (s, 2 H), 3,88 - 4,02 (m, 1 H), 7,17 (t, J=2,40 Гц, 1 H), 7,31 - 7,42 (m, 1 H), 7,46 (dd, J=7,58, 1,26 Гц, 1 H), 7,52 - 7,59 (m, 1 H), 7,62 (s, 1 H), 7,66 - 7,74 (m, 1 H), 7,94 (d, J=2,02 Гц, 1 H), 8,06 (dd, J=5,43, 2,65 Гц, 1 H), 8,12 (s, 1 H)
247		N-ізопропіл-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-метил-5-(2-морфолін-4-ілетокси)бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 1,22 (dd, J=6,57, 2,27 Гц, 3,4 H), 1,28 (d, J=6,82 Гц, 2,9 H), 2,51 - 2,60 (m, 4,1 H), 2,76 (s, 1,4 H), 2,80 (t, J=5,43 Гц, 2,1 H), 3,01 (s, 1,7 H), 3,68 - 3,76 (m, 4,1 H), 3,81 (s, 3 H), 3,82 - 3,89 (m, 0,7 H), 4,03 - 4,17 (m, 2,1 H), 4,86 - 4,99 (m, 0,4 H), 6,72 - 6,79 (m, 1 H), 6,82 (t, J=2,27 Гц, 1 H), 7,21 (t, J=2,27 Гц, 1 H), 7,54 (dd, J=8,59, 3,79 Гц, 1 H), 7,75 - 7,91 (m, 1 H), 7,93 - 7,98 (m, 1 H), 8,04 - 8,11 (m, 1 H)
248		5-[3-(диметиламіно)пропокси]-N-ізопропіл-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-метилбензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 1,22 (dd, J=6,69, 4,42 Гц, 3,5 H), 1,28 (d, J=6,82 Гц, 2,7 H), 1,93 - 2,01 (m, 3,3 H), 2,27 (d, J=1,52 Гц, 6,2 H), 2,44 - 2,51 (m, 2,2 H), 2,76 (s, 1,3 H), 3,01 (s, 1,6 H), 3,81 (s, 2,8 H), 3,82 - 3,91 (m, 0,6 H), 3,96 - 4,08 (m, 1,9 H), 4,89 - 4,97 (m, 0,4 H), 6,73 - 6,78 (m, 0,9 H), 6,80 (t, J=2,27 Гц, 1 H), 7,21 (t, J=2,40 Гц, 1 H), 7,53 (dd, J=8,59, 4,55 Гц, 1 H), 7,96 (t,

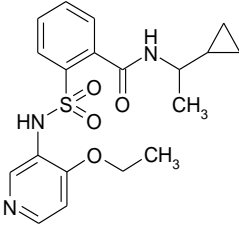
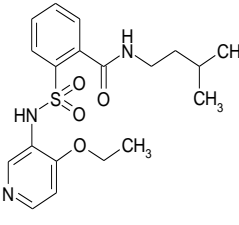
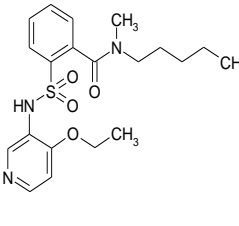
			J=2,27 Гц, 1 H), 8,06 (dd, J=2,53, 1,26 Гц, 1 H)
249		N-(трет-бутил)-2-[[4-етоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 8,69 (s, 1 H) 8,62 (s, 1 H) 8,22 (d, J=5,79 Гц, 1 H) 7,76 (d, J=7,81 Гц, 1 H) 7,36 - 7,58 (m, 3 H) 6,63 (d, J=5,54 Гц, 1 H) 5,88 (s, 1 H) 3,85 (q, J=7,05 Гц, 2 H) 1,52 (s, 9 H) 1,17 (t, J=6,92 Гц, 3 H)
250		2-[[4-етоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-[4-фтор-3-(трифторметил)бензил]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 8,64 (s, 1 H) 8,39 - 8,62 (m, 1 H) 8,21 (d, J=5,54 Гц, 1 H) 7,74 (d, J=7,05 Гц, 1 H) 7,61 - 7,72 (m, 2 H) 7,50 - 7,60 (m, 2 H) 7,38 - 7,47 (m, 1 H) 7,22 (t, J=9,19 Гц, 1 H) 6,70 (s, 1 H) 6,63 (d, J=5,54 Гц, 1 H) 4,71 (d, J=6,04 Гц, 2 H) 3,84 (q, J=6,88 Гц, 2 H) 0,99 - 1,18 (m, 3 H)
251		N-(3,4-дифторбензил)-2-[[4-етоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-метилбензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 8,57 - 8,74 (m, 1 H) 8,15 - 8,33 (m, 1 H) 7,95 (s, 1 H) 7,67 - 7,78 (m, 1 H) 7,52 - 7,63 (m, 1 H) 7,28 - 7,47 (m, 3 H) 6,96 - 7,23 (m, 2 H) 6,65 (d, J=5,79 Гц, 1 H) 4,24 - 4,94 (m, 2 H) 3,60 - 4,09 (m, 2 H) 3,06 (s, 1 H) 2,83 (s, 2 H) 1,02 - 1,30 (m, 3 H)
252		N-(3,4-дифторбензил)-2-[[4-етоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 8,66 (s, 1 H) 8,40 - 8,62 (m, 1 H) 8,23 (d, J=5,54 Гц, 1 H) 7,79 (d, J=7,81 Гц, 1 H) 7,41 - 7,67 (m, 3 H) 7,25 - 7,34 (m, 1 H) 7,01 - 7,22 (m, 2 H) 6,65 (d, J=5,29 Гц, 1 H) 6,33 - 6,57 (m, 1 H) 4,66 (d, J=5,79 Гц, 2 H) 3,87 (q, J=6,63 Гц, 2 H) 1,07 - 1,27 (m, 3 H)

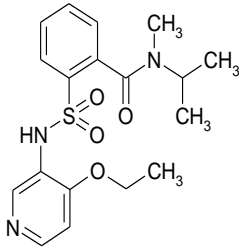
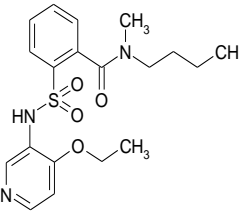
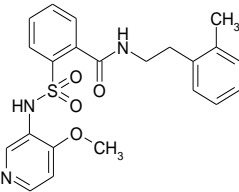
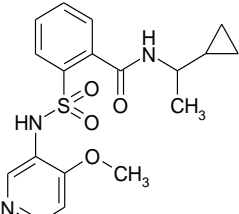
253		N-(4-фторбензил)-2-(((5-метоксипіридин-3-іл)аміно)сульфоніл)-5-(2-піперазин-1-ілетокси)бензамід	(400 МГц, MeOD) d част. на млн. 2,72 (d, J=4,29 Гц, 4 H) 2,86 (t, J=5,18 Гц, 2 H) 3,04 - 3,13 (m, 4 H) 3,83 (s, 3 H) 4,21 (t, J=5,31 Гц, 2 H) 4,62 (s, 2 H) 7,04 (dd, J=8,84, 2,53 Гц, 1 H) 7,07 - 7,13 (m, 2 H) 7,14 (d, J=2,78 Гц, 1 H) 7,26 - 7,35 (m, 1 H) 7,47 - 7,57 (m, 2 H) 7,74 (d, J=8,84 Гц, 1 H) 7,93 (dd, J=8,97, 2,40 Гц, 2 H)
254		N-(трет-бутил)-2-(((4-метоксипіридин-3-іл)аміно)сульфоніл)бензамід	(400 МГц, MeOD): d 8,123 (s, 2H), 7,812 (d, J=7,2 Гц, 1H), 7,658 (m, 1H), 7,543 (m, 3H), 3,891 (s, 3H), 1,474 (s, 9H).
255		N-[4-фтор-3-(трифторметил)бензил]-2-(((4-метоксипіридин-3-іл)аміно)сульфоніл)бензамід	(400 МГц, ХЛОРОФОРМ-d) d част. на млн. 8,64 (s, 1 H) 8,41 (s, 1 H) 8,25 (d, J=5,54 Гц, 1 H) 7,79 (d, J=7,81 Гц, 1 H) 7,63 - 7,75 (m, 2 H) 7,53 - 7,63 (m, 2 H) 7,41 - 7,51 (m, 1 H) 7,19 - 7,24 (m, 1 H) 6,68 (d, J=5,54 Гц, 1 H) 6,49 - 6,61 (m, 1 H) 4,73 (d, J=6,04 Гц, 2 H) 3,47 - 3,70 (m, 3 H)
256		N-(3,4-дифторбензил)-2-(((4-метоксипіридин-3-іл)аміно)сульфоніл)-N-метилбензамід	(400 МГц, ХЛОРОФОРМ-d) d част. на млн. 8,52 - 8,74 (m, 1 H) 8,29 (d, J=5,54 Гц, 1 H) 7,88 (s, 1 H) 7,53 - 7,66 (m, 1 H) 7,28 - 7,47 (m, 4 H) 6,95 - 7,23 (m, 2 H) 6,68 (d, J=5,54 Гц, 1 H) 4,19 - 4,97 (m, 2 H) 3,48 - 3,76 (m, 3 H) 3,07 (s, 1 H) 2,83 (s, 2 H)
257		N-(3,4-дифторбензил)-2-(((4-метоксипіридин-3-іл)аміно)сульфоніл)бензамід	(400 МГц, ХЛОРОФОРМ-d) d част. на млн. 8,61 (s, 1 H) 8,24 (d, J=5,79 Гц, 1 H) 7,77 (d, J=7,30 Гц, 1 H) 7,51 - 7,62 (m, 2 H) 7,43 - 7,49 (m, 1 H) 7,24 - 7,33 (m, 2 H) 7,05 - 7,22 (m, 2 H) 6,57 - 6,73 (m, 2 H) 4,66 (d, J=6,04 Гц, 2 H) 3,60 (s, 3 H)

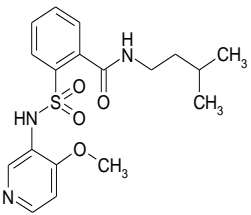
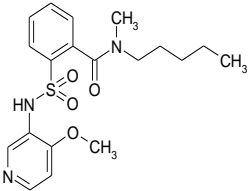
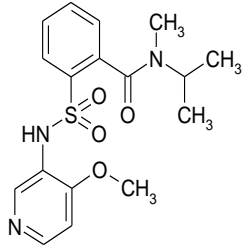
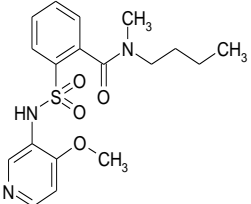
258		N-[2-(2-фторфеніл)етил]-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 8,64 (s, 1 H) 8,06 (d, J=2,52 Гц, 1 H) 7,96 (d, J=2,01 Гц, 1 H) 7,67 - 7,77 (m, 1 H) 7,49 - 7,59 (m, 1 H) 7,38 - 7,45 (m, 2 H) 7,35 (t, J=7,43 Гц, 1 H) 7,19 - 7,29 (m, 2 H) 7,02 - 7,16 (m, 2 H) 6,10 - 6,21 (m, 1 H) 3,73 - 3,87 (m, 5 H) 3,07 (t, J=6,55 Гц, 2 H) РХМС ESI: 430,20 МН+
259		N-(3,4-дифторбензил)-2-[[4-метилпіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 8,27 (d, J=5,04 Гц, 2 H) 8,17 (s, 1 H) 7,71 (d, J=8,06 Гц, 1 H) 7,56 - 7,66 (m, 2 H) 7,44 - 7,52 (m, 1 H) 7,27 - 7,34 (m, 1 H) 7,14 - 7,22 (m, 2 H) 7,10 (d, J=4,78 Гц, 1 H) 6,51 (s, 1 H) 4,68 (d, J=6,04 Гц, 2 H) 2,30 (s, 3 H) РХМС ESI: 418,15 МН+
260		N-бутил-2-[[4-метилпіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 8,43 (s, 1 H) 8,26 (d, J=4,78 Гц, 1 H) 8,17 (s, 1 H) 7,66 (d, J=7,55 Гц, 1 H) 7,58 - 7,63 (m, 1 H) 7,49 - 7,58 (m, 1 H) 7,40 - 7,49 (m, 1 H) 7,08 (d, J=5,04 Гц, 1 H) 6,21 (s, 1 H) 3,45 - 3,59 (m, 2 H) 2,29 (s, 3 H) 1,61 - 1,73 (m, 2 H) 1,40 - 1,53 (m, 2 H) 1,00 (t, J=7,43 Гц, 3 H) РХМС ESI: 348,20 МН+
261		N-(2-метоксіетил)-2-[[піридин-3-іламіно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 8,80 (s, 1 H) 8,37 (d, J=2,52 Гц, 1 H) 8,34 (d, J=4,78 Гц, 1 H) 7,76 (d, J=7,81 Гц, 1 H) 7,51 - 7,65 (m, 3 H) 7,39 - 7,49 (m, 1 H) 7,17 (dd, J=8,06, 4,78 Гц, 1 H) 6,68 (s, 1 H) 3,70 - 3,80 (m, 2 H) 3,65 - 3,70 (m, 2 H) 3,43 (s, 3 H) РХМС ESI: 336,20 МН+

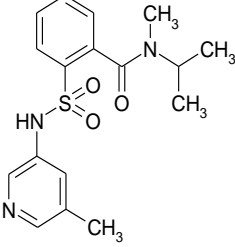
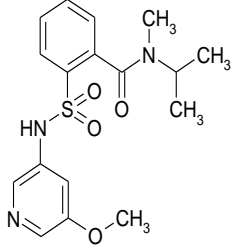
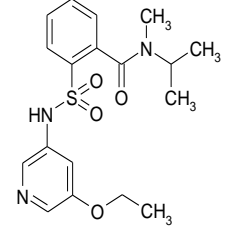
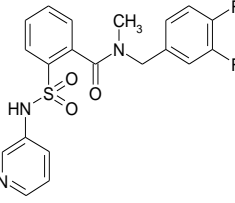
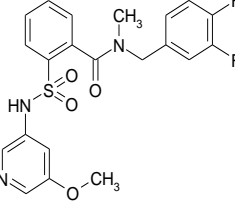
262		N-(3-хлор-4-фторбензил)-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 8,48 (s, 1 H) 8,06 (d, J=2,52 Гц, 1 H) 7,94 (d, J=2,01 Гц, 1 H) 7,74 (d, J=7,81 Гц, 1 H) 7,52 - 7,63 (m, 2 H) 7,41 - 7,53 (m, 2 H) 7,30 - 7,39 (m, 1 H) 7,21 - 7,29 (m, 1 H) 7,17 (t, J=8,69 Гц, 1 H) 6,48 (s, 1 H) 4,67 (d, J=6,04 Гц, 2 H) 3,82 (s, 3 H) РХМС ESI: 450,10 МН+
263		N-[2-(2-метоксифеніл)етил]-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 8,79 (s, 1 H) 8,05 (d, J=2,77 Гц, 1 H) 7,96 (d, J=2,01 Гц, 1 H) 7,72 (dd, J=7,68, 1,13 Гц, 1 H) 7,47 - 7,56 (m, 1 H) 7,32 - 7,44 (m, 2 H) 7,20 - 7,30 (m, 3 H) 6,95 (t, J=7,30 Гц, 1 H) 6,91 (d, J=8,56 Гц, 1 H) 6,43 (s, 1 H) 3,83 (s, 3 H) 3,81 (s, 3 H) 3,71 - 3,80 (m, 2 H) 3,02 (t, J=6,42 Гц, 2 H) РХМС ESI: 442,20 МН+
264		N-(4-фторбензил)-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-5-(піперидин-4-ілокси)бензамід	(400 МГц, MeOD) δ част. на млн. 1,80 - 1,90 (m, 2 H) 2,05 - 2,16 (m, 2 H) 2,93 - 3,05 (m, 2 H) 3,18 - 3,28 (m, 2 H) 3,81 (s, 3 H) 4,61 (s, 2 H) 4,68 - 4,79 (m, 1 H) 7,05 - 7,15 (m, 3 H) 7,17 (d, J=2,53 Гц, 1 H) 7,21 - 7,31 (m, 1 H) 7,46 - 7,56 (m, 2 H) 7,78 (d, J=8,84 Гц, 1 H) 7,87 (d, J=1,26 Гц, 2 H)
265		N-(4-фторбензил)-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-5-(2-морфолін-4-ілетокси)бензамід	(400 МГц, MeOD) δ част. на млн. 2,58 (d, J=4,29 Гц, 4 H) 2,81 (t, J=5,43 Гц, 2 H) 3,67 - 3,77 (m, 4 H) 3,83 (s, 3 H) 4,21 (t, J=5,43 Гц, 2 H) 4,62 (s, 2 H) 7,04 (dd, J=8,84, 2,53 Гц, 1 H) 7,07 - 7,14 (m, 2 H) 7,15 (d, J=2,53 Гц, 1 H) 7,26 - 7,37 (m, 1 H) 7,47 - 7,57 (m, 2 H) 7,72 (d, J=8,84 Гц, 1 H) 7,93 - 8,04 (m, 2 H)

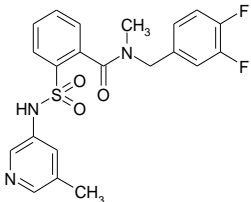
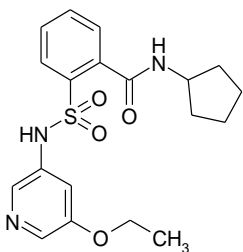
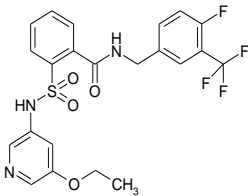
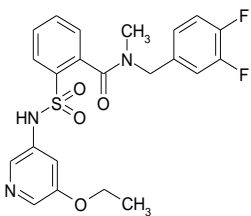
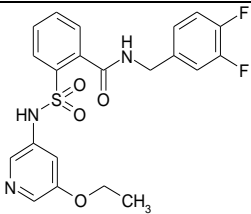
266		5-[3-(диметиламіно)пропокси]-N-(4-фторбензил)-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, MeOD) d част. на млн. 1,93 (dt, J=15,09, 6,09 Гц, 2 H) 2,35 (s, 6 H) 2,57 - 2,67 (m, 2 H) 3,70 (s, 3 H) 4,00 (t, J=6,06 Гц, 2 H) 4,49 (s, 2 H) 6,90 (dd, J=8,84, 2,53 Гц, 1 H) 6,94 - 7,02 (m, 3 H) 7,13 - 7,20 (m, 1 H) 7,33 - 7,40 (m, 2 H) 7,60 (d, J=8,84 Гц, 1 H) 7,82 (dd, J=9,35, 2,27 Гц, 2 H)
267		4-фтор-N-(5-метоксипіридин-3-іл)-2-[[3-метилпіперидин-1-іл)карбоніл]бензолсульфонамід	(400 МГц, ХЛОРОФОРМ-d) d част. на млн. 0,81 (dd, J=19,33, 6,44 Гц, 1,5 H) 1,02 (dd, J=17,94, 6,57 Гц, 1,5 H) 1,12 - 1,28 (m, 1,3 H) 1,72 - 1,84 (m, 1,5 H) 1,85 - 2,01 (m, 1,9 H) 2,49 (dd, J=12,51, 10,99 Гц, 0,3 H) 2,63 - 2,89 (m, 1,2 H) 2,98 - 3,14 (m, 0,6 H) 3,30 - 3,59 (m, 1,1 H) 3,81 (s, 3 H) 4,44 (dd, J=12,76, 3,66 Гц, 0,2 H) 4,55 - 4,72 (m, 0,8 H) 6,94 - 7,12 (m, 1,9 H) 7,18 (d, J=2,02 Гц, 0,9 H) 7,65 (dd, J=8,97, 4,67 Гц, 1,3 H) 7,94 - 8,01 (m, 1,3 H) 8,09 (s, 1,2 H)
268		5-хлор-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-метил-N-пентилбензамід	(400 МГц, ХЛОРОФОРМ-d) d част. на млн. 8,86 (s, 1 H), 8,28 (s, 1 H), 8,20 (s, 1 H), 7,75 (t, J=8,34 Гц, 1 H), 7,66 (s, 1 H), 7,44 (ddd, J=8,34, 4,67, 1,89 Гц, 1 H), 7,36 (dd, J=5,05, 2,02 Гц, 1 H), 3,95 (s, 3 H), 3,57 (t, J=7,71 Гц, 1 H), 3,16 - 3,22 (m, 1 H), 3,15 (s, 1 H), 2,93 - 2,96 (m, 2 H), 1,71 (s, 1 H), 1,42 (d, J=2,53 Гц, 3 H), 1,16 - 1,27 (m, 2 H), 0,96 (t, J=6,82 Гц, 2 H), 0,87 (t, J=7,07 Гц, 1 H)
269		2-[[4-етоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-[2-(2-метилфеніл)етил]бензамід	(400 МГц, ХЛОРОФОРМ-d) d част. на млн. 8,65 (s, 2 H) 8,13 - 8,29 (m, 1 H) 7,70 - 7,92 (m, 1 H) 7,48 - 7,62 (m, 1 H) 7,42 (t, J=7,05 Гц, 1 H) 7,12 - 7,25 (m, 3 H)

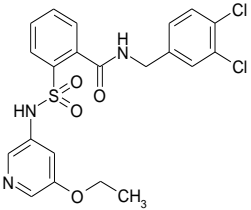
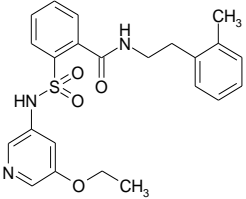
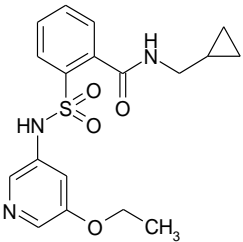
			6,63 (t, J=5,04 Гц, 1 H) 5,97 - 6,21 (m, 1 H) 3,85 (q, J=6,97 Гц, 2 H) 3,74 (q, J=7,05 Гц, 2 H) 3,02 (t, J=7,05 Гц, 2 H) 2,27 - 2,47 (m, 2 H) 1,64 (s, 3 H) 1,06 - 1,23 (m, 3 H)
270		N-(1-циклопропілетил)-2-{{(4-етоксипіридин-3-іл)аміно}сульфоніл}бензамід	(400 МГц, ХЛОРОФОРМ-d) δ част. на млн. 8,63 (s, 2 H) 8,23 (d, J=5,79 Гц, 1 H) 7,78 (d, J=7,81 Гц, 1 H) 7,49 - 7,64 (m, 2 H) 7,36 - 7,48 (m, 1 H) 6,62 (d, J=5,54 Гц, 1 H) 6,09 (d, J=7,55 Гц, 1 H) 3,85 (q, J=7,05 Гц, 2 H) 3,49 - 3,68 (m, 1 H) 1,64 (s, 3 H) 1,38 (d, J=6,55 Гц, 2 H) 1,06 - 1,22 (m, 2 H) 0,85 - 1,04 (m, 1 H) 0,42 - 0,60 (m, 2 H) 0,26 - 0,42 (m, 1 H)
271		2-{{(4-етоксипіридин-3-іл)аміно}сульфоніл}-N-(3-метилбутил)бензамід	(400 МГц, ХЛОРОФОРМ-d) δ част. на млн. 8,71 (s, 1 H) 8,61 (s, 1 H) 8,22 (d, J=5,54 Гц, 1 H) 7,70 (d, J=7,81 Гц, 1 H) 7,46 - 7,60 (m, 2 H) 7,40 (t, J=7,43 Гц, 1 H) 6,62 (d, J=5,54 Гц, 1 H) 6,27 (t, J=5,04 Гц, 1 H) 3,83 (q, J=6,88 Гц, 2 H) 3,37 - 3,60 (m, 2 H) 1,66 - 1,84 (m, 2 H) 1,46 - 1,63 (m, 2 H) 1,06 - 1,20 (m, 3 H) 0,84 - 1,05 (m, 5 H)
272		2-{{(4-етоксипіридин-3-іл)аміно}сульфоніл}-N-метил-N-пентилбензамід	(400 МГц, ХЛОРОФОРМ-d) δ част. на млн. 8,60 (t, J=5,79 Гц, 1 H) 8,24 (d, J=5,54 Гц, 1 H) 7,90 - 8,06 (m, 1 H) 7,65 - 7,79 (m, 1 H) 7,49 - 7,62 (m, 1 H) 7,32 - 7,46 (m, 2 H) 6,63 (d, J=5,54 Гц, 1 H) 3,71 - 4,00 (m, 2 H) 3,46 - 3,68 (m, 1 H) 3,03 - 3,20 (m, 2 H) 2,78 - 2,98 (m, 1 H) 1,60 - 1,84 (m, 3 H) 1,35 - 1,46 (m, 2 H) 1,23 - 1,29 (m, 2 H) 1,09 - 1,20 (m, 3 H) 0,91 - 1,01 (m, 2 H) 0,84 (t, J=7,18 Гц, 1 H)

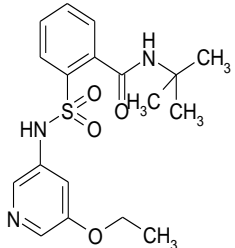
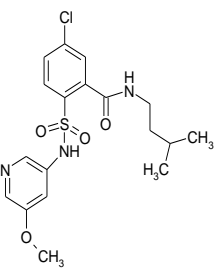
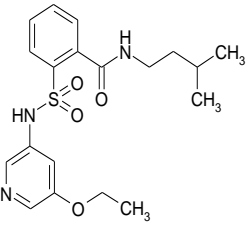
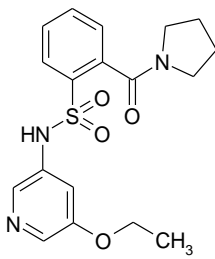
273		2-([(4-етоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл)-N-ізопропіл-N-метилбензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 8,00 - 8,07 (m, 2 H) 7,89 - 7,98 (m, 2 H) 7,52 - 7,66 (m, 2 H) 7,29 - 7,40 (m, 2 H) 7,17 (t, J=2,27 Гц, 1 H) 3,72 - 4,10 (m, 3 H) 3,03 (s, 2 H) 2,75 (s, 1 H) 1,39 (t, J=7,05 Гц, 3 H) 1,29 (d, J=6,80 Гц, 2 H) 1,22 (dd, J=6,55, 3,78 Гц, 3 H)
274		N-бутил-2-([(4-етоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл)-N-метилбензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 8,60 (t, J=5,79 Гц, 1 H) 8,24 (d, J=5,54 Гц, 1 H) 7,90 - 8,06 (m, 1 H) 7,65 - 7,79 (m, 1 H) 7,49 - 7,62 (m, 1 H) 7,32 - 7,46 (m, 2 H) 6,63 (d, J=5,54 Гц, 1 H) 3,71 - 4,00 (m, 2 H) 3,46 - 3,68 (m, 1 H) 3,03 - 3,20 (m, 2 H) 2,78 - 2,98 (m, 1 H) 1,60 - 1,84 (m, 3 H) 1,35 - 1,46 (m, 2 H) 1,23 - 1,29 (m, 2 H) 1,09 - 1,20 (m, 3 H) 0,84 (t, J=7,18 Гц, 1 H)
275		2-([(4-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл)-N-[2-(2-метилфеніл)етил]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 8,52 - 8,68 (m, 2 H) 8,15 - 8,30 (m, 1 H) 7,74 (d, J=7,81 Гц, 1 H) 7,49 - 7,60 (m, 1 H) 7,36 - 7,48 (m, 2 H) 7,21 - 7,27 (m, 1 H) 7,08 - 7,20 (m, 3 H) 6,66 (d, J=5,54 Гц, 1 H) 6,30 (t, J=5,67 Гц, 1 H) 3,74 (q, J=7,05 Гц, 2 H) 3,44 - 3,65 (m, 3 H) 3,02 (t, J=7,18 Гц, 2 H) 2,31 - 2,47 (m, 3 H)
276		N-(1-циклопропілетил)-2-([(4-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл)бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 8,61 (s, 1 H) 8,05 (d, J=2,52 Гц, 1 H) 7,95 (d, J=2,01 Гц, 1 H) 7,72 (d, J=8,06 Гц, 1 H) 7,50 - 7,61 (m, 2 H) 7,36 - 7,45 (m, 1 H) 7,23 (t, J=2,27 Гц, 1 H) 6,12 (s, 1 H) 3,81 (s, 3 H) 3,56 - 3,70 (m, 1 H) 1,39 (d, J=6,55 Гц, 3 H) 0,88 - 1,02 (m, 1 H) 0,44 - 0,70 (m, 3 H) 0,29 - 0,43 (m, 1 H)

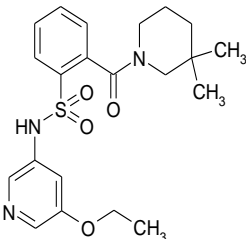
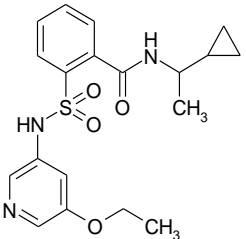
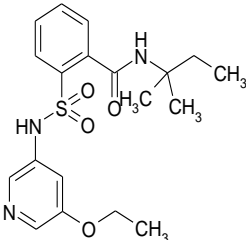
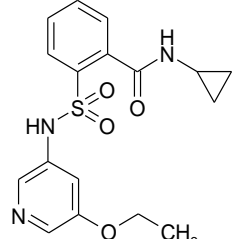
277		2-[[[(4-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-(3-метилбутил)бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 8,51 - 8,67 (m, 2 H) 8,25 (d, J=5,54 Гц, 1 H) 7,74 (d, J=7,81 Гц, 1 H) 7,49 - 7,61 (m, 2 H) 7,27 - 7,47 (m, 1 H) 6,66 (d, J=5,54 Гц, 1 H) 6,16 (s, 1 H) 3,42 - 3,64 (m, 5 H) 1,63 - 1,80 (m, 2 H) 1,49 - 1,63 (m, 2 H) 0,98 (d, J=6,55 Гц, 5 H)
278		2-[[[(4-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-метил-N-пентилбензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 8,60 (d, J=10,07 Гц, 1 H) 8,27 (dd, J=5,54, 1,26 Гц, 1 H) 7,93 (s, 1 H) 7,70 (dd, J=7,30, 6,04 Гц, 1 H) 7,50 - 7,63 (m, 1 H) 7,32 - 7,44 (m, 2 H) 6,66 (dd, J=5,54, 1,26 Гц, 1 H) 4,12 (q, J=7,05 Гц, 1 H) 3,58 (s, 4 H) 3,08 - 3,20 (m, 2 H) 2,89 (s, 1 H) 2,05 (s, 1 H) 1,50 - 1,83 (m, 2 H) 1,38 - 1,45 (m, 1 H) 1,07 - 1,29 (m, 3 H) 0,95 (t, J=6,80 Гц, 1 H) 0,83 (t, J=7,18 Гц, 1 H)
279		N-ізопропіл-2-[[[(4-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-метилбензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 8,61 (s, 1 H) 8,27 (d, J=5,54 Гц, 1 H) 7,97 (d, J=26,19 Гц, 1 H) 7,71 (t, J=7,43 Гц, 1 H) 7,57 (t, J=7,55 Гц, 1 H) 7,31 - 7,44 (m, 2 H) 6,66 (dd, J=5,54, 2,52 Гц, 1 H) 4,87 - 5,13 (m, 1 H) 3,59 (d, J=5,54 Гц, 2 H) 3,02 (s, 2 H) 2,73 (s, 1 H) 1,67 (s, 2 H) 1,05 - 1,35 (m, 5 H)
280		N-бутил-2-[[[(4-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-метилбензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 8,60 (d, J=10,07 Гц, 1 H) 8,27 (dd, J=5,54, 1,26 Гц, 1 H) 7,93 (s, 1 H) 7,70 (dd, J=7,30, 6,04 Гц, 1 H) 7,50 - 7,63 (m, 1 H) 7,32 - 7,44 (m, 2 H) 6,66 (dd, J=5,54, 1,26 Гц, 1 H) 4,12 (q, J=7,05 Гц, 1 H) 3,58 (s, 4 H) 3,08 - 3,20 (m, 2 H) 2,89 (s, 1 H) 2,05 (s, 1 H) 1,38 -

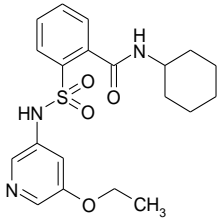
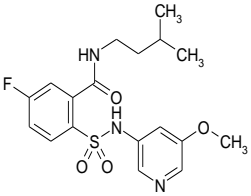
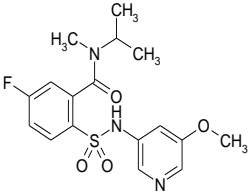
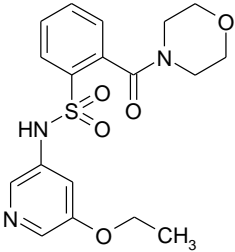
			1,45 (m, 1 H) 1,07 - 1,29 (m, 3 H) 0,95 (t, J=6,80 Гц, 1 H) 0,83 (t, J=7,18 Гц, 1 H)
281		N-ізопропіл-N-метил-2-[[5-метилпіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРОФОРМ-d) δ част. на млн. 8,10 - 8,26 (m, 2 H) 7,96 (d, J=25,43 Гц, 1 H) 7,51 - 7,67 (m, 2 H) 7,41 (s, 1 H) 7,31 - 7,39 (m, 2 H) 4,91 - 5,03 (m, 1 H) 3,03 (s, 2 H) 2,75 (s, 1 H) 2,26 (s, 3 H) 1,71 (s, 1 H) 1,30 (d, J=6,80 Гц, 2 H) 1,18 - 1,25 (m, 3 H)
282		N-ізопропіл-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-метилбензамід	(400 МГц, ХЛОРОФОРМ-d) δ част. на млн. 8,03 - 8,09 (m, 1 H) 7,92 - 8,00 (m, 1 H) 7,63 (dd, J=7,93, 4,66 Гц, 1 H) 7,53 - 7,59 (m, 1 H) 7,31 - 7,40 (m, 2 H) 7,14 - 7,20 (m, 1 H) 3,74 - 3,86 (m, 4 H) 3,03 (s, 2 H) 2,75 (s, 1 H) 1,65 (s, 2 H) 1,30 (d, J=6,80 Гц, 2 H) 1,22 (dd, J=6,55, 3,78 Гц, 3 H)
283		2-[[5-етоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-ізопропіл-N-метилбензамід	(400 МГц, ХЛОРОФОРМ-d) δ част. на млн. 8,00 - 8,07 (m, 2 H) 7,89 - 7,98 (m, 2 H) 7,52 - 7,66 (m, 2 H) 7,29 - 7,40 (m, 2 H) 7,17 (t, J=2,27 Гц, 1 H) 3,72 - 4,10 (m, 3 H) 3,03 (s, 2 H) 2,75 (s, 1 H) 1,39 (t, J=7,05 Гц, 3 H) 1,29 (d, J=6,80 Гц, 2 H) 1,22 (dd, J=6,55, 3,78 Гц, 3 H)
284		N-(3,4-дифторбензил)-N-метил-2-[[піридин-3-іламіно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРОФОРМ-d) δ част. на млн. 8,25 - 8,51 (m, 2 H) 7,94 (s, 1 H) 7,49 - 7,68 (m, 3 H) 7,37 (q, J=7,39 Гц, 2 H) 7,28 - 7,37 (m, 1 H) 7,05 - 7,28 (m, 3 H) 5,05 (none, 1 H) 4,25 - 4,97 (m, 2 H) 3,08 (s, 1 H) 2,65 - 2,94 (m, 2 H)
285		N-(3,4-дифторбензил)-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-метилбензамід	(400 МГц, ХЛОРОФОРМ-d) δ част. на млн. 8,09 (d, J=1,51 Гц, 1 H) 7,88 - 8,00 (m, 2 H) 7,67 (d, J=8,06 Гц, 1 H) 7,49 - 7,63 (m, 1 H) 7,34 - 7,45 (m, 2 H) 7,23 - 7,34 (m, 1 H) 7,08 -

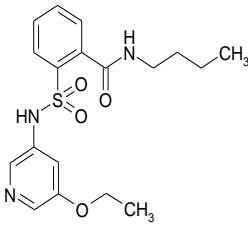
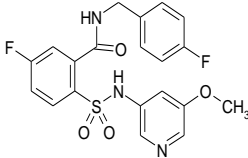
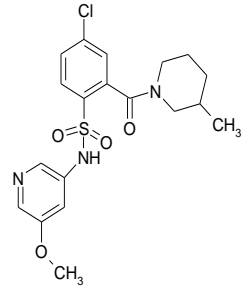
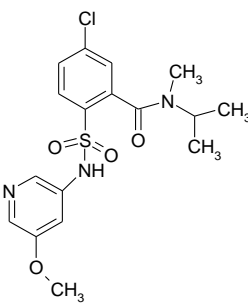
			7,22 (m, 3 H) 4,63 - 4,94 (m, 1 H) 4,40 (d, J=9,32 Гц, 1 H) 3,77 - 3,83 (m, 3 H) 3,08 (s, 1 H) 2,86 (s, 2 H)
286		N-(3,4-дифторбензил)-N-метил-2-[[5-метилпіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРОФОРМ-d) δ част. на млн. 8,21 (s, 1 H) 8,17 (d, J=2,01 Гц, 1 H) 7,87 (s, 1 H) 7,65 (d, J=8,31 Гц, 1 H) 7,57 - 7,62 (m, 1 H) 7,44 (s, 1 H) 7,35 - 7,42 (m, 2 H) 7,28 - 7,34 (m, 1 H) 7,11 - 7,23 (m, 2 H) 4,79 (d, J=55,90 Гц, 1 H) 4,40 (d, J=9,82 Гц, 1 H) 2,86 (s, 3 H) 2,28 (s, 3 H)
287		N-циклопентил-2-[[5-етоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	Зосереджена маса = РХМС 390,6 МН+
288		2-[[5-етоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-[4-фтор-3-(трифторметил)бензил]бензамід	(400 МГц, ХЛОРОФОРМ-d) δ част. на млн. 8,42 (s, 1 H) 8,03 (d, J=2,52 Гц, 1 H) 7,90 (d, J=2,01 Гц, 1 H) 7,63 - 7,78 (m, 3 H) 7,50 - 7,62 (m, 2 H) 7,41 - 7,49 (m, 1 H) 7,18 - 7,26 (m, 2 H) 6,64 (t, J=5,79 Гц, 1 H) 4,73 (d, J=6,04 Гц, 2 H) 4,03 (q, J=7,05 Гц, 2 H) 1,40 (t, J=7,05 Гц, 3 H)
289		N-(3,4-дифторбензил)-2-[[5-етоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-метилбензамід	(400 МГц, ХЛОРОФОРМ-d) δ част. на млн. 8,07 (d, J=2,52 Гц, 1 H) 7,85 - 7,95 (m, 2 H) 7,67 (d, J=7,30 Гц, 1 H) 7,50 - 7,63 (m, 1 H) 7,34 - 7,45 (m, 2 H) 7,31 (d, J=9,57 Гц, 1 H) 7,00 - 7,24 (m, 4 H) 4,79 (d, J=67,73 Гц, 1 H) 3,93 - 4,11 (m, 2 H) 2,86 (s, 3 H) 1,34 - 1,48 (m, 3 H)
290		N-(3,4-дифторбензил)-2-[[5-етоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРОФОРМ-d) δ част. на млн. 8,46 (s, 1 H) 8,03 (d, J=2,52 Гц, 1 H) 7,91 (d, J=1,51 Гц, 1 H) 7,72 (d, J=7,81 Гц, 1 H) 7,50 - 7,62

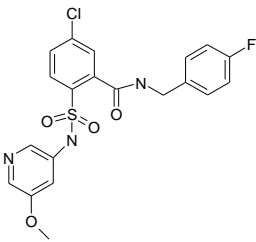
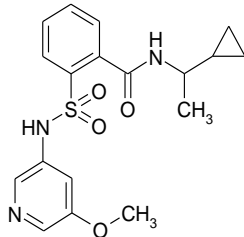
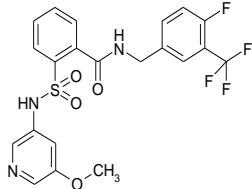
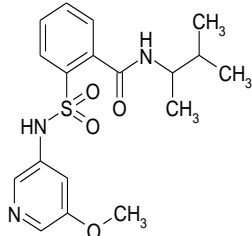
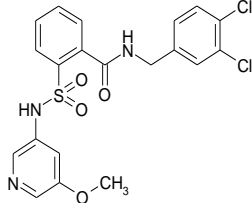
			(m, 2 H) 7,38 - 7,47 (m, 1 H) 7,26 - 7,33 (m, 1 H) 7,11 - 7,23 (m, 3 H) 6,54 (t, J=5,54 Гц, 1 H) 4,67 (d, J=6,04 Гц, 2 H) 4,03 (q, J=6,97 Гц, 2 H) 1,41 (t, J=6,92 Гц, 3 H)
291		N-(3,4-дихлорбензил)-2-[[5-етоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 8,44 (s, 1 H) 8,04 (d, J=2,52 Гц, 1 H) 7,92 (d, J=1,76 Гц, 1 H) 7,73 (d, J=7,81 Гц, 1 H) 7,51 - 7,62 (m, 3 H) 7,40 - 7,50 (m, 2 H) 7,31 (dd, J=8,18, 1,64 Гц, 1 H) 7,21 (t, J=2,14 Гц, 1 H) 6,52 (t, J=5,67 Гц, 1 H) 4,67 (d, J=6,04 Гц, 2 H) 4,03 (q, J=6,97 Гц, 2 H) 1,41 (t, J=6,92 Гц, 3 H)
292		2-[[5-етоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-[2-(2-метилфеніл)етил]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 8,63 (s, 1 H) 8,05 (d, J=2,52 Гц, 1 H) 7,94 (d, J=2,01 Гц, 1 H) 7,65 - 7,76 (m, 1 H) 7,50 - 7,59 (m, 1 H) 7,33 - 7,45 (m, 2 H) 7,13 - 7,26 (m, 5 H) 6,14 (s, 1 H) 4,03 (q, J=7,05 Гц, 2 H) 3,76 (q, J=6,80 Гц, 2 H) 3,03 (t, J=6,92 Гц, 2 H) 2,40 (s, 3 H) 1,41 (t, J=7,05 Гц, 3 H)
293		N-(циклопропілметил)-2-[[5-етоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 8,61 (s, 1 H) 8,04 (d, J=2,52 Гц, 1 H) 7,93 (d, J=2,01 Гц, 1 H) 7,71 (d, J=7,81 Гц, 1 H) 7,52 - 7,61 (m, 2 H) 7,35 - 7,47 (m, 1 H) 7,20 (t, J=2,27 Гц, 1 H) 6,28 (s, 1 H) 4,02 (q, J=7,05 Гц, 2 H) 3,39 (dd, J=7,18, 5,67 Гц, 2 H) 1,28 - 1,51 (m, 3 H) 1,00 - 1,17 (m, 1 H) 0,49 - 0,67 (m, 2 H) 0,33 (q, J=4,78 Гц, 2 H)

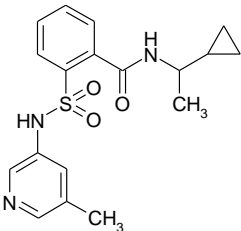
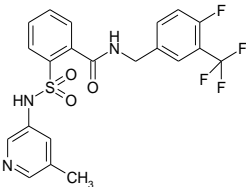
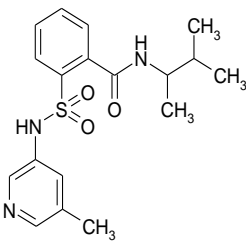
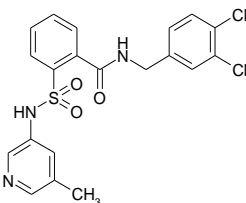
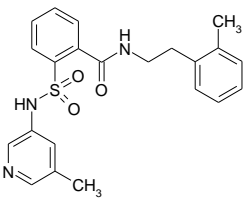
294		N-(трет-бутил)-2-[[5-етоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 8,55 (s, 1 H) 8,04 (d, J=2,52 Гц, 1 H) 7,93 (d, J=1,76 Гц, 1 H) 7,67 (d, J=7,81 Гц, 1 H) 7,47 - 7,58 (m, 2 H) 7,35 - 7,42 (m, 1 H) 7,18 - 7,22 (m, 1 H) 5,92 (s, 1 H) 4,02 (q, J=6,88 Гц, 2 H) 1,53 (s, 9 H) 1,32 - 1,44 (m, 3 H)
295		5-хлор-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-(3-метилбутил)бензамід	(400 МГц, ДМСО-d6) δ част. на млн. 9,98 (s, 1 H), 8,74 (t, J=5,31 Гц, 1 H), 8,03 (d, J=2,53 Гц, 1 H), 7,93 (d, J=1,77 Гц, 1 H), 7,78 (d, J=8,59 Hz, 1 H), 7,66 (dd, J=8,46, 2,15 Гц, 1 H), 7,59 (d, J=2,27 Гц, 1 H), 7,15 (t, J=2,27 Гц, 1 H), 3,78 (s, 3 H), 3,24 - 3,32 (m, 2 H), 1,62 - 1,73 (m, J=13,34, 6,95, 6,71, 6,71, 6,71 Гц, 1 H), 1,43 (q, J=7,16 Гц, 2 H), 1,17 (s, 1 H), 0,91 (d, J=6,57 Гц, 6 H)
296		2-[[5-етоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-(3-метилбутил)бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 8,62 (s, 1 H) 8,04 (d, J=2,52 Гц, 1 H) 7,93 (d, J=2,01 Гц, 1 H) 7,70 (d, J=7,81 Гц, 1 H) 7,48 - 7,61 (m, 2 H) 7,33 - 7,46 (m, 1 H) 7,20 (t, J=2,27 Гц, 1 H) 6,13 (s, 1 H) 3,92 - 4,12 (m, 2 H) 3,41 - 3,64 (m, 2 H) 1,67 - 1,83 (m, 1 H) 1,53 - 1,63 (m, 2 H) 1,23 - 1,43 (m, 3 H) 0,88 - 1,03 (m, 6 H)
297		N-(5-етоксипіридин-3-іл)-2-(піролідин-1-ілкарбоніл)бензолсульфонамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 8,15 (s, 1 H) 8,05 (d, J=2,27 Гц, 1 H) 7,97 (d, J=1,51 Гц, 1 H) 7,65 (d, J=7,81 Гц, 1 H) 7,57 (t, J=7,55 Гц, 1 H) 7,33 - 7,44 (m, 2 H) 7,18 (s, 1 H) 4,00 (q, J=7,05 Гц, 2 H) 3,72 (s, 1 H) 3,48 (q, J=6,97 Гц, 1 H) 3,29 (t, J=6,55 Гц, 2 H) 1,92 - 2,08 (m, 3 H) 1,39 (t, J=6,92 Гц, 2 H) 1,14 - 1,32 (m, 2 H)

			H)
298		2-[(3,3-диметилпіперидин-1-іл)карбоніл]-N-(5-етоксипіридин-3-іл)бензолсульфонамід	Зосереджена маса = PXMC 418,7 MH+
299		N-(1-циклопропілетил)-2-[[5-етоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО- ФОРМ-d) δ част. на млн. 8,60 (s, 1 H) 8,02 (d, J=2,52 Гц, 1 H) 7,92 (d, J=2,01 Гц, 1 H) 7,71 (d, J=7,81 Гц, 1 H) 7,51 - 7,59 (m, 2 H) 7,36 - 7,46 (m, 1 H) 7,08 - 7,24 (m, 1 H) 6,25 (d, J=7,81 Гц, 1 H) 3,92 - 4,08 (m, 2 H) 1,31 - 1,48 (m, 6 H) 0,83 - 1,04 (m, 1 H) 0,45 - 0,69 (m, 4 H) 0,22 - 0,43 (m, 1 H)
300		N-(1,1-диметилпропіл)-2-[[5-етоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО- ФОРМ-d) δ част. на млн. 0,99 (t, J=7,43 Гц, 3 H) 1,16 (t, J=6,92 Гц, 3 H) 1,47 (s, 6 H) 1,89 (q, J=7,55 Гц, 2 H) 3,83 (q, J=6,97 Гц, 2 H) 5,75 (s, 1 H) 6,62 (d, J=5,54 Гц, 1 H) 7,33 - 7,47 (m, 1 H) 7,48 - 7,64 (m, 2 H) 7,76 (d, J=7,81 Гц, 1 H) 8,23 (d, J=5,54 Гц, 1 H) 8,62 (s, 1 H) 8,73 (s, 1 H)
301		N-циклопропіл-2-[[5-етоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО- ФОРМ-d) δ част. на млн. 8,50 (s, 1 H) 7,99 - 8,07 (m, 1 H) 7,89 - 7,96 (m, 1 H) 7,63 (d, J=7,81 Гц, 1 H) 7,49 - 7,56 (m, 1 H) 7,43 - 7,49 (m, 1 H) 7,33 - 7,41 (m, 1 H) 7,18 (t, J=2,39 Гц, 1 H) 6,53 (s, 1 H) 3,94 - 4,10 (m, 2 H) 2,89 - 3,02 (m, 1 H) 1,29 - 1,45 (m, 3 H) 0,87 - 0,98 (m, 2 H) 0,70 - 0,80 (m, 2 H)

302		N-циклогексил-2-[[5-етоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 8,62 (s, 1 H) 7,99 - 8,10 (m, 1 H) 7,93 (d, J=2,01 Гц, 1 H) 7,69 (d, J=7,81 Гц, 1 H) 7,47 - 7,58 (m, 2 H) 7,35 - 7,45 (m, 1 H) 7,20 (t, J=2,27 Гц, 1 H) 6,09 (d, J=8,06 Гц, 1 H) 3,92 - 4,10 (m, 3 H) 2,06 - 2,17 (m, 2 H) 1,62 - 1,87 (m, 4 H) 1,14 - 1,51 (m, 7 H)
303		5-фтор-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-(3-метилбутил)бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 0,99 (d, J=6,57 Гц, 6 H) 1,74 (ddd, J=13,26, 6,82, 6,69 Гц, 1 H) 3,54 (td, J=7,39, 5,94 Гц, 2 H) 3,82 (s, 3 H) 6,05 (s, 1 H) 7,09 (td, J=8,21, 2,53 Гц, 1 H) 7,17 - 7,24 (m, 2 H) 7,73 (dd, J=8,59, 5,31 Гц, 1 H) 7,97 (d, J=2,02 Гц, 1 H) 8,08 (d, J=2,53 Гц, 1 H) 8,45 (s, 1 H)
304		5-фтор-N-ізопропіл-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-метилбензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 1,21 - 1,27 (m, 3 H) 1,29 (d, J=6,82 Гц, 3 H) 2,77 (s, 1 H) 3,02 (s, 2 H) 3,77 - 3,85 (m, 4 H) 6,99 - 7,07 (m, 2 H) 7,18 (t, J=2,27 Гц, 1 H) 7,61 - 7,68 (m, 1 H) 7,93 - 8,00 (m, 1 H) 8,06 - 8,11 (m, 1 H)
305		N-(5-етоксипіридин-3-іл)-2-(морфолін-4-ілкарбоніл)бензолсульфонамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 8,06 (d, J=2,52 Гц, 1 H) 7,92 (d, J=1,76 Гц, 1 H) 7,87 (d, 1 H) 7,65 (d, J=7,81 Гц, 1 H) 7,54 - 7,61 (m, 1 H) 7,30 - 7,41 (m, 2 H) 7,18 (t, J=2,27 Гц, 1 H) 4,16 - 4,25 (m, 1 H) 3,95 - 4,08 (m, 2 H) 3,82 - 3,88 (m, 2 H) 3,71 - 3,79 (m, 1 H) 3,60 - 3,69 (m, 1 H) 3,49 - 3,60 (m, 1 H) 3,24 - 3,44 (m, 2 H) 1,33 - 1,45 (m, 3 H)

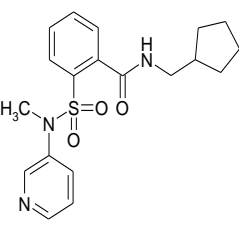
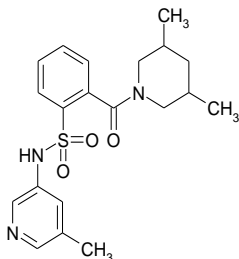
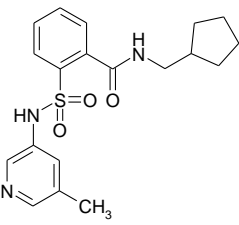
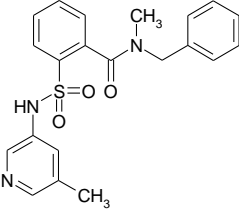
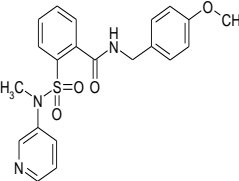
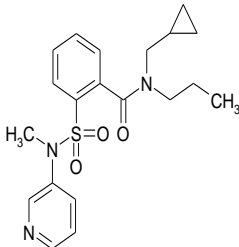
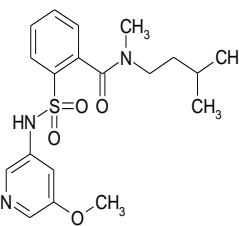
306		N-бутил-2-[[5-етоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 8,62 (s, 1 H) 8,04 (d, J=2,52 Гц, 1 H) 7,94 (d, J=1,76 Гц, 1 H) 7,71 (d, J=7,81 Гц, 1 H) 7,48 – 7,60 (m, 2 H) 7,38 – 7,45 (m, 1 H) 7,21 (t, J=2,27 Гц, 1 H) 6,12 (s, 1 H) 4,02 (q, J=7,05 Гц, 2 H) 3,42 – 3,59 (m, 2 H) 1,58 – 1,72 (m, 2 H) 1,43 – 1,53 (m, 2 H) 1,40 (t, J=6,92 Гц, 3 H) 1,00 (t, J=7,30 Гц, 3 H)
307		5-фтор-N-(4-фторбензил)-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 3,83 (s, 3 H) 4,68 (d, J=5,81 Гц, 2 H) 6,43 (s, 1 H) 7,06 – 7,17 (m, 3 H) 7,19 – 7,26 (m, 2 H) 7,41 (dd, J=8,59, 5,31 Гц, 2 H) 7,75 (dd, J=8,72, 5,18 Гц, 1 H) 7,96 (d, J=2,02 Гц, 1 H) 8,08 (d, J=2,53 Гц, 1 H) 8,37 (s, 1 H)
308		4-хлор-N-(5-метоксипіридин-3-іл)-2-[(3-метилпіперидин-1-іл)карбоніл]бензолсульфонамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 8,57 (s, 1 H), 8,23 (s, 1 H), 8,16 (s, 1 H), 7,65 – 7,72 (m, 1 H), 7,45 – 7,53 (m, 1 H), 7,30 – 7,42 (m, 2 H), 3,90 (s, 3 H), 3,04 – 3,15 (m, 1 H), 2,77 – 2,85 (m, 1 H), 2,71 (dd, J=11,37, 6,32 Гц, 1 H), 2,45 – 2,55 (m, 1 H), 1,92 (d, J=4,29 Гц, 1 H), 1,77 (d, J=4,29 Гц, 1 H), 1,73 (s, 1 H), 1,58 (d, J=13,64 Hz, 1 H), 1,26 (s, 1 H), 1,14 – 1,23 (m, 1 H), 1,04 (dd, J=19,58, 6,44 Гц, 1 H), 0,78 – 0,90 (m, 1 H)
309		5-хлор-N-ізопропіл-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-метилбензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 8,21 (d, J=2,27 Гц, 1 H), 8,13 (s, 1 H), 7,65 (dd, J=8,34, 5,56 Гц, 1 H), 7,43 (t, J=2,15 Гц, 1 H), 7,39 (ddd, J=8,34, 4,04, 2,02 Гц, 1 H), 7,34 (t, J=1,89 Гц, 1 H), 3,89 (s, 3 H), 3,03 (s, 1 H), 2,90 (s, 3 H), 2,78 (s, 1 H), 1,25 – 1,34 (m, 4 H), 1,23 (d, J=6,57 Гц,

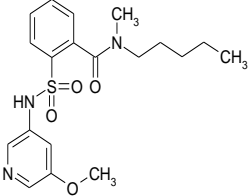
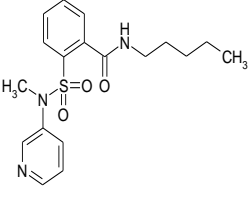
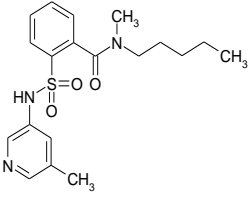
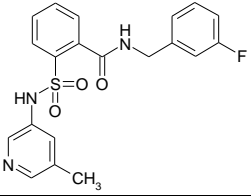
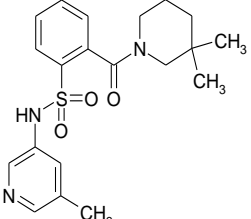
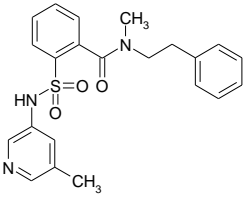
			1 H)
310		5-хлор-N-(4-фторбензил)-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл}бензамід	(400 МГц, ДМСО-d6) d част. на млн. 10,07 (s, 1 H), 9,29 (t, J=5,81 Гц, 1 H), 8,03 (d, J=2,78 Гц, 1 H), 7,95 (d, J=2,02 Гц, 1 H), 7,82 (d, J=8,34 Гц, 1 H), 7,65 - 7,72 (m, 2 H), 7,45 (dd, J=8,34, 5,56 Гц, 2 H), 7,20 (s, 1 H), 7,17 (ddd, J=4,61, 2,21, 2,02 Гц, 2 H), 4,49 (d, J=5,81 Гц, 2 H), 3,77 (s, 3 H)
311		N-(1-циклопропілєтил)-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл}бензамід	(400 МГц, ХЛОРОФОРМ-d) d част. на млн. 8,61 (s, 1 H) 8,05 (d, J=2,52 Гц, 1 H) 7,95 (d, J=2,01 Гц, 1 H) 7,72 (d, J=8,06 Гц, 1 H) 7,50 - 7,61 (m, 2 H) 7,36 - 7,45 (m, 1 H) 7,23 (t, J=2,27 Гц, 1 H) 6,12 (s, 1 H) 3,81 (s, 3 H) 3,56 - 3,70 (m, 1 H) 1,39 (d, J=6,55 Гц, 3 H) 0,88 - 1,02 (m, 1 H) 0,44 - 0,70 (m, 3 H) 0,29 - 0,43 (m, 1 H)
312		N-[4-фтор-3-(трифторметил)бензил]-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл}бензамід	(400 МГц, ХЛОРОФОРМ-d) d част. на млн. 8,37 (s, 1 H) 8,15 (dd, J=9,69, 1,64 Гц, 2 H) 7,64 - 7,74 (m, 3 H) 7,50 - 7,60 (m, 2 H) 7,39 - 7,47 (m, 2 H) 7,20 - 7,26 (m, 1 H) 6,67 (t, J=5,67 Гц, 1 H) 4,73 (d, J=5,79 Гц, 2 H) 2,28 (s, 3 H)
313		N-(1,2-диметилпропіл)-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл}бензамід	(400 МГц, ХЛОРОФОРМ-d) d част. на млн. 8,39 (d, J=2,27 Гц, 1 H) 8,16 (dd, J=8,44, 1,64 Гц, 2 H) 7,70 (d, J=7,55 Гц, 1 H) 7,51 - 7,61 (m, 3 H) 7,39 - 7,49 (m, 3 H) 7,31 (dd, J=8,31, 2,01 Гц, 1 H) 6,59 (t, J=5,79 Гц, 1 H) 4,67 (d, J=6,04 Гц, 2 H) 2,28 (s, 3 H)
314		N-(3,4-дихлорбензил)-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл}бензамід	(400 МГц, ХЛОРОФОРМ-d) d част. на млн. 8,39 (d, J=2,27 Гц, 1 H) 8,16 (dd, J=8,44, 1,64 Гц, 2 H) 7,70 (d, J=7,55 Гц, 1 H) 7,51 - 7,61 (m, 3 H) 7,39 - 7,49 (m, 3 H) 7,31 (dd, J=8,31, 2,01

			Гц, 1 H) 6,59 (t, J=5,79 Гц, 1 H) 4,67 (d, J=6,04 Гц, 2 H) 2,28 (s, 3 H)
315		N-(1-циклопропілетил)-2-[[5-метилпіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) d част. на млн. 8,54 (s, 1 H) 8,18 (s, 2 H) 7,70 (d, J=7,81 Гц, 1 H) 7,50 - 7,60 (m, 2 H) 7,36 - 7,48 (m, 2 H) 6,12 (s, 1 H) 3,57 - 3,70 (m, 1 H) 2,27 (s, 3 H) 1,39 (d, J=6,55 Гц, 3 H) 0,90 - 1,01 (m, 1 H) 0,45 - 0,66 (m, 3 H) 0,30 - 0,43 (m, 1 H)
316		N-[4-фтор-3-(трифторметил)бензил]-2-[[5-метилпіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) d част. на млн. 8,37 (s, 1 H) 8,15 (dd, J=9,69, 1,64 Гц, 2 H) 7,64 - 7,74 (m, 3 H) 7,50 - 7,60 (m, 2 H) 7,39 - 7,47 (m, 2 H) 7,20 - 7,26 (m, 1 H) 6,67 (t, J=5,67 Гц, 1 H) 4,73 (d, J=5,79 Гц, 2 H) 2,28 (s, 3 H)
317		N-(1,2-диметилпропіл)-2-[[5-метилпіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) d част. на млн. 8,39 (d, J=2,27 Гц, 1 H) 8,16 (dd, J=8,44, 1,64 Гц, 2 H) 7,70 (d, J=7,55 Гц, 1 H) 7,51 - 7,61 (m, 3 H) 7,39 - 7,49 (m, 3 H) 7,31 (dd, J=8,31, 2,01 Гц, 1 H) 6,59 (t, J=5,79 Гц, 1 H) 4,67 (d, J=6,04 Гц, 2 H) 2,28 (s, 3 H)
318		N-(3,4-дихлорбензил)-2-[[5-метилпіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) d част. на млн. 8,39 (d, J=2,27 Гц, 1 H) 8,16 (dd, J=8,44, 1,64 Гц, 2 H) 7,70 (d, J=7,55 Гц, 1 H) 7,51 - 7,61 (m, 3 H) 7,39 - 7,49 (m, 3 H) 7,31 (dd, J=8,31, 2,01 Гц, 1 H) 6,59 (t, J=5,79 Гц, 1 H) 4,67 (d, J=6,04 Гц, 2 H) 2,28 (s, 3 H)
319		N-[2-(2-метилфеніл)етил]-2-[[5-метилпіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) d част. на млн. 2,15 - 2,46 (m, 3 H) 2,80 - 2,98 (m, 3 H) 3,39 - 3,51 (m, 2 H) 3,50 - 3,70 (m, 2 H) 5,90 - 6,41 (m, 1 H) 6,98 - 7,31 (m, 7 H) 7,36 - 7,71 (m, 3 H) 8,01 (s, 1 H) 8,49 (dd,

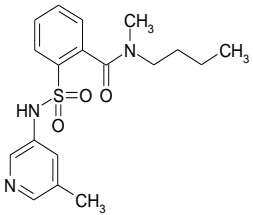
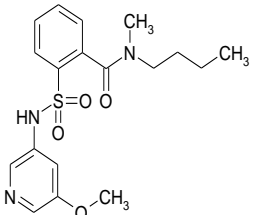
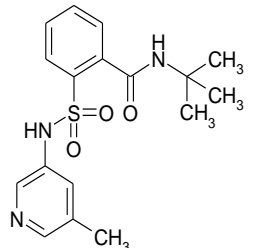
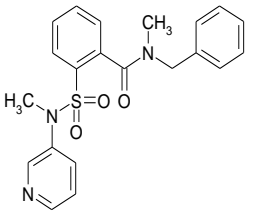
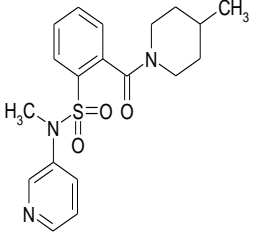
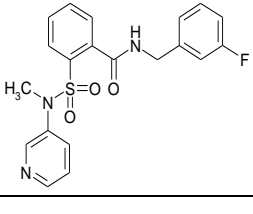
			J=9,69, 3,15 Гц, 1 H)
320		N-(3,4-дифторбензил)-2-[[5-метилпіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРОФОРМ-d) δ част. на млн. 8,39 (d, J=2,27 Гц, 1 H) 8,16 (dd, J=8,44, 1,64 Гц, 2 H) 7,70 (d, J=7,55 Гц, 1 H) 7,51 - 7,61 (m, 3 H) 7,39 - 7,49 (m, 3 H) 7,31 (dd, J=8,31, 2,01 Гц, 1 H) 6,59 (t, J=5,79 Гц, 1 H) 4,67 (d, J=6,04 Гц, 2 H) 2,28 (s, 3 H)
321		N-(5-метилпіридин-3-іл)-2-(піролідин-1-ілкарбоніл)бензолсульфонамід	(400 МГц, ХЛОРОФОРМ-d) δ част. на млн. 8,50 (d, J=2,52 Гц, 2 H) 7,52 - 7,70 (m, 2 H) 7,39 (d, J=7,55 Гц, 1 H) 7,31 - 7,37 (m, 2 H) 7,20 - 7,29 (m, 1 H) 3,63 (s, 2 H) 3,33 - 3,38 (m, 3 H) 3,23 - 3,32 (m, 1 H) 3,03 (s, 1 H) 1,80 - 2,07 (m, 4 H)
322		N-(3-фторбензил)-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)(метил)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, MeOD) δ 8,300 (s, 2H), 7,744-6,972 (m, 9H), 4,441 (s, 2H), 3,913 (s, 3H), 3,324 (s, 3H)
323		N-(3-метилбутил)-2-[[метил(піридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, MeOD) δ 8,470 (m, 2H), 7,743 (m, 2H), 7,514 9m, 5H), 3,364 (m, 5H), 1,735 (m, 1H), 1,514 (m, 2H), 0,963 (d, J=8,8 Гц, 6H)
324		N-(циклопентилметил)-N-метил-2-[[піридин-3-іламіно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, MeOD) δ 8,600 (s, 1H), 8,450 9s, 1H), 8,153 (m, 1H), 7,982 (m, 1H), 7,771 (m, 2H), 7,611 (m, 1H), 7,441 (m, 1H), 3,713 (m, 1H), 3,294 (m, 2H), 2,854 (s, 2H), 2,419 (m, 1H), 1,863-1,000 (m, 8H)
325		N-[2-(2-метилфеніл)етил]-2-[[метил(піридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРОФОРМ-d) δ част. на млн. 2,15 - 2,46 (m, 3 H) 2,80 - 2,98 (m, 3 H) 3,39 - 3,51 (m, 2 H) 3,50 - 3,70 (m, 2 H) 5,90 - 6,41 (m, 1 H) 6,98 - 7,31 (m, 7 H) 7,36 - 7,71 (m, 3 H) 8,01 (s, 1 H) 8,49 (dd, J=9,69, 3,15 Гц, 1 H)

326		N-метил-2-(морфолін-4-ілкарбоніл)-N-піридин-3-ілбензолсульфонамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 2,61 - 3,03 (m, 3 H) 3,02 - 3,19 (m, 1 H) 3,17 - 3,29 (m, 1 H) 3,43 - 3,59 (m, 1 H) 3,65 - 3,90 (m, 5 H) 7,00 - 7,48 (m, 4 H) 7,53 - 7,76 (m, 2 H) 8,39 - 8,66 (m, 2 H)
327		N-(3,4-дифторбензил)-2-[[метил(піридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 2,92 - 3,03 (m, 3 H) 3,21 - 3,39 (m, 2 H) 4,47 (d, J=5,79 Гц, 1 H) 6,32 (s, 1 H) 6,99 - 7,32 (m, 3 H) 7,35 - 7,48 (m, 1 H) 7,50 - 7,68 (m, 4 H) 8,01 (s, 1 H) 8,50 (d, J=2,77 Гц, 1 H)
328		N-метил-N-піридин-3-іл-2-(піролідін-1-ілкарбоніл)бензолсульфонамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 8,50 (d, J=2,52 Гц, 2 H) 7,52 - 7,70 (m, 2 H) 7,39 (d, J=7,55 Гц, 1 H) 7,31 - 7,37 (m, 2 H) 7,20 - 7,29 (m, 1 H) 3,63 (s, 2 H) 3,33 - 3,38 (m, 3 H) 3,23 - 3,32 (m, 1 H) 3,03 (s, 1 H) 1,80 - 2,07 (m, 4 H)
329		N-(циклопропілметил)-2-([(5-метоксипіридин-3-іл)(метил)аміно]сульфоніл)-N-пропілбензамід	(400 МГц, MeOD) δ 8,453 (m, 2H), 7,802 (m, 3H), 7,667 (m, 1H), 7,432 (m, 1H), 3,956 (s, 3H), 3,594 (m, 1H), 3,344 (s, 3H), 3,294-2,868 (m, 3H), 1,685-1,579 (m, 2H), 0,974 (m, 3H), 0,700--0,100 (m, 5H)
330		N-(2,2-диметилпропіл)-2-([(5-метилпіридин-3-іл)аміно]сульфоніл)бензамід	(400 МГц, MeOD) δ 8,440 (s, 1H), 8,312 (s, 1H), 7,939 (m, 2H), 7,705 (m, 1H), 7,610 (m, 2H), 3,237 (s, 2H), 2,416 (s, 3H), 1,029 (s, 9H)
331		N-(циклопропілметил)-2-([(5-метилпіридин-3-іл)аміно]сульфоніл)-N-пропілбензамід	(400 МГц, MeOD) δ 8,453 (s, 1H), 8,340 (s, 1H), 7,977 (m, 2H), 7,740 (m, 1H), 7,694 (m, 1H), 7,449 (m, 1H), 3,631 (m, 2H), 3,024 (m, 2H), 2,439 (s, 3H), 1,818-1,500 (m, 2H), 1,300-0,348 (m, 8H)

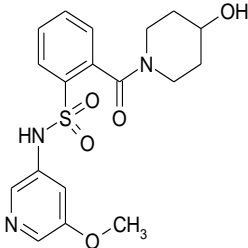
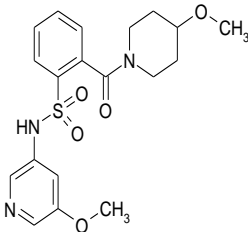
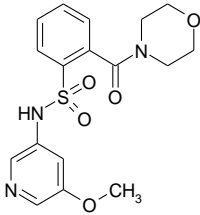
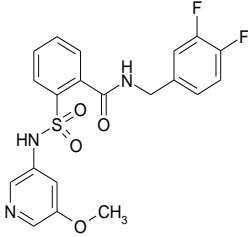
332		N-(циклопентилметил)-2- {[метил(піридин-3- іл)аміно]сульфоніл}бензамід	(400 МГц, MeOD) δ 8,799 (m, 1H), 8,620 (d, 1H), 8,333 (m, 1H), 7,938-7,434 (m, 5H), 3,366 (s, 3H), 3,166 (d, J=9,6 Гц, 2H), 2,130 (m, 1H), 1,831- 1,587 (m, 6H), 1,300 (m, 2H)
333		2-[(3,5-диметилпіперидин-1- іл)карбоніл]-N-(5-метилпіридин-3- іл)бензолсульфонамід	(400 МГц, MeOD): δ 8,458 (m, 1H), 8,320 (s, 1H), 7,936 (m, 2H), 7,746-7,395 (m, 3H), 4,672 (m, 1H), 3,243 (m, 1H), 2,689 (m, 1H), 2,433 (s, 3H), 2,365 (m, 1H), 1,902- 1,649 (m, 3H), 1,012 (m, 3H), 0,952 (m, 1H), 0,752 (m, 3H)
334		N-(циклопентилметил)-2-{[(5- метилпіридин-3- іл)аміно]сульфоніл}бензамід	(400 МГц, MeOD) δ 8,446 (s, 1H), 8,325 (s, 1H), 7,954 (s, 1H), 7,898 (m, 1H), 7,717 (m, 1H), 7,591 (m, 2H), 3,346 (m, 2H), 2,419 (s, 3H), 2,305 (m, 1H), 1,897-1,337 (m, 8H)
335		N-бензил-N-метил-2-{[(5- метилпіридин-3- іл)аміно]сульфоніл}бензамід	(400 МГц, MeOD): δ 8,400 (s, 1H), 8,290 (s, 1H), 7,900 (m, 2H), 7,717-7,210 (m, 8H), 4,878 (s, 2H), 2,981 (s, 1H), 2,716 (s, 2H), 2,373 (s, 3H).
336		N-(4-метоксибензил)-2- {[метил(піридин-3- іл)аміно]сульфоніл}бензамід	(400 МГц, MeOD) δ 8,750 (m, 1H), 8,580 (m, 1H), 8,238 (m, 1H), 7,825-7,470 (m, 5H), 7,265 (d, J=6,0 Гц, 2H), 6,872 (d, J=9,2 Гц, 2H), 4,326 (s, 1H), 3,766 (s, 3H), 3,325 (s, 3H)
337		N-(циклопропілметил)-2- {[метил(піридин-3-іл)аміно]сульфоніл}- N-пропілбензамід	(400 МГц, MeOD) δ 8,755 (s, 1H), 8,651 (m, 1H), 8,320 (m, 1H), 7,936-7,620 (m, 4H), 7,414 (m, 1H), 3,522-2,856 (m, 7H), 1,651 (m, 2H), 1,017 (m, 3H), 0,700-0,100 (m, 5H)
338		2-{[(5-метоксипіридин-3- іл)аміно]сульфоніл}-N-метил-N-(3- метилбутил)бензамід	(400 МГц, MeOD) δ 8,159 (s, 2H), 7,987(m, 1H), 7,746 (m, 1H), 7,696 (m, 2H), 7,460 (m, 1H), 3,926 (s, 3H), 3,611 (m, 1H), 3,128 (m, 2H), 2,831 (2H), 1,722-1,364 (m, 3H),

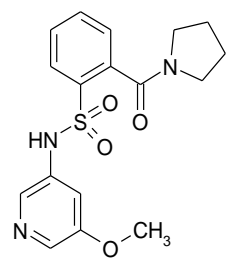
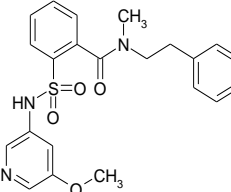
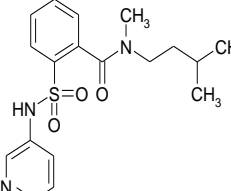
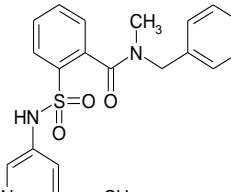
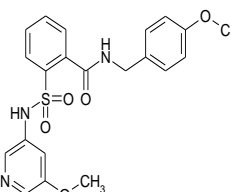
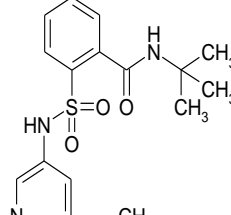
			1,017 (d, J=8,8 Гц, 3H), 0,752 (m, 3H)
339		2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-метил-N-пентилбензамід	(400 МГц, MeOD) δ 8,121 (m, 2H), 7,987 (m, 1H), 7,732 (m, 1H), 7,605 (m, 2H), 7,447 (m, 1H), 3,899 (s, 3H), 3,563 (m, 1H), 3,102 (m, 2H), 2,827 (s, 2H), 1,742-1,399 (m, 4H), 1,194 (m, 2H), 0,990 (m, 2H), 0,840 (m, 1H)
340		2-[[метил(піридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-пентилбензамід	(400 МГц, MeOD) δ 8,800 (s, 1H), 8,643 (d, J=6,8 Гц, 1H), 8,377 (m, 1H), 7,964-7,428 (m, 5H), 3,367 (s, 3H), 3,186 (m, 2H), 1,540 (m, 2H), 1,361 (m, 4H), 0,949 (m, 3H)
341		N-метил-2-[[5-метилпіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-пентилбензамід	(400 МГц, MeOD) δ 8,480 (s, 1H), 8,350 (s, 1H), 8,010 (m, 2H), 7,752 (m, 2H), 7,445 (m, 1H), 3,597 (m, 1H), 3,114 (m, 2H), 2,833 (s, 2H), 2,447 (s, 3H), 1,744-1,402 (m, 4H), 1,202 (m, 2H), 0,992 (m, 2H), 0,853 (m, 1H)
342		N-(3-фторбензил)-2-[[5-метилпіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, MeOD) δ 8,500 (s, 1H), 8,300 (s, 1H), 7,955 (m, 2H), 7,738-7,562 (m, 3H), 7,398-7,192 (m, 3H), 7,032 (m, 1H), 4,623 (s, 2H), 2,420 (s, 3H)
343		2-[(3,3-диметилпіперидин-1-іл)карбоніл]-N-(5-метилпіридин-3-іл)бензолсульфонамід	(400 МГц, MeOD) δ 8,408 (m, 1H), 8,308 (m, 1H), 7,965 (m, 2H), 7,719 (m, 1H), 7,586 (m, 1H), 7,421 (m, 1H), 3,580 (m, 1H), 3,170 (m, 2H), 2,862 (s, 1H), 2,422 (s, 3H), 1,800-1,498 (m, 4H), 1,086 (s, 6H)
344		N-метил-2-[[5-метилпіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-(2-фенілетил)бензамід	(400 МГц, MeOD): δ 8,490 (dd, 2H), 8,350 (d, 2H), 8,050 (m, 4H), 7,708-7,449 (m, 4H), 7,336-7,221 (m, 9H), 6,997 (m, 2H), 6,592 (m, 1H), 4,000-3,600 (m, 2H), 3,334 (m, 2H), 3,265 (s, 3H), 3,164-2,814 (m, 4H), 2,764 (s, 3H), 2,433 (s, 3H), 2,406 (s, 3H).

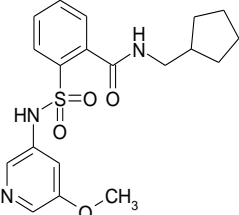
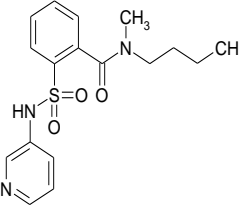
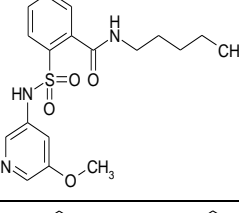
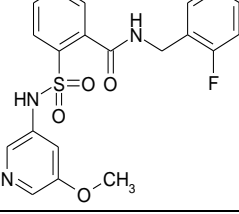
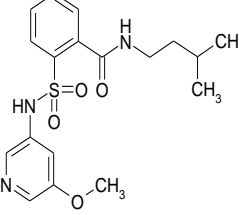
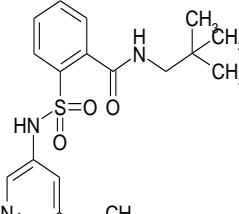
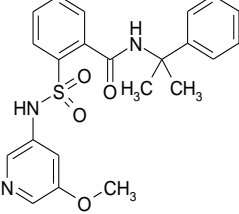
345		2-[(3,3-диметилпіперидин-1-іл)карбоніл]-N-метил-N-піридин-3-ілбензолсульфонамід	(400 МГц, MeOD) δ 8,800 (s, 1H), 8,650 (d, 1H), 8,300 (m, 1H), 7,800-7,610 (m, 4H), 7,402 (d, J=10 Гц, 1H), 3,370 (m, 4H), 3,100 (m, 2H), 2,737 (m, 1H), 1,626 (m, 4H), 1,100-0,700 (m, 6H)
346		N-(3-фторбензил)-2-[(5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-метилбензамід	(400 МГц, MeOD) δ 8,180 (s, 2H), 7,950 (d, 1H), 7,704-7,232 (m, 6H), 7,102 (m, 2H), 4,817 (m, 2H), 3,895 (s, 3H), 3,034 (s, 1H), 2,773 (s, 2H)
347		N-(циклопентилметил)-N-метил-2-[(5-метилпіридин-3-іл)аміно]сульфоніл}бензамід	(400 МГц, MeOD) δ 8,445 (s, 1H), 8,342 (s, 1H), 7,992 (m, 2H), 7,753 (m, 2H), 7,440 (m, 1H), 3,694 (m, 1H), 3,119 (m, 2H), 2,857 (s, 2H), 2,441 (m, 4H), 1,872-1,000 (m, 9H)
348		N-метил-N-(3-метилбутил)-2-[(5-метилпіридин-3-іл)аміно]сульфоніл}бензамід	(400 МГц, MeOD) δ 8,500 (s, 1H), 8,350 (s, 1H), 8,024 (m, 2H), 7,750 (m, 2H), 7,454 (m, 1H), 3,617 (m, 1H), 3,132 (m, 2H), 2,454 (s, 2H), 1,732 (m, 2H), 1,397 (m, 1H), 1,018 (d, J=8,4 Гц, 3H), 0,753 (m, 3H)
349		N-(3-фторбензил)-N-метил-2-[(5-метилпіридин-3-іл)аміно]сульфоніл}бензамід	(400 МГц, MeOD) δ 8,480 (s, 1H), 8,320 (s, 1H), 7,987 (m, 2H), 7,766-7,228 (m, 5H), 7,102 (m, 2H), 4,802 (s, 2H), 3,032 (s, 1H), 2,777 (s, 2H), 2,436 (s, 3H)
350		N-(3-фторбензил)-N-метил-2-[(піридин-3-іламіно)сульфоніл}бензамід	(400 МГц, MeOD) δ 8,650 (br, 1H), 8,485 (br, 1H), 8,181 (m, 1H), 7,996 (m, 1H), 7,749-6,998 (m, 8H), 4,801 (m, 2H), 2,767 (s, 3H)
351		N-бутил-2-[(метил(піридин-3-іл)аміно]сульфоніл}бензамід	(400 МГц, MeOD) δ 8,800 (s, 1H), 8,655 (d, J=7,2 Гц, 1H), 8,415 (m, 1H), 7,980-7,627 (m, 4H), 7,459 (d, J=10 Гц, 1H), 3,307 (s, 3H), 3,192 (m, 2H), 1,564 (m, 4H), 0,937 (m, 3H)

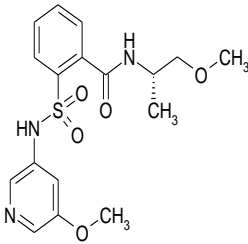
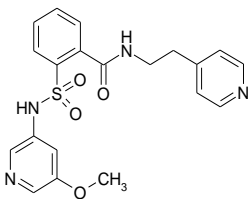
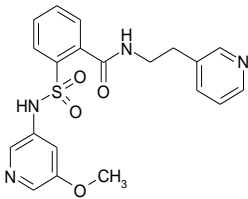
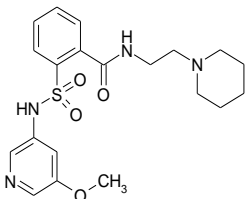
352		N-бутил-N-метил-2-[[5-метилпіридин-3-іл]аміно]сульфонілбензамід	(400 МГц, MeOD) δ 8,450 (s, 1H), 8,352 (s, 1H), 7,995 (m, 2H), 7,749 (m, 2H), 7,415 (m, 1H), 3,578 (m, 1H), 3,120 (m, 2H), 2,830 (s, 2H), 2,446 (s, 3H), 1,731-1,414 (m, 3H), 1,196 (m, 1H), 1,041 (m, 2H), 0,819 (m, 1H)
353		N-бутил-2-[[5-метоксипіридин-3-іл]аміно]сульфоніл-N-метилбензамід	(400 МГц, MeOD) δ 8,200 (s, 2H), 7,980 (m, 1H), 7,745 (m, 1H), 7,625 (m, 2H), 7,451 (m, 1H), 3,925 (s, 3H), 3,578 (m, 1H), 3,116 (s, 2H), 2,836 (s, 2H), 1,734-1,412 (m, 3H), 1,195 (m, 1H), 1,039 (m, 2H), 0,810 (m, 1H)
354		N-(трет-бутил)-2-[[5-метилпіридин-3-іл]аміно]сульфонілбензамід	(400 МГц, MeOD) δ 8,466 (s, 1H), 8,330 (s, 1H), 7,971 (m, 2H), 7,863 (m, 1H), 7,666 (m, 1H), 7,550 (m, 1H), 2,426 (s, 3H), 1,468 (s, 9H)
355		N-бензил-N-метил-2-[[метил(піридин-3-іл)аміно]сульфонілбензамід	(400 МГц, MeOD) δ 8,800 (s, 1H), 8,650 (m, 1H), 8,365 (m, 1H), 8,000-7,163 (m, 10H), 4,667 (m, 1H), 4,259 (m, 1H), 3,468 (s, 3H), 2,808 (s, 1H), 2,638 (s, 2H)
356		N-метил-2-[[4-метилпіперидин-1-іл]карбоніл]-N-піридин-3-ілбензолсульфонамід	(400 МГц, MeOD) δ 8,800 (m, 1H), 8,650 (d, 1H), 8,400 (m, 1H), 7,980-7,625 (m, 4H), 7,422 (m, 1H), 4,327 (m, 1H), 3,392 (s, 3H), 3,296-2,567 (m, 3H), 1,800-0,900 (m, 9H)
357		N-(3-фторбензил)-2-[[метил(піридин-3-іл)аміно]сульфонілбензамід	(400 МГц, MeOD) δ 8,780 (m, 1H), 8,590 (m, 1H), 8,258 (m, 1H), 7,900-6,942 (m, 9H), 4,403 (s, 2H), 3,314 (s, 3H)

358		2-[(3,5-диметилпіперидин-1-іл)карбоніл]-N-метил-N-піридин-3-ілбензолсульфонамід	(400 МГц, MeOD) δ 8,800 (d, 1H), 8,650 (d, 1H), 8,350 (m, 1H), 7,914-7,628 (m, 4H), 7,388 (m, 1H), 4,368 (m, 1H), 3,362 (s, 3H), 3,116 (m, 1H), 2,565 (m, 1H), 2,226 (m, 1H), 1,913-1,670 (m, 3H), 1,000-0,600 (m, 7H)
359		N-(2,2-диметилпропіл)-2-[[метил(піридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, MeOD) δ 8,821 (d, J=3,2 Гц, 1H), 8,631 (d, 1H), 8,370 (m, 1H), 7,919 (m, 2H), 7,753 (m, 2H), 7,478 (m, 1H), 3,373 (s, 3H), 2,996 (s, 2H), 0,919 (s, 9H)
360		2-[[5-метилпіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-пентилбензамід	(400 МГц, MeOD) δ 8,462 (s, 1H), 8,334 (s, 1H), 7,978 (m, 2H), 7,713 (m, 1H), 7,586 (m, 2H), 3,413 (m, 2H), 2,430 (s, 3H), 1,662 (m, 2H), 1,418 (m, 4H), 0,957 (m, 3H)
361		N-(4-метоксibenзил)-2-[[5-метилпіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, MeOD) δ 8,439 (s, 1H), 8,305 (s, 1H), 7,934 (m, 2H), 7,681 (m, 1H), 7,592 (m, 2H), 7,372 (d, J=12 Гц, 2H), 6,920 (d, J=12 Гц, 2H), 4,544 (s, 2H), 3,783 (s, 3H), 2,405 (s, 3H)
362		N-(3-метилбутил)-2-[[5-метилпіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, MeOD) δ 8,437 (s, 1H), 8,312 (s, 1H), 7,950 (m, 2H), 7,715 (m, 1H), 7,585 (m, 2H), 3,452 (m, 2H), 2,417 (s, 3H), 1,767 (m, 12H), 1,581 (m, 2H), 0,992 (d, J=8,8 Гц, 6H)
363		2-[(4-метилпіперидин-1-іл)карбоніл]-N-(5-метилпіридин-3-іл)бензолсульфонамід	(400 МГц, MeOD) δ 8,500-8,300 (m, 2H), 7,948 (m, 2H), 7,747-7,384 (m, 3H), 4,695 (m, 1H), 3,402 (m, 1H), 3,297-2,809 (m, 2H), 2,437 (s, 3H), 1,853-1,100 (m, 5H), 1,000 (m, 3H)
364		2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-пентилбензамід	(400 МГц, MeOD) δ 8,285 (m, 2H), 7,744-7,455 (m, 5H), 3,912 (s, 3H), 3,331 (s, 3H), 3,292 (m, 2H), 1,590 (m, 2H), 1,385 (m, 4H), 0,934 (m, 3H)

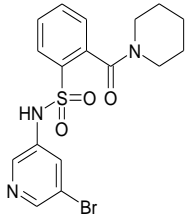
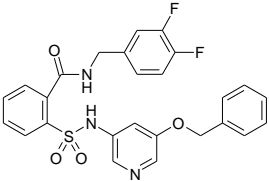
365		2-[(4-гідроксипіперидин-1-іл)карбоніл]- N-(5-метоксипіридин-3- іл)бензолсульфонамід	(400 МГц, ХЛОРО- ФОРМ-d) δ част. на млн. 8,05 - 8,10 (m, 1 H) 8,02 - 8,05 (m, 1 H) 7,94 (dd, J=4,66, 1,64 Гц, 1 H) 7,64 (dd, J=8,06, 3,78 Гц, 1 H) 7,53 - 7,60 (m, 1 H) 7,31 - 7,40 (m, 2 H) 7,14 - 7,22 (m, 1 H) 4,07 - 4,17 (m, 1 H) 3,83 - 3,98 (m, 1 H) 3,80 (d, J=2,27 Гц, 3 H) 3,50 - 3,64 (m, 1 H) 3,10 - 3,31 (m, 2 H) 1,95 - 2,17 (m, 2 H) 1,59 - 1,84 (m, 3 H)
366		2-[(4-метоксипіперидин-1-іл)карбоніл]- N-(5-метоксипіридин-3- іл)бензолсульфонамід	(400 МГц, ХЛОРО- ФОРМ-d) δ част. на млн. 8,07 (d, J=2,52 Гц, 2 H) 7,92 - 7,97 (m, 1 H) 7,64 (d, J=7,81 Гц, 1 H) 7,52 - 7,59 (m, 1 H) 7,32 - 7,40 (m, 2 H) 7,14 - 7,21 (m, 1 H) 3,98 - 4,25 (m, 1 H) 3,79 (s, 3 H) 3,63 - 3,75 (m, 1 H) 3,42 - 3,59 (m, 2 H) 3,33 - 3,39 (m, 3 H) 3,13 - 3,29 (m, 1 H) 1,72 - 2,04 (m, 3 H) 1,52 - 1,68 (m, 1 H)
367		N-(5-метоксипіридин-3-іл)-2- (морфолін-4- іл)карбоніл)бензолсульфонамід	(400 МГц, ХЛОРО- ФОРМ-d) δ част. на млн. 8,08 (d, J=2,52 Гц, 1 H) 7,88 - 7,97 (m, 2 H) 7,65 (d, J=7,81 Гц, 1 H) 7,58 (t, J=7,55 Гц, 1 H) 7,32 - 7,42 (m, 2 H) 7,19 (s, 1 H) 4,15 - 4,25 (m, 1 H) 3,85 (t, J=3,90 Гц, 2 H) 3,80 (s, 3 H) 3,71 - 3,79 (m, 1 H) 3,61 - 3,69 (m, 1 H) 3,50 - 3,59 (m, 1 H) 3,28 - 3,44 (m, 2 H)
368		N-(3,4-дифторбензил)-2-[(5- метоксипіридин-3- іл)аміно]сульфоніл)бензамід	(400 МГц, ХЛОРО- ФОРМ-d) δ част. на млн. 8,48 (s, 1 H) 8,05 (d, J=2,52 Гц, 1 H) 7,93 (d, J=2,01 Гц, 1 H) 7,73 (d, J=8,06 Гц, 1 H) 7,52 - 7,64 (m, 2 H) 7,41 - 7,48 (m, 1 H) 7,27 - 7,32 (m, 2 H) 7,23 (t, J=2,27 Гц, 1 H) 7,15 - 7,20 (m, 2 H) 4,67 (d, J=5,79 Гц, 2 H) 3,82 (s, 3 H)

369		N-(5-метоксипіридин-3-іл)-2-(піролідин-1-ілкарбоніл)бензолсульфонамід	(400 МГц, ХЛОРОФОРМ-d) δ част. на млн. 8,17 (s, 1 H), 8,06 (t, J=2,39 Гц, 1 H), 7,98 (s, 1 H), 7,65 (d, J=7,81 Гц, 1 H), 7,52 - 7,61 (m, 1 H), 7,31 - 7,46 (m, 2 H), 7,19 (d, J=2,27 Гц, 1 H), 3,66 - 3,84 (m, 5 H), 3,29 (t, J=6,29 Гц, 2 H), 1,85 - 2,08 (m, 4 H)
370		2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-метил-N-(2-фенілетил)бензамід	(400 МГц, MeOD) δ 8,100 (m, 2H), 7,900 (m, 1H), 7,649-7,450 (3H), 7,362-7,217 (m, 4H), 6,991 (m, 1H), 3,899 (s, 3H), 3,332 (m, 21H), 3,173 (s, 3H), 3,074 (m, 2H)
371		N-метил-N-(3-метилбутил)-2-[[піридин-3-іламіно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, MeOD) δ 8,630 (s, 1H), 8,485 (m, 1H), 8,121 (m, 1H), 7,997 (m, 1H), 7,805-7,388 (m, 4H), 3,642 (m, 1H), 3,130 (s, 2H), 2,823 (s, 2H), 1,719-1,343 (m, 3H), 1,013 (d, J=8,8 Гц, 3H), 0,749 (m, 3H)
372		N-бензил-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-метилбензамід	(400 МГц, MeOD) δ 8,150 (s, 2H), 7,900 (m, 1H), 7,800-7,245 (m, 9H), 4,731 (m, 1H), 4,370 (m, 1H), 3,899 (s, 3H), 3,020 (s, 1H), 2,749 (s, 2H)
373		N-(4-метоксибензил)-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, MeOD) δ 8,163 (br, 2H), 7,920 (d, J=9,6 Гц, 1H), 7,710 (m, 4H), 7,371 (d, J=8,8 Гц, 2H), 6,911 (d, J=8,8 Гц, 2H), 4,540 (s, 2H), 3,904 (s, 3H), 3,782 (s, 3H)
374		N-(трет-бутил)-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, MeOD) δ 8,123 (s, 2H), 7,812 (d, J=7,2 Гц, 1H), 7,658 (m, 1H), 7,543 (m, 3H), 3,891 (s, 3H), 1,474 (s, 9H)

375		N-(циклопентилметил)-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, MeOD) δ 8,071 (br, 2H), 7,836-7,458 (m, 5H), 3,867 (s, 3H), 3,311 (m, 2H), 2,283 (m, 1H), 1,898 (m, 2H), 1,718 (m, 4), 1,393 (m, 2H)
376		N-бутил-N-метил-2-[[піридин-3-іламіно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, MeOD) δ 8,700 (s, 1H), 8,500 (m, 1H), 8,255 (m, 1H), 8,035 (m, 1H), 7,905 (m, 1H), 7,747 (m, 1H), 7,636 (m, 1H), 7,440 (m, 1H), 3,606 (m, 1H), 3,119 (m, 2H), 2,830 (s, 2H), 1,721-1,400 (m, 3H), 1,189 (m, 1H), 1,025 (m, 2H), 0,800 (m, 1H)
377		2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-пентилбензамід	(400 МГц, MeOD) δ 8,134 (s, 2H), 7,880 (m, 1H), 7,710 (m, 1H), 7,579 (m, 3H), 3,896 (s, 3H), 3,418 (m, 2H), 1,683 (m, 2H), 1,441 (m, 4H), 0,977 (m, 3H)
378		N-(2-фторбензил)-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	
379		2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-(3-метилбутил)бензамід	(400 МГц, MeOD) δ 8,132 (s, 2H), 7,881 (m, 1H), 7,713 (m, 1H), 7,584 (m, 3H), 3,905 (s, 3H), 3,453 (m, 2H), 1,766 (m, 1H), 1,581 (m, 2H), 0,999 (d, J=8,8 Гц, 6H)
380		N-(2,2-диметилпропіл)-2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]бензамід	(400 МГц, MeOD) δ 8,099 (s, 2H), 7,852 (d, J=9,2 Гц, 1H), 7,671 (m, 1H), 7,581 (m, 3H), 3,865 (s, 3H), 3,207 (s, 2H), 0,987 (s, 9H)
381		2-[[5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл]-N-(1-метил-1-фенілетил)бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 8,47 (d, J=2,52 Гц, 1 H) 8,42 (d, J=1,76 Гц, 1 H) 8,33 (s, 1 H) 8,18 (d, J=7,30 Гц, 1 H) 8,00 - 8,06 (m, 1 H) 7,91 - 7,99 (m, 2 H) 7,88 (d,

			J=2,01 Гц, 1 H) 7,70 (d, J=7,81 Гц, 1 H) 7,54 - 7,63 (m, 2 H) 7,38 - 7,47 (m, 2 H) 7,32 (d, J=7,30 Гц, 1 H) 3,78 (s, 3 H) 1,89 (s, 6 H)
382		N-[(1S)-2-метокси-1-метилетил]-2-[(5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл)бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) d част. на млн. 8,14 (d, J=2,77 Гц, 1 H) 8,01 (s, 1 H) 7,88 (d, J=8,31 Гц, 2 H) 7,46 (d, J=8,31 Гц, 2 H) 7,32 (dd, J=8,18, 5,92 Гц, 1 H) 6,99 (d, J=1,76 Гц, 1 H) 6,84 - 6,94 (m, 1 H) 4,61 (s, 3 H) 3,82 (s, 3 H) 2,99 - 3,12 (m, 4 H) 2,79 - 2,95 (m, 2 H)
383		2-[(5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл)-N-(2-піридин-4-ілетил)бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) d част. на млн. 8,66 (s, 1 H) 8,21 (d, J=4,53 Гц, 2 H) 8,06 (d, J=2,27 Гц, 1 H) 7,96 (s, 1 H) 7,73 (d, J=7,55 Гц, 1 H) 7,52 (t, J=7,43 Гц, 1 H) 7,37 - 7,48 (m, 2 H) 7,23 - 7,28 (m, 1 H) 7,17 (t, J=5,54 Гц, 3 H) 3,73 - 3,84 (m, 5 H) 2,99 (t, J=6,29 Гц, 2 H)
384		2-[(5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл)-N-(2-піридин-3-ілетил)бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) d част. на млн. 8,50 (d, J=1,76 Гц, 1 H) 8,41 (d, J=4,78 Гц, 1 H) 8,06 (d, J=2,52 Гц, 1 H) 7,95 (s, 1 H) 7,72 (d, J=7,81 Гц, 1 H) 7,66 (d, J=7,81 Гц, 1 H) 7,53 (t, J=7,43 Гц, 1 H) 7,42 (t, J=7,43 Гц, 2 H) 7,20 - 7,26 (m, 2 H) 6,47 (s, 1 H) 3,73 - 3,84 (m, 5 H) 3,03 (t, J=6,80 Гц, 2 H)
385		2-[(5-метоксипіридин-3-іл)аміно]сульфоніл)-N-(2-піперидин-1-ілетил)бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) d част. на млн. 7,93 - 8,01 (m, 3 H) 7,84 - 7,93 (m, 1 H) 7,68 (dd, J=7,55, 1,26 Гц, 1 H) 7,48 - 7,56 (m, 1 H) 7,40 - 7,46 (m, 1 H) 7,18 (t, J=2,27 Гц, 5 H) 2,96 - 3,00 (m, 2 H) 2,74 (s, 6 H) 1,62 - 1,68 (m, 4 H) 1,47 (s, 2 H)

386		2-(((5-метоксипіридин-3-іл)аміно)сульфоніл)-N-(2-піролідин-1-ілетил)бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 7,96 (d, J=9,32 Гц, 3 H) 7,80 (s, 1 H) 7,66 (d, J=7,55 Гц, 1 H) 7,50 (t, J=7,43 Гц, 1 H) 7,42 (t, J=7,68 Гц, 1 H) 7,13 (s, 1 H) 3,74 (s, 6 H) 3,14 (t, J=5,04 Гц, 2 H) 2,95 (s, 3 H) 1,80 (s, 5 H)
387		2-(((5-метоксипіридин-3-іл)аміно)сульфоніл)-N-[2-(1-метилпіролідин-2-іл)етил]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 8,19 (s, 1 H) 7,72 - 7,92 (m, 3 H) 7,28 - 7,52 (m, 3 H) 7,04 (s, 1 H) 3,73 (s, 4 H) 3,43 (s, 1 H) 2,93 (s, 1 H) 1,47 - 2,48 (m, 12 H)
388		2-(((5-метоксипіридин-3-іл)аміно)сульфоніл)-N-[2-(2-метилфеніл)етил]бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 8,66 (s, 1 H) 8,05 (d, J=2,52 Гц, 1 H) 7,95 (d, J=2,01 Гц, 1 H) 7,67 - 7,73 (m, 1 H) 7,48 - 7,57 (m, 1 H) 7,37 - 7,44 (m, 2 H) 7,10 - 7,25 (m, 5 H) 6,23 (s, 1 H) 3,81 (s, 3 H) 3,75 (q, J=6,97 Гц, 2 H) 3,03 (t, J=7,05 Гц, 2 H) 2,39 (s, 3 H)
389		N-(5-метоксипіридин-3-іл)-2-[(4-метилпіперидин-1-іл)карбоніл]бензолсульфонамід	(400 МГц, MeOD) δ 8,120 (m, 2H), 7,939 (m, 1H), 7,735 (m, 1H), 7,603-7,395 (m, 3H), 4,663 (m, 1H), 3,900 (s, 3H), 3,413 (m, 1H), 3,134-2,845 (m, 2H), 1,810-1,160 (m, 5H), 0,988 (m, 3H)
390		N-(циклопропілметил)-2-(((5-метоксипіридин-3-іл)аміно)сульфоніл)-N-пропілбензамід	(400 МГц, MeOD) δ 8,177 (s, 2H), 7,959 (m, 1H), 7,741 (m, 1H), 7,620 (m, 2H), 7,430 (d, J=10 Гц), 3,929 (s, 3H), 3,649 (m, 2H), 3,260 (m, 2H), 1,824 (m, 2H), 1,041 (m, 3H), 0,753 (m, 1H), 0,625 (m, 3H), 0,185 (m, 1H)
391		2-[(3,3-диметилпіперидин-1-іл)карбоніл]-N-(5-метоксипіридин-3-іл)бензолсульфонамід	(400 МГц, MeOD) δ 8,150 (s, 2H), 7,946 (d, J=10 Гц, 1H), 7,746 (m, 1H), 7,615 (m, 2H), 7,422 (m, 1H), 3,909 (s, 3H), 3,602 (m, 1H), 3,326 (m, 2H), 2,856 (s, 1H), 1,726-1,467 (m, 4H), 1,083 (d, J=16,8 Гц, 3H), 0,909 (d, J=37,2

			Гц, 3H)
392		N-(5-бромпіридин-3-іл)-2-(піперидин-1-ілкарбоніл)бензолсульфонамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 8,43 (d, J=2,02 Гц, 1 H) 8,32 (d, J=2,27 Гц, 1 H) 8,27 (s, 1 H) 7,83 (t, J=2,15 Гц, 1 H) 7,69 (dd, J=7,83, 1,01 Гц, 1 H) 7,60 (td, J=7,52, 1,14 Гц, 1 H) 7,41 (td, J=7,71, 1,26 Гц, 1 H) 7,37 (dd, J=7,45, 1,14 Гц, 1 H) 3,97 - 4,05 (m, 1 H) 3,55 - 3,64 (m, 1 H) 3,24 - 3,40 (m, 2 H) 1,65 - 1,89 (m, 5 H) 1,24 - 1,33 (m, 1 H)
393		2-({[5-(бензилокси)піридин-3-іл]аміно}сульфоніл)-N-(3,4-дифторбензил)бензамід	(400 МГц, ХЛОРО-ФОРМ-d) δ част. на млн. 4,69 (d, J=5,81 Гц, 2 H), 5,10 (s, 2 H), 6,50 (t, J=5,68 Гц, 1 H), 7,16 - 7,23 (m, 2 H), 7,29 - 7,33 (m, 1 H), 7,36 - 7,46 (m, 7 H), 7,53 - 7,56 (m, 1 H), 7,59 (td, J=7,39, 1,14 Гц, 1 H), 7,65 (dd, J=7,83, 0,76 Гц, 1 H), 7,96 (d, J=2,02 Гц, 1 H), 8,14 (d, J=2,53 Гц, 1 H), 8,51 (s, 1 H)

Приклад G: Дані активності сполук із прикладів в умовах *in vitro*

1. Визначення K_{iapp} сполуки

Визначення K_{iapp} сполук за винаходом по відношенню до рекомбінантного ферменту CYP3A4 здійснювали в такий спосіб. Аналіз проводили в 100 мМ натрій-фосфатному буфері pH 7,0, 5 мМ ТСЕР та який містить 2 % диметилформамід (кінцева концентрація) при додаванні субстрату та інгібітора. Типову реакцію для визначення значень K_{iapp} здійснювали при кімнатній температурі в твердому чорному поліпропіленовому планшеті Costar на 96 лунок із У-подібним дном. В кожній лунці, рекомбінантний фермент CYP3A4 (5,5 нМ або 8 нМ, кінцева концентрація залежно від комерційного джерела ферменту) попередньо інкубували в присутності інгібітора протягом принаймні 30 хвилин в буфері для дослідження. Після завершення попередньої інкубації (~30 хв), реакцію ініціювали шляхом додавання NADPH (200 мкМ, кінцева концентрація), та 7-бензилокси-4-(трифторметил)-кумарину (BFC) (5 мкМ, кінцева концентрація). Окислення кумаринового субстрату аналізувати за допомогою 96-лунокового планшет-ридера POLARstar (BMG LABTECH, Offenburg, Німеччина).

Початкові швидкості реакції вимірювали протягом перших 5 хвилин реакції, коли вивільнення флуоресцентного продукту є лінійним, за відсутності та в присутності різних концентрації інгібітора.

Для повних та часткових інгібіторів значення K_{iapp} визначали за допомогою рівняння інгібітора сильного зв'язку, запропонованого Morrison, JF (Morrison JF. BioChim Biophys Acta. 1969, 185: 269-86) і Szedlaseck SE та ін. (Szedlaseck, S.E., Ostafe, V., Serban, M., та Vlad, M.O. BioChem. J. 1988, 254:311-312), відповідно.

Флуоресцентний субстрат BFC отримували від Sigma (St Louis, MO). В цьому дослідженні використовували два комерційні джерела рекомбінантних ферментів: рекомбінантний фермент CYP3A4 - b5 (Baculosomes[®]), отриманий від Invitrogen (Carlsbad, CA) та рекомбінантний фермент CYP3A4 + b5 (Supersomes[®]), отриманий від BD Biosciences (Woburn, MA).

2. Визначення IC_{50} по відношенню до CYP3A4 шляхом вимірювання інгібування метаболізму тестостерону

Це дослідження здійснювали за стандартною схемою із використанням планшета на 96 лунок. Значення IC_{50} розраховували на основі відсотка інгібування, визначеного для кожної тестованої сполуки при 6 концентраціях (наприклад: 750, 250, 83,3, 27,8, 9,3 та 3,1 нМ). Інкубаційна субстратна суміш містить 25 мкМ тестостерону, 0,1 мг/мл мікросом печінки людини, 1 мМ NADPH, та калій-фосфатний буфер (100 мМ, pH 7,4). Кількісне визначення співвідношення площі піку метаболіту відносно внутрішнього стандарту проводили за допомогою PX-MC/MC аналізу. Метаболізм утво-

рення 6- β -ОН-тестостерону із тестостерону визначали після інкубування впродовж восьми хвилин в порівнянні із стандартною кривою, отриманою для метаболіту.

Зразки аналізували в MRM режимі, використовуючи мас-спектрометр Sciex API 3000 (Applied Biosystems, Foster City, CA) із бінарною помпою Paradigm MS4 (Michrom BioResources Inc., Auburn, CA) та автоматичним пробовідбірником LEAP CTC PAL (LEAP Technologies, Carrboro, NC). Для розділення використовували колонку Phenomenex Synergi, 4 μ , Polar-RP, 10 X 2,0 мм (Phenomenex, Torrance, CA) із рухомою фазою, яка складається з: 0,1% мурашиної кислоти у воді (A) та: 0,1% мурашиної кислоти в метанолі (B). Застосовували

наступний градієнт:

Час (хвилини)	%B	Швидкість потоку (мл/хв)
0,0	0	0,8
0,1	95	0,8
0,55	95	0,8
0,6	0	0,8

Ін'єкований об'єм зразка становив 10 мкл і потік після колонки розділяли із 0,4 мл/хв, направляючи в мас-спектрометр. Аналіз здійснювали при наступних налаштуваннях мас-спектрометра API 3000:

Налаштування приладу

Метод іонізації	електророзпилювальна іонізація, позитивна
Інтерфейс	турбо-іонорозпилювальний
Температура десольватації (TEM)	450 °C
Напруга розпилення іонів (IS)	5000
Екрануючий газ (CUR)	15
Розпилювач (NEB)	10
Газ зіткнення (CAD)	6
Потенціал на вході (EP)	10

Сполука		перехід (m/z)	DP	FP	CE	CXP	Час утримання (хв)
6-ОН-тестостерон	Аналіт	305,4>269,2	56	170	21	18	0,44

3. Визначення IC₅₀ по відношенню до CYP3A4 шляхом вимірювання інгібування метаболізму мідазоламу

Це дослідження здійснювали за стандартною схемою із використанням планшету на 96 лунок. Значення IC₅₀ розраховували на основі відсотка інгібування, визначеного для кожної тестованої сполуки при 6 концентраціях (наприклад: 750, 250, 83,3, 27,8, 9,3 та 3,1 нМ). Інкубаційна субстратна суміш містить 2 мкМ мідазоламу, 0,1 мг/мл мікросом печінки людини, 1 мМ NADPH, та калій-фосфатний буфер (100 мМ, pH 7,4). Кількісне визначення співвідношення площі піку метаболіту відносно внутрішнього стандарту проводили за допомогою PX-MC/MC аналізу. Метаболізм утворення 1-гідроксимідазоламу із мідазоламу визначали після інкубування впродовж восьми хвилин в порівнянні зі стандартною кривою, отриманою для метаболіту.

Зразки аналізували в MRM режимі, використовуючи мас-спектрометр Sciex API 3000 (Applied Biosystems, Foster City, CA) із бінарною помпою Paradigm MS4 (Michrom BioResources Inc., Auburn, CA) та автоматичним пробовідбірником LEAP CTC PAL (LEAP Technologies, Carrboro, NC). Для розділення використовували колонку Phenomenex Synergi, 4 μ , Polar-RP, 10 X 2,0 мм (Phenomenex, Torrance, CA) із рухомою фазою, яка складається з: 0,1% мурашиної кислоти у воді (A) та: 0,1% мурашиної кислоти в метанолі (B). Застосовували

наступний градієнт:

наступний градієнт:

Час (хвилини)	%B	Швидкість потоку (мл/хв)
0,0	0	0,8
0,1	95	0,8
0,55	95	0,8
0,6	0	0,8

Ін'єкований об'єм зразка становив 10 мкл і потік після колонки розділяли із 0,4 мл/хв, направляючи в мас-спектрометр. Аналіз здійснювали при наступних налаштуваннях мас-спектрометра API 3000:

Метод іонізації	електророзпилювальна іонізація, позитивна
Інтерфейс	турбо-іонорозпилювальний
Температура десольватації (TEM)	450 °C
Напруга розпилення іонів (IS)	5000
Екрануючий газ (CUR)	15
Розпилювач (NEB)	10
Газ зіткнення (CAD)	6
Потенціал на вході (EP)	10

Сполука		Перехід (m/z)	DP	FP	CE	CXP	Час
---------	--	---------------	----	----	----	-----	-----

							утримання
1-гідроксимідазолам	Аналіт	342,2>203,1	46	130	29	18	0,44

№ пр.	Kiapp (BFC, Baculo.) (мкМ)	Kiapp (BFC, Super.) (мкМ)	IC50 (Те- сто.) (мкМ)	IC50 (Мідазо- лам) (мкМ)	№ пр.	Kiapp (BFC, Baculo.) (мкМ)	Kiapp (BFC, Super.) (мкМ)	IC50 (Те- сто.) (мкМ)	IC50 (Міда- золам) (мкМ)
1	0,538	0,662	< 0,003	0,39	46	0,325		0,023	0,023
2	0,901	0,57	>0,750	>0,750	47	0,332		0,03	0,026
3	0,858	>1,00	>0,750	>0,750	48	>1,00		0,335	0,327
4	0,167	0,0436	0,096	0,052	49	>1,00		>0,500	0,328
5	0,0559	0,0058	0,066	0,041	50	>1,00		0,371	0,254
6			0		51	0,68		0,057	0,034
7	>1,00	>1,00	>0,750	>0,750	52	0,56		0,073	0,027
8	0,46	0,0446	0,067	0,063	53	0,613		0,049	0,024
9	0,173	0,004	0,009	0,011	54	0,239		0,026	0,015
10	>1,00	0,558	>0,750	0,279	55	0,385	0,0142	0,0545	0,0406
11	>1,00	0,563	>0,750	>0,750	56	0,34	0,0224	0,062	0,0489
12	0,27	0,0105	0,029	0,031	57	0,353	0,035	0,0933	0,0696
13	0,251		0,024		58	0,15	0,0091	0,0253	0,0265
14	0,503		0,06		59	0,838	0,0574	0,117	0,109
15			0		60	0,151		0,024	0,017
16	0,433		0,117	0,065	61	0,131	0,0077	0,0302	0,0268
17	0,133		0,062	0,026	62	>1,00	0,0833	0,211	0,184
18	0,57		0,349	0,146	63	0,449	0,0424	0,0841	0,0842
19	0,329		0,169	0,069	64	0,19	0,0128	0,0318	0,0305
20	>1,00		0,445	0,379	65	0,92		0,214	0,254
21	>1,00		>0,750	>0,750	66	>1,00	0,21	0,302	0,146
22	>1,00		>0,750	>0,750	67	0,844	0,062	0,247	0,11
23	>1,00	0,28	0,325	0,103	68	0,116		0,036	0,017
24	>1,00		>0,750	0,567	69	>1,00		0,179	0,105
25	0,239		0,077	0,045	70	0,8		0,421	
26	>1,00		0,691	0,494	71	0,245	0,0051	< 0,003	0,029
27	>1,00		>0,750	0,658	72	0,164	0,0129	< 0,003	0,027
28	>1,00		>0,750	>0,750	73	0,124	0,0107	< 0,003	0,038
29	0,324		0,172	0,076	74	0,174	0,0048	< 0,003	0,023
30	0,69		0,125	0,056	75	0,043	0,0024	0,013	0,016
31	0,0701		0,038	0,023	76	0,0767	0,0094	0,029	0,024
32	No Data		>0,750	0,413	77	0,131	0,0056	0,192	0,023
33	>1,00		0,473	0,111	78	0,158	0,0138	> 0,750	0,022
34	>1,00		>0,750	>0,750	79	0,144	0,0262	0,177	0,03
35	>1,00		>0,750	>0,750	80	0,206	0,0041	0,071	0,025
36	>1,00		>0,750	>0,750	81	>1,00	0,276	< 0,003	0,501
37	>1,00		>0,750	>0,750	82	0,743	0,0209	0,025	0,028
38	0,644		0,084	0,068	83	0,127	0,0128	0,028	0,035
39	>1,00		>0,500	>0,500	84	>1,00	0,464	0,028	>0,750
40	>1,00		0,34	0,179	85	0,105	0,0121	0,041	0,016
41	0,486	0,0303	0,0834	0,0628	86	>1,00	0,209	0,027	0,118
42	0,378	0,0225	0,0515	0,0359	87	0,09	0,0063	0,01	0,03
43	0,269	0,0165	0,0217	0,0134	88	0,362	0,0476	0,028	0,185
44	0,617		0,167	0,072	89	>1,00	0,218	0,06	0,054
45	0,382		0,042	0,02	90	0,313	0,0252	0,036	0,01

№ пр.	Kiapp (BFC, Baculo.) (мкМ)	Kiapp (BFC, Super.) (мкМ)	IC50 (Тес- то.) (мкМ)	IC50 (Мідазо- лам) (мкМ)	№ пр.	Kiapp (BFC, Baculo.) (мкМ)	Kiapp (BFC, Super.) (мкМ)	IC50 (Тес- то.) (мкМ)	IC50 (Мідазо- лам) (мкМ)
91	0,058	0,0172		0,018	136	0,0598	0,0048		0,01
92	0,0457	0,0175		0,022	137	0,115	0,0073		0,018
93	0,166	0,0147		0,01	138	0,0196	0,0027		0,016
94	0,182	0,0257		0,016	139	0,388	0,0511		0,048
95	0,078	0,0254		0,008	140	0,16	0,0173		0,056

237

95250

238

96	0,124	0,0223		0,009	141	0,172	0,0211		0,036
97	0,421	0,157		0,107	142	0,111	0,0118		0,026
98	0,506	0,196		0,051	143	0,169	0,029		0,058
99	0,406	0,223		0,09	144	0,327	0,039		0,072
100	0,0883	0,0357		0,014	145	0,0439	0,0059		0,018
101	0,244	0,0548		0,026	146	0,0546	0,0086		0,011
102	0,375	0,056		0,055	147	0,209	0,0192		0,016
103	0,129	0,026		0,021	148	0,0181	0,0049	0,015	<0,00300
104	0,141	0,0235		0,035	149	0,208	0,0123	0,021	0,012
105	0,0831	0,0286		0,021	150	0,0522	0,0092	0,015	0,038
106	0,345	0,0875		0,051	151	0,12	0,0122	0,016	0,028
107	0,214	0,044		0,057	152	0,0461	0,0064	0,023	0,013
108	0,506	0,115		0,098	153	0,262	0,0271	0,019	0,005
109	0,213	0,0372		0,035	154	0,0115	0,0032	0,023	0,006
110	0,156	0,0504		0,026	155	0,0028	0,0016	0,015	0,008
111	0,0273	0,0068		0,01	156	0,084	0,005	0,011	0,013
112	0,438	0,119		0,046	157	0,0494	0,0013	0,008	0,008
113	0,698	0,0975		0,09	158	0,0197	0,0009	0,01	0,006
114	0,466	0,105		0,134	159	0,751	0,144	0,129	0,064
115	0,124	0,026		0,023	160	>1,00	0,163	0,202	0,129
116	0,317	0,0509		0,033	161	>1,00	0,418	0,371	0,308
117	0,159	0,0148		0,02	162	0,469	0,0999	0,17	0,093
118	0,103	0,0135		0,018	163	0,263	0,058	0,082	0,049
119	0,249	0,0712		0,045	164	0,281	0,0343	0,047	0,024
120	0,487	0,14		0,086	165	0,163	0,0296	0,054	0,043
121	0,49	0,0712		0,031	166	0,196	0,0351	0,026	0,023
122	0,0495	0,01		0,031	167	0,159	0,0174	0,016	0,009
123	0,0725	0,0152		0,01	168	0,066	0,0117	0,018	0,009
124	0,136	0,018		0,014	169	>1,00	0,187	0,395	0,139
125	0,185	0,0312		0,02	170	>1,00	0,427	0,285	0,557
126	0,194	0,0848		0,053	171	0,299	0,0491	0,038	0,035
127	0,694	0,282		0,107	172	0,173	0,0217	0,034	0,044
128	0,448	0,0549		0,067	173	0,104	0,0099	0,018	0,016
129	0,0876	0,0096		0,012	174	>1,00	0,392	0,356	0,451
130	0,134	0,0628		0,022	175	0,024	0,0013	0,009	0,009
131	>1,00	0,329		>0,750	176	>1,00	0,625	>0,750	0,406
132	0,0406	0,0084		0,008	177	0,0706	0,0035	0,012	0,011
133	0,0678	0,0116		0,018	178	>1,00	0,106	0,097	0,07
134	0,0697	0,0087		0,014	179	0,314	0,0637	0,058	0,045
135	0,0248	0,0049		0,018	180	0,0928	0,007	0,011	0,004

№ пр.	Kiapp (BFC, Baculo.) (мкМ)	Kiapp (BFC, Super.) (мкМ)	IC50 (Тес- то.) (мкМ)	IC50 (Мідазо- лам) (мкМ)	№ пр.	Kiapp (BFC, Baculo.) (мкМ)	Kiapp (BFC, Super.) (мкМ)	IC50 (Тес- то.) (мкМ)	IC50 (Мідазо- лам) (мкМ)
181	0,0718	0,0108	0,013	0,007	226	0,0164	0,0026	0,008	<0,00300
182	0,0374	0,0035	0,013	0,006	227	0,0868	0,0086	0,011	0,005
183	0,0226	0,002	0,011	0,005	228	>1,00	0,12	0,161	0,053
184	0,0545	0,0059	0,011	0,013	229	0,203	0,0243	0,037	0,016
185	0,0171	0,0028	0,01	0,011	230	0,373	0,0784	0,087	0,042
186	0,171	0,0097	0,007	0,006	231	0,0591	0,0089	0,031	0,02
187	0,257	0,0359	0,028	0,022	232	0,0994	0,0115	0,032	0,028
188	0,0364	0,0034	0,012	0,008	233	>1,00	0,182	0,195	0,067
189	0,175	0,0274	0,048	0,024	234	0,0379	0,0081	>0,750	>0,750
190	0,0169	0,0034	0,016	0,007	235	0,107	0,0087	0,019	0,01
191	0,0597	0,005	0,015	0,01	236	>1,00	0,142	0,223	0,132
192	0,0237	0,0027	0,007	0,007	237	0,979	0,142	0,215	0,125
193	0,0412	0,0217	0,027	0,013	238	0,23	0,018	0,031	0,017
194	0,376	0,0685	0,099	0,073	239	0,849	0,191	0,301	0,163
195	0,0708	0,0356	0,032	0,015	240	0,022	0,0032	0,009	0,004
196	0,379	0,0745	0,058	0,051	241	0,751	0,097	0,15	0,077
197	0,0695	0,0201	0,018	0,004	242	0,246	0,2	0,289	0,254

198	0,0417	0,0166	0,01	<0,00300	243	0,0284	0,0858	0,264	0,069
199	0,0127	0,0105	0,011	0,006	244	0,0456	0,0268	0,052	<0,0160
200	0,0361	0,0099	0,021	0,012	245	0,164	0,0187	0,063	0,029
201	0,0293	0,008	0,016	0,009	246	0,0503	0,0185	0,072	0,036
202	0,0842	0,0334	0,007	<0,00300	247	0,0484	0,0889	0,108	0,054
203	0,101	0,0258	0,012	0,005	248	0,439	0,193	0,235	0,108
204	0,0525	0,0126	0,012	<0,00300	249	0,0601	0,0377	0,045	0,0285
205	0,206	0,0419	0,027	<0,0155	250	0,0043	0,00314	0,007	0,01
206	0,0036	0,0029	0,006	<0,00300	251	0,0086	0,00531	0,012	0,01
207	0,105	0,0191	0,024	0,005	252	0,0171	0,00541	0,009	0,009
208	0,0573	0,0161	0,019	0,0095	253	0,203	0,0352	0,08	0,05
209	0,0182	0,0061	0,005	0,004	254	0,284	0,122	0,12	0,04
210	0,286	0,0396	0,049	0,01	255	0,0227	0,00406	0,009	0,007
211	0,0336	0,0079	0,019	0,004	256	0,0302	0,00525	0,016	0,0145
212	0,0203	0,006	0,008	<0,00300	257	0,101	0,0141	0,014	0,015
213	0,0272	0,0098	0,013	<0,00300	258	0,0509	0,00649	0,011	0,006
214	0,355	0,0473	0,066	0,014	259	0,135	0,0125	0,015	0,015
215	0,216	0,0433	0,058	0,025	260	0,485	0,0715	0,065	0,047
216	0,0069	0,0035	0,007	0,005	261	>1,00	0,453	0,627	0,256
217	0,965	0,216	0,23	0,179	262	0,0102	0,00163	0,0075	0,005
218	0,748	0,146	0,189	0,096	263	0,0547	0,0054	0,011	0,009
219	0,108	0,0403	0,032	0,027	264	0,0347	0,00988	0,058	0,026
220	0,0137	0,0091	0,011	0,006	265	0,0296	0,0126	0,041	0,023
221	0,016	0,0089	0,012	0,011	266	0,145	0,0268	0,109	0,054
222	0,207	0,0127	0,034	0,015	267	0,27	0,0432	0,216	0,12
223	>1,00	0,326	0,745	0,26	268	0,11	0,0194	0,063	0,044
224	0,399	0,0568	0,056	0,029	269	0,0181	0,00331	0,013	0,009
225	0,0157	0,0017	0,009	0,007	270	0,352	0,0398	0,052	0,022

№ пр.	Kiapp (BFC, Baculo.) (мкМ)	Kiapp (BFC, Super.) (мкМ)	IC50 (Тес- то.) (мкМ)	IC50 (Мідазо- лам) (мкМ)	№ пр.	Kiapp (BFC, Baculo.) (мкМ)	Kiapp (BFC, Super.) (мкМ)	IC50 (Тес- то.) (мкМ)	IC50 (Мідазо- лам) (мкМ)
271	0,118	0,0172	0,021	0,018	316	0,0084	0,0012	0,027	0,017
272	0,0673	0,00568	0,019	0,012	317	0,144	0,0516	0,019	0,015
273	0,513	0,0377	0,112	0,084	318	0,0099	0,0019	0,165	0,145
274	0,0701	0,00885	0,046	0,025	319	0,0043	0,0072	0,011	0,01
275	0,0429	0,00376	0,007	0,009	320	0,0101	0,0284	0,008	0,006
276	0,563	0,0629	0,134	0,071	321	0,195	0,46	0,129	0,094
277	0,459	0,0479	0,065	0,053	322	0,0544	0,0198	0,015	0,011
278	0,131	0,0119	0,066	0,031	323	0,21	0,221	0,059	0,028
279	>1,00	0,0952	0,337	0,123	324	0,0851	0,0217	0,02	0,011
280	0,4	0,0525	0,095	0,039	325	0,035	0,0086	0,084	0,119
281	0,468	0,0426	0,065	0,031	326	0,884	0,273	0,164	0,132
282	0,33	0,0577	0,062	0,049	327	0,0864	0,0198		
283	0,314	0,0272	0,046	0,031	328	>1,00	0,484	>0,750	>0,750
284	0,0998	0,0142	0,049	0,015	329	0,034	0,0177	0,058	0,032
285	0,026	0,00724	0,028	0,019	330	0,204	0,0227	0,055	0,06
286	0,0272	0,00406	0,0095	0,00767	331	0,0752	0,0109	0,014	0,012
287	0,216	0,0477	0,099	0,043	332	0,334	0,0612	0,013	0,013
288	0,0022	0,00308	0,018	0,012	333	0,0692	0,0229	0,013	0,024
289	0,0059	0,00497	0,027	0,015	334	0,0826	0,0091	0,017	0,012
290	0,0146	0,00394	0,016	0,004	335	0,0977	0,0168	0,028	0,02
291	0,0045	0,00298	0,027	0,021	336	0,319	0,0682	0,019	0,037
292	0,0016	0,000618	0,016	<0,00300	337	0,285	0,0613	0,064	0,088
293	0,268	0,0581	0,145	0,081	338	0,024	0,0068	0,03	0,023
294	0,135	0,0321	0,057	0,024	339	0,0354	0,0061	0,026	0,014
295	0,184	0,042	0,231	0,042	340	0,338	0,0922	0,044	0,041
296	0,0358	0,00932	0,09	0,012	341	0,0366	0,0131	0,026	0,022
297	0,444	0,11	>0,750	0,17	342	0,063	0,0131	0,015	0,011
298	0,0585	0,0156	0,135	0,031	343	0,206	0,0603	0,08	0,037
299	0,0565	0,0206	0,053	0,026	344	0,0544	0,0212	0,009	0,007

242

300	0,0576	0,0195	0,039	0,016	345	0,409	0,135	0,048	0,075
301	0,409	0,152	>0,750	0,14	346	0,052	0,0132	0,011	0,019
302	0,0789	0,0245	0,11	0,023	347	0,0347	0,0054	0,026	0,013
303	0,118	0,0316	0,156	0,03	348	0,0308	0,0047	0,012	0,007
304	0,536	0,171	>0,750	0,119	349	0,0564	0,0074	0,025	0,011
305	0,753	0,27	>0,750	0,347	350	0,139	0,0214	0,039	0,02
306	0,0778	0,0249	0,048	0,032	351	0,456	0,138	0,11	0,113
307	0,143	0,0168	0,036	0,044	352	0,0704	0,0226	0,031	0,016
308	0,513	0,042	0,095	0,062	353	0,0281	0,0115	0,031	0,018
309	0,808	0,145	0,427	0,149	354	0,305	0,0253	0,061	0,031
310	0,14	0,0283	0,064	0,053	355	0,181	0,0449	0,064	0,063
311	0,209	0,0762	0,073	0,034	356	0,483	0,148	0,114	0,083
312	0,0086	0,0035	0,012	0,013	357	0,123	0,0304	0,043	0,032
313	0,197	0,0487	0,055	0,019	358	0,592	0,137	0,1	0,068
314	0,0187	0,0045	0,017	0,017	359	0,593	0,14	0,26	0,101
315	0,25	0,0422	0,043	0,022	360	0,0808	0,0218	0,043	0,025

[illegible]

243

95250

244

Комп'ютерна верстка М. Ломалова

Підписне

Тираж 23 прим.

Міністерство освіти і науки України

Державний департамент інтелектуальної власності, вул. Урицького, 45, м. Київ, МСП, 03680, Україна

ДП "Український інститут промислової власності", вул. Глазунова, 1, м. Київ – 42, 01601