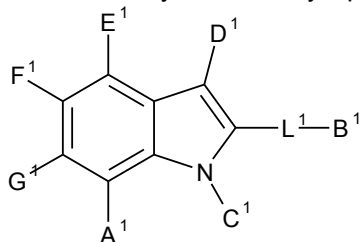




УКРАЇНА

(19) **UA** (11) **102516** (13) **C2**
(51) МПК (2013.01)**C07D 209/34** (2006.01)**C07D 401/12** (2006.01)**C07D 413/06** (2006.01)**C07D 417/04** (2006.01)**A61P 35/00****A61K 31/404** (2006.01)ДЕРЖАВНА СЛУЖБА
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІ
УКРАЇНИ**(12) ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА ВІНАХІД****(21)** Номер заявки: **а 2009 11544****(22)** Дата подання заявки: **16.04.2008****(24)** Дата, з якої є чинними
права на винахід: **25.07.2013****(31)** Номер попередньої
заявки відповідно до
Паризької конвенції: **60/912,038,**
60/949,650**(32)** Дата подання
попередньої заявки
відповідно до
Паризької конвенції: **16.04.2007,**
13.07.2007**(33)** Код держави-учасниці
Паризької конвенції,
до якої подано
попередню заявку: **US,**
US**(41)** Публікація відомостей
про заявку: **10.02.2010, Бюл.№ 3****(46)** Публікація відомостей
про видачу патенту: **25.07.2013, Бюл.№ 14****(86)** Номер та дата
подання міжнародної
заявки, поданої
відповідно до
Договору РСТ **PCT/US2008/060472,**
16.04.2008**(72)** Винахідник(и):**Елмор Стівен В. (US),**
Сауерс Ендрю Дж. (US),
Бранко Мілан (US),
Сун Сяохун (US),
Ван Сілу (US),
Хасвольд Ліза А. (US),
Ван Ле (US),
Канзер Аарон Р. (US),
Парк Чеол-мін (US),
Уендт Майкл Д. (US),
Тао Чжи-фу (US),
Мадар Девід (US)**(73)** Власник(и):**ЕББОТТ ЛЕБОРЕТРИЗ,**
100 Abbott Park Road, Abbott Park, IL 60064,
United States of America (US)**(74)** Представник:**Мошинська Ніна Миколаївна, реєстр.**
№115**(56)** Перелік документів, взятих до уваги
експертизою:**WO 02/30895 A1; 18.04.2002**
EP 0 673 937 A1; 27.09.1995
WO 2007/008627 A2; 18.01.2007
WO 2006/041961 A1; 20.04.2006**(54) ІНГІБІТОРИ MCL-1 НА ОСНОВІ 7-ЗАМІЩЕНИХ ІНДОЛІВ****(57)** Реферат:

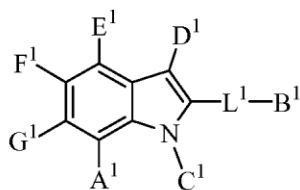
Винахід стосується сполук формули (I)



, (I)

UA 102516 C2

які інгібують активність антиапоптичного білка Mcl-1, композицій, що містять такі сполуки, та способів лікування захворювань, опосередкованих надекспресованим або нерегульованим білком Mcl-1.



(I),

ГАЛУЗЬ ВІНАХОДУ

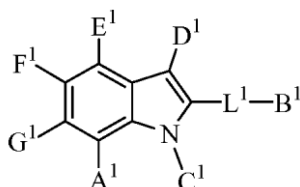
Даний винахід стосується сполук, які інгібують активність анти-апоптичного білка Mcl-1, композицій, що містять такі сполуки, і способів лікування захворювань, що включають білок Mcl-1, що надмірно експресується або не регулюється.

5 ПЕРЕДУМОВИ ВІНАХОДУ

Білок Mcl-1 пов'язаний з різними захворюваннями. Тому у галузі терапії існує необхідність у сполуках, які зв'язуються з білком Mcl-1 та інгібують його активність.

КОРОТКИЙ ОПИС ВІНАХОДУ

Один варіант втілення даного винаходу, отже, стосується сполук, які інгібують активність білка Mcl-1, сполук Формули I,



(I),

і їх терапевтично прийнятних солей, де

15 A¹ являє собою A², OA², SA², S(O)A², SO₂A², NH₂, NHA², N(A²)₂, C(O)A², C(O)NH₂, C(O)NHA², C(O)N(A²)₂, NHC(O)A², NA²C(O)A², NHSO₂A², NA²SO₂A², NHC(O)OA², NA²C(O)OA², SO₂NH₂, SO₂NHA², SO₂N(A²)₂, NHC(O)NH₂, NHC(O)A² NHC(O)N(A²)₂, NA²C(O)N(A²)₂ F, Cl, Br або I;

A² являє собою R¹, R², R³ або R⁴;

20 R¹ являє собою феніл, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або R¹A; R¹A являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

R² являє собою гетероарил, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або R²A; R²A являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

25 R³ являє собою циклоалкіл, циклоалкеніл, гетероциклоалкіл або гетероциклоалкеніл, кожний з яких є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або R³A; R³A являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

30 R⁴ являє собою алкіл, алкеніл або алкініл, кожний з яких є незаміщеним або заміщений одним, двома, трьома, чотирма або п'ятьма замісниками, незалежно вибраними з R⁵, OR⁵, SR⁵, S(O)R⁵, SO₂R⁵, NH₂, NHR⁵, N(R⁵)₂, C(O)R⁵, C(O)NH₂, C(O)NHR⁵, C(O)N(R⁵)₂, NHC(O)R⁵, NR⁵C(O)R⁵, NHSO₂R⁵, NR⁵SO₂R⁵, NHC(O)OR⁵, NR⁵C(O)OR⁵, SO₂NH₂, SO₂NHR⁵, SO₂N(R⁵)₂, NHC(O)NH₂, NHC(O)R⁵, NHC(O)N(R⁵)₂, NR⁵C(O)N(R⁵)₂, OH, (O), C(O)OH, CN, CF₃, OCF₃, CF₂CF₃, F, Cl, Br або I;

R⁵ являє собою R⁶, R⁷ або R⁸;

35 R⁶ являє собою феніл, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або R⁶A; R⁶A являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

R⁷ являє собою гетероарил, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або R⁷A; R⁷A являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

40 R⁸ являє собою циклоалкіл, циклоалкеніл, гетероциклоалкіл або гетероциклоалкеніл, кожний з яких є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або R⁸A; R⁸A являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

L¹ являє собою або зв'язок являє собою алкілен, алкенілен, алкінілен або L²; і B¹ являє собою C(O)OH або його біоізостеру, або являє собою C(O)OR¹, C(O)OR², C(O)OR³ або C(O)OR⁴; L² являє собою C₂-C₆-алкілен, C₄-C₆-алкенілен або C₄-C₆-алкінілен, кожний з яких містить одну CH₂ групу, заміщену групою O, S, S(O), SO₂, NH або N(W¹);

W¹ являє собою алкіл, алкеніл або алкініл;

50 C¹ і D¹ незалежно являють собою H, R⁹, R¹⁰, R¹¹, R¹², C(O)OR¹², F, Cl, Br, I, або один з C¹ і D¹ являє собою H, а інший являє собою R⁹, R¹⁰, R¹¹, R¹², C(O)OR¹², F, Cl, Br або I;

R⁹ являє собою феніл, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або R⁹A; R⁹A являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

R^{10} являє собою гетероарил, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або R^{10A} ; R^{10A} являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

5 R^{11} являє собою циклоалкіл, циклоалкеніл, гетероциклоалкіл або гетероциклоалкеніл, кожний з яких є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або R^{11A} ; R^{11A} являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

10 R^{12} являє собою алкіл, алкеніл або алкініл, кожний з яких є незаміщеним або заміщений одним, двома, трьома, чотирма або п'ятьма замісниками, незалежно вибраними з R^{13} , OR^{13} , SR^{13} , $S(O)R^{13}$, SO_2R^{13} , NH_2 , NHR^{13} , $N(R^{13})_2$, $C(O)R^{13}$, $C(O)NH_2$, $C(O)NHR^{13}$, $C(O)N(R^{13})_2$, $NHC(O)R^{13}$, $NR^{13}C(O)R^{13}$, $NHC(O)R^{13}$, $NR^{13}C(O)R^{13}$, $NHSO_2R^{13}$, $NR^{13}SO_2R^{13}$, $NHC(O)OR^{13}$, $NR^{13}C(O)OR^{13}$, SO_2NH_2 , SO_2NHR^{13} , $SO_2N(R^{13})_2$, $NHC(O)NH_2$, $NHC(O)R^{13}$, $NHC(O)N(R^{13})_2$, $NR^{13}C(O)N(R^{13})_2$, OH , (O) , $C(O)OH$, CN , CF_3 , OCF_3 , CF_2CF_3 , F , Cl , Br або I ;

R^{13} являє собою R^{14} , R^{15} , R^{16} або R^{16A} ;

15 R^{14} являє собою феніл, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або R^{14A} ; R^{14A} являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен; кожний з яких є неконденсованим або є конденсованим з R^{14B} ; R^{14B} являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

20 R^{15} являє собою гетероарил, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або R^{15A} ; R^{15A} являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

R^{16} являє собою циклоалкіл, циклоалкеніл, гетероциклоалкіл або гетероциклоалкеніл, кожний з яких є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або R^{16A} ; R^{16A} являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

25 R^{16A} являє собою алкіл, алкеніл або алкініл; i один або два, або кожний, з E^1 і F^1 , і G^1 незалежно являють собою H , CF_3 , F , Cl , Br або I , а інші незалежно являють собою R^{17} , R^{18} , R^{19} , R^{20} або OR^{20} ;

R^{17} являє собою феніл, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або R^{17A} ; R^{17A} являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

30 R^{18} являє собою гетероарил, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або R^{18A} ; R^{18A} являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

35 R^{19} являє собою циклоалкіл, циклоалкеніл, гетероциклоалкіл або гетероциклоалкеніл, кожний з яких є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або R^{19A} ; R^{19A} являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

40 R^{20} являє собою алкіл, алкеніл або алкініл, кожний з яких є незаміщеним або заміщений одним, двома, трьома, чотирма або п'ятьма замісниками, незалежно вибраними з R^{20} , OR^{20} , SR^{20} , $S(O)R^{20}$, SO_2R^{20} , NH_2 , NHR^{20} , $N(R^{20})_2$, $C(O)R^{20}$, $C(O)NH_2$, $C(O)NHR^{20}$, $C(O)N(R^{20})_2$, $NHC(O)R^{20}$, $NHC(O)R^{20}$, $NR^{20}C(O)R^{20}$, $NR^{20}C(O)R^{20}$, $NHSO_2R^{20}$, $NR^{20}SO_2R^{20}$, $NHC(O)OR^{20}$, $NR^{20}C(O)OR^{20}$, SO_2NH_2 , SO_2NHR^{20} , $SO_2N(R^{20})_2$, $NHC(O)NH_2$, $NHC(O)R^{20}$, $NHC(O)N(R^{20})_2$, $NR^{20}C(O)N(R^{20})_2$, OH , (O) , $C(O)OH$, CN , CF_3 , OCF_3 , CF_2CF_3 , F , Cl , Br або I ;

R^{20} являє собою R^{21} , R^{22} або R^{23} ;

45 R^{21} являє собою феніл, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або R^{21A} ; R^{21A} являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

R^{22} являє собою гетероарил, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або R^{22A} ; R^{22A} являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

50 R^{23} являє собою циклоалкіл, циклоалкеніл, гетероциклоалкіл або гетероциклоалкеніл, кожний з яких є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або R^{23A} ; R^{23A} являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

де кожна з зазначених вище циклічних груп, незалежно, є незаміщеною або заміщена одним або двома, або трьома, або чотирма, або п'ятьма замісниками, незалежно вибраними зі спірогетероалкілу, R^{30} , OR^{30} , OCH_2R^{30} , SR^{30} , $S(O)R^{30}$, SO_2R^{30} , $C(O)R^{30}$, $CO(O)R^{30}$, $^{\circ}C(O)R^{30}$, $^{\circ}C(O)OR^{30}$, NO , NO_2 , NH_2 , NHR^{30} , $N(R^{30})_2$, CH_2R^{30} , $C(O)NH_2$, $C(O)NHR^{30}$, $C(O)N(R^{30})_2$, $NHC(O)R^{30}$, $NR^{30}C(O)R^{30}$, $C(O)NHOH$, $C(O)NHOH$, $C(O)NHSO_2R^{30}$, $C(O)NR^{30}SO_2R^{30}$, SO_2NH_2 , SO_2NHR^{30} , $SO_2N(R^{30})_2$, CF_3 , CF_2CF_3 , $C(O)H$, $C(O)OH$, $C(N)NH_2$, $C(N)NHR^{30}$, $C(N)N(R^{30})_2$, $=NO$ -(алкілен)- $C(O)CF_3$, $CNOH$, $CNOCH_3$, OH , (O) , CN , N_3 , CF_3 , CF_2CF_3 , OCF_3 , OCF_2CF_3 , F , Cl , Br або I ;

60 R^{30} являє собою R^{31} , R^{32} , R^{33} або R^{34} ;

R^{31} являє собою феніл, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або R^{31A} ; R^{31A} являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

5 R^{32} являє собою гетероарил, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або R^{32A} ; R^{32A} являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

R^{33} являє собою циклоалкіл, циклоалкеніл, гетероциклоалкіл або гетероциклоалкеніл, кожний з яких є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або R^{33A} ; R^{33A} являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

10 R^{34} являє собою алкіл, алкеніл або алкініл, кожний з яких є незаміщеним або заміщений одним, двома, трьома, чотирма або п'ятьма замісниками, незалежно вибраними з R^{35} , OR^{35} , SR^{35} , $S(O)R^{35}$, SO_2R^{35} , NH_2 , NHR^{35} , $N(R^{35})_2$, $C(O)R^{35}$, $C(O)NH_2$, $C(O)NHR^{35}$, $C(O)N(R^{35})_2$, $NHC(O)R^{35}$, $NR^{35}C(O)R^{35}$, $NHSO_2R^{35}$, $NR^{35}SO_2R^{35}$, $NHC(O)OR^{35}$, $NR^{35}C(O)OR^{35}$, SO_2NH_2 , SO_2NHR^{35} , $SO_2N(R^{35})_2$, $NHC(O)NH_2$, $NHC(O)R^{35}$, $NHC(O)N(R^{35})_2$, $NR^{35}C(O)N(R^{35})_2$, OH , (O) , $C(O)OH$, CN , CF_3 , OCF_3 , CF_2CF_3 , F , Cl , Br або I ;

15 R^{35} являє собою R^{36} , R^{37} , R^{38} або R^{39} ;

R^{36} являє собою феніл, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або R^{36A} ; R^{36A} являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

20 R^{37} являє собою гетероарил, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або R^{37A} ; R^{37A} являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

R^{38} являє собою циклоалкіл, циклоалкеніл, гетероциклоалкіл або гетероциклоалкеніл, кожний з яких є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або R^{38A} ; R^{38A} являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

25 R^{39} являє собою алкіл, алкеніл або алкініл, кожний з яких є незаміщеним або заміщений групою NH_2 , $N(R^{40})_2$, OR^{40} або R^{40} ;

R^{40} являє собою алкіл, алкеніл, алкініл, феніл, гетероарил, циклоалкіл, циклоалкеніл або гетероциклоалкіл;

30 де групи, представлені як R^{31} , R^{32} , R^{33} , R^{36} , R^{37} , R^{38} і R^{40} , є, незалежно, незаміщеними або заміщені одним або двома, або трьома замісниками, незалежно вибраними з R^{50} , OR^{50} , $C(O)R^{50}$, $C(O)OR^{50}$, SO_2R^{50} , $NHC(O)R^{50}$, F , Cl , Br , I , $C(O)OH$, CN , NO_2 , NH_2 , CF_3 , (O) або OH ;

R^{50} являє собою R^{51} , R^{52} , R^{53} або R^{54} ;

35 R^{51} являє собою феніл, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або R^{51A} ; R^{51A} являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

R^{52} являє собою гетероарил, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або R^{52A} ; R^{52A} являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

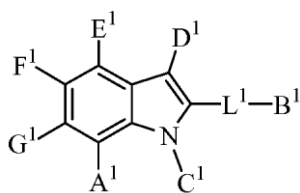
40 R^{53} являє собою циклоалкіл, циклоалкеніл, гетероциклоалкіл або гетероциклоалкеніл, кожний з яких є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або R^{53A} ; R^{53A} являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

45 R^{54} являє собою алкіл, алкеніл або алкініл; кожний з яких є незаміщеним або заміщений одним, двома, трьома, чотирма або п'ятьма замісниками, незалежно вибраними з F , Cl , Br , I , $C(O)OH$, CN , NO_2 , NH_2 , CF_3 , (O) , OH , фенілу, гетероарилу, циклоалкілу, циклоалкенілу або гетероциклоалкілу, і

50 де групи, представлені як R^{51} , R^{52} і R^{53} є, незалежно, незаміщеними або заміщені одним або двома, або трьома замісниками, незалежно вибраними з R^{55} , OR^{55} , OCH_2R^{55} , SR^{55} , $S(O)R^{55}$, SO_2R^{55} , $C(O)R^{55}$, $CO(O)R^{55}$, $^{\circ}C(O)R^{55}$, $^{\circ}C(O)OR^{55}$, NO_2 , NH_2 , NHR^{55} , $N(R^{55})_2$, CH_2R^{55} , $C(O)NH_2$, $C(O)NHR^{55}$, $C(O)N(R^{55})_2$, $NHC(O)R^{55}$, $NR^{55}C(O)R^{55}$, $C(O)NHOH$, $C(O)NHOR^{55}$, $C(O)NHSO_2R^{55}$, $C(O)NR^{55}SO_2R^{55}$, SO_2NH_2 , SO_2NHR^{55} , $SO_2N(R^{55})_2$, CF_3 , CF_2CF_3 , $C(O)H$, $C(O)OH$, $C(N)NH_2$, $C(N)NHR^{55}$, $C(N)N(R^{55})_2$, $=NO$ -(алкілен)- $C(O)CF_3$, $CNOH$, $CNOCH_3$, OH , (O) , CN , N_3 , CF_3 , CF_2CF_3 , OCF_3 , OCF_2CF_3 , F , Cl , Br або I ; і

55 R^{55} являє собою алкіл, алкеніл, алкініл, феніл, гетероарил, циклоалкіл, циклоалкеніл або гетероциклоалкіл.

Інший варіант втілення винаходу стосується сполук Формули I



(I),

і їх терапевтично прийнятних солей, де

5 A^1 являє собою A^2 , OA^2 , SA^2 , $S(O)A^2$, SO_2A^2 , NH_2 , NHA^2 , $N(A^2)_2$, $C(O)A^2$, $C(O)NH_2$, $C(O)NHA^2$, $C(O)N(A^2)_2$, $NHC(O)A^2$, $NA^2C(O)A^2$, $NHSO_2A^2$, $NA^2SO_2A^2$, $NHC(O)OA^2$, $NA^2C(O)OA^2$, SO_2NH_2 , SO_2NHA^2 , $SO_2N(A^2)_2$, $NHC(O)NH_2$, $NHC(O)A^2$, $NHC(O)N(A^2)_2$, $NA^2C(O)N(A^2)_2$, F, Cl, Br або I;

A^2 являє собою R^1 , R^2 , R^3 або R^4 ;

10 R^1 являє собою феніл, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або R^{1A} ; R^{1A} являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

R^2 являє собою гетероарил, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або R^{2A} ; R^{2A} являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

15 R^3 являє собою циклоалкіл, циклоалкеніл, гетероциклоалкіл або гетероциклоалкеніл, кожний з яких є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або R^{3A} ; R^{3A} являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

20 R^4 являє собою алкіл, алкеніл або алкініл, кожний з яких є незаміщеним або заміщений одним, двома, трьома, чотирма або п'ятьма замісниками, незалежно вибраними з R^5 , OR^5 , SR^5 , $S(O)R^5$, SO_2R^5 , NH_2 , NHR^5 , $N(R^5)_2$, $C(O)R^5$, $C(O)NH_2$, $C(O)NHR^5$, $C(O)N(R^5)_2$, $NHC(O)R^5$, $NR^5C(O)R^5$, $NHSO_2R^5$, $NR^5SO_2R^5$, $NHC(O)OR^5$, $NR^5C(O)OR^5$, SO_2NH_2 , SO_2NHR^5 , $SO_2N(R^5)_2$, $NHC(O)NH_2$, $NHC(O)R^5$, $NHC(O)N(R^5)_2$, $NR^5C(O)N(R^5)_2$, OH, (ПО), $C(O)OH$, CN, CF_3 , OCF_3 , CF_2CF_3 , F, Cl, Br або I;

R^5 являє собою R^6 , R^7 або R^8 ;

25 R^6 являє собою феніл, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або R^{6A} ; R^{6A} являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

R^7 являє собою гетероарил, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або R^{7A} ; R^{7A} являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

30 R^8 являє собою циклоалкіл, циклоалкеніл, гетероциклоалкіл або гетероциклоалкеніл, кожний з яких є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або R^{8A} ; R^{8A} являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

L^1 являє собою зв'язок або являє собою алкілен, алкенілен, алкінілен або L^2 ; і B^1 являє собою $C(O)OH$ або його біоізостеру, або являє собою $C(O)OR^1$, $C(O)OR^2$, $C(O)OR^3$ або $C(O)OR^4$;

35 L^2 являє собою C_2 - C_6 -алкілен, C_4 - C_6 -алкенілен або C_4 - C_6 -алкінілен, кожний з яких містить одну CH_2 групу, заміщену групою O, S, $S(O)$, SO_2 , NH або $N(W^1)$;

W^1 являє собою алкіл, алкеніл або алкініл;

C^1 і D^1 незалежно являють собою H, R^9 , R^{10} , R^{11} , R^{12} , $C(O)OR^{12}$, F, Cl, Br, I, або

один з C^1 і D^1 являє собою H, а інший являє собою R^9 , R^{10} , R^{11} , R^{12} , $C(O)OR^{12}$, F, Cl, Br або I;

40 R^9 являє собою феніл, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або R^{9A} ; R^{9A} являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

45 R^{10} являє собою гетероарил, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або R^{10A} ; R^{10A} являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

R^{11} являє собою циклоалкіл, циклоалкеніл, гетероциклоалкіл або гетероциклоалкеніл, кожний з яких є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або R^{11A} ; R^{11A} являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

50 R^{12} являє собою алкіл, алкеніл або алкініл, кожний з яких є незаміщеним або заміщений одним, двома, трьома, чотирма або п'ятьма замісниками, незалежно вибраними з R^{13} , OR^{13} , SR^{13} , $S(O)R^{13}$, SO_2R^{13} , NH_2 , NHR^{13} , $N(R^{13})_2$, $C(O)R^{13}$, $C(O)NH_2$, $C(O)NHR^{13}$, $C(O)N(R^{13})_2$, $NHC(O)R^{13}$, $NR^{13}C(O)R^{13}$, $NHC(O)R^{13}$, $NR^{13}C(O)R^{13}$, $NHSO_2R^{13}$, $NR^{13}SO_2R^{13}$, $NHC(O)OR^{13}$,

$\text{NR}^{13}\text{C}(\text{O})\text{OR}^{13}$, SO_2NH_2 , $\text{SO}_2\text{NHR}^{13}$, $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^{13})_2$, $\text{NHC}(\text{O})\text{NH}_2$, $\text{NHC}(\text{O})\text{R}^{13}$, $\text{NHC}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{13})_2$, $\text{NR}^{13}\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{13})_2$, OH , (O) , $\text{C}(\text{O})\text{OH}$, CN , CF_3 , OCF_3 , CF_2CF_3 , F , Cl , Br або I ;

R^{13} являє собою R^{14} , R^{15} , R^{16} або $\text{R}^{16\text{A}}$;

5 R^{14} являє собою феніл, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або $\text{R}^{14\text{A}}$; $\text{R}^{14\text{A}}$ являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен; кожний з яких є неконденсованим або є конденсованим з $\text{R}^{14\text{B}}$; $\text{R}^{14\text{B}}$ являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

10 R^{15} являє собою гетероарил, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або $\text{R}^{15\text{A}}$; $\text{R}^{15\text{A}}$ являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

R^{16} являє собою циклоалкіл, циклоалкеніл, гетероциклоалкіл або гетероциклоалкеніл, кожний з яких є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або $\text{R}^{16\text{A}}$; $\text{R}^{16\text{A}}$ являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

$\text{R}^{16\text{A}}$ являє собою алкіл, алкеніл або алкініл; і

15 один або два, або кожний, з E^1 і F^1 , і G^1 незалежно являють собою H , CF_3 , F , Cl , Br або I , а інші незалежно являють собою R^{17} , R^{18} , R^{19} , R^{20} або OR^{20} ;

R^{17} являє собою феніл, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або $\text{R}^{17\text{A}}$; $\text{R}^{17\text{A}}$ являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

20 R^{18} являє собою гетероарил, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або $\text{R}^{18\text{A}}$; $\text{R}^{18\text{A}}$ являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

R^{19} являє собою циклоалкіл, циклоалкеніл, гетероциклоалкіл або гетероциклоалкеніл, кожний з яких є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або $\text{R}^{19\text{A}}$; $\text{R}^{19\text{A}}$ являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

25 R^{20} являє собою алкіл, алкеніл або алкініл, кожний з яких є незаміщеним або заміщений одним, двома, трьома, чотирма або п'ятьма замісниками, незалежно вибраними з R^{20} , OR^{20} , SR^{20} , $\text{S}(\text{O})\text{R}^{20}$, SO_2R^{20} , NH_2 , NHR^{20} , $\text{N}(\text{R}^{20})_2$, $\text{C}(\text{O})\text{R}^{20}$, $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$, $\text{C}(\text{O})\text{NHR}^{20}$, $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{20})_2$, $\text{NHC}(\text{O})\text{R}^{20}$, $\text{NHC}(\text{O})\text{R}^{20}$, $\text{NR}^{20}\text{C}(\text{O})\text{R}^{20}$, $\text{NR}^{20}\text{C}(\text{O})\text{R}^{20}$, $\text{NHSO}_2\text{R}^{20}$, $\text{NR}^{20}\text{SO}_2\text{R}^{20}$, $\text{NHC}(\text{O})\text{OR}^{20}$, $\text{NR}^{20}\text{C}(\text{O})\text{OR}^{20}$, SO_2NH_2 , $\text{SO}_2\text{NHR}^{20}$, $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^{20})_2$, $\text{NHC}(\text{O})\text{NH}_2$, $\text{NHC}(\text{O})\text{R}^{20}$, $\text{NHC}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{20})_2$, $\text{NR}^{20}\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{20})_2$, OH , (O) , $\text{C}(\text{O})\text{OH}$, CN , CF_3 , OCF_3 , CF_2CF_3 , F , Cl , Br або I ;

R^{20} являє собою R^{21} , R^{22} або R^{23} ;

35 R^{21} являє собою феніл, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або $\text{R}^{21\text{A}}$; $\text{R}^{21\text{A}}$ являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

R^{22} являє собою гетероарил, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або $\text{R}^{22\text{A}}$; $\text{R}^{22\text{A}}$ являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

40 R^{23} являє собою циклоалкіл, циклоалкеніл, гетероциклоалкіл або гетероциклоалкеніл, кожний з яких є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або $\text{R}^{23\text{A}}$; $\text{R}^{23\text{A}}$ являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

де кожна з зазначених вище циклічних груп, незалежно, є незаміщеною або заміщена одним або двома, або трьома, або чотирма, або п'ятьма замісниками, незалежно вибраними зі спірогетероалкілу, R^{30} , OR^{30} , SO_2R^{30} , $\text{C}(\text{O})\text{R}^{30}$, NO , NO_2 , NH_2 , $\text{N}(\text{R}^{30})_2$, $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$, $\text{C}(\text{O})\text{NHR}^{30}$, $\text{NHC}(\text{O})\text{R}^{30}$, $\text{C}(\text{O})\text{NHSO}_2\text{R}^{30}$, SO_2NH_2 , $\text{C}(\text{O})\text{OH}$, OH , (O) , CN , CF_3 , OCF_3 , F , Cl , Br або I ;

45 R^{30} являє собою R^{31} , R^{32} , R^{33} або R^{34} ;

R^{31} являє собою феніл, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або $\text{R}^{31\text{A}}$; $\text{R}^{31\text{A}}$ являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

50 R^{32} являє собою гетероарил, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або $\text{R}^{32\text{A}}$; $\text{R}^{32\text{A}}$ являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

R^{33} являє собою циклоалкіл, циклоалкеніл, гетероциклоалкіл або гетероциклоалкеніл, кожний з яких є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або $\text{R}^{33\text{A}}$; $\text{R}^{33\text{A}}$ являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

55 R^{34} являє собою алкіл, алкеніл або алкініл, кожний з яких є незаміщеним або заміщений одним, двома, трьома, чотирма або п'ятьма замісниками, незалежно вибраними з R^{35} , OR^{35} , SR^{35} , $\text{S}(\text{O})\text{R}^{35}$, SO_2R^{35} , NH_2 , NHR^{35} , $\text{N}(\text{R}^{35})_2$, $\text{C}(\text{O})\text{R}^{35}$, $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$, $\text{C}(\text{O})\text{NHR}^{35}$, $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{35})_2$, $\text{NHC}(\text{O})\text{R}^{35}$, $\text{NR}^{35}\text{C}(\text{O})\text{R}^{35}$, $\text{NHSO}_2\text{R}^{35}$, $\text{NR}^{35}\text{SO}_2\text{R}^{35}$, $\text{NHC}(\text{O})\text{OR}^{35}$, $\text{NR}^{35}\text{C}(\text{O})\text{OR}^{35}$, SO_2NH_2 ,

$\text{SO}_2\text{NHR}^{35}$, $\text{SO}_2\text{N(R}^{35})_2$, NHC(O)NH_2 , NHC(O)R^{35} , $\text{NHC(O)N(R}^{35})_2$, $\text{NR}^{35}\text{C(O)N(R}^{35})_2$, OH , (O) , C(O)OH , CN , CF_3 , OCF_3 , CF_2CF_3 , F , Cl , Br або I ;

R^{35} являє собою R^{36} , R^{37} , R^{38} або R^{39} ;

5 R^{36} являє собою феніл, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або $\text{R}^{36\text{A}}$; $\text{R}^{36\text{A}}$ являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

R^{37} являє собою гетероарил, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або $\text{R}^{37\text{A}}$; $\text{R}^{37\text{A}}$ являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

10 R^{38} являє собою циклоалкіл, циклоалкеніл, гетероциклоалкіл або гетероциклоалкеніл, кожний з яких є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або $\text{R}^{38\text{A}}$; $\text{R}^{38\text{A}}$ являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

R^{39} являє собою алкіл, алкеніл або алкініл, кожний з яких є незаміщеним або заміщений групою NH_2 , $\text{N(R}^{40})_2$, OR^{40} або R^{40} ;

15 R^{40} являє собою алкіл, алкеніл, алкініл, феніл, гетероарил, циклоалкіл, циклоалкеніл або гетероциклоалкіл;

де групи, представлені як R^{31} , R^{32} , R^{33} , R^{36} , R^{37} і R^{40} , є, незалежно, незаміщеними або заміщені одним або двома, або трьома замісниками, незалежно вибраними з R^{50} , OR^{50} , C(O)R^{50} , C(O)OR^{50} , SO_2R^{50} , NHC(O)R^{50} , F , Cl , Br , I , C(O)OH , CN , NO_2 , NH_2 , CF_3 , (O) або OH ;

20 R^{50} являє собою R^{51} , R^{52} , R^{53} або R^{54} ;

R^{51} являє собою феніл, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або $\text{R}^{51\text{A}}$; $\text{R}^{51\text{A}}$ являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

25 R^{52} являє собою гетероарил, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або $\text{R}^{52\text{A}}$; $\text{R}^{52\text{A}}$ являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

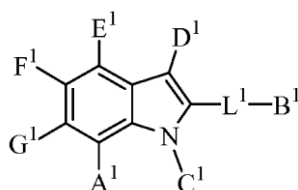
R^{53} являє собою циклоалкіл, циклоалкеніл, гетероциклоалкіл або гетероциклоалкеніл, кожний з яких є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або $\text{R}^{53\text{A}}$; $\text{R}^{53\text{A}}$ являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

30 R^{54} являє собою алкіл, алкеніл або алкініл; кожний з яких є незаміщеним або заміщений одним, двома, трьома, чотирма або п'ятьма замісниками, незалежно вибраними з F , Cl , Br , I , C(O)OH , CN , NO_2 , NH_2 , CF_3 , (O) , OH , фенілу, гетероарилу, циклоалкілу, циклоалкенілу або гетероциклоалкілу, і

35 де групи, представлені як R^{51} , R^{52} і R^{53} , є, незалежно, незаміщеними або заміщені одним або двома, або трьома замісниками, незалежно вибраними з CO(O)R^{55} , C(O)OH , (O) , F , Cl , Br або I ; і

R^{55} являє собою алкіл, алкеніл, алкініл, феніл, гетероарил, циклоалкіл, циклоалкеніл або гетероциклоалкіл.

Ще один варіант втілення стосується сполук Формули (I)



(I),

і їх терапевтично прийнятних солей, де

45 A^1 являє собою A^2 , OA^2 , SA^2 , S(O)A^2 , SO_2A^2 , NH_2 , NHA^2 , $\text{N(A}^2)_2$, C(O)A^2 , C(O)NH_2 , C(O)NHA^2 , $\text{C(O)N(A}^2)_2$, NHC(O)A^2 , $\text{NA}^2\text{C(O)A}^2$, $\text{NH}_2\text{SO}_2\text{A}^2$, $\text{NA}^2\text{SO}_2\text{A}^2$, NHC(O)OA^2 , $\text{NA}^2\text{C(O)OA}^2$, SO_2NH_2 , SO_2NHA^2 , $\text{SO}_2\text{N(A}^2)_2$, NHC(O)NH_2 , NHC(O)A^2 , $\text{NHC(O)N(A}^2)_2$, $\text{NA}^2\text{C(O)N(A}^2)_2$, F , Cl , Br або I ;

A^2 являє собою R^1 , R^2 , R^3 або R^4 ;

R^1 являє собою феніл, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або $\text{R}^{1\text{A}}$; $\text{R}^{1\text{A}}$ являє собою циклоалкан, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

50 R^2 являє собою гетероарил, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом або гетероареном;

R^3 являє собою циклоалкіл, циклоалкеніл, гетероциклоалкіл або гетероциклоалкеніл, кожний з яких є неконденсованим або є конденсованим з бензолом;

- R^4 являє собою алкіл, алкеніл або алкініл, кожний з яких є незаміщеним або заміщений одним, двома, трьома, чотирма або п'ятьма замісниками, незалежно вибраними з R^5 , OR , SR^5 , $S(O)R^5$, SO_2R^5 , NH_2 , NHR^5 , $N(R^5)_2$, $C(O)R^5$, $C(O)NH_2$, $C(O)NHR^5$, $C(O)N(R^5)_2$, $NHC(O)R^5$, $NR^5C(O)R^5$, $NHSO_2R^5$, $NR^5SO_2R^5$, $NHC(O)OR^5$, $NR^5C(O)OR^5$, SO_2NH_2 , SO_2NHR^5 , $SO_2N(R^5)_2$, $NHC(O)NH_2$, $NHC(O)R^5$, $NHC(O)N(R^5)_2$, $NR^5C(O)N(R^5)_2$, OH , (O) , $C(O)OH$, CN , CF_3 , OCF_3 , CF_2CF_3 , F , Cl , Br або I ;
- R^5 являє собою R^6 , R^7 або R^8 ;
- R^6 являє собою феніл, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом;
- R^7 являє собою гетероарил;
- R^8 являє собою циклоалкіл, циклоалкеніл, гетероциклоалкіл або гетероциклоалкеніл;
- L^1 являє собою зв'язок або являє собою алкілен, алкенілен, алкінілен або L^2 ; і B^1 являє собою $C(O)OH$ або його біоізостеру, або являє собою $C(O)OR^1$, $C(O)OR^2$, $C(O)OR^3$ або $C(O)OR^4$;
- L^2 являє собою C_2 - C_6 -алкілен, C_4 - C_6 -алкенілен або C_4 - C_6 -алкінілен, кожний з яких містить одну CH_2 групу, заміщену групою O , S , $S(O)$, SO_2 , NH або $N(W^1)$;
- W^1 являє собою алкіл, алкеніл або алкініл;
- C^1 і D^1 незалежно являють собою H , R^9 , R^{10} , R^{11} , R^{12} , $C(O)OR^{12}$, F , Cl , Br , I , або один з C^1 і D^1 являє собою H , а інший являє собою R^9 , R^{10} , R^{11} , R^{12} , $C(O)OR^{12}$, F , Cl , Br або I ;
- R^9 являє собою феніл;
- R^{10} являє собою гетероарил;
- R^{11} являє собою циклоалкіл, циклоалкеніл, гетероциклоалкіл або гетероциклоалкеніл;
- R^{12} являє собою алкіл, алкеніл або алкініл, кожний з яких є незаміщеним або заміщений одним, двома, трьома, чотирма або п'ятьма замісниками, незалежно вибраними з R^{13} , OR^{13} , SR^{13} , $S(O)R^{13}$, SO_2R^{13} , NH_2 , NHR^{13} , $N(R^{13})_2$, $C(O)R^{13}$, $C(O)NH_2$, $C(O)NHR^{13}$, $C(O)N(R^{13})_2$, $NHC(O)R^{13}$, $NR^{13}C(O)R^{13}$, $NHC(O)OR^{13}$, $NR^{13}C(O)OR^{13}$, $NHSO_2R^{13}$, $NR^{13}SO_2R^{13}$, $NHC(O)OR^{13}$, $NR^{13}C(O)OR^{13}$, SO_2NH_2 , SO_2NHR^{13} , $SO_2N(R^{13})_2$, $NHC(O)NH_2$, $NHC(O)R^{13}$, $NHC(O)N(R^{13})_2$, OH , (O) , $C(O)OH$, CN , CF_3 , OCF_3 , CF_2CF_3 , F , Cl , Br або I ;
- R^{13} являє собою R^{14} , R^{15} , R^{16} або R^{16A} ;
- R^{14} являє собою феніл, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або R^{14A} ; R^{14A} являє собою циклоалкан або гетероциклоалкан; кожний з яких є неконденсованим або є конденсованим з R^{14B} , R^{14B} являє собою циклоалкан;
- R^{15} являє собою гетероарил, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом або гетероареном;
- R^{16} являє собою циклоалкіл, циклоалкеніл, гетероциклоалкіл або гетероциклоалкеніл, кожний з яких є неконденсованим або є конденсованим з бензолом;
- R^{16A} являє собою алкіл, алкеніл або алкініл; і
- один або два, або кожний, з E^1 і F^1 , і G^1 незалежно являють собою H , CF_3 , F , Cl , Br або I , а інші незалежно являють собою R^{17} , R^{18} , R^{19} , R^{20} або OR^{20} ;
- R^{17} являє собою феніл, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом;
- R^{18} являє собою гетероарил;
- R^{19} являє собою циклоалкіл, циклоалкеніл, гетероциклоалкіл або гетероциклоалкеніл;
- R^{20} являє собою алкіл, алкеніл або алкініл, кожний з яких є незаміщеним або заміщений одним, двома, трьома, чотирма або п'ятьма замісниками, незалежно вибраними з R^{20} , OR^{20} , SR^{20} , $S(O)R^{20}$, SO_2R^{20} , NH_2 , NHR^{20} , $N(R^{20})_2$, $C(O)R^{20}$, $C(O)NH_2$, $C(O)NHR^{20}$, $C(O)N(R^{20})_2$, $NHC(O)R^{20}$, $NR^{20}C(O)R^{20}$, $NR^{20}C(O)OR^{20}$, $NHSO_2R^{20}$, $NR^{20}SO_2R^{20}$, $NHC(O)OR^{20}$, $NR^{20}C(O)OR^{20}$, SO_2NH_2 , SO_2NHR^{20} , $SO_2N(R^{20})_2$, $NHC(O)NH_2$, $NHC(O)R^{20}$, $NHC(O)N(R^{20})_2$, $NR^{20}C(O)N(R^{20})_2$, OH , (O) , $C(O)OH$, CN , CF_3 , OCF_3 , CF_2CF_3 , F , Cl , Br або I ;
- R^{20} являє собою R^{21} , R^{22} або R^{23} ;
- R^{21} являє собою феніл, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом;
- R^{22} являє собою гетероарил;
- R^{23} являє собою циклоалкіл, циклоалкеніл, гетероциклоалкіл або гетероциклоалкеніл;
- де кожна з зазначених вище циклічних груп, незалежно, є незаміщеною або заміщена одним або двома, або трьома, або чотирма, або п'ятьма замісниками, незалежно вибраними зі спірогетероалкілу, R^{30} , OR^{30} , SO_2R^{30} , $C(O)R^{30}$, NO , NO_2 , NH_2 , $N(R^{30})_2$, $C(O)NH_2$, $C(O)NHR^{30}$, $NHC(O)R^{30}$, $C(O)NHSO_2R^{30}$, SO_2NH_2 , $C(O)OH$, OH , (O) , CN , CF_3 , OCF_3 , F , Cl , Br або I ;
- R^{30} являє собою R^{31} , R^{32} , R^{33} або R^{34} ;
- R^{31} являє собою феніл, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом;
- R^{32} являє собою гетероарил;
- R^{33} являє собою циклоалкіл, циклоалкеніл, гетероциклоалкіл або гетероциклоалкеніл, кожний з яких є неконденсованим або є конденсованим з бензолом;

R^{34} являє собою алкіл, алкеніл або алкініл, кожний з яких є незаміщеним або заміщений одним, двома, трьома, чотирма або п'ятьма замісниками, незалежно вибраними з R^{35} , OR^{35} , SR^{35} , $S(O)R^{35}$, SO_2R^{35} , NH_2 , NHR^{35} , $N(R^{35})_2$, $C(O)R^{35}$, $C(O)NH_2$, $C(O)NHR^{35}$, $C(O)N(R^{35})_2$, $NHC(O)R^{35}$, $NR^{35}C(O)R^{35}$, $NHSO_2R^{35}$, $NR^{35}SO_2R^{35}$, $NHC(O)OR^{35}$, $NR^{35}C(O)OR^{35}$, SO_2NH_2 , SO_2NHR^{35} , $SO_2N(R^{35})_2$, $NHC(O)NH_2$, $NHC(O)R^{35}$, $NHC(O)N(R^{35})_2$, $NR^{35}C(O)N(R^{35})_2$, OH , (O) , $C(O)OH$, CN , CF_3 , OCF_3 , CF_2CF_3 , F , Cl , Br або I ;

R^{35} являє собою R^{36} , R^{37} , R^{38} або R^{39} ;

R^{36} являє собою феніл, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом або R^{36A} ; R^{36A} являє собою циклоалкен;

R^{37} являє собою гетероарил, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом;

R^{38} являє собою циклоалкіл, циклоалкеніл, гетероциклоалкіл або гетероциклоалкеніл, кожний з яких є неконденсованим або є конденсованим з бензолом;

R^{39} являє собою алкіл, алкеніл або алкініл, кожний з яких є незаміщеним або заміщений групою NH_2 , $N(R^{40})_2$, OR^{40} або R^{40} ;

R^{40} являє собою алкіл, алкеніл, алкініл, феніл, гетероарил, циклоалкіл, циклоалкеніл або гетероциклоалкіл;

де групи, представлені як R^{31} , R^{32} , R^{33} , R^{36} , R^{37} , R^{38} або R^{40} є, незалежно, незаміщеними або заміщені одним або двома, або трьома замісниками, незалежно вибраними з R^{50} , OR^{50} , $C(O)R^{50}$, $C(O)OR^{50}$, SO_2R^{50} , $NHC(O)R^{50}$, F , Cl , Br , I , $C(O)OH$, CN , NO_2 , NH_2 , CF_3 , (O) або OH ;

R^{50} являє собою R^{51} , R^{52} , R^{53} або R^{54} ;

R^{51} являє собою феніл;

R^{52} являє собою гетероарил;

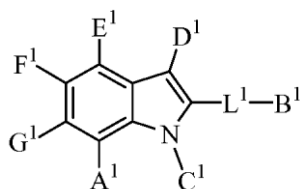
R^{53} являє собою циклоалкіл, циклоалкеніл, гетероциклоалкіл або гетероциклоалкеніл;

R^{54} являє собою алкіл, алкеніл або алкініл; кожний з яких є незаміщеним або заміщений одним, двома, трьома, чотирма або п'ятьма замісниками, незалежно вибраними з F , Cl , Br , I , $C(O)OH$, CN , NO_2 , NH_2 , CF_3 , (O) , OH , фенілу, гетероарилу, циклоалкілу, циклоалкенілу або гетероциклоалкілу, і

де групи, представлені як R^{51} , R^{52} і R^{53} є, незалежно, незаміщеними або заміщені одним або двома, або трьома замісниками, незалежно вибраними з $CO(O)R^{55}$, $C(O)OH$, (O) , F , Cl , Br або I ; і

R^{55} являє собою алкіл, алкеніл, алкініл, феніл, гетероарил, циклоалкіл, циклоалкеніл або гетероциклоалкіл.

Ще один варіант втілення стосується сполук Формули (I)



(I),

і їх терапевтично прийнятних солей, де

A^1 являє собою A^2 , NHA^2 , $N(A^2)_2$, F , Cl , Br або I ;

A^2 являє собою R^1 , R^2 , R^3 або R^4 ;

R^1 являє собою феніл, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або R^{1A} ; R^{1A} являє собою циклоалкан, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

R^2 являє собою гетероарил, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом або гетероареном;

R^3 являє собою циклоалкеніл, гетероциклоалкіл або гетероциклоалкеніл, кожний з яких є неконденсованим або є конденсованим з бензолом;

R^4 являє собою алкіл або алкеніл, кожний з яких є незаміщеним або заміщений одним, двома, трьома, чотирма або п'ятьма замісниками, незалежно вибраними з R^5 , OR^5 , SR^5 , $C(O)OH$, F , Cl , Br або I ;

R^5 являє собою R^6 , R^7 або R^8

R^6 являє собою феніл, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом;

R^7 являє собою гетероарил;

R^8 являє собою циклоалкіл;

L^1 являє собою зв'язок, і B^1 являє собою $C(O)OH$ або його біоізостеру, або являє собою $C(O)OR^4$;

C^1 і D^1 незалежно являють собою H , R^9 , R^{12} , $C(O)OR^{12}$, F , Cl , Br , I , або один з C^1 і D^1 являє собою H , а інший являє собою R^{12} , F , Cl , Br або I ;
 R^9 являє собою феніл;

5 R^{12} являє собою алкіл, алкеніл або алкініл, кожний з яких є незаміщеним або заміщений одним, двома, трьома, чотирма або п'ятьма замісниками, незалежно вибраними з R^{13} , OR^{13} , SR^{13} , NHR^{13} , $N(R^{13})_2$, $C(O)R^{13}$, $C(O)N(R^{13})_2$, $C(O)OH$, F , Cl , Br або I ;

R^{13} являє собою R^{14} , R^{15} , R^{16} або R^{16A} ;

10 R^{14} являє собою феніл, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або R^{14A} ; R^{14A} являє собою циклоалкан або гетероциклоалкан; кожний з яких є неконденсованим або є конденсованим з R^{14B} ; R^{14B} являє собою циклоалкан;

R^{15} являє собою гетероарил, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом або гетероареном;

R^{16} являє собою циклоалкіл або гетероциклоалкіл, кожний з яких є неконденсованим або є конденсованим з бензолом;

15 R^{16A} являє собою алкіл; і

один або два, або кожний, з E^1 і F^1 , і G^1 незалежно являють собою H , CF_3 , F , Cl , Br або I , а інші незалежно являють собою R^{17} , R^{20} або OR^{20} ;

R^{17} являє собою феніл, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом;

R^{18} являє собою гетероарил;

20 R^{19} являє собою циклоалкіл, циклоалкеніл, гетероциклоалкіл або гетероциклоалкеніл;

R^{20} являє собою алкіл або алкеніл, кожний з яких є незаміщеним або заміщений одним, двома, трьома, чотирма або п'ятьма замісниками, незалежно вибраними з R^{20} , OR^{20} , F , Cl , Br або I ;

R^{20} являє собою R^{21} ;

25 R^{21} являє собою феніл, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом;

де кожна з зазначених вище циклічних груп, незалежно, є незаміщеною або заміщена одним або двома, або трьома, або чотирма, або п'ятьма замісниками, незалежно вибраними зі спірогетероалкілу, R^{30} , OR^{30} , SO_2R^{30} , $C(O)R^{30}$, NO , NO_2 , NH_2 , $N(R^{30})_2$, $C(O)NH_2$, $C(O)NHR^{30}$, $NHC(O)R^{30}$, $C(O)NHSO_2R^{30}$, SO_2NH_2 , $C(O)OH$, OH , (O) , CN , CF_3 , OCF_3 , F , Cl , Br або I ;

30 R^{30} являє собою R^{31} , R^{32} , R^{33} або R^{34} ;

R^{31} являє собою феніл, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом;

R^{32} являє собою гетероарил;

R^{33} являє собою циклоалкіл, циклоалкеніл або гетероциклоалкіл, кожний з яких є неконденсованим або є конденсованим з бензолом;

35 R^{34} являє собою алкіл, алкеніл або алкініл, кожний з яких є незаміщеним або заміщений одним, двома, трьома, чотирма або п'ятьма замісниками, незалежно вибраними з R^{35} , OR^{35} , SR^{35} , $S(O)R^{35}$, SO_2R^{35} , NH_2 , $N(R^{35})_2$, $C(O)NHR^{35}$, OH , $C(O)OH$, F , Cl , Br або I ;

R^{35} являє собою R^{36} , R^{37} , R^{38} або R^{39} ;

R^{36} являє собою феніл, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом або R^{36A} ;

40 R^{36A} являє собою циклоалкені;

R^{37} являє собою гетероарил, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом;

R^{38} являє собою циклоалкіл або гетероциклоалкіл, кожний з яких є неконденсованим або є конденсованим з бензолом;

R^{39} являє собою алкіл, кожний з яких є незаміщеним або заміщений групою NH_2 , $N(R^{40})_2$ або OR^{40} ;

45 R^{40} являє собою алкіл або феніл;

де групи, представлені як R^{31} , R^{32} , R^{33} , R^{36} , R^{37} , R^{38} і R^{40} є, незалежно, незаміщеними або заміщені одним або двома, або трьома замісниками, незалежно вибраними з R^{50} , OR^{50} , $C(O)R^{50}$, $C(O)OR^{50}$, SO_2R^{50} , $NHC(O)R^{50}$, F , Cl , Br , I , $C(O)OH$, CN , NO_2 , NH_2 , (O) або OH ;

50 R^{50} являє собою R^{51} , R^{52} , R^{53} або R^{54} ;

R^{51} являє собою феніл;

R^{52} являє собою гетероарил;

R^{53} являє собою гетероциклоалкіл;

55 R^{54} являє собою алкіл; кожний з яких є незаміщеним або заміщений одним, двома, трьома, чотирма або п'ятьма замісниками, незалежно вибраними з OH , фенілу або гетероарилу;

де групи, представлені як R^{51} і R^{53} є, незалежно, незаміщеними або заміщені одним або двома, або трьома замісниками, незалежно вибраними з $CO(O)R^{55}$, $C(O)OH$, (O) , F , Cl , Br або I ; і

R^{55} являє собою алкіл.

60 Ще один варіант втілення стосується композицій, що включають ексципієнт і терапевтично ефективну кількість сполуки Формули I.

- 7-циклогекс-1-ен-1-іл-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2-фенілциклогекс-1-ен-1-іл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-(2-циклогексилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-(6-карбоксіпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 5 7-(3-метил-5-нітропіридин-2-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-(2,3-дигідро-1,4-бензодіоксин-6-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова
 кислота;
 7-(1,3-бензодіоксол-5-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 3-(3-((4-хлор-1-нафтил)окси)пропіл)-7-(2-метоксифеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 10 3-(3-(2-бромфенокси)пропіл)-7-(2-метоксифеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-(2-метил-4-(((2-морфолін-4-ілетил)аміно)карбоніл)феніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-
 індол-2-карбонова кислота;
 7-(3-метилхінолін-2-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-(4-(гідроксиметил)феніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 15 7-(3-(гідроксиметил)феніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 5-хлор-7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-(3-метилпіридин-2-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-(2,6-диметилпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-(6-аміно-2-метилпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 20 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2-піперазин-1-ілфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-(4-(3-хлорфеніл)піперазин-1-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-(2-метилфеніл)-1-(2-морфолін-4-ілетил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова
 кислота;
 7-(2-метилфеніл)-3-(3-(5,6,7,8-тетрагідронафталін-1-ілокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова
 25 кислота;
 5-хлор-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-феніл-1H-індол-2-карбонова кислота;
 5-хлор-7-(4-хлор-2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 5-хлор-7-циклопент-1-ен-1-іл-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-(3,5-дихлорпіридин-2-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 30 7-(5-(амінокарбоніл)піридин-2-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-(3-хлор-5-(трифторметил)піридин-2-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова
 кислота;
 7-(5-аміно-2-(трифторметокси)феніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова
 кислота;
 35 7-(5-карбоксі-2-метоксифеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-(4-карбоксі-2-нітрофеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-(5-карбоксі-2-хлорфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-(1-бензил-3-метил-1,2,3,6-тетрагідропіридин-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-
 карбонова кислота;
 40 7-(4-аміно-2-(трифторметил)феніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова
 кислота;
 7-(1,4-діокса-8-азаспіро(4,5)дец-8-ил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова
 кислота;
 7-(3-карбоксіпіперидин-1-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 45 7-(4-карбоксіпіперидин-1-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-піролідин-1-іл-1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-морфолін-4-іл-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-піперидин-1-іл-1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-(4-(аміносультфоніл)-2-(трифторметил)феніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-
 50 карбонова кислота;
 4-(2-(етоксикарбоніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-7-іл)-3-метилбензойна кислота;
 7-(2-метил-4-(морфолін-4-ілкарбоніл)феніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-
 карбонова кислота;
 7-(4-((4-карбоксіпіперидин-1-іл)карбоніл)-2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-
 55 індол-2-карбонова кислота;
 7-(4-((3-карбоксіпіперидин-1-іл)карбоніл)-2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-
 індол-2-карбонова кислота;
 7-(4-(карбоксиметилкарбамоїл)-2-метилфеніл)-3-(3-(нафталін-1-ілокси)пропіл)-1H-індол-2-
 карбонова кислота;

- 3-(3-(3,4-дигідрохінолін-1(2H)-іл)пропіл)-7-(2-(трифторметил)феніл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 7-(2-метилфеніл)-3-(3-(3-феноксифенокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 3-(3-(2,3-диметилфенокси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 5 7-(4-метилпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 7-(2-метилбензил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 3,3'-біс(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H, 1'H-7,7'-бііндол-2,2'-дикарбонова кислота;
- 3-(4-(3,4-дигідрохінолін-1(2H)-іл)бутил)-7-(2-(трифторметил)феніл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 10 7-(4-карбокси-2-метилфеніл)-3-(4-(3,4-дигідрохінолін-1(2H)-іл)бутил)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 7-(2-метилфеніл)-3-(4-(1-нафтил)бутил)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 7-(2-метилфеніл)-3-(4-(1-нафтилокси)бутил)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 3-(3-(2,4-диметилфенокси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 15 3-(3-(2,5-диметилфенокси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 7-(1,1'-біфеніл-2-іл)-3-(4-(1-нафтилокси)бутил)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 7-(4-((2-карбоксипіперидин-1-іл)карбоніл)-2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 7-(4-((S)-1-карбокси-2-метилпропілкарбамоїл)-2-метилфеніл)-3-(3-(нафталін-1-ілокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 20 N-(4-(2-карбокси-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-7-іл)-3-метилбензоїл)-4-хлорфенілаланін;
- N-(4-(2-карбокси-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-7-іл)-3-метилбензоїл)-L-триптофан;
- (3S)-2-(4-(2-карбокси-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-7-іл)-3-метилбензоїл)-1,2,3,4-
- 25 тетрагідроізохінолін-3-карбонова кислота;
- N-(4-(2-карбокси-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-7-іл)-3-метилбензоїл)-L-тирозин;
- 7-(4-((R)-2-карбоксипіролідин-1-карбоніл)-2-метилфеніл)-3-(3-(нафталін-1-ілокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 7-(4-((S)-1-карбоксиетилкарбамоїл)-2-метилфеніл)-3-(3-(нафталін-1-ілокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 30 N-(4-(2-карбокси-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-7-іл)-3-метилбензоїл)-4-нітро-L-фенілаланін;
- N-(4-(2-карбокси-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-7-іл)-3-метилбензоїл)-1-фенілаланін;
- 7-(4-(((S)-карбокси(феніл)метил)аміно)карбоніл)-2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-
- 35 1H-індол-2-карбонова кислота;
- 7-(4-карбокси-2-метилфеніл)-3-(3-(2,4,5-трихлорфенокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 7-(4-карбокси-2-метилфеніл)-3-(3-(2,3,4-трихлорфенокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 40 7-(4-карбокси-2-метилфеніл)-3-(3-(2,3,5-триметилфенокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 3-(3-(2-трет-бутилфенокси)пропіл)-7-(4-карбокси-2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 7-(4-карбокси-2-метилфеніл)-3-(3-(2-(трифторметил)фенокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 45 7-(4-карбокси-2-метилфеніл)-3-(3-(хінолін-8-ілокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 7-(4-карбокси-2-метилфеніл)-3-(3-((5-оксо-5,6,7,8-тетрагідронафталін-1-іл)окси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 3-(3-(3-бензоїлфенокси)пропіл)-7-(4-карбокси-2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 50 7-(2-метилфеніл)-1-(2-морфолін-4-ілетил)-3-(3-(5,6,7,8-тетрагідронафталін-1-ілокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 7-(4-(циклогексилокси)феніл)-3-(4-(1-нафтилокси)бутил)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 7-(1,1'-біфеніл-2-іл)-1-(2-морфолін-4-ілетил)-3-(3-(5,6,7,8-тетрагідронафталін-1-ілокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 55 3-(3-(3,4-диметилфенокси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 3-(3-(3,5-диметилфенокси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 3-(3-(2,3-диметоксифенокси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтиламіно)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 1-(карбоксиметил)-7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова
- 60 кислота;

- 3-(3-(3-(диметиламіно)фенокси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 3-(4-(3,4-дигідрохінолін-1(2Н)-іл)бутил)-7-(4-(морфолін-4-ілкарбоніл)-2-(трифторметил)феніл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 3-(4-(2-метил-3,4-дигідрохінолін-1(2Н)-іл)бутил)-7-(4-(морфолін-4-ілкарбоніл)-2-(трифторметил)феніл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 3-(4-(6-метил-3,4-дигідрохінолін-1(2Н)-іл)бутил)-7-(4-(морфолін-4-ілкарбоніл)-2-(трифторметил)феніл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 3-(4-(6-метокси-3,4-дигідрохінолін-1(2Н)-іл)бутил)-7-(4-(морфолін-4-ілкарбоніл)-2-(трифторметил)феніл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 3-(4-(етил(1-нафтил)аміно)бутил)-7-(4-(морфолін-4-ілкарбоніл)-2-(трифторметил)феніл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 3-(4-(2,3-дигідро-1Н-індол-1-іл)бутил)-7-(4-(морфолін-4-ілкарбоніл)-2-(трифторметил)феніл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 3-(4-(2-метил-2,3-дигідро-1Н-індол-1-іл)бутил)-7-(4-(морфолін-4-ілкарбоніл)-2-(трифторметил)феніл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 7-(4-(морфолін-4-ілкарбоніл)-2-(трифторметил)феніл)-3-(4-(5-нітро-2,3-дигідро-1Н-індол-1-іл)бутил)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 3-(4-(5-бром-2,3-дигідро-1Н-індол-1-іл)бутил)-7-(4-(морфолін-4-ілкарбоніл)-2-(трифторметил)феніл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 3-(4-(2,3-дигідро-4Н-1,4-бензоксазин-4-іл)бутил)-7-(4-(морфолін-4-ілкарбоніл)-2-(трифторметил)феніл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 7-(2-метилфеніл)-3-(3-(2,3,5-триметилфенокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 7-(2-метилфеніл)-3-(3-(2,3,6-триметилфенокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 3-(3-(2,3-дихлорфенокси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 7-(2-метилфеніл)-3-(5-(5,6,7,8-тетрагідронафталін-1-ілокси)пентил)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 7-(2-метилфеніл)-3-(5-(1-нафтилокси)пентил)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 7-(2,3-диметилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1-(піридин-4-ілметил)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 7-(2-(4-фторфеніл)циклогекс-1-ен-1-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 7-(3,5-диметил-1-(2-(2-оксопіролідін-1-іл)етил)-1Н-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 1-(трет-бутоксикарбоніл)-7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)бензил)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)бензил)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 7-(2-метилфеніл)-4-((Е)-2-фенілвініл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 7-(2-метилфеніл)-4-(1-нафтил)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 7-(2-метилфеніл)-4-(2-нафтил)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 7-(2-метилфеніл)-4-(3-(2-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 7-(2-метилфеніл)-4-(4-(1-нафтилокси)бутил)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 7-(2-метилфеніл)-4-(4-(2-нафтилокси)бутил)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 7-(2-метилфеніл)-4-(2-(2-нафтил)етил)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-тієн-3-іл-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 7-((3-(амінокарбоніл)феніл)аміно)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 7-((3-ціанофеніл)аміно)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 7-((2-бензилфеніл)аміно)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 7-(1,1'-біфеніл-2-іламіно)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 7-((2-етилфеніл)аміно)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-((2-пропілфеніл)аміно)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 7-(5-карбокси-3-метилтієн-2-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 7-((2-карбоксифеніл)аміно)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 7-((3-карбоксифеніл)аміно)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 7-(2-морфолін-4-іл-5-нітропіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 7-(5-аміно-2-морфолін-4-ілпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 7-((3-хлорпіридин-4-іл)аміно)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 7-((2-ізопропілфеніл)аміно)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;

- 7-(2-морфолін-4-ілпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-(5-(амінокарбоніл)-1,2-диметил-6-оксо-1,6-дигідропіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-(5-ціано-1,2-диметил-6-оксо-1,6-дигідропіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-(5-аміно-4-хлор-2-морфолін-4-ілпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 2-метил-3'-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-2,3-дигідро-1'H-1,7'-бііндол-2'-карбонова кислота;
 7-(2-фтор-5-метилпіридин-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-((2-метоксипіридин-3-іл)аміно)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-(5-метил-2-оксо-1,2-дигідропіридин-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-(5-метил-2-(2-піролідін-1-ілетокси)піридин-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-(2-(диметиламіно)-5-нітропіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-(2-(2-(диметиламіно)етокси)-5-метилпіридин-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-(5-метил-2-(2-морфолін-4-ілетокси)піридин-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-(2-(1,4-діокса-8-азаспіро(4,5)дец-8-ил)-5-нітропіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(5-нітро-2-(4-оксопіперидин-1-іл)піридин-3-іл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-(5-аміно-2-(диметиламіно)піридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-(2-(4-гідроксипіперидин-1-іл)-5-нітропіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-(6-метокси-4-метилпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-(2-фтор-5-метилпіридин-4-іл)-1-(2-морфолін-4-ілетил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(1,3,5-триметил-1H-піразол-4-іл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-((2-морфолін-4-ілпіридин-3-іл)аміно)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-(5-метил-2-(2-фенілетокси)піридин-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-(5-метил-2-(2-піридин-3-ілетокси)піридин-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-((2-морфолін-4-ілфеніл)аміно)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-((4-карбоксипіридин-3-іл)аміно)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-((4-(трифторметил)піридин-3-іл)аміно)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-(2-(3-амінопропокси)-5-метилпіридин-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-(5-метил-2-(тетрагідрофуран-3-ілметокси)піридин-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-(5-метил-2-(4-фенілбутокси)піридин-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-(2-(3-метоксифеніл)циклогекс-1-ен-1-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-(1-(карбоксиметил)-3,5-диметил-1H-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-(1-бензил-1H-імідазол-5-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-(2-(2-метилфеніл)циклогекс-1-ен-1-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-(3,5-диметил-1-(2-морфолін-4-ілетил)-1H-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;

- 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2-(4-нітрофеніл)циклогекс-1-ен-1-іл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 7-(4,4-диметил-2-фенілциклогекс-1-ен-1-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 5 1-етил-7-(етил(феніл)аміно)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 7-аніліно-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 7-(5-метил-2-(тетрагідро-2H-піран-3-ілметокси)піридин-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 7-(5-метил-2-(2-(2-оксопіролідін-1-іл)етокси)піридин-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 10 7-(5-метил-2-(2-(4-метилпіперазин-1-іл)етокси)піридин-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2-(2-оксоциклогексил)піридин-3-іл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 15 7-(2-фтор-5-метилпіридин-4-іл)-1-(2-(4-метилпіперазин-1-іл)етил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 7-(5,5-диметил-2-фенілциклогекс-1-ен-1-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(піридин-3-іламіно)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 20 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(феніл(пропіл)аміно)-1-пропіл-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 7-(3-циклогекс-1-ен-1-ілпіридин-2-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2-піридин-3-ілциклогекс-1-ен-1-іл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 25 3-(3-((8-хлорхіназолін-4-іл)окси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 1-бутил-7-(бутил(феніл)аміно)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 3-(3-(7-хлор-1H-піроло(2,3-с)піридин-1-іл)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 7-(3-циклогексилпіридин-2-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 30 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(1-(1,3-тіазол-5-ілметил)-1H-піроло(2,3-с)піридин-3-іл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 7-(1-(3,3-диметил-2-оксобутил)-1H-піроло(2,3-с)піридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 7-(4-циклогекс-1-ен-1-ілпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 35 7-(1-(3,5-дифторбензил)-1H-піроло(2,3-с)піридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(1-фенілвініл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(1H-піроло(2,3-с)піридин-7-іл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 40 7-(4-циклогексилпіридин-3-іл)-3-(3-феноксипропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 7-(2,4-диметил-1,3-тіазол-5-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 7-(1-(карбоксиметил)-1H-піроло(2,3-с)піридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(1-фенілетил)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 45 7-(1-бензил-3,5-диметил-1H-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 7-(2-(2-хлорфеніл)циклогекс-1-ен-1-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H, 1'H-7,7'-бііндол-2-карбонова кислота;
- 50 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(1-(2-(2-оксопіролідін-1-іл)етил)-1H-піроло(2,3-с)піридин-7-іл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 7-(5-метил-3-феніл-1H-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 7-(2-метилфеніл)-4-(2-(1-нафтилокси)етил)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 55 7-(2-метилфеніл)-4-(2-(2-нафтилокси)етил)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 4-(2-(2,3-дихлорфенокси)етил)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 3-(3-(1H-індол-4-ілокси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 4-(2-(2-хлор-3-(трифторметил)фенокси)етил)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота;

- 1-метил-3-(3-((1-метил-1H-індол-4-іл)окси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 7-(2-(4-етилфеніл)циклогекс-1-ен-1-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 5 7-(2-(4-ізопропілфеніл)циклогекс-1-ен-1-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 7-(1,3-диметил-5-феніл-1H-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 7-(1,5-диметил-3-феніл-1H-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 10 7-(3,5-диметил-1-((3-метилоксетан-3-іл)метил)-1H-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 7-(3,5-диметил-1-тетрагідрофуран-3-іл-1H-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 15 7-(3,5-диметил-1-піридин-2-іл-1H-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 7-(2-хлор-4-метилпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 7-(4-метил-2-(2-(2-оксопіролідін-1-іл)етокси)піридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 20 7-(3,5-диметил-1-(тетрагідрофуран-3-ілметил)-1H-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 7-(1-циклопентил-3,5-диметил-1H-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 7-(1-((2,2-диметил-1,3-діоксолан-4-іл)метил)-3,5-диметил-1H-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 25 7-(4-метил-2-(2-морфолін-4-ілетокси)піридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 7-(4-метил-2-морфолін-4-ілпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 30 7-(2-хлор-4-метилпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1-(піридин-3-ілметил)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 7-(2-(1H-імідазол-1-іл)-4-метилпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 7-(1-(2,3-дигідроксипропіл)-3,5-диметил-1H-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 35 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(3-феніл-5-(2-фенілетил)-1H-піразол-4-іл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 7-(4-метил-2-фенілпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 7-(4-метил-2-вінілпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 40 7-(4-метил-2-((1E)-проп-1-еніл)піридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 7-(2-етил-4-метилпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 7-(3,5-диметил-1-(піридин-3-ілметил)-1H-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 45 7-(2-ізопропеніл-4-метилпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 7-(4-метил-2-пентилпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 7-(4-метил-2-пропілпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 7-(2-ізопропіл-4-метилпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 50 7-(3,5-діізопропіл-1-метил-1H-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 7-(5-карбокси-1,3-диметил-1H-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 55 7-(4-метил-2-(2-метилпроп-1-еніл)піридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 7-(4-карбокси-1-феніл-1H-піразол-5-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 7-(2-ізобутил-4-метилпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 60

- 7-(4-метил-2,3'-біпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-(2-(4-метоксифеніл)-4-метилпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-
 карбонова кислота;
 7-(4-метил-2-(1-метил-1H-піразол-4-іл)піридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-
 5 карбонова кислота;
 7-(3-(гідроксиметил)-1,5-диметил-1H-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-
 карбонова кислота;
 3-бром-7-(1,3-диметил-5-феніл-1H-піразол-4-іл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-(1,3-диметил-5-(феноксиметил)-1H-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-
 10 карбонова кислота;
 7-(1-метил-1H-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 3-бром-7-(2-((E)-2-циклогексилвініл)-4-метилпіридин-3-іл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-(3-ізопропіл-1-метил-5-(феноксиметил)-1H-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-
 індол-2-карбонова кислота;
 15 7-(1,5-диметил-3-(феноксиметил)-1H-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-
 карбонова кислота;
 7-(4-(анілінокарбоніл)-1-феніл-1H-піразол-5-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-
 карбонова кислота;
 7-(3-((3-хлорфенокси)метил)-1,5-диметил-1H-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-
 20 індол-2-карбонова кислота;
 7-(1,5-диметил-3-((3-феноксифенокси)метил)-1H-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-
 1H-індол-2-карбонова кислота;
 3-бром-4-(2-((4-бром-1-нафтил)окси)етил)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-(1,5-диметил-3-((4-морфолін-4-ілфенокси)метил)-1H-піразол-4-іл)-3-(3-(1-
 25 нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-(3-(((5-хлорпіридин-3-іл)окси)метил)-1,5-диметил-1H-піразол-4-іл)-3-(3-(1-
 нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-(3,5-диметил-1-(2-нітрофеніл)-1H-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-
 карбонова кислота;
 30 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-((2-(фенілтіо)етил)аміно)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-(3-((2-ціанофенокси)метил)-1,5-диметил-1H-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-
 індол-2-карбонова кислота;
 7-(3-((4-(4-ацетилпіперазин-1-іл)фенокси)метил)-1,5-диметил-1H-піразол-4-іл)-3-(3-(1-
 нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 35 3-бром-7-(2-метилфеніл)-4-(2-(1-нафтилокси)етил)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-(1-(2-амінофеніл)-3,5-диметил-1H-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-
 карбонова кислота;
 7-(3-(1H-імідазол-1-ілметил)-1,5-диметил-1H-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-
 індол-2-карбонова кислота;
 40 7-(2-метилфеніл)-4-(2-(1-нафтилокси)етил)-3-вініл-1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-(4-((бензиламіно)карбоніл)-1-феніл-1H-піразол-5-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-
 2-карбонова кислота;
 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(1-феніл-4-(((3-піролідін-1-ілпропіл)аміно)карбоніл)-1H-
 піразол-5-іл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 45 7-(4,6-диметилпіримідин-5-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-(4,6-диметилпіримідин-5-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1-(піридин-3-ілметил)-1H-індол-2-
 карбонова кислота;
 7-(2-етил-4-метилпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1-(піридин-3-ілметил)-1H-індол-2-
 карбонова кислота;
 50 7-(2-етил-4-метилпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1-(1,3-тіазол-4-ілметил)-1H-індол-
 2-карбонова кислота;
 7-(2-хлор-4-((4-морфолін-4-ілфенокси)метил)піридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-
 індол-2-карбонова кислота;
 7-(5-ізопропіл-1-метил-3-((4-морфолін-4-ілфенокси)метил)-1H-піразол-4-іл)-3-(3-(1-
 нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 55 7-(3-ізопропіл-1-метил-5-((4-морфолін-4-ілфенокси)метил)-1H-піразол-4-іл)-3-(3-(1-
 нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-(2-ізопропеніл-4-метилпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1-(піридин-2-ілметил)-1H-
 індол-2-карбонова кислота;

- 7-(1,5-диметил-3-((4-морфолін-4-ілфенокси)метил)-1Н-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1-(піридин-3-ілметил)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 7-(2-етил-4-((4-морфолін-4-ілфенокси)метил)піридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 5 7-(4-метил-2-піримідин-5-ілпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 7-(4-метил-6'-морфолін-4-іл-2,3'-біпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 7-(4,6-диметилпіримідин-5-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1-(піридин-2-ілметил)-1Н-індол-2-
 10 карбонова кислота;
 7-(4,6-диметилпіримідин-5-іл)-1-(2-(4-метилпіперазин-1-іл)-2-оксоетил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 1-(2-(диметиламіно)-2-оксоетил)-7-(4,6-диметилпіримідин-5-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 15 7-(3-((4-(1,1-діоксидотіоморфолін-4-іл)фенокси)метил)-1,5-диметил-1Н-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 7-(4,6-диметилпіримідин-5-іл)-1-(2-морфолін-4-ілетил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 7-(1,5-диметил-3-((4-піперазин-1-ілфенокси)метил)-1Н-піразол-4-іл)-3-(3-(1-
 20 нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 7-(3-((4-(4-ацетилпіперазин-1-іл)фенокси)метил)-1,5-диметил-1Н-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1-(піридин-3-ілметил)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 7-(4,6-диметилпіримідин-5-іл)-1-(2-(4-метилпіперазин-1-іл)етил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 25 7-(3-((4-(4-(трет-бутоксикарбоніл)піперазин-1-іл)фенокси)метил)-1,5-диметил-1Н-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 1-(2-(диметиламіно)етил)-7-(4,6-диметилпіримідин-5-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(4-(1Н-піразол-1-іл)феніл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 30 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2,3,4-трифторфеніл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 7-(4-гідрокси-3-метоксифеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(3,4,5-триметоксифеніл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(4-(трифторметокси)феніл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 7-(2-метокси-5-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 35 7-(3-фтор-4-метоксифеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(4-(5-оксо-2,5-дигідро-1Н-піразол-3-іл)феніл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 7-(3-(морфолін-4-ілметил)феніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 7-(4-(морфолін-4-ілметил)феніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 40 7-(4-ізопропокси-2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(4-(1Н-піразол-5-іл)феніл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 7-(2,5-диметилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2,4,5-триметилфеніл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(3-(трифторметокси)феніл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 45 7-(2-метил-4-пропоксифеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 7-(3-ціанофеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2,3,5,6-тетраметилфеніл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 7-(3-ціано-2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 7-(3-етиніл-2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 50 7-(5-(((3-(диметиламіно)пропіл)аміно)карбоніл)-2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 7-(2-ізопропілфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 7-(5-(((2-(диметиламіно)етил)аміно)карбоніл)-2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 55 7-(2-метил-5-(((2-морфолін-4-ілетил)аміно)карбоніл)феніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 7-(2-метил-5-(((3-морфолін-4-ілпропіл)аміно)карбоніл)феніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
 7-(2-метил-5-(((2-фенілетил)аміно)карбоніл)феніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-
 60 карбонова кислота;

- 7-(1H-індазол-5-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-(5-(((1S, 4R)-біцикло(2.2.1)гепт-2-илметил)аміно)карбоніл)-2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-(2-метил-5-(((3-фенілпропіл)аміно)карбоніл)феніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-
 5 карбонова кислота;
 7-(2-((2-ізопропіл-5-метилфенокси)метил)феніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-
 карбонова кислота;
 7-(2-хлор-6-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-(2-бензилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 10 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2,4,6-триізопропілфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(1-оксо-2,3-дигідро-1H-інден-4-іл)-1H-індол-2-карбонова
 кислота;
 7-(2-циклопентилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-(2',6'-диметокси-1,1'-біфеніл-2-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова
 15 кислота;
 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(5,6,7,8-тетрагідронафталін-1-іл)-1H-індол-2-карбонова
 кислота;
 7-(4'-трет-бутил-1,1'-біфеніл-2-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-(5-фтор-2-метил-3-((метилсульфоніл)метил)феніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-
 20 карбонова кислота;
 7-(5-(((2-гідрокси-1,1-диметилетил)аміно)карбоніл)-2,3,4-триметилфеніл)-3-(3-(1-
 нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-(2-(4-(етоксикарбоніл)піперазин-1-іл)феніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-
 карбонова кислота;
 25 7-(2-метил-6-нітрофеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2-(4-пропіонілпіперазин-1-іл)феніл)-1H-індол-2-карбонова
 кислота;
 7-(2-метил-6-тієн-2-ілфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2-(4-(1,3-тіазол-4-ілметил)піперазин-1-іл)феніл)-1H-індол-2-
 30 карбонова кислота;
 7-(2-(4-(2-гідроксietил)піперазин-1-іл)феніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-
 карбонова кислота;
 7-(2-(4-(метилсульфоніл)піперазин-1-іл)феніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-
 карбонова кислота;
 35 7-(2-((4-(трет-бутоксикарбоніл)піперазин-1-іл)сульфоніл)феніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-
 1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-(2-((4-етилпіперазин-1-іл)сульфоніл)феніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-
 карбонова кислота;
 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2-((4-(2-оксопіролідін-1-іл)піперидин-1-іл)сульфоніл)феніл)-
 40 1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-(3-((1S, 4R)-2-гідроксибіцикло(2.2.1)гепт-2-ил)-2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-
 1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-((1E)-1-етилбут-1-еніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-((Z)-2-карбоксі-1-пентилвініл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 45 7-(5,7-диметилпіразоло(1,5-а)піримідин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-
 карбонова кислота;
 7-(4-(4-фторфеніл)-5-(4-(метилсульфоніл)феніл)тієн-2-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-
 індол-2-карбонова кислота;
 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1-(піридин-4-ілметил)-7-(2-(трифторметил)феніл)-1H-індол-2-
 50 карбонова кислота;
 7-(5-(((2-(диметиламіно)етил)(піридин-2-іл)аміно)метил)тієн-2-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-
 1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-(2-морфолін-4-іл-6-(трифторметил)феніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-
 карбонова кислота;
 55 7-(4-метокси-2-феніл-1-бензофуран-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова
 кислота;
 4-фтор-7-(2-морфолін-4-ілфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 4-фтор-7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-(2-((2-адамантиламіно)карбоніл)-6-метилімідазо(1,2-а)піридин-8-іл)-3-(3-(1-
 60 нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;

- 7-(1-(1-адамантил)-3-карбокси-1Н-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
- 7-(2-(1-гідрокси-4-метоксициклогексил)-1-бензотієн-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
- 5 7-(5-хлор-3-метил-1-тетрагідро-2Н-піран-2-іл-1Н-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
- 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2,2,4-триметил-1-(фенілсульфоніл)-1,2-дигідрохінолін-3-іл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
- 10 7-(7,8-диметил-2-(1-метил-1-фенілетил)імідазо(1,2-а)піридин-6-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
- 7-(1-(4-((2-фторбензоїл)аміно)феніл)-3-(трифторметил)-1Н-піразол-5-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
- 7-(5-аміно-3-(піперидин-1-ілкарбоніл)-1Н-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
- 15 7-(3-метил-1-(2-нітрофеніл)-5-феніл-1Н-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
- 7-(5-метил-1-(2-оксо-2-((2-фенілетил)аміно)етил)-3-(трифторметил)-1Н-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
- 7-(2-(1-адамантил)імідазо(1,2-а)піридин-5-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
- 20 7-(1,1-діоксидо-1-бензотієн-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
- 7-(2-циклогексил-6-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
- 7-(4-(((2-(2-(2-аміноетокси)етокси)етил)аміно)карбоніл)-2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
- 25 7-(1-метил-3,5-дифеніл-1Н-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
- 7-((Z)-2-(1Н-імідазол-1-іл)-1-фенілвініл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
- 7-(1-бензил-2-метил-4-нітро-1Н-імідазол-5-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
- 30 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2-проп-1-інілфеніл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
- 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2-(фенілетиніл)феніл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
- 3,7-біс(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
- 1-(2-(диметиламіно)-2-оксоетил)-7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
- 35 1-(2-метилбензил)-7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
- 1-(3-метилбензил)-7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
- 40 1-(4-метилбензил)-7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
- 7-(2-метилфеніл)-1-(3-морфолін-4-ілпропіл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
- 7-(2-метилфеніл)-1-(2-(4-метилпіперазин-1-іл)-2-оксоетил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
- 45 7-(2-метилфеніл)-1-(2-(4-метилпіперазин-1-іл)етил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
- 1-(1,1'-біфеніл-2-ілметил)-7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
- 50 1-(1,1'-біфеніл-3-ілметил)-7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
- 1-(1,1'-біфеніл-4-ілметил)-7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
- 1-(2,4-диметилбензил)-7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
- 55 1-(4-карбоксибензил)-7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;
- 1-(1,1'-біфеніл-2-ілметил)-7-(2-морфолін-4-ілфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;

- 1-(1,1'-біфеніл-3-ілметил)-7-(2-морфолін-4-ілфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 1-(1,1'-біфеніл-4-ілметил)-7-(2-морфолін-4-ілфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 5 1-(2,4-диметилбензил)-7-(2-морфолін-4-ілфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 1-(2,6-дихлорбензил)-7-(2-морфолін-4-ілфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 10 1-(4-карбоксибензил)-7-(2-морфолін-4-ілфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 7-(6,6-диметилциклогекс-1-ен-1-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 7-(5,5-диметилциклопент-1-ен-1-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 15 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(7-фенілциклогепт-1-ен-1-іл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-трицикло(4.3.1.1^{3,8})ундец-4-ен-4-іл-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2-фенілциклогепт-1-ен-1-іл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2,6,6-триметилциклогекс-1-ен-1-іл)-1H-індол-2-карбонова
- 20 кислота;
- 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-((1R, 4R)-1,7,7-триметилбіцикло(2.2.1)гепт-2-ен-2-іл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-4-(трифторметил)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 25 7-(2-морфолін-4-ілфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-4-(трифторметил)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 1-(2-(диметиламіно)етил)-7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 7-(1,1'-біфеніл-2-ілметил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 30 7-(1,1'-біфеніл-3-ілметил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 7-(1-(2-(1-нафтилокси)етил)вініл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2-(феноксиметил)бензил)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2-(2-феноксіетил)феніл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(3-(2-феноксіетил)феніл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 35 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2-(3-феноксипропіл)феніл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(3-(3-феноксипропіл)феніл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 3-(3-(3-гідрокси-2-метилфенокси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 3-(3-(3-(2-метоксіетокси)-2-метилфенокси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова
- 40 кислота;
- 7-(1,2-диметилпроп-1-еніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 3-(3-(2-метил-3-(2-морфолін-4-ілетокси)фенокси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 3-(3-(2,3-дихлорфенокси)пропіл)-7-(2-морфолін-4-ілфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 1-(2-морфолін-4-ілетил)-7-(2-морфолін-4-ілфеніл)-3-(3-(5,6,7,8-тетрагідронафталін-1-
- 45 ілокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилтіо)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 3-(3-(3-(2-метоксіетокси)-5-метилфенокси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 7-(2-морфолін-4-ілфеніл)-3-(3-(5,6,7,8-тетрагідронафталін-1-ілокси)пропіл)-1H-індол-2-
- 50 карбонова кислота;
- 3-(3-(3-метил-5-(3-морфолін-4-ілпропокси)фенокси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 3-(3-(3-(3-циклогексилпропокси)-5-метилфенокси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 55 3-(3-(3-(3-(2-карбокси-1H-індол-3-іл)пропокси)-5-метилфенокси)пропіл)-7-(2-морфолін-4-ілфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 7-бром-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1-(піридин-4-ілметил)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 7-(2-морфолін-4-ілфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1-(піридин-4-ілметил)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 60 7-(1,1'-бі(циклогексан)-2-ен-2-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;

- 3-(3-(2,3-дихлорфенокси)пропіл)-7-(1,2-диметилпроп-1-еніл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1-(піридин-2-ілметил)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 5 7-(2-метил-4-(трифторметил)феніл)-3-(3-(2,3,5-триметилфенокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
7-(4-фтор-2-метилфеніл)-3-(3-(2,3,5-триметилфенокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
7-(4-метокси-2-метилфеніл)-3-(3-(2,3,5-триметилфенокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 10 7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1-(піридин-3-ілметил)-1H-індол-2-карбонова кислота;
6-метил-7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
3-(3-(2,3-дихлорфенокси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1-(піридин-2-ілметил)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 15 7-(2-метилфеніл)-1-(2-морфолін-4-іл-2-оксоетил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
3-(3-(3,5-дихлорфенокси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
1-метил-7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
1-метил-7-(2-морфолін-4-ілфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 20 1-(3-(амінометил)бензил)-7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
1-(3-(амінометил)бензил)-7-(2-морфолін-4-ілфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
7-((E)-2-(2-((E)-2-циклогексилвініл)феніл)вініл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 25 7-(2-(3-карбоксифеніл)етил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-((E)-2-(2-піридин-3-ілфеніл)вініл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2-(3-(((фенілсульфоніл)аміно)карбоніл)феніл)етил)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 30 7-(2-(3-((4-метилпіперидин-1-іл)карбоніл)феніл)етил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2-(3-(((2-піролідін-1-ілетил)аміно)карбоніл)феніл)етил)-1H-індол-2-карбонова кислота;
7-(2-(3-(((2-морфолін-4-ілетил)аміно)карбоніл)феніл)етил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 35 7-(2-(3-(((2-диметиламіно)етил)аміно)карбоніл)-феніл)етил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-((E)-2-(3-(((фенілсульфоніл)аміно)карбоніл)феніл)вініл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 40 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-((E)-2-(2-піридин-4-ілфеніл)вініл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
7-((E)-2-(3-хлорфеніл)вініл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
7-((E)-2-(3-((циклогексиламіно)карбоніл)феніл)вініл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 45 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-((E)-2-(3-(((2-феноксіетил)аміно)карбоніл)феніл)вініл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
7-((E)-2-(3-(((2-(2-аміноетокси)етокси)етил)аміно)-карбоніл)феніл)вініл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 50 7-((E)-2-(3-((4-бензилпіперидин-1-іл)карбоніл)феніл)вініл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-((E)-2-(3-((4-фенілпіперазин-1-іл)карбоніл)феніл)вініл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
7-((E)-2-(3-((3-метилпіперидин-1-іл)карбоніл)феніл)вініл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 55 7-(2-(3-(((2-(2-аміноетокси)етокси)етил)аміно)-карбоніл)феніл)етил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-((E)-2-(3-((E)-2-фенілвініл)феніл)вініл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 60 7-((E)-2-(1,1'-біфеніл-3-іл)вініл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;

- 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-((E)-2-(3-((1E)-3-фенілпроп-1-еніл)феніл)вініл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-((E)-2-(4-((E)-2-фенілвініл)феніл)вініл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 5 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-((E)-2-(4-((1E)-3-фенілпроп-1-еніл)феніл)вініл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 7-((E)-2-(1,1'-біфеніл-4-іл)вініл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 7-(2-(1,1'-біфеніл-3-іл)етил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2-(3-(3-фенілпропіл)феніл)етил)-1H-індол-2-карбонова
- 10 кислота;
- 7-((E)-2-(2-хлорфеніл)вініл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 7-((E)-2-(1,1'-біфеніл-2-іл)вініл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-((E)-2-(2-((E)-2-фенілвініл)феніл)вініл)-1H-індол-2-карбонова
- кислота;
- 15 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2-фенілетил)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 7-(2-(2-хлорфеніл)етил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 7-(2-(1,1'-біфеніл-4-іл)етил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2-(4-(2-фенілетил)феніл)етил)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2-(4-(3-фенілпропіл)феніл)етил)-1H-індол-2-карбонова
- 20 кислота;
- 7-(4-карбокси-2-метилфеніл)-3-(3-((2-ціанохінолін-8-іл)окси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 3-(3-((2-ацетил-1-бензофуран-7-іл)окси)пропіл)-7-(4-карбокси-2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 25 7-(4-карбокси-2-метилфеніл)-3-(3-((2,2-диметил-2,3-дигідро-1-бензофуран-7-іл)окси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 7-(4-карбокси-2-метилфеніл)-3-(3-(2,3-дифторфенокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 7-(4-карбокси-2-метилфеніл)-3-(3-(3-метил-2-нітрофенокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова
- 30 кислота;
- 7-(4-карбокси-2-метилфеніл)-3-(3-(2-метил-3-нітрофенокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 7-(4-карбокси-2-метилфеніл)-3-(3-(2-хлор-3-(трифторметил)фенокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 35 7-(4-карбокси-2-метилфеніл)-3-(3-(2-фтор-3-(трифторметил)фенокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 7-(2-хлорфеніл)-3-(3-(етил(1-нафтил)аміно)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 7-(4-(морфолін-4-ілкарбоніл)-2-(трифторметил)феніл)-3-(4-(5-оксо-2,3,4,5-тетрагідро-1H-1-бензазепін-1-іл)бутил)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 40 7-(4-(морфолін-4-ілкарбоніл)-2-(трифторметил)феніл)-3-(4-(2,3,4,5-тетрагідро-1H-1-бензазепін-1-іл)бутил)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 3-(4-(2,3-дигідро-4H-1,4-бензотіазин-4-іл)бутил)-7-(4-(морфолін-4-ілкарбоніл)-2-(трифторметил)феніл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 3-(4-(3,4-дигідрохінолін-1(2H)-іл)бутил)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 45 3-(4-(2-метил-3,4-дигідрохінолін-1(2H)-іл)бутил)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 3-(4-(6-метил-3,4-дигідрохінолін-1(2H)-іл)бутил)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 3-(4-(8-метил-3,4-дигідрохінолін-1(2H)-іл)бутил)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова
- 50 кислота;
- 3-(4-(2-метил-2,3-дигідро-1H-індол-1-іл)бутил)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 7-(2-метилфеніл)-3-(4-(2,3,4,5-тетрагідро-1H-1-бензазепін-1-іл)бутил)-1H-індол-2-карбонова
- кислота;
- 55 3-(4-(3-метил-3,4-дигідрохінолін-1(2H)-іл)бутил)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 3-(4-(3-(гідроксиметил)-3,4-дигідрохінолін-1(2H)-іл)бутил)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
- 3-(4-(2,3-дигідро-4H-1,4-бензотіазин-4-іл)бутил)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова
- 60 кислота;

- 4-метоксі-7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 3-(3-(((1R, 4S)-8-гідрокси-1,2,3,4-тетрагідро-1,4-метанонафталін-5-іл)окси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-(2-метилфеніл)-3-(3-(((1R, 4S)-1,2,3,4-тетрагідро-1,4-метанонафталін-5-ілокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 3-(3-((4-метокси-1-нафтил)окси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-(2-метилфеніл)-3-(3-((2-нітро-1-нафтил)окси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 3-(3-((3-гідрокси-1-нафтил)окси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-(3,5-диметилізоксазол-4-іл)-3-(3-(2,3,6,7-тетрагідро-1H, 5H-піридо(3,2,1-ij)хінолін-8-ілокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-(2-метилфеніл)-3-(3-(2,3,6,7-тетрагідро-1H, 5H-піридо(3,2,1-ij)хінолін-8-ілокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-(2-метилфеніл)-3-(3-((2-нітрозо-1-нафтил)окси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 3-(3-((5-гідрокси-1-нафтил)окси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-(2-метилфеніл)-3-(3-(2,3,4-трифторфенокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 3-(3-(3-хлор-2-метилфенокси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 3-(3-((8-гідрокси-1-нафтил)окси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 3-(3-(3-хлор-2-ціанфенокси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 3-(3-(2-бром-3-метилфенокси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-(2-метилфеніл)-3-(3-(3-метил-2-вінілфенокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 3-(3-(3-метил-2-нітрофенокси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 3-(3-(2-аміно-3-метилфенокси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-(4-(морфолін-4-ілкарбоніл)-2-(трифторметил)феніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 3-(3-((6-аміно-1-нафтил)окси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1,2,3,4-тетрагідронафталін-1-ілокси)проп-1-ініл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 3-(3-((6-(акрилоїламіно)-1-нафтил)окси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-(2-метилфеніл)-3-(3-((6-(пропіоніламіно)-1-нафтил)окси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1,2,3,4-тетрагідронафталін-1-ілокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 3-(3-((6-метокси-1-нафтил)окси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 1-(4-метоксибензил)-7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)проп-1-ініл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 3-(3-((2,3,4,5,6,7,8-гептафтор-1-нафтил)окси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 3-(3-(1-бензотієн-7-ілокси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 3-(3-((4-фтор-1-нафтил)окси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 3-(3-((8-фтор-1-нафтил)окси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 3-(3-((5-фтор-1-нафтил)окси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-фтор-3-(2-ізопропілфеніл)-1-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-фтор-3-(2-метилфеніл)-1-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 3-(3-((5-фтор-1-нафтил)окси)пропіл)-7-(1,3,5-триметил-1H-піразол-4-іл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1-(піридин-4-ілметил)-7-(1,3,5-триметил-1H-піразол-4-іл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1-(піридин-2-ілметил)-7-(1,3,5-триметил-1H-піразол-4-іл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1-(піридин-3-ілметил)-7-(1,3,5-триметил-1H-піразол-4-іл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-2-(1H-тетразол-5-іл)-1H-індол;
 1-(4-метоксибензил)-7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-2-(1H-тетразол-5-іл)-1H-індол;
 7-(1-метил-1H-імідазол-5-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 1-(2-(диметиламіно)-2-оксоетил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(1,3,5-триметил-1H-піразол-4-іл)-1H-індол-2-карбонова кислота;
 1-(2-(4-метилпіперазин-1-іл)-2-оксоетил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(1,3,5-триметил-1H-піразол-4-іл)-1H-індол-2-карбонова кислота;

7-(4,6-диметилпіримідин-5-іл)-1-(2-морфолін-4-іл-2-оксоетил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;

1-(2-(4-метилпіперазин-1-іл)етил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(1,3,5-триметил-1Н-піразол-4-іл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;

5 1-(2-морфолін-4-ілетил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(1,3,5-триметил-1Н-піразол-4-іл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;

1-(2-морфолін-4-іл-2-оксоетил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(1,3,5-триметил-1Н-піразол-4-іл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;

10 1-(2-(диметиламіно)етил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(1,3,5-триметил-1Н-піразол-4-іл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;

7-(2-метилімідазо(1,2-а)піридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;

7-(2-(1Н-імідазол-1-іл)-4-метилпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1-(піридин-2-ілметил)-1Н-індол-2-карбонова кислота;

15 7-(2-етил-4-метилпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1-(піридин-2-ілметил)-1Н-індол-2-карбонова кислота;

7-(2-етил-4-метилпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1-((1-(піридин-4-ілметил)піридин-4-іл)метил)-1Н-індол-2-карбоксилат;

20 7-(2-етил-4-метилпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1-(піридин-4-ілметил)-1Н-індол-2-карбонова кислота;

7-(2-етил-4-метилпіридин-3-іл)-1-(2-морфолін-4-іл-2-оксоетил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;

1-(2-(диметиламіно)-2-оксоетил)-7-(2-етил-4-метилпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;

25 7-(2-етил-4-метилпіридин-3-іл)-1-(2-(4-метилпіперазин-1-іл)-2-оксоетил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;

7-(2-етил-4-метилпіридин-3-іл)-1-(2-морфолін-4-ілетил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;

30 1-(2-(диметиламіно)етил)-7-(2-етил-4-метилпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;

7-(2-етил-4-метилпіридин-3-іл)-1-(2-(4-метилпіперазин-1-іл)етил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;

7-(2-((4-(4-карбоксифеніл)піперазин-1-іл)метил)феніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;

35 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2-піперазин-1-ілпіридин-3-іл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;

1-(2-(диметиламіно)-2-оксоетил)-7-(2-(1Н-імідазол-1-іл)-4-метилпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;

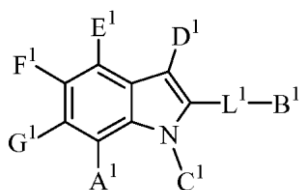
40 7-(2-(1Н-імідазол-1-іл)-4-метилпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1-(піридин-3-ілметил)-1Н-індол-2-карбонова кислота;

7-(2-(1Н-імідазол-1-іл)-4-метилпіридин-3-іл)-1-(2-морфолін-4-іл-2-оксоетил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота;

7-(2-(1Н-імідазол-1-іл)-4-метилпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1-(2-оксо-2-піперазин-1-ілетил)-1Н-індол-2-карбонова кислота;

45 і їх терапевтично прийнятних солей, проліків, складних ефірів, амідів, солей проліків, солей складних ефірів і солей амідів.

Ще один варіант втілення стосується способів лікування ссавців, які страждають захворюванням, що характеризується надекспресією або порушеною регуляцією білка Mcl-1, що включають введення таким ссавцям терапевтично ефективної кількості сполуки Формули I



(I),

і її терапевтично прийнятних солей, де

A^1 являє собою A^2 , OA^2 , SA^2 , $S(O)A^2$, SO_2A^2 , NH_2 , NHA^2 , $N(A^2)_2$, $C(O)A^2$, $C(O)NH_2$, $C(O)NHA^2$, $C(O)N(A^2)_2$, $NHC(O)A^2$, $NA^2C(O)A^2$, $NHSO_2A^2$, $NA^2SO_2A^2$, $NHC(O)OA^2$, $NA^2C(O)OA^2$, SO_2NH_2 , SO_2NHA^2 , $SO_2N(A^2)_2$, $NHC(O)NH_2$, $NHC(O)A^2$, $NHC(O)N(A^2)_2$, $NA^2C(O)N(A^2)_2$;

A^2 являє собою R^1 , R^2 , R^3 , R^4 ;

5 R^1 являє собою феніл, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або R^{1A} ; R^{1A} являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

R^2 являє собою гетероарил, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або R^{2A} ; R^{2A} являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

10 R^3 являє собою циклоалкіл, циклоалкеніл, гетероциклоалкіл або гетероциклоалкеніл, кожний з яких є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або R^{3A} ; R^{3A} являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

R^4 являє собою алкіл, алкеніл або алкініл, кожний з яких є незаміщеним або заміщений одним, двома, трьома, чотирма або п'ятьма замісниками, незалежно вибраними з R^5 , OR^5 , SR^5 , $S(O)R^5$, SO_2R^5 , NH_2 , NHR^5 , $N(R^5)_2$, $C(O)R^5$, $C(O)NH_2$, $C(O)NHR^5$, $C(O)N(R^5)_2$, $NHC(O)R^5$, $NR^5C(O)R^5$, $NHSO_2R^5$, $NR^5SO_2R^5$, $NHC(O)OR^5$, $NR^5C(O)OR^5$, SO_2NH_2 , SO_2NHR^5 , $SO_2N(R^5)_2$, $NHC(O)NH_2$, $NHC(O)R^5$, $NHC(O)N(R^5)_2$, $NR^5C(O)N(R^5)_2$, OH , (O) , $C(O)OH$, CN , CF_3 , OCF_3 , CF_2CF_3 , F , Cl , Br або I ;

20 R^5 являє собою R^6 , R^7 або R^8 ;

R^6 являє собою феніл, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або R^{6A} ; R^{6A} являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

25 R^7 являє собою гетероарил, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або R^{7A} ; R^{7A} являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

R^8 являє собою циклоалкіл, циклоалкеніл, гетероциклоалкіл або гетероциклоалкеніл, кожний з яких є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або R^{8A} ; R^{8A} являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

30 L^1 являє собою зв'язок або являє собою алкілен, алкенілен, алкінілен або L^2 ; i B^1 являє собою $C(O)OH$ або його біоізостеру, або являє собою $C(O)OR^1$, $C(O)OR^2$, $C(O)OR^3$ або $C(O)OR^4$;

L^2 являє собою C_2 - C_6 -алкілен, C_4 - C_6 -алкенілен або C_4 - C_6 -алкінілен, кожний з яких містить одну CH_2 групу, заміщену групою O , S , $S(O)$, SO_2 , NH або $N(W^1)$;

W^1 являє собою алкіл, алкеніл або алкініл;

35 C^1 і D^1 незалежно являють собою H , R^9 , R^{10} , R^{11} або R^{12} ; або один з C^1 і D^1 являє собою H , а інший являє собою R^9 , R^{10} , R^{11} або R^{12} ;

R^9 являє собою феніл, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або R^{9A} ; R^{9A} являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

40 R^{10} являє собою гетероарил, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або R^{10A} ; R^{10A} являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

R^{11} являє собою циклоалкіл, циклоалкеніл, гетероциклоалкіл або гетероциклоалкеніл, кожний з яких є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або R^{11A} ; R^{11A} являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

45 R^{12} являє собою алкіл, алкеніл або алкініл, кожний з яких є незаміщеним або заміщений одним, двома, трьома, чотирма або п'ятьма замісниками, незалежно вибраними з R^{13} , OR^{13} , SR^{13} , $S(O)R^{13}$, SO_2R^{13} , NH_2 , NHR^{13} , $N(R^{13})_2$, $C(O)R^{13}$, $C(O)NH_2$, $C(O)NHR^{13}$, $C(O)N(R^{13})_2$, $NHC(O)R^{13}$, $NR^{13}C(O)R^{13}$, $NHC(O)OR^{13}$, $NR^{13}C(O)OR^{13}$, $NHSO_2R^{13}$, $NR^{13}SO_2R^{13}$, $NHC(O)OR^{13}$, $NR^{13}C(O)OR^{13}$, SO_2NH_2 , SO_2NHR^{13} , $SO_2N(R^{13})_2$, $NHC(O)NH_2$, $NHC(O)R^{13}$, $NHC(O)N(R^{13})_2$, OH , (O) , $C(O)OH$, CN , CF_3 , OCF_3 , CF_2CF_3 , F , Cl , Br або I ;

R^{13} являє собою R^{14} , R^{15} або R^{16} ;

55 R^{14} являє собою феніл, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або R^{14A} ; R^{14A} являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

R^{15} являє собою гетероарил, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або R^{15A} ; R^{15A} являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

R^{16} являє собою циклоалкіл, циклоалкеніл, гетероциклоалкіл або гетероциклоалкеніл, кожний з яких є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або R^{16A} ; R^{16A} являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен; і

5 один або два, або кожний, з E^1 і F^1 , і G^1 незалежно являють собою H, F, Cl, Br або I, а інші незалежно являють собою R^{17} , R^{18} , R^{19} або R^{20} ;

R^{17} являє собою феніл, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або R^{17A} ; R^{17A} являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

10 R^{18} являє собою гетероарил, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або R^{18A} ; R^{18A} являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

R^{19} являє собою циклоалкіл, циклоалкеніл, гетероциклоалкіл або гетероциклоалкеніл, кожний з яких є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або R^{19A} ; R^{19A} являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

15 R^{20} являє собою алкіл, алкеніл або алкініл, кожний з яких є незаміщеним або заміщений одним, двома, трьома, чотирма або п'ятьма замісниками, незалежно вибраними з R^{20} , OR^{20} , SR^{20} , $S(O)R^{20}$, SO_2R^{20} , NH_2 , NHR^{20} , $N(R^{20})_2$, $C(O)R^{20}$, $C(O)NH_2$, $C(O)NHR^{20}$, $C(O)N(R^{20})_2$, $NHC(O)R^{20}$, $NHC(O)R^{20}$, $NR^{20}C(O)R^{20}$, $NR^{20}C(O)R^{20}$, $NHSO_2R^{20}$, $NR^{20}SO_2R^{20}$, $NHC(O)OR^{20}$, $NR^{20}C(O)OR^{20}$, SO_2NH_2 , SO_2NHR^{20} , $SO_2N(R^{20})_2$, $NHC(O)NH_2$, $NHC(O)R^{20}$, $NHC(O)N(R^{20})_2$, $NR^{20}C(O)N(R^{20})_2$, OH, (O), $C(O)OH$, CN, CF_3 , OCF_3 , CF_2CF_3 , F, Cl, Br або I;

R^{20} являє собою R^{21} , R^{22} або R^{23} ;

R^{21} являє собою феніл, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або R^{21A} ; R^{21A} являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

25 R^{22} являє собою гетероарил, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або R^{22A} ; R^{22A} являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

R^{23} являє собою циклоалкіл, циклоалкеніл, гетероциклоалкіл або гетероциклоалкеніл, кожний з яких є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або R^{23A} ; R^{23A} являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

30 де кожна з зазначених вище циклічних груп, незалежно, є незаміщеною або заміщена одним або двома, або трьома, або чотирма, або п'ятьма замісниками, незалежно вибраними зі спірогетероалкілу, R^{30} , OR^{30} , OCH_2R^{30} , SR^{30} , $S(O)R^{30}$, SO_2R^{30} , $C(O)R^{30}$, $CO(O)R^{30}$, $C(O)R^{30}$, $C(O)OR^{30}$, NO_2 , NH_2 , NHR^{30} , $N(R^{30})_2$, CH_2R^{30} , $C(O)NH_2$, $C(O)NHR^{30}$, $C(O)N(R^{30})_2$, $NHC(O)R^{30}$, $NR^{30}C(O)R^{30}$, $C(O)NHOH$, $C(O)NHOR^{30}$, $C(O)NHSO_2R^{30}$, $C(O)NR^{30}SO_2R^{30}$, SO_2NH_2 , SO_2NHR^{30} , $SO_2N(R^{30})_2$, CF_3 , CF_2CF_3 , $C(O)H$, $C(O)OH$, $C(N)NH_2$, $C(N)NHR^{30}$, $C(N)N(R^{30})_2$, $=NO$ -(алкілен)- $C(O)CF_3$, $CNOH$, $CNOCH_3$, OH, (O), N_3 , CF_3 , CF_2CF_3 , OCF_3 , OCF_2CF_3 , F, Cl, Br або I;

R^{30} являє собою R^{31} , R^{32} , R^{33} або R^{34} ;

40 R^{31} являє собою феніл, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або R^{31A} ; R^{31A} являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

R^{32} являє собою гетероарил, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або R^{32A} ; R^{32A} являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

45 R^{33} являє собою циклоалкіл, циклоалкеніл, гетероциклоалкіл або гетероциклоалкеніл, кожний з яких є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або R^{33A} ; R^{33A} являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

50 R^{34} являє собою алкіл, алкеніл або алкініл, кожний з яких є незаміщеним або заміщений одним, двома, трьома, чотирма або п'ятьма замісниками, незалежно вибраними з R^{35} , OR^{35} , SR^{35} , $S(O)R^{35}$, SO_2R^{35} , NH_2 , NHR^{35} , $N(R^{35})_2$, $C(O)R^{35}$, $C(O)NH_2$, $C(O)NHR^{35}$, $C(O)N(R^{35})_2$, $NHC(O)R^{35}$, $NR^{35}C(O)R^{35}$, $NHSO_2R^{35}$, $NR^{35}SO_2R^{35}$, $NHC(O)OR^{35}$, $NR^{35}C(O)OR^{35}$, SO_2NH_2 , SO_2NHR^{35} , $SO_2N(R^{35})_2$, $NHC(O)NH_2$, $NHC(O)R^{35}$, $NHC(O)N(R^{35})_2$, $NR^{35}C(O)N(R^{35})_2$, OH, (O), $C(O)OH$, CN, CF_3 , OCF_3 , CF_2CF_3 , F, Cl, Br або I;

55 R^{35} являє собою R^{36} , R^{37} , R^{38} або R^{39} ;

R^{36} являє собою феніл, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або R^{36A} ; R^{36A} являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

R^{37} являє собою гетероарил, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або R^{37A} ; R^{37A} являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

5 R^{38} являє собою циклоалкіл, циклоалкеніл, гетероциклоалкіл або гетероциклоалкеніл, кожний з яких є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або R^{38A} ; R^{38A} являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

R^{39} являє собою алкіл, алкеніл або алкініл, кожний з яких є незаміщеним або заміщений групою R^{40} ;

10 R^{40} являє собою феніл, гетероарил, циклоалкіл, циклоалкеніл або гетероциклоалкіл; де групи, представлені як R^{31} , R^{32} , R^{33} , R^{36} , R^{37} , R^{38} і R^{40} є, незалежно, незаміщеними або заміщені одним або двома, або трьома замісниками, незалежно вибраними з R^{50} , F, Cl, Br, I, C(O)OH, NO₂, NH₂, CF₃, (O) або OH;

R^{50} являє собою R^{51} , R^{52} , R^{53} або R^{54} ;

15 R^{51} являє собою феніл, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або R^{51A} ; R^{51A} являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

R^{52} являє собою гетероарил, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або R^{52A} ; R^{52A} являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

20 R^{53} являє собою циклоалкіл, циклоалкеніл, гетероциклоалкіл або гетероциклоалкеніл, кожний з яких є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або R^{53A} ; R^{53A} являє собою циклоалкан, циклоалкен, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен; і

R^{54} являє собою алкіл, алкеніл або алкініл,

25 з або без введення одного або більше одного додаткового терапевтичного засобу, і з або без введення також променевої терапії ссавцям.

Ще один варіант втілення включає способи лікування ссавців, які страждають захворюванням, що характеризується надекспресією або порушеною регуляцією білка Mcl-1, що включають введення ссавцям терапевтично ефективних кількостей сполуки Формули I і одного або більш ніж одного додаткового терапевтичного засобу, і з або без введення також променевої терапії ссавцям.

ДОКЛАДНИЙ ОПИС ВИНАХОДУ

У даній заявці різні групи сполук, що мають змінні значення, представлені символами (заголовні букви з цифровими і/або буквеними індексами), і вони можуть мати конкретне втілення.

35 Повинно бути зрозуміло, що потрібні валентності зберігаються для всіх комбінацій, зазначених у даній заявці, що одновалентні групи, які містять більше одного атома, приєднані через їх ліві кінці, і що двовалентні групи представлені зліва направо.

Також повинно бути зрозуміло, що конкретний варіант втілення групи, яка має змінні значення, може бути таким же або відмінним від іншого конкретного варіанту втілення, що має таке ж позначення.

40 Термін "алкеніл", як він використовується у даній заявці, означає одновалентні вуглеводневі групи з лінійним або розгалуженим ланцюгом, що містять один або декілька вуглець-вуглецевих подвійних зв'язків, такі як C₂-алкеніл, C₃-алкеніл, C₄-алкеніл, C₅-алкеніл, C₆-алкеніл і подібні.

45 Термін "алкенілен", як він використовується у даній заявці, означає двовалентні вуглеводневі групи з лінійним або розгалуженим ланцюгом, що містять один або декілька вуглець-вуглецевих подвійних зв'язків, такі як C₂-алкенілен, C₃-алкенілен, C₄-алкенілен, C₅-алкенілен, C₆-алкенілен і подібні.

50 Термін "алкіл", як він використовується у даній заявці, означає одновалентні насичені вуглеводневі групи з лінійним або розгалуженим ланцюгом, такі як C₁-алкіл, C₂-алкіл, C₃-алкіл, C₄-алкіл, C₅-алкіл, C₆-алкіл і подібні.

Термін "алкілен", як він використовується у даній заявці, означає двовалентні насичені вуглеводневі групи з лінійним або розгалуженим ланцюгом, такі як C₁-алкілен, C₂-алкілен, C₃-алкілен, C₄-алкілен, C₅-алкілен, C₆-алкілен і подібні.

55 Термін "алкініл", як він використовується у даній заявці, означає одновалентні вуглеводневі групи з лінійним або розгалуженим ланцюгом, що містять один або декілька вуглець-вуглецевих потрійних зв'язків, такі як C₂-алкініл, C₃-алкініл, C₄-алкініл, C₅-алкініл, C₆-алкініл і подібні.

Термін "алкінілен", як він використовується у даній заявці, означає двовалентні вуглеводневі групи з лінійним або розгалуженим ланцюгом, що містять один або декілька вуглець-вуглецевих потрійних зв'язків, такі як C₂-алкінілен, C₃-алкінілен, C₄-алкінілен, C₅-алкінілен, C₆-алкінілен і подібні.

60

Термін "C(O)OH біоізостера", як він використовується у даній заявці, означає групу з, власне кажучи, такою ж фізичною або хімічною властивістю, що надає аналогічні біологічні властивості сполуці Формули (I). Приклади C(O)OH біоізостер включають одновалентні радикали, утворені шляхом видалення одного атома водню з молекули, такої як ізотіазол-3(2H)-он 1,1-діоксид, ізотіазолідин-3-он 1,1-діоксид, 1,2,4-оксадіазол-5(2H)-он, 1,2,5-тіадіазолідин-3-он 1,1-діоксид, 1,2,5-тіадіазол-3-ол, 1,2,4-оксадіазолідин-3,5-діон, 2H-тетразол і подібні.

Термін "циклоалкан", як він використовується у даній заявці, означає насичені циклічні або біциклічні вуглеводневі групи, такі як C₄-циклоалкан, C₅-циклоалкан, C₆-циклоалкан, C₇-циклоалкан, C₈-циклоалкан, C₉-циклоалкан, C₁₀-циклоалкан, C₁₁-циклоалкан, C₁₂-циклоалкан і подібні.

Термін "циклоалкіл", як він використовується у даній заявці, означає одновалентні насичені циклічні і біциклічні вуглеводневі групи, такі як C₃-циклоалкіл, C₄-циклоалкіл, C₅-циклоалкіл, C₆-циклоалкіл, C₇-циклоалкіл, C₈-циклоалкіл, C₉-циклоалкіл, C₁₀-циклоалкіл, C₁₁-циклоалкіл, C₁₂-циклоалкіл і подібні.

Термін "циклоалкен", як він використовується у даній заявці, означає циклічні і біциклічні вуглеводневі групи, що містять один або декілька вуглець-вуглецевих подвійних зв'язків, такі як C₅-циклоалкен, C₆-циклоалкен, C₇-циклоалкен, C₈-циклоалкен, C₉-циклоалкен, C₁₀-циклоалкен, C₁₁-циклоалкен, C₁₂-циклоалкен і подібні.

Термін "циклоалкеніл", як він використовується у даній заявці, означає одновалентні циклічні вуглеводневі групи, що містять один або декілька вуглець-вуглецевих подвійних зв'язків, такі як C₄-циклоалкеніл, C₅-циклоалкеніл, C₆-циклоалкеніл, C₇-циклоалкеніл, C₈-циклоалкеніл, C₉-циклоалкеніл, C₁₀-циклоалкеніл, C₁₁-циклоалкеніл, C₁₂-циклоалкеніл і подібні.

Термін "гетероарен", як він використовується у даній заявці, означає фуран, імідазол, ізотіазол, ізоксазол, 1,2,3-оксадіазол, 1,2,5-оксадіазол, 1,3,4-оксадіазол, оксазол, піразин, піразол, піридазин, піридин, піримідин, пірол, тіазол, 1,3,4-тіадіазол, тіофен, триазин і 1,2,3-триазол.

Термін "гетероарил", як він використовується у даній заявці, означає фураніл, імідазоліл, ізотіазоліл, ізоксазоліл, 1,2,3-оксадіазоліл, 1,2,5-оксадіазоліл, 1,3,4-оксадіазоліл, оксазоліл, піразиніл, піразоліл, піридазиніл, піридиніл, піримідиніл, піроліл, тетразоліл, тіазоліл, 1,2,3-тіадіазоліл, 1,2,5-тіадіазоліл, 1,3,4-тіадіазоліл, тіофеніл, триазиніл і 1,2,3-триазоліл.

Термін "гетероциклоалкан", як він використовується у даній заявці, означає циклоалкан, що містить одну або дві, або три CH₂ групи, заміщені групами, незалежно вибраними з O, S, S(O), SO₂ або NH, і одну або дві CH групи, незаміщені або заміщені групою N, а також означає циклоалкан, що містить одну або дві, або три CH₂ групи, незаміщені або заміщені групами, незалежно вибраними з O, S, S(O), SO₂ або NH, і одну або дві CH групи, заміщені групою N.

Термін "гетероциклоалкен", як він використовується у даній заявці, означає циклоалкен, що містить одну або дві, або три CH₂ групи, заміщені групами, незалежно вибраними з O, S, S(O), SO₂ або NH, і одну або дві CH групи, незаміщені або заміщені групою N, а також означає циклоалкен, що містить одну або дві, або три CH₂ групи, незаміщені або заміщені групами, незалежно вибраними з O, S, S(O), SO₂ або NH, і одну або дві CH групи, заміщені групою N.

Термін "гетероциклоалкіл", як він використовується у даній заявці, означає циклоалкіл, що містить одну або дві, або три CH₂ групи, заміщені групами, незалежно вибраними з O, S, S(O), SO₂ або NH, і одну або дві CH групи, незаміщені або заміщені групою N, а також означає циклоалкіл, що містить одну або дві, або три CH₂ групи, незаміщені або заміщені групами, незалежно вибраними з O, S, S(O), SO₂ або NH, і одну або дві CH групи, заміщені групою N.

Термін "гетероциклоалкеніл", як він використовується у даній заявці, означає циклоалкеніл, що містить одну або дві, або три CH₂ групи, заміщені групами, незалежно вибраними з O, S, S(O), SO₂ або NH, і одну або дві CH групи, незаміщені або заміщені групою N, і також означає циклоалкеніл, що містить одну або дві, або три CH₂ групи, незаміщені або заміщені групами, незалежно вибраними з O, S, S(O), SO₂ або NH, і одну або дві CH групи, заміщені групою N.

Термін "спіроалкіл", як він використовується у даній заявці, означає насичені двовалентні вуглеводневі групи, обидва кінці яких приєднані до того самого атома вуглецю, такі як C₂-спіроалкіл, C₃-спіроалкіл, C₄-спіроалкіл, C₅-спіроалкіл і подібні.

Термін "циклічна група", як він використовується у даній заявці, означає бензол, циклоалкан, циклоалкіл, циклоалкен, циклоалкеніл, гетероарен, гетероарил, гетероциклоалкан, гетероциклоалкіл, гетероциклоалкен, гетероциклоалкеніл, феніл і спіроалкіл.

Сполуки за даним винаходом можуть містити асиметрично заміщені вуглецеві атоми в R або S конфігурації, при цьому терміни "R" і "S" визначені у Pure Appl. Chem. (1976) 45, 13-10. Сполуки, що містять асиметрично заміщені вуглецеві атоми з рівними кількостями R і S конфігурацій, є рацемічними по цих атомах. Для атомів, що мають надлишок однієї конфігурації

відносно іншої, вказується надлишок конфігурації, переважно, надлишок близько 85 %-90 %, більш переважно, надлишок близько 95 %-99 %, і ще більш переважно, надлишок більш ніж близько 99 %. Відповідно, передбачається, що даний винахід охоплює рацемічні суміші, відносні та абсолютні діастереоізомери і їх поєднання.

5 Сполуки за даним винаходом також можуть містити вуглець-вуглецеві подвійні зв'язки або вуглець-азотні подвійні зв'язки у Z або E конфігурації, при цьому термін "Z" представляє два більш великі замісники на одній і тій же стороні вуглець-вуглецевого або вуглець-азотного подвійного зв'язку, а термін "E" представляє два більш крупних замісники на протилежних сторонах вуглець-вуглецевого або вуглець-азотного подвійного зв'язку. Сполуки за даним

10 винаходом також можуть існувати у вигляді суміші "Z" і "E" ізомерів.
Сполуки за даним винаходом, що містять групи NH, C(O)H, C(O)OH, C(O)NH₂, OH або SH, можуть містити приєднані до них групи, що утворюють проліки. Групи, що утворюють проліки, видаляються під дією метаболічних процесів і вивільняють сполуки, які містять *in vivo* вільні групи NH, C(O)H, C(O)OH, C(O)NH₂, OH або SH. Проліки є корисними для регулювання таких

15 фармакокінетичних властивостей сполук, як розчинність і/або гідрофобність, абсорбція у шлунково-кишковому тракті, біодоступність, проникнення у тканини і швидкість виведення з організму.

Метаболіти сполук Формули I, утворені у процесі метаболізму *in vitro* або *in vivo*, також можуть бути корисними для лікування захворювань, що викликані або загострюються через

20 білок Mcl-1, що надекспресується або не регулюється.
Деякі сполуки, що є попередниками сполук Формули I, можуть метаболізуватися в умовах *in vitro* або *in vivo* з утворенням сполук Формули I і, таким чином, також можуть бути корисними для лікування захворювань, що викликані або загострюються через білок Mcl-1, що надекспресується або не регулюється.

25 Сполуки Формули I можуть існувати у вигляді кислотно-адитивних солей, основно-адитивних солей або цвітер-іонів. Солі сполук Формули I одержують у процесі їх виділення або після їх очищення. Кислотно-адитивні солі являють собою такі, які одержані у результаті взаємодії сполуки Формули I з кислотою. Відповідно, передбачається, що солі, які включають ацетатні, адипатні, альгінатні, бікарбонатні, цитратні, аспартатні, бензоатні, бензолсульфонатні

30 (безилатні), бісульфатні, бутиратні, камфоратні, камфорсульфонатні, диглюкотан, форміатні, фумаратні, гліцерофосфатні, глутаматні, гемісульфатні, гептаноатні, гексаноатні, гідрохлорид, гідробромід, гідройодид, лактобінатні, лактатні, малеатні, мезитиленсульфонатні, метансульфонатні, нафтиленсульфонатні, нікотинатні, оксалатні, памоатні, пектинатні, персульфатні, фосфатні, пікратні, пропіонатні, сукцинатні, тартратні, тіоціанатні,

35 трихлорацетатні, трифторацетатні, пара-толуолсульфонатні та ундеканатні солі сполук Формули I охоплюються даним винаходом. Основно-адитивні солі сполук являють собою такі, які одержані у результаті взаємодії сполук Формули I з бікарбонатом, карбонатом, гідроксидом або фосфатом катіонів, таких як літій, натрій, калій, кальцій і магній.

Сполуки Формули I можна вводити, наприклад, букально, шляхом введення через око, перорально, осмотично, парентерально (внутрішньом'язово, інтраперитонеально, інтратерально, внутрішньовенно, підшкірно), ректально, місцевим шляхом, черезшкірно і вагінально.

Терапевтично ефективні кількості сполуки Формули I залежать від реципієнта, який приймає лікування, захворювання, що підлягає лікуванню, і його тяжкості, композиції, що включає такі

45 сполуки, часу введення, шляху введення, тривалості лікування, активності сполук, швидкості виведення з організму і від того, вводять або ні разом з цим інший лікарський засіб. Кількість сполуки Формули I, яку використовують для одержання композиції для щоденного введення пацієнту у вигляді однієї дози або окремих доз, складає від близько 0,001 до близько 200 мг/кг маси тіла. Композиції у вигляді окремих доз містять зазначені вище кількості або комбінацію їх

50 кратних часток.

Сполуки Формули I можна вводити з або без ексципієнта. Ексципієнти включають, наприклад, інкапсулюючі речовини і домішки, такі як прискорювачі абсорбції, антиоксиданти, зв'язуючі, буфери, агенти покриття, барвники, розріджувачі, розпушувачі, емульгатори, наповнювачі, віддушки, зволожувальні речовини, змащувальні речовини, ароматизатори,

55 консерванти, пропеленти, агенти вивільнення, стерилізуючі речовини, підсолоджувачі, солюбілізуючі речовини, змочувальні речовини і суміші таких речовин.

Сполуки Формули I можуть бути радіоактивно міченими радіоактивним ізотопом, таким як вуглець (тобто ¹³C), водень (тобто ³H), азот (тобто ¹⁵N), фосфор (тобто ³²P), сірка (тобто ³⁵S), йод (тобто ¹²⁵I) і подібні. Радіоактивні ізотопи можуть бути включені у сполуки Формули I шляхом

60 взаємодії цих сполук і радіоактивного агента дериватизації або шляхом включення радіоактивно

міченої проміжної сполуки в їх синтез. Радіоактивно мічені сполуки Формули I є корисними як для прогностичних, так і діагностичних застосувань, а також для *in vivo* та *in vitro* візуалізації.

Сполуки Формули I можуть бути включені у пристрої, такі як, але не обмежуючись цим, артеріо-венозні імплантати, біліарні стенти, обхідні судинні шунти, катетери, ЦНС шунти, коронарні стенти, балони для доставки лікарських засобів, периферичні стенти і уретральні стенти, кожний з яких можна використовувати у таких ділянках як, але не обмежуючись цим, судинна сітка, для введення сполуки Формули I у потрібні тканини або органи організму. Одним показником ефективності сполук Формули I є зменшення або усунення пов'язаних з введенням такого пристрою тромбів і пов'язаних з цим ускладнень.

Сполуки Формули I можна використовувати як сенсibiliзатори радіоактивності, що підвищують ефективність променевої терапії. Приклади променевої терапії включають, але не обмежуються цим, променеву терапію з використанням зовнішнього променя, дистанційну променеву терапію, брахітерапію і променеву терапію з ізольованим і неізольованим джерелом випромінювання.

Експіциєнти для одержання композицій, що включають сполуку Формули I, для введення пероральним шляхом включають, наприклад, агар, альгінову кислоту, гідроксид алюмінію, бензиловий спирт, бензилбензоат, 1,3-бутиленгліколь, карбомери, рицинову олію, целюлозу, ацетат целюлози, олію какао, кукурудзяний крохмаль, кукурудзяну олію, олію насіння бавовнику, кросповідон, дигліцериди, етанол, етилцелюлозу, етиллаурат, етилолеат, складні ефіри жирних кислот, желатин, олію зародків насіння, глюкозу, гліцерин, арахісову олію, гідроксипропілметилцелюлозу, ізопропанол, ізотонічний сольовий розчин, лактозу, гідроксид магнію, стеарат магнію, солод, маніт, моногліцериди, маслинову олію, олію земляного горіха, калійфосфатні солі, картопляний крохмаль, повідон, пропіленгліколь, розчин Рінгера, сафлорову олію, кунжутну олію, натрієву сіль карбоксиметилцелюлози, натрійфосфатні солі, лаурилсульфат натрію, натрійсорбіт, соєву олію, стеаринові кислоти, стеарилфумарат, сахарозу, поверхнево-активні речовини, тальк, трагакант, тетрагідрофурфуріловий спирт, тригліцериди, воду і суміші цих речовин. Експіциєнти для одержання композицій, що включають сполуку Формули I, для введення офтальмічним або пероральним шляхом, включають, наприклад, 1,3-бутиленгліколь, рицинову олію, кукурудзяну олію, олію насіння бавовнику, етанол, складні ефіри жирних кислот сорбітану, олію зародків рослин, арахісову олію, гліцерин, ізопропанол, маслинову олію, поліетиленгліколи, пропіленгліколь, кунжутну олію, воду і суміші цих речовин. Експіциєнти для одержання композицій, що включають сполуку Формули I, для введення осмотичним шляхом, включають, наприклад, хлорфторвуглеводні, етанол, воду і суміші цих речовин. Експіциєнти для одержання композицій, що включають сполуку Формули I, для введення парентеральним шляхом, включають, наприклад, 1,3-бутандіол, рицинову олію, кукурудзяну олію, олію насіння бавовнику, декстрозу, олію зародків рослин, арахісову олію, ліпосоми, олеїнову кислоту, маслинову олію, олію земляного горіха, розчин Рінгера, сафлорову олію, кунжутну олію, соєву олію, U.S.P. або ізотонічний розчин хлориду натрію, воду і суміші цих речовин. Експіциєнти для одержання композицій, що включають сполуку Формули I, для введення ректальним або вагінальним шляхом, включають, наприклад, олію какао, поліетиленгліколь, віск і суміші цих речовин.

АНАЛІЗ

(Fam)-NoxaCF(6-FAM)-GELEVEFATQLRRFGDKLNF-амід (SEQ. ID NO.1) одержували в автоматичному синтезаторі 433A (Applied Biosystems, Foster City, CA), використовуючи стандартні Fastmoc™ цикли видалення захисту/зв'язування з використанням 0,25 ммоль MBHA амідної смоли Рінка (SynPer, Dublin, CA). Картриджі, що містять N^α-Fmoc-амінокислоти (1 ммоль) із захистом бічного ланцюга (Arg: 2,2,5,7,8-пентаметилхроман-6-сульфоніл; Asp і Glu: трет-бутиловий ефір; Asn, Cys, Gln і His: тритил; Lys і Trp: трет-бутилоксикарбоніл; Ser, Thr і Tyr: трет-бутиловий ефір) активували за допомогою гексафторфосфату О-бензотриазол-1-іл-N, N,N',N'-тетраметилуронію (1 ммоль), 1-гідроксибензотриазолу (1 ммоль) і діізопропілетиламіну (2 ммоль) в N-метилпіролідоні (NMP). Активовану амінокислоту піддавали зв'язуванню протягом 30 хвилин після видалення N-кінцевої групи Fmoc з використанням 20 % розчину піперидину в NMP. Мічення здійснювали шляхом суспендування зв'язаного зі смолою пептидного полімеру з видаленим захистом по N-кінцю і захистом бічного ланцюга (0,04 ммоль) і 6-карбоксифлуоресцеїн-NHS ефіру (57 мг) у безводному диметилформаміді (2 мл), що містить 0,02 мл діізопропілетиламіну (DIEA), і струшування при температурі навколишнього середовища протягом ночі. Смолу дренували, промивали 3 рази сумішшю 1:1 дихлорметан/метанол і сушили. Мічену смолу розщеплювали і видаляли захист шляхом змішування з сумішшю TFA:вода:тіоанізол:фенол:3,6-діокса-1,8-октандитіол:триізопропілсилан 80:5:5:5:2,5:2,5 протягом 3 годин при температурі навколишнього середовища. Після упарювання при

зниженому тиску, неочищений пептид відновлювали шляхом осадження за допомогою простого ефіру. Продукт очищали за допомогою препаративної ВЕРХ з використанням програми аналізу Unipoint (Gilson, Inc., Middleton, WI) на колонці радіального стиснення 25 мм × 200 мм з набивкою Delta-Pak C₁₈ (Waters, Inc., Taunton, MA), при швидкості потоку 20 мл/хв. Елюювання пептидів здійснювали з використанням лінійного градієнта 0,1 % TFA/вода і ацетонітрилу. Фракції, що містять продукт, об'єднували і ліофілізували. Чистоту кінцевих продуктів підтверджували за допомогою зворотно-фазової аналітичної ВЕРХ з використанням системи Hewlett-Packard серії 1050 з діодним і флуоресцентним детектором (Agilent Technologies, Palo Alto, CA), використовуючи для елювання лінійний градієнт 0,1 % трифтороцтової кислоти/вода і ацетонітрил, на колонці 4,6×250 мм YMC ODS-AQ, 5 мкМ, 120 А (Waters Inc.), з одержанням, після ліофілізації, продукту (45,6 мг) у вигляді жовтого порошку. Природу продукту підтверджували мас-спектрографічним методом з використанням матричної лазерної десорбційної іонізації (MALDI-MS) на Voyager DE-PRO (Applied Biosystems), m/z 1470,00 і 1448,01 (M+H)⁺.

Аналіз поляризації флуоресценції використовували для визначення ІК₅₀ для репрезентативних сполук Формули І проти рекомбінантного білка Mcl-1. Використовували серійне розведення сполук у DMSO, починаючи з 10 мкМ, і переносили (5 мкл) у 96-ямковий планшет. Потім у кожен ямку додавали 120 мкл суміші, що містить 10 нМ флуоресцентного Ноха ВНЗ пептиду і 80 нМ білка Mcl-1. Для кожного аналізу, у кожний аналітичний планшет включали контроль, що містить вільний пептид (тільки флуоресцентний пептид), і контроль, що містить зв'язаний пептид (флуоресцентний пептид у присутності Mcl-1). Планшет поміщали на струшуючий пристрій для змішування протягом 1 хвилини та інкубували при кімнатній температурі ще протягом 15 хвилин. Поляризацію (в mP) вимірювали при кімнатній температурі при 485 нм хвилі збудження і при 530 нм хвилі випромінювання з використанням Analyst (LJL, Molecular Dynamic, Sunnyvale, CA). Відсоток інгібування розраховували з використанням рівняння: % інгібування = $100 \times (1 - (mP - mP_i) / (mP_b - mP_i))$, де mP_i являє собою контроль, що містить вільний пептид, і mP_b являє собою контроль, що містить зв'язаний пептид. На основі відсотка інгібування одержували значення ІК₅₀ (концентрація інгібітору, при якій відбувається заміщення 50 % зв'язаного пептиду) шляхом підгонки даних інгібування з використанням програми Prism 3,0 (Graphpad Software Inc, San Diego, CA). Результати представлені у Таблиці 1.

< 0.030	< 0.030	< 0.030	< 0.030	< 0.030
< 0.030	< 0.030	< 0.030	< 0.030	< 0.030
< 0.030	< 0.030	< 0.030	< 0.030	< 0.030
< 0.030	< 0.030	< 0.030	< 0.030	< 0.030
< 0.030	< 0.030	< 0.030	< 0.030	0.030
0.030	0.030	0.030	0.031	0.031
0.031	0.031	0.031	0.031	0.031
0.032	0.032	0.032	0.032	0.032
0.032	0.033	0.033	0.033	0.033
0.033	0.033	0.034	0.034	0.035
0.035	0.035	0.036	0.036	0.037
0.037	0.037	0.037	0.037	0.038
0.038	0.038	0.038	0.038	0.039
0.039	0.039	0.039	0.040	0.040
0.040	0.041	0.041	0.041	0.042
0.042	0.043	0.043	0.043	0.044
0.044	0.044	0.044	0.044	0.044
0.045	0.045	0.045	0.045	0.045
0.045	0.045	0.045	0.046	0.046
0.047	0.047	0.047	0.047	0.047
0.048	0.048	0.048	0.049	0.050
0.050	0.050	0.050	0.051	0.051
0.051	0.051	0.051	0.052	0.052
0.052	0.052	0.052	0.053	0.053
0.053	0.053	0.053	0.054	0.054
0.054	0.054	0.054	0.055	0.056
0.057	0.057	0.057	0.057	0.058
0.058	0.058	0.058	0.058	0.059
0.059	0.059	0.060	0.060	0.060
0.061	0.061	0.062	0.062	0.062
0.063	0.063	0.063	0.064	0.065
0.065	0.065	0.067	0.067	0.067

0.068	0.068	0.069	0.069	0.070
0.071	0.072	0.072	0.072	0.073
0.074	0.074	0.074	0.075	0.076
0.077	0.077	0.078	0.078	0.079
0.079	0.079	0.080	0.080	0.081
0.082	0.083	0.084	0.085	0.085
0.085	0.086	0.086	0.087	0.088
0.089	0.089	0.089	0.090	0.090
0.090	0.090	0.090	0.091	0.091
0.093	0.093	0.095	0.096	0.096
0.097	0.097	0.097	0.098	0.100
0.101	0.101	0.101	0.101	0.103
0.104	0.104	0.105	0.105	0.106
0.106	0.107	0.108	0.108	0.110
0.111	0.112	0.114	0.118	0.119
0.121	0.121	0.122	0.123	0.125
0.127	0.128	0.130	0.132	0.132
0.133	0.134	0.136	0.137	0.137
0.138	0.139	0.143	0.145	0.145
0.148	0.148	0.151	0.154	0.155
0.156	0.156	0.156	0.157	0.163
0.163	0.165	0.165	0.166	0.166
0.168	0.169	0.170	0.173	0.173
0.173	0.174	0.175	0.175	0.176
0.179	0.180	0.180	0.182	0.183
0.185	0.186	0.186	0.186	0.186
0.186	0.187	0.191	0.197	0.200
0.200	0.201	0.203	0.206	0.207
0.208	0.209	0.210	0.212	0.212
0.213	0.215	0.216	0.218	0.219
0.220	0.220	0.222	0.222	0.223
0.224	0.224	0.227	0.228	0.229

0.230	0.232	0.234	0.235	0.235
0.240	0.240	0.241	0.242	0.244
0.245	0.256	0.257	0.261	0.265
0.268	0.271	0.272	0.273	0.273
0.277	0.277	0.279	0.279	0.282
0.282	0.283	0.283	0.288	0.288
0.293	0.300	0.301	0.301	0.316
0.318	0.320	0.322	0.326	0.334
0.338	0.338	0.340	0.340	0.350
0.363	0.370	0.373	0.378	0.378
0.379	0.381	0.383	0.391	0.398
0.399	0.400	0.409	0.430	0.439
0.440	0.440	0.447	0.449	0.459
0.475	0.480	0.482	0.489	0.497
0.502	0.505	0.514	0.525	0.532
0.540	0.545	0.547	0.553	0.558
0.562	0.565	0.566	0.573	0.598
0.601	0.611	0.623	0.628	0.630
0.633	0.635	0.684	0.704	0.716
0.738	0.751	0.757	0.782	0.814
0.820	0.851	0.885	0.886	0.910
0.952	0.973	1.002	1.003	1.026
1.030	1.053	1.085	1.097	1.123
1.145	1.175	1.193	1.246	1.256
1.326	1.349	1.353	1.359	1.364
1.385	1.386	1.491	1.557	1.576
1.591	1.765	1.992	2.019	2.054
2.058	2.121	2.186	2.242	2.336
2.449	2.483	2.570	2.682	2.683
2.694	2.727	2.734	2.757	2.759
2.929	2.962	2.982	3.156	3.373
3.388	3.557	3.586	3.763	3.846

4.743	4.890	4.900	4.946	5.105
5.184	5.199	5.448	5.480	5.539
6.283	6.610	6.760	7.270	7.302
8.638				

Ці дані демонструють застосовність репрезентативних сполук Формули I як інгібіторів активності білка Mcl-1.

Відповідно, сполуки Формули I, як очікують, будуть корисними для лікування захворювань, у ході яких експресується анти-апоптичний Mcl-1, а також корисними для лікування захворювань, у ході яких експресуються члени сімейства анти-апоптичних білків, що мають близьку структурну гомологію з Mcl-1, такі як, наприклад, білок Bcl-xL, білок Bcl-2 і білок Bcl-w.

Надекспресію Mcl-1 співвідносять з резистентністю до хіміотерапії, клінічним результатом, прогресуванням захворювання, загальним прогнозом або їх поєднанням при різних гематологічних і солідних пухлинах, таких як акустична невринома, гострий лейкоз, гострий лімфобластний лейкоз, гострий мієлогенний лейкоз (моноцитарний, мієлобластний, аденокарцинома, ангіосаркома, астроцитома, мієломоноцитарний і промієлоцитарний), гострий Т-клітинний лейкоз, базально-клітинна карцинома, карцинома жовчних проток, рак сечового міхура, рак головного мозку, рак молочної залози (що включає естроген-позитивний рак молочної залози), бронхіогенна карцинома, цервікальний рак, хондросаркома, хордома, хоріокарцинома, хронічний лейкоз, хронічний лімфоцитарний лейкоз, хронічний мієлоцитарний (гранулоцитарний) лейкоз, хронічний мієлогенний лейкоз, рак прямої кишки, колоректальний рак, краніофарингіома, цистаденокарцинома, дифузна велико-В-клітинна лімфома, диспроліферативні зміни (дисплазії і метаплазії), ембріональна карцинома, ендометріальний рак, ендотеліосаркома, епендіома, епітеліальна карцинома, еритролейкоз, рак стравоходу, естроген-позитивний рак молочної залози, есенціальна тромбоцитемія, пухлина Юїнга, фібросаркома, фолікулярна лімфома, рак шлунка, яйцеклітинний тестикулярний рак, гестаційне трофобластичне захворювання, гліобластома, рак голови і шиї, захворювання, пов'язане з порушенням важкого ланцюга, гемангіобластома, гепатома, гепатоклітинний рак, гормон-нечутливий рак передміхурової залози, лейоміосаркома, ліпосаркома, рак легені (що включає дрібноклітинний рак легені і не-дрібноклітинний рак легені), лімфангіоендотеліосаркома, лімфангіосаркома, лімфобластний лейкоз, лімфома (лімфома, що включає дифузну велико-В-клітинну лімфому, фолікулярну лімфому, лімфому Ходжкіна і не-ходжкінську лімфому), злоякісні і гіперпроліферативні розлади сечового міхура, молочної залози, прямої кишки, легенів, яєчників, підшлункової залози, передміхурової залози, шкіри і матки, лімфоїдні злоякісні захворювання Т-клітинного або В-клітинного походження, лейкоз, лімфома, медулярна карцинома, медулобластома, меланома, менінгіома, мезотеліома, множинна мієлома, мієлогенний лейкоз, мієлома, міксосаркома, нейробластома, не-дрібноклітинний рак легені, олігодендрогліома, оральний рак, остеогенна саркома, рак яєчників, рак підшлункової залози, папілярні аденокарциноми, папілярна карцинома, периферична Т-клітинна лімфома, пінеалома, справжня поліцитемія, рак передміхурової залози (що включає гормон-нечутливий (рефракторний) рак передміхурової залози), ректальний рак, нирково-клітинна карцинома, ретинобластома, рабдоміосаркома, саркома, карцинома сальної залози, семіома, рак шкіри, дрібноклітинний рак легені, солідні пухлини (карциноми і саркоми), дрібноклітинний рак легені, рак шлунка, сквамозно-клітинна карцинома, синовіома, карцинома потової залози, тестикулярний рак (що включає яйцеклітинний тестикулярний рак), рак щитовидної залози, макроглобулінемія Вальденстрема, пухлини яєчників, рак матки, пухлина Вільмса і подібні.

Також очікується, що сполуки Формули I будуть інгібувати ріст клітин, які утворюються у результаті педіатричного раку, або пухлини, що включають ембріональну рабдоміосаркому, педіатричний гострий лімфобластний лейкоз, педіатричний гострий мієлогенний лейкоз, педіатричну альвеолярну рабдоміосаркому, педіатричну анапластичну епендіому, педіатричну анапластичну великоклітинну лімфому, педіатричну анапластичну медулобластома, педіатричну атипичну тератоїдну/рабдоїдну пухлину центральної нервової системи, педіатричний біфенотипічний гострий лейкоз, педіатричну лімфому Беркета, педіатричний рак типу пухлин Юїнга, наприклад, ембріональні нейроектодермальні пухлини, педіатричну дифузну анапластичну пухлину Вільмса, педіатричну пухлину Вільмса з хорошою гістологією, педіатричну гліобластома, педіатричну медулобластома, педіатричну нейробластома,

педіатричний викликаний нейробластомою мієлоцитоматоз, педіатричні перед-В-клітинні ракові захворювання (такі як лейкоз), педіатричну остеосаркому, педіатричну рабдоїдну пухлину нирки, педіатричну рабдіоміосаркому і педіатричні Т-клітинні ракові захворювання, такі як лімфома і рак шкіри, і подібні.

5 Про роль Mcl-1 у гострому лімфобластному лейкозі повідомляється у Blood 1998, 91, 991-1000.

Про роль Mcl-1 у гострому мієлогенному лейкозі також повідомляється у Blood 1998, 91, 991-1000.

10 Про роль Mcl-1 у цервікальному раку повідомляється у Cancer Letters (Shannon, Ireland) 2002, 180, 63-68.

Про роль Mcl-1 у хронічному лімфоцитарному лейкозі повідомляється у Journal of the National Cancer Institute 2004, 96, 673-682 і Immunology 2005, 114, 441-449.

Про роль Mcl-1 у колоректальному раку повідомляється в Annals of oncology: Official Journal of the European Society for Medical Oncology/ESMO 2001, 12, 779-785.

15 Про роль Mcl-1 у раку шлунка повідомляється у Gastric Cancer 2004, 7, 78-84.

Про роль Mcl-1 у гестаційному трофобластичному захворюванні повідомляється у Cancer 2005, 103, 268-276.

Про роль Mcl-1 у гліобластомі повідомляється у Journal of Neurology, Neurosurgery and Psychiatry 1999, 67, 763-768.

20 Про роль Mcl-1 у раку голови і шиї повідомляється в Archives of Otolaryngology-Head and Neck Surgery 1999, 125, 417-422.

Про роль Mcl-1 у раку легені повідомляється у Pathology Oncology Research: POR 1999, 5, 179-186.

Про роль Mcl-1 у мезотеліомі повідомляється у Clinical Cancer Research 1999, 5, 3508-3515.

25 Про роль Mcl-1 у множинній мієломі повідомляється в European Journal of Immunology 2004, 34, 3156-3164.

Про роль Mcl-1 у не-ходжкінській лімфомі повідомляється у British Journal of Haematology 2002, 116, 158-161.

Про роль Mcl-1 в олігодендрогліомі повідомляється у Cancer (New York) 1999, 86, 1832-1839.

30 Про роль Mcl-1 у раку яєчника повідомляється у Journal of Clinical Oncology: Official Journal of the American Society of Clinical Oncology 2000, 18, 3775-3781.

Про роль Mcl-1 у раку підшлункової залози повідомляється в Oncology 2002, 62, 354-362.

Про роль Mcl-1 у периферичній Т-клітинній лімфомі повідомляється у Journal of Pathology 2003, 200, 240-248.

35 Очікується, що сполуки Формули I будуть корисними при використанні з алкілувальними агентами, інгібіторами ангіогенезу, антитілами, антиметаболітами, антимітотичними засобами, антипроліферативними засобами, інгібіторами кінази аутофа, інгібіторами білків сімейства Bcl-2 (наприклад, Bcl-xL, Bcl-2, Bcl-w, Bcl-l), інгібіторами кінази Bcr-Abl, модифікаторами біологічної відповіді, інгібіторами циклін-залежної кінази, інгібіторами клітинного циклу, інгібіторами циклооксигенази-2, інгібіторами рецептора гомолога онкогена вірусного лейкозу (ErbB2), інгібіторами фактора росту, інгібіторами білка теплового шоку (HSP)-90, інгібіторами гістондеацетилази (HDAC), гормональною терапією, імунотерапією, інтеркалюючими антибіотиками, інгібіторами кіназ, інгібіторами прицільної дії рапоміцину у ссавців, інгібіторами мітоген-активованої регульованої позаклітинним сигналом кінази, не-стероїдними протизапальними лікарськими засобами (NSAID's), хіміотерапевтичними засобами на основі платини, інгібіторами кінази типу polo, інгібіторами протеасоми, аналогами пуринів, аналогами піримідину, інгібіторами тирозинових кіназ-рецепторів, рослинними алкалоїдами ретиноїдами/дельтоїдами, інгібіторами топоізомерази і подібними речовинами.

40 Алкілувальні агенти включають алтретамін, AMD-473, AP-5280, апазиквон, бендамустин, бросталіцин, бусульфан, карбоксон, кармустин (BCNU), хлорамбуцил, Cloretazine™ (VNP 40101 M), циклофосфамід, декарбазин, естрамустин, фотемусти, глуфосфамід, іфосфамід, KW-2170, ломустин (CCNU), мафосфамід, мелфалан, мітобронітол, мітолактол, німусти, азотний іприт N-оксид, ранімусти, темозоломід, тіотепу, треосульфат, трофосфамід і подібні засоби.

50 Інгібітори ангіогенезу включають інгібітори ендотеліально-специфічних рецепторних тирозинових кіназ (Tie-2), інгібітори рецепторів епідермального фактора росту (EGFR), інгібітори рецепторів інсуліноподібного ростового фактора-2 (IGFR-2), інгібітори металопротеїнази-2 матриксу (MMP-2), інгібітори металопротеїнази-9 матриксу (MMP-9), інгібітори ростового фактора, що продукується тромбоцитами (PDGFR), аналоги тромбоспондину, інгібітори тирозинових кіназ рецепторів фактора росту судинного ендотелію (VEGFR) і подібні засоби.

60 Інгібітори кінази аутофа включають AZD-1152, MLN-8054, VX-680 і подібні засоби.

Інгібітори білків сімейства Bcl-2 включають AT-101 ((-)-госипол), GENASENSE (G3139 або облімерсен (Bcl-2-таргетуючий антисмисловий олігонуклеотид)), IPI-194, IPI-565, N-(4-(4-((4'-хлор(1,1'-біфеніл)-2-іл)метил)піперазин-1-іл)бензоїл)-4-(((1R)-3-(диметиламіно)-1-((фенілсульфаніл)метил)пропіл)аміно)-3-нітробензолсульфонамід) (ABT-737), N-(4-(4-((2-(4-хлорфеніл)-5,5-диметил-1-циклогекс-1-ен-1-іл)метил)піперазин-1-іл)бензоїл)-4-(((1R)-3-(морфолін-4-іл)-1-((фенілсульфаніл)метил)пропіл)аміно)-3-((трифторметил)сульфоніл)бензолсульфонамід (ABT-263), GX-070 (обатоклак) і подібні засоби.

Інгібітори Bcr-Abl кінази включають DASATINIB® (BMS-354825), GLEEVEC® (імаїніб) і подібні засоби.

Інгібітори CDK включають AZD-5438, BMI-1040, BMS-032, BMS-387, CVT-2584, флавопіридол, GPC-286199, MCS-5A, PD0332991, PHA-690509, селіцикліб (CYC-202, R-росковітин), ZK-304709 і подібні засоби.

Інгібітори COX-2 включають ABT-963, ARCOXIA® (еторикоксиб), BEXTRA® (валдекоксиб), BMS347070, CELEBREX™ (целекоксиб), COX-189 (луміраоксиб), CT-3, DERAMAXX® (дераоксиб), JTE-522, 4-метил-2-(3,4-диметилфеніл)-1-(4-сульфамойлфеніл-1H-пірол), MK-663 (еторикоксиб), NS-398, парекоксиб, RS-57067, SC-58125, SD-8381, SVT-2016, S-2474, T-614, VIOXX® (рофекоксиб) і подібні засоби.

Інгібітори EGFR включають ABX-EGF, анти-EGFR імуноліпосоми, EGF-вакцину, EMD-7200, ERBITUX® (цетуксимаб), HR3, IgA антитіла, IRESSA® (гефітініб), TARCEVA® (ерлотиніб або OSI-774), TP-38, EGFR гібридний білок, TYKERB® (лапатиніб) і подібні засоби.

Інгібітори ErbB2 рецептора включають CP-724-714, CI-1033 (канертиніб), Herceptin® (трастузумаб), TYKERB® (лапатиніб), OMNITARG® (2C4, петузумаб), TAK-165, GW-572016 (іонафарніб), GW-282974, EKB-569, PI-166, dHER2 (HER2 вакцина), APC-8024 (HER-2 вакцина), анти-HER/2neu біспецифічне антитіло, B7.her2IgG3, AS HER2 трифункціональні біспецифічні антитіла, mAB AR-209, mAB 2B-1 і подібні засоби.

Інгібітори гістондеацетилази включають депсипептид, LAQ-824, MS-275, трапоксин, субероїланілідгідроксамову кислоту (SAHA), TSA, валпроєву кислоту і подібні засоби.

Інгібітори HSP-90 включають 17-AAG-nab, 17-AAG, CNF-101, CNF-1010, CNF-2024, 17-DMAG, гелданаміцин, IPI-504, KOS-953, MYCOGRAB®, NCS-683664, PU24FC1, PU-3, радицикол, SNX-2112, STA-9090 VER49009 і подібні засоби.

Інгібітори MEK включають ARRY-142886, ARRY-438162, PD-325901, PD-98059 і подібні засоби.

Інгібітори mTOR включають AP-23573, CCI-779, еверолімус, RAD-001, рапаміцин, темсиролімус і подібні засоби.

Не-стероїдні протизапальні лікарські засоби включають AMIGESIC® (сулсалат), DOLOBID® (дифлунізал), MOTRIN® (ібупрофен), ORUDIS® (кетопрофен), RELAFEN® (набуметон), FELDENE (піроксикам) ібупрофен крем, ALEVE® і NAPROSYN® (напроксен), VOLTAREN® (диклофенак), INDOCIN® (індометацин), CLINORIL® (суліндак), TOLECTIN® (толметин), LODINE® (етодолак), TORADOL® (кеторолак), DAYPRO® (окспрозин) і подібні засоби.

Інгібітори PDGFR включають C-451, CP-673, CP-868596 і подібні засоби.

Хіміотерапевтичні засоби на основі платини включають цисплатин, ELOXATIN® (оксалиплатин), ептаплатин, лобаплатин, недаплатин, PARAPLATIN® (карбоплатин), сатраплатин і подібні засоби.

Інгібітори кінази типу ролю включають BI-2536 і подібні засоби.

Аналоги тромбоспондину включають ABT-510, ABT-567, ABT-898, TSP-1 і подібні засоби.

Інгібітори VEGFR включають AVASTIN® (бевацизумаб), ABT-869, AEE-788, ANGIOZYME™, акситиніб (AG-13736), AZD-2171, CP-547,632, IM-862, Macugen (пегаптаміб), NEXAVAR® (сорафеніб, BAY43-9006), пазопаніб (GW-786034), (PTK-787, ZK-222584), SUTENT® (сунітиніб, SU-11248), пастку для VEGF, ваталаніб, ZACTIMA™ (вандетаніб, ZD-6474) і подібні засоби.

Антиметаболіти включають ALIMTA® (преметрексед динатрій, LY231514, МТА), 5-азацитидин, XELODA® (капецитабін), кармофур, LEUSTAT® (кладрибін), клофарабін, цитарабін, цитарабін оксфосфат, цитозин арабінозид, децитабін, дефероксамін, доксифлуридин, ефлорнітин, EICAR, еноцитабін, етнілцитидин, флударабін, гідроксисечовину, 5-фторурацил (5-FU) окремо або у поєднанні з лейковорином, GEMZAR® (гемцитабін), гідроксисечовину, ALKERAN® (мелфалан), меркаптопурин, 6-меркаптопурин рибозид, метотрексат, мікофенолову кислоту, неларабін, нолатрексед, окфосат, пелітрексол, пентостатин, ралтитрексед, Рибавірин, триапін, триметрексед, S-1, тіазофурин, тегафур, TS-I, відарабін, UFT і подібні засоби.

Антибіотики включають інтеркалюючі антибіотики акларубіцин, актиноміцин D, амрубіцин, анаміцин, адріаміцин, BLENOXANE® (блеоміцин), даунорубіцин, CAELYX® або MYOCET® (доксорубіцин), елсамітруцин, епірбуцин, гларбуїцин, ZAVEDOS® (ідарубіцин), мітоміцин C,

неморубіцин, неокарзиностатин, пепломіцин, пірарубіцин, ребекаміцин, стилмаламер, стрептозоцин, VALSTAR® (валрубіцин), зиностатин і подібні засоби.

Інгібітори топоізомерази включають акларубіцин, 9-амінокамптотецин, амонафід, амсакрин, бекатекарин, белотекан, BN-80915, CAMPTOSAR® (іринотекан гідрохлорид), камптотецин, 5 CARDIOXANE® (дексразоксин), дифломотекан, едотекарин, ELLENCE® або PHARMORUBICIN® (епірубіцин), етопозид, ексатекан, 10-гідроксикамптотецин, гіматекан, луртотекан, мітоксантрон, оратекан, пірарбуцин, піксантрон, рубітекан, собузоксан, SN-38, тафлупозид, топотекан і подібні засоби.

Антитіла включають AVASTIN® (бевацизумаб), CD40-специфічні антитіла, chTNT-1/B, деносумаб, ERBITUX® (цетуксимаб), HUMAX-CD4® (заноліумаб), IGF1R-специфічні антитіла, лінтузумаб, PANOREX® (едреколомаб), RENCAREX® (WX G250), RITUXAN® (ритуксимаб), тицліліумаб, трастузумаб і подібні засоби.

Гормональні терапевтичні засоби включають ARIMIDEX® (анастрозол), AROMASIN® (ексеместан), арзоксифен, CASODEX® (бікалутамід), CETROTIDE (цетрорелікс), дегарелікс, 15 деслорелін, DESOPAN® (трилостан), дексаметазон, DROGENIL® (флутамід), EVISTA® (ралоксифен), фазрозол, FARESTON® (тореміфен), FASLODEX® (фулвестрант), FEMARA® (летрозол), форместан, глюкокортикоїди, HECTOROL® або RENAGEL® (доксеркалциферол), лазофоксифен, леуролід ацетат, MEGACE® (мегестрол), MIFEPREX® (міфепристон), NILANDRON™ (нілутамід), NOLVADEX® (тамоксифен цитрат), PLENAXIS™ (абарелікс), 20 предизон, PROPECIA® (фінастерид), рилостан, SUPREFACT® (бусерелін), TRELSTAR® (фактор, що вивільняє лютеїнізуючий гормон (LHRH)), вантас, VETORYL®, (трилостан або модростан), ZOLADEX® (фосрелін, гoserелін) і подібні засоби.

Дельтоїди і ретиноїди включають сеокальцитол (EB 1089, CB 1093), лексакальцитрол (KH 1060), фенретинід, PANRETIN® (аліретиніон), ATRAGEN® (ліпосомальний третиноїн), 25 TARGRETIN® (бексаротен), LGD-1550 і подібні засоби.

Рослинні алкалоїди включають, але не обмежуються цим, вінкристин, вінбластин, віндезин, вінорелбін і подібні засоби.

Інгібітори протеасоми включають VELCADE® (бортезоміб), MG132, NPI-0052, PR-171 і подібні засоби.

30 Приклади імунотерапевтичних засобів включають інтерферони та інші імуностимулюючі засоби. Інтерферони включають інтерферон альфа, інтерферон альфа-2а, інтерферон альфа-2b, інтерферон бета, інтерферон гамма-1а, ACTIMMUNE® (інтерферон гамма-1b) або інтерферон гамма-n1, поєднання цих речовин і подібні засоби. Інші засоби включають 35 ALFAFERONE®, BAM-002, BEROMUN® (тасонермін), BEXXAR® (тоситумомаб), CamPath® (алемтузумаб), CTLA4 (цитотоксичний лімфоцитний антиген 4), декарбазин, денілейкін, епратузумаб, GRANOCYTE® (ленограстим), лентинан, лейкоцитарний альфа інтерферон, іміквімод, MDX-010, вакцину проти меланоми, мітумомаб, молграмостин, MYLOTARG™ (гемтузумаб озогаміцин), NEUPOGEN® (філграстим), OncoVAC-CL, OvaRex (ореговомомаб), 40 пемтумомаб (Y-muHMFGI), PROVENGE®, сарграмостим, сизофілан, тецелейкін, TheraCys, убенімекс, VIRULIZIN®, Z-100, WF-10, PROLEUKIN® (альдеслейкін), ZADAXIN® (тималфасин), ZENAPAX® (даклізумаб), ZEVALIN® (90Y-Ібритумомаб тіуксетан) і подібні засоби.

Модифікатори біологічної відповіді являють собою засоби, що модифікують захисні механізми живих організмів або біологічні відповіді, такі як виживання, ріст або диференціація клітин тканин, направляючи їх на набуття протипухлинної активності, і включають крестин, 45 лентинан, сизофілан, піцибаніл PF-3512676 (CPG-8954), убенімекс і подібні засоби.

Аналоги піримідину включають цитарабін (ара С або Арабінозид С), цитозин арабінозид, доксифлуридин, FLUDARA® (флударабін), 5-FU (5-фторурацил), флоксуридин, GEMZAR® (гемцитабін), TOMUDEX® (ратитрексед), TROXATYL™ (триацетилуридин троксацитабін) і подібні засоби.

50 Аналог пуринів включають LANVIS® (тіогуанін) і PURI-NETHOL® (меркаптопурин).

Антимітотичні засоби включають батабулін, епотилон D (KOS-862), N-(2-((4-гідроксифеніл)аміно)піридин-3-іл)-4-метоксибензолсульфонамід, іксабепілон (BMS 247550), паклітаксел, TAXOTERE® (доцетаксел), PNU100940 (109881), патупілон, XRP-9881, вінфлунін, ZK-EPO і подібні засоби.

55 Сполуки за даним винаходом також передбачаються для використання як сенсibiliзатори радіоактивності, що підвищують ефективність променевої терапії. Приклади променевої терапії включають, але не обмежуються цим, променеву терапію з використанням зовнішнього променя, дистанційну променеву терапію, брахітерапію і променеву терапію з ізольованим і неізольованим джерелом випромінювання.

Крім того, сполуки Формули I можна поєднувати з іншими хіміотерапевтичними засобами, такими як ABRAXANE™ (ABI-007), ABT-100 (інгібітор фарнезилтрансферази), ADVEXIN®, ALTOCOR® або MEVACOR® (ловастатин), AMPLIGEN® (полі I:полі C12U, синтетична РНК), APTOSYN™ (ексисулід), AREDIA® (памідронова кислота), арглабін, L-асапарагіназа, атаместан (1-метил-3,17-діон-адроста-1,4-дієн), AVAGE® (тазаротен), AVE-8062, BEC2 (мітумомаб), кахектин або кахексин (фактор некрозу пухлини), канваксин (вакцина), SeaVac™ (протиракова вакцина), CELEUK (целмолейкін), CEPLENE® (гістамін дигідрохлорид), CERVARIX™ (вакцина проти папілома-вірусу людини), CHOP® (C: CYTOXAN® (циклофосфамід); H: ADRIAMYCIN® (гідроксидоксо-рубіцин); O: ONCOVIN® (вінкристин); P: преднізон), CyPat™, комбрестатин A4P, DAB(389)EGF або TransMID-107R™ (дифтерійні токсини), дакарбазин, дактиноміцин, 5,6-диметилксантенон-4-оцтова кислота (DMXAA), енілурацил, EVIZON™ (скваламін лактат), DIMERICINE® (T4N5 ліпосомний лосьйон), дискодермолід, DX-8951f (ексатекан мезилат), ензастаурин, EPO906, GARDASIL® (рекомбінантна вакцина проти квадριвалентного папілома-вірусу людини (типи 6, 11, 16, 18)), гастрімуно, генасенсе, GMK (вакцина на основі кон'югату гангліозидів), GVAX® (вакцина проти раку передміхурової залози), галофугінон, гістерелін, гідроксикарбамід, ібандронова кислота, IGN-101, IL-13-PE38, IL-13-PE38QQR (цинтредекін бесудотокс), IL-13-pseudomonas екзотоксин, інтерферон-α, інтерферон-γ, JUNOVAN™ або МЕРАСТ™ (міфамуртид), лонафарніб, 5,10-метилентетрагідрофолат, мілтефосин (гексадецилфосфохолін), NEOVASTAT® (AE-941), NEUTREXIN® (триметрексат глюкуронат), NIPENT® (пентостатин), ONCONASE® (фермент рибонуклеаза), ONCOPHAGE® (вакцина для лікування меланоми), OncoVAX (IL-2 Вакцина), ORATHECIN™ (рубітекан), OSIDEM® (лікарський засіб на основі антитіл), OvaRex® MAb (мишаче моноклональне антитіло), падитаксел, PANDIMEX™ (агліконсапоніни з женьшеню, що включають 20(S)протопанаксادیол (aPPD) і 20(S)протопанаксатриол (aPPT)), панітумумаб, PANYAC-VF® (протиракова вакцина, що знаходиться на дослідженні), пегаспаргаза, PEG Інтерферон А, феноксодіол, прокарбазин, ребімастат, REMOVAB® (катумаксомаб), REVLIMID® (леналідомід), RSR13 (ефапроксирал), SOMATULINE® LA (ланреотид), SORIATANE® (ацитрелін), стауроспорин (Streptomyces staurospores), талабостат (PT100), TARGRETIN® (бексаротен), Тахоргексін® (DHA-паклітаксел), TELCYTA™ (TLK286), теміліфен, TEMODAR® (темозоломід), тесміліфен, талідомід, THERATOPE® (STn-KLH), тимітак (2-аміно-3,4-дигідро-6-метил-4-оксо-5-(4-піридилтіо)хіназолін дигідрохлорид), TNFerade™ (аденовектор: носій ДНК, що містить ген для фактора некрозу пухлини-α), TRACLEER® або ZAVESCA® (босентап), третиноїн (Retin-A), тетрандрин, TRISENOX® (триоксид миш'яку), VIRULIZIN®, україн (похідне алкалоїдів з рослини чистотілу), вітаксин (анти-альфаβ3 антитіло), XCYTRIN (мотексафін гадоліній), XINLAY™ (атрасентан), XYOTAX™ (паклітаксел поліглумекс), YONDELIS™ (трабактедин), ZD-6126, ZINECARD® (дексразоксан), зомета (золендроновна кислота), зорубіцин і подібні засоби.

Також очікується, що сполуки Формули I будуть інгібувати ріст клітин, які походять з педіатричного раку або пухлин, що включають ембріональну рабдоміосаркому, педіатричний гострий лімфобластний лейкоз, педіатричний гострий мієлогенний лейкоз, педіатричну альвеолярну рабдоміосаркому, педіатричну анапластичну епендіому, педіатричну анапластичну великоклітинну лімфому, педіатричну анапластичну медулобластому, педіатричну атипичну тератоїдну/рабдоїдну пухлину центральної нервової системи, педіатричний біфенотипічний гострий лейкоз, педіатричну лімфому Беркета, педіатричний рак типу пухлин Юїнга, наприклад, ембріональні нейроектодермальні пухлини, педіатричну дифузну анапластичну пухлину Вільмса, педіатричну пухлину Вільмса з хорошою гістологією, педіатричну гліобластому, педіатричну медулобластому, педіатричну нейробластому, педіатричний викликаний нейробластомою мієлоцитоматоз, педіатричні перед-В-клітинні ракові захворювання (такі як лейкоз), педіатричну остеосаркому, педіатричну рабдоїдну пухлину нирки, педіатричну рабдоміосаркому і педіатричні Т-клітинні ракові захворювання, такі як лімфома і рак шкіри, і подібні (заявка США, серійний номер 10/988338, що знаходиться у спільному володінні, Cancer Res., 2000, 60, 6101-10); і аутоімунні розлади включають синдром набутого імунodefіциту, аутоімунний лімфопроліферативний синдром, гемолітичну анемію, запальні захворювання, тромбоцитопенію і т.п. (Current Allergy and Asthma Reports 2003, 3:378-384; Br. J. Haematol. 2000 Sep; 110(3): 584-90; Blood 2000 Feb 15;95(4): 1283-92; New England Journal of Medicine 2004 Sep; 351(14): 1409-1418).

Сполуки Формули I можна одержати з використанням способів хімічного синтезу, приклади яких представлені нижче. Повинно бути зрозуміло, що порядок здійснення стадій в описаних способах може змінюватися, що зазначені реагенти, розчинники і реакційні умови можуть бути замінені іншими, і що вразливі групи, такі як C(O)OH, C(O) і C(O)H, NH, C(O)NH₂, OH і SH групи, можуть бути захищені, і у цих груп може бути видалений захист, як це необхідно.

Захисні групи для C(O)ОН груп включають, але не обмежуються цим, ацетоксиметил, аліл, бензоїлметил, бензил, бензилоксиметил, трет-бутил, трет-бутилдифенілсиліл, дифенілметил, циклобутил, циклогексил, циклопентил, циклопропіл, дифенілметилсиліл, етил, пара-метоксибензил, метоксиметил, метоксіетоксиметил, метил, метилтіометил, нафтил, пара-нітробензил, феніл, н-пропіл, 2,2,2-трихлоретил, триетилсиліл, 2-(триметилсиліл)етил, 2-(триметилсиліл)етоксиметил, трифенілметил і подібні.

Захисні групи для C(O) і C(O)H груп включають, але не обмежуються цим, 1,3-діоксилкеталь, діетилкеталь, диметилкеталь, 1,3-дитіанілкеталь, О-метилоксим, О-фенілоксим і подібні.

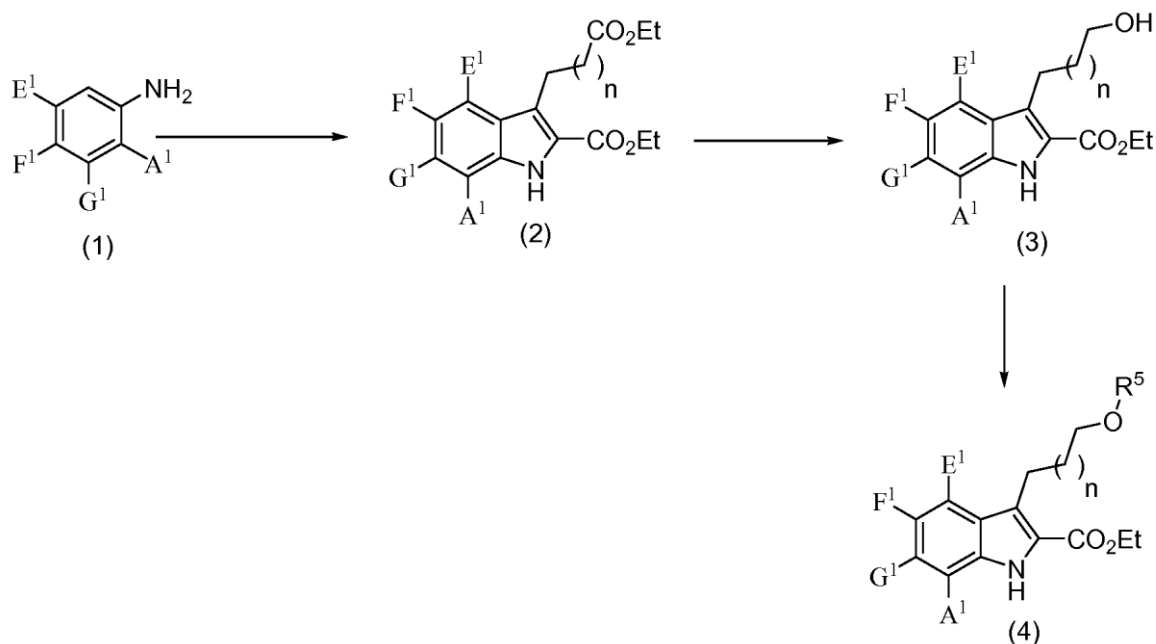
Захисні групи для NH груп включають, але не обмежуються цим, ацетил, аланіл, бензоїл, бензил (фенілметил), бензиліден, бензилоксикарбоніл (Cbz), трет-бутоксикарбоніл (Boc), 3,4-диметоксибензилоксикарбоніл, дифенілметил, дифенілфосфорил, форміл, метансульфоніл, пара-метоксибензилоксикарбоніл, фенілацетил, фталоїл, сукциніл, трихлоретоксикарбоніл, триетилсиліл, трифторацетил, триметилсиліл, трифенілметил, трифенілсиліл, пара-толуолсульфоніл і подібні.

Захисні групи для OH і SH груп включають, але не обмежуються цим, ацетил, аліл, алілоксикарбоніл, бензилоксикарбоніл (Cbz), бензоїл, бензил, трет-бутил, трет-бутилдиметилсиліл, трет-бутилдифенілсиліл, 3,4-диметоксибензил, 3,4-диметоксибензилоксикарбоніл, 1,1-диметил-2-пропеніл, дифенілметил, форміл, метансульфоніл, метоксіацетил, 4-метоксибензилоксикарбоніл, пара-метоксибензил, метоксикарбоніл, метил, пара-толуолсульфоніл, 2,2,2-трихлоретоксикарбоніл, 2,2,2-трихлоретил, триетилсиліл, трифторацетил, 2-(триметилсиліл)етоксикарбоніл, 2-триметилсилілетил, трифенілметил, 2-(трифенілфосфоніо)етоксикарбоніл і подібні.

Обговорення захисних груп представлено у Т. Н. Greene and P.G.M. Wuts, *Protective Groups in Organic Synthesis*, 3rd Ed., John Wiley & Sons, New York (1999).

Перераховані нижче аббревіатури мають зазначене значення. ADDP означає 1,1'-(азодикарбоніл)дипіперидин; AD-mix-β означає суміш (DHQD)₂PHAL, K₃Fe(CN)₆, K₂CO₃ і K₂SO₄; 9-BBN означає 9-борабіцикло(3,3,1)нонан; (DHQD)₂PHAL означає гідрохінідин 1,4-фталазіндіїлдіетиловий ефір; DBU означає 1,8-діазабіцикло(5.4.0)ундец-7-ен; DIBAL означає діізобутилалюмінійгідрид; DIEA означає діізопропілетиламін; DMAP означає N, N-диметиламінопіридин; DMF означає N, N-диметилформамід; dmpe означає 1,2-біс(диметилфосфіно)етан; DMSO означає диметилсульфоксид; dppb означає 1,4-біс(дифенілфосфіно)бутан; dppe означає 1,2-біс(дифенілфосфіно)етан; dppf означає 1,1'-біс(дифеніл-фосфіно)фероцен; d означає 1,1-біс(дифенілфосфіно)метан; EDAC означає 1-(3-диметиламінопропіл)-3-етилкарбодіїмід; Fmoc означає флуоренілметоксикарбоніл; HATU означає гексафторфосфат О-(7-азабензотриазол-1-іл)-N, N'N'N'-тетраметилуронію; HMPA означає гексаметилфосфорамід; IPA означає ізопропіловий спирт; MP-BH₃ означає макропористий триетиламонійметил-полістиролціаноборогідрид; PyBOP означає гексафторфосфат бензотриазол-1-ілокситрипіролідинофосфонію; TEA означає триетиламін; TFA означає трифтороцтову кислоту; ТГФ означає тетрагідрофуран; NCS означає N-хлорсукцинімід; NMM означає N-метилморфолін; NMP означає N-метилпіролідін і PPh₃ означає трифенілфосфін.

СХЕМА 1



Як показано на Схемі 1, сполуки Формули (1) можуть бути перетворені у сполуки Формули (2) шляхом взаємодії перших з нітратом натрію і водним розчином кислоти з подальшим додаванням водного розчину ацетату натрію і придатного 2-оксоциклоалкілового ефіру.

Приклади кислот включають хлористоводневу кислоту і подібні.

Приклади придатних 2-оксоциклоалкілових ефірів включають етил 2-оксоциклогексанкарбоксилат, етил 2-оксоциклопентанкарбоксилат і подібні.

Реакцію спочатку здійснюють при температурі близько 0 °C, протягом часу від близько 30 хвилин до близько однієї години і потім нагрівають до температури у межах близько 15 °C-25 °C протягом часу від близько однієї до чотирьох годин, у воді.

Сполуки Формули (2) можуть бути перетворені у сполуки Формули (3) шляхом взаємодії перших з розчином борану.

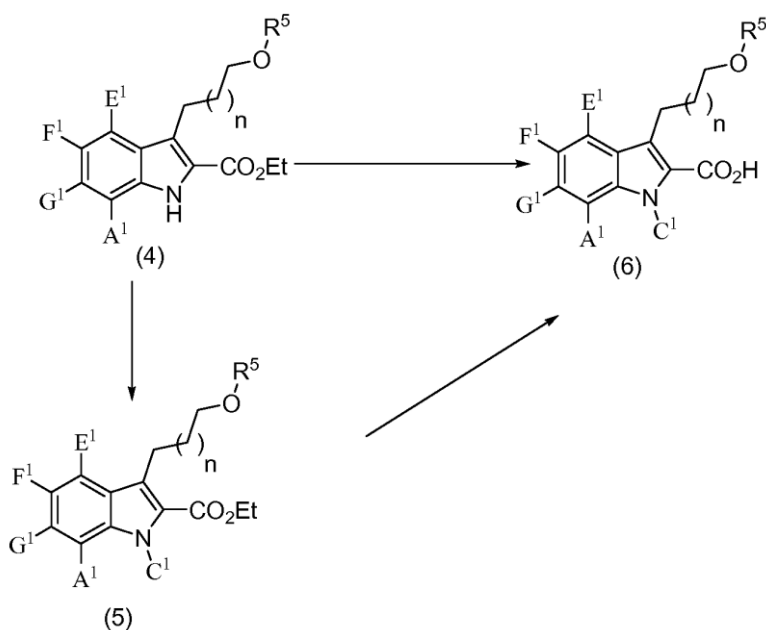
Реакцію типово здійснюють при температурі навколишнього середовища, протягом часу від близько 8 годин до близько 20 годин, у розчиннику, такому як, але не обмежуючись цим, ТГФ.

Сполуки Формули (3) можуть бути перетворені у сполуки Формули (4) шляхом взаємодії перших з R⁵OH, трифенілфосфіном і реагентом, таким як, але не обмежуючись цим, DEAD або TBAD.

Додавання типово здійснюють при температурі нижче кімнатної, перед нагріванням до температури навколишнього середовища, протягом часу близько 8-72 годин, у розчиннику, такому як, але не обмежуючись цим, ТГФ.

Введення груп, представлених як E¹, F¹, G¹ і A¹, можна здійснити шляхом взаємодії заміщених анілінів Формули (1), як показано на Схемі (1). Альтернативно, броманіліни Формули (1) можна піддати взаємодії, як показано на Схемі (1), потім зі здійсненням їх подальшої взаємодії з використанням способів, описаних у літературі (таких як способи, описані у Palladium Reagents and Catalysts: New Perspectives For The 21st Century, By J. Tsuji, John Wiley & Sons, Ltd, Chichester, 200-4. 1-670) і відомих фахівцям у даній галузі для реакцій вуглецевого перехресного зв'язування, що каталізуються паладієм.

СХЕМА 2



Як показано на Схемі 2, сполуки Формули (4) можуть бути перетворені у сполуки Формули (5) шляхом взаємодії перших з основою, а потім з придатною сполукою Формули C¹Br (5a) або C¹Cl (5b).

Приклади основи включають гідрид натрію, карбонат калію і подібні.

Приклади придатних сполук Формули (5a) включають 1-(3-бромпропокси)нафталін і подібні.

Приклади придатних сполук Формули (5b) включають 2-хлор-1-морфоліноетанон і подібні.

Реакцію типово здійснюють при температурі навколишнього середовища або нижче, протягом часу від близько 15 хвилин до однієї години у процесі додавання основи, потім від близько 20 °C до 80 °C, протягом часу від близько однієї до восьми годин після додавання сполуки Формули (5a) або (5b), у розчиннику, такому як, але не обмежуючись цим, DMF.

Сполуки Формули (5) можуть бути перетворені у сполуки Формули (6) шляхом взаємодії перших з основою.

Приклади основ включають гідроксид літію, гідроксид натрію, гідроксид калію і подібні.

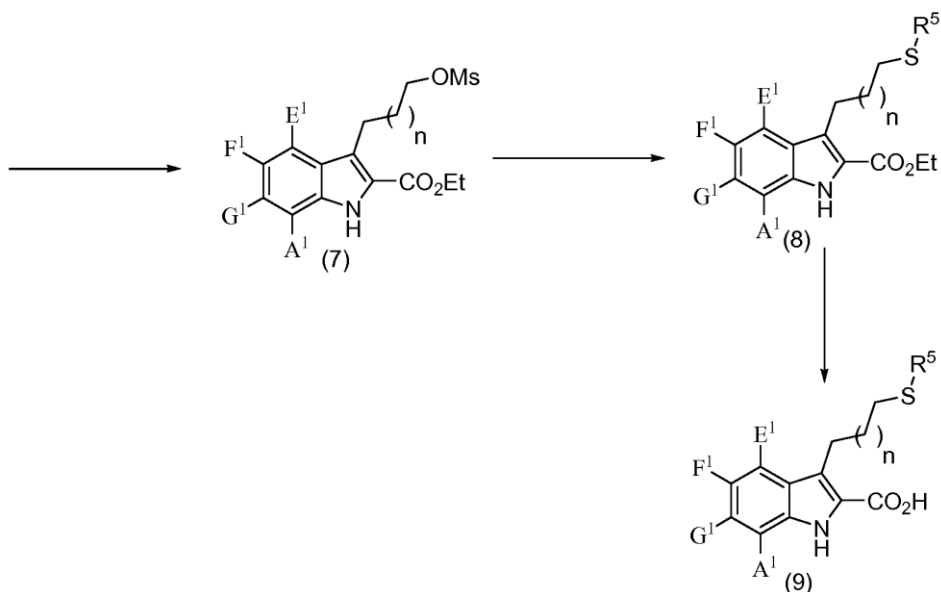
Реакцію типово здійснюють протягом часу від близько 1 години до близько 48 годин, при температурі у межах від близько 0°C до 35°C, у розчинниках, таких як вода, метанол, етанол, ізопропанол, суміш таких розчинників і т.п.

Сполуки Формули (4), де C¹ являє собою H, можуть бути перетворені у сполуки Формули (6) шляхом взаємодії перших з основою.

Приклади основ включають гідроксид літію, гідроксид натрію, гідроксид калію і подібні.

Реакцію типово здійснюють протягом часу від близько 1 години до близько 48 годин, при температурі у межах від близько 0°C до 35°C, у розчинниках, таких як вода, метанол, етанол, ізопропанол, суміш таких розчинників і т.п.

СХЕМА 3



Як показано на Схемі 3, сполуки Формули (3) можуть бути перетворені у сполуки Формули (7) шляхом взаємодії перших з основою, а потім з метансульфонілхлоридом.

Приклади основ включають TEA, піридин і подібні.

Реакцію типово здійснюють протягом часу від близько 30 хвилин до близько трьох годин, при температурі у межах від близько 0°C до 20°C, в ацетонітрилі.

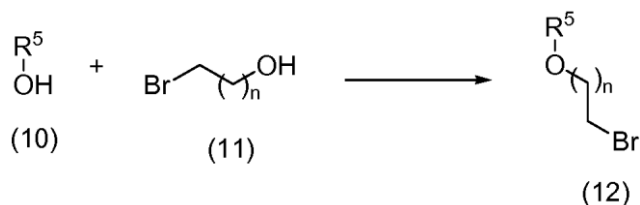
Сполуки Формули (7) можуть бути перетворені у сполуки Формули (8) шляхом взаємодії перших зі сполукою Формули R⁵SH і основою.

Приклади основ включають карбонат калію і карбонат натрію.

Реакцію типово здійснюють протягом від одного до п'яти днів, при температурі у межах від близько 50°C до 100°C, у розчиннику, такому як, але не обмежуючись цим, ацетонітрил.

Сполуки Формули (8) можуть бути перетворені у сполуки Формули (9), як показано на Схемі 2, для перетворення сполук Формули (4) у сполуки Формули (6).

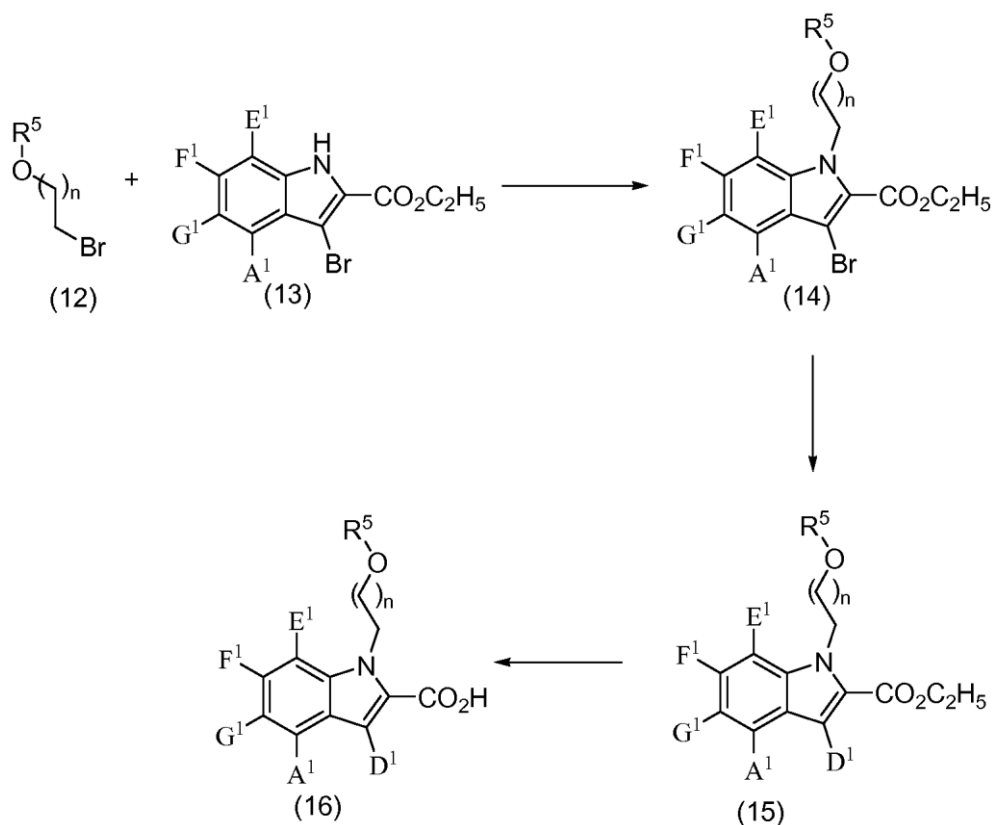
СХЕМА 4



Як показано на Схемі 4, сполуки Формули (10) можуть бути перетворені у сполуки Формули (12) шляхом взаємодії перших зі сполуками Формули (11), трифенілфосфіном і реагентом, таким як, але не обмежуючись цим, DEAD або TBAD.

Додавання можна здійснити при температурі нижче кімнатної, перед нагріванням до температури навколишнього середовища, протягом часу від близько 8 до 72 годин, у розчиннику, такому як, але не обмежуючись цим, ТГФ.

СХЕМА 5



Як показано на Схемі 5, сполуки Формули (12) можуть бути перетворені у сполуки Формули (14) шляхом взаємодії перших, сполуки Формули (13) і основи.

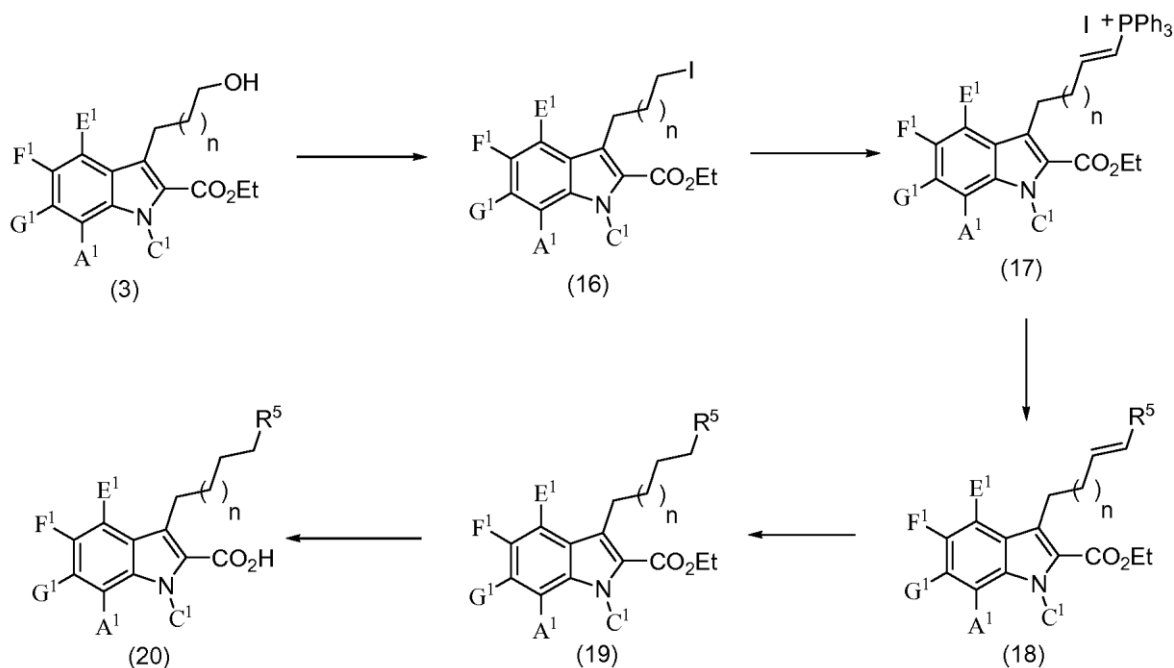
Приклади основ включають гідрид натрію і карбонат калію, і подібні.

Реакцію типово здійснюють при температурі навколишнього середовища або нижче, протягом часу від близько 15 хвилин до однієї години у процесі додавання основи, і потім при температурі у межах від близько 20 °C до 80 °C, протягом часу від близько однієї до восьми годин після додавання сполуки Формули (13), у розчиннику, такому як, але не обмежуючись цим, DMF.

Сполуки Формули (14) можуть бути перетворені у сполуки Формули (15) з використанням способів, описаних у літературі (таких як способи, описані у *Palladium Reagents and Catalysts: New Perspectives For The 21st Century*, By J. Tsuji, John Wiley & Sons, Ltd, Chichester, 200-4. 1-670) і відомих фахівцям у даній галузі для реакцій вуглецевого перехресного зв'язування, що каталізуються паладієм.

Сполуки Формули (15) можуть бути перетворені у сполуки Формули (16), як показано на Схемі 2, для перетворення сполук Формули (4) у сполуки Формули (6).

СХЕМА 6



Як показано на Схемі 6, сполуки Формули (3) можуть бути перетворені у сполуки Формули (16) шляхом взаємодії перших, йоду, трифенілфосфіну та імідазолу, з подальшою взаємодією з основою.

Приклади основ включають карбонат натрію і подібні.

Реакцію типово здійснюють при температурі у межах від близько -10°C до близько 10°C , протягом часу від близько 15 хвилин до однієї години, потім продовжують ще протягом часу від 30 хвилин до однієї години після додавання основи, у розчиннику, такому як, але не обмежуючись цим, дихлорметан.

Сполуки Формули (16) можуть бути перетворені у сполуки Формули (17) шляхом взаємодії перших і трифенілфосфіну.

Реакцію типово здійснюють протягом часу від близько 8 до близько 48 годин при температурі кипіння зі зворотним холодильником, у розчиннику, такому як, але не обмежуючись цим, ацетонітрил або дихлорметан.

Сполуки Формули (17) можуть бути перетворені у сполуки Формули (18) шляхом взаємодії перших, основи і сполуки Формули $R^5C(O)H$.

Приклади основ включають гідрид натрію і н-бутиллітій.

Реакцію спочатку здійснюють протягом близько однієї години, при температурі від близько 60°C до близько 100°C після додавання основи, і потім охолоджують до температури у межах близько 10°C - 25°C і обробляють сполуками Формули (17). Після проходження часу від близько 10 хвилин до близько 20 хвилин додають сполуку Формули $R^5C(O)H$ і суміш знову нагрівають при температурі у межах від близько 60°C до близько 100°C , протягом часу від близько однієї до восьми годин.

Сполуки Формули (18) можуть бути перетворені у сполуки Формули (19) шляхом взаємодії перших з джерелом водню і каталізатором.

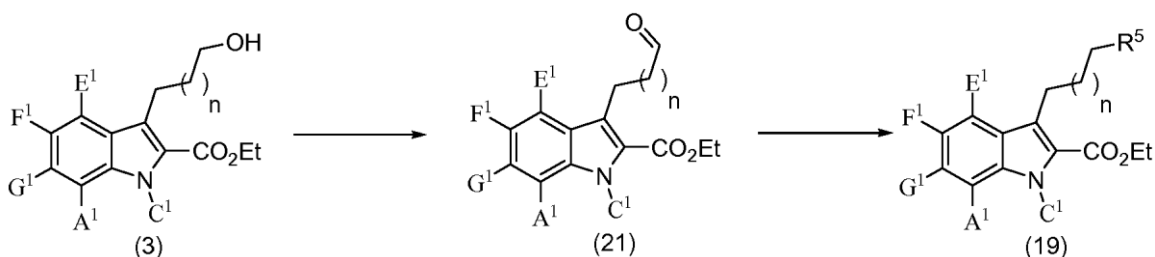
Приклади джерел водню включають гідразин і газоподібний водень.

Приклади каталізаторів включають Pd/C і нікель Ренея, і подібні.

Температуру і тиск варіюють в залежності від способу гідрування і використовуваних субстратів. Типові розчинники включають метанол, етанол, етилацетат і подібні.

Сполуки Формули (19) можуть бути перетворені у сполуки Формули (20), як показано на Схемі 2, для перетворення сполук Формули (4) у сполуки Формули (6).

СХЕМА 7



Як показано на Схемі 7, сполуки Формули (3) можуть бути перетворені у сполуки Формули (21) шляхом взаємодії перших, DMSO, основи і агента дегідратування.

Приклади основ включають триетиламін, діізопропіламін і подібні.

Приклади дегідратуючих речовин включають оксалілхлорид, трифтороцтовий ангідрид і піридинсульфат.

Реакцію типово здійснюють протягом часу від близько однієї до близько восьми годин, при температурі у межах від близько -60°C до близько 0°C , в залежності від використовуваних субстрату і способу.

Наведені далі приклади представлені з метою забезпечення, як вважають, найбільш корисного і найбільш зрозумілого опису процедур і концептуальних аспектів даного винаходу.

ПРИКЛАД 1А

етил 7-бром-3-(3-етоксі-3-оксопропіл)-1Н-індол-2-карбоксилат

Суміш 2-броманіліну (34,2 г) у 5М НСІ (50 мл) і воді (250 мл) при 0°C обробляли за допомогою NaNO_2 (13,8 г) у воді (200 мл). Після завершення додавання, додавали ацетат натрію (92,3 г) у воді (250 мл) і етиловий ефір 2-оксо-циклопентанкарбонової кислоти (30 мл). Суміш перемішували протягом 15 хвилин, нагрівали до 19°C протягом двох годин і екстрагували дихлорметаном. Екстракт сушили (MgSO_4), фільтрували і концентрували. Концентрат розчиняли у суміші 1,1:1 H_2SO_4 :етанол (30 мл), кип'ятили зі зворотним холодильником протягом ночі, охолоджували до кімнатної температури, гасили водою (1,5 л) і фільтрували. Фільтрат розчиняли у дихлорметані (200 мл) і фільтрували через картридж Flash 75 з використанням дихлорметану. Після концентрування продукт перекристалізовували з гексану.

ПРИКЛАД 1В

етил 7-бром-3-(3-гідроксипропіл)-1Н-індол-2-карбоксилат

До суміші сполуки Прикладу 1А (1,85 г) у ТГФ (50 мл) додавали розчин 1М борану у ТГФ (30 мл). Суміш перемішували при кімнатній температурі протягом 16 годин, гасили метанолом (10 мл) і концентрували. Концентрат очищали колонковою флеш-хроматографією на силікагелі з використанням суміші 5-25 % етилацетату/гексан.

ПРИКЛАД 1С

етил 7-бром-3-(3-(нафталін-1-ілокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбоксилат

До суміші сполуки Прикладу 1В (10,87 г), 1-нафтолу (5,77 г) і трифенілфосфіну (10,5 г) у ТГФ (100 мл) додавали ди-трет-бутилазодикарбоксилат (9,21 г). Суміш перемішували протягом 3 днів, концентрували, знову розчиняли у дихлорметані, промивали водою і насиченим сольовим розчином, і сушили (MgSO_4), фільтрували і концентрували. Концентрат очищали колонковою флеш-хроматографією на силікагелі з використанням суміші 0-10 % етилацетату у гексані. Продукт перекристалізовували з гексану.

ПРИКЛАД 1D

3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-((Е)-2-фенілвініл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

Суміш сполуки Прикладу 1С (0,034 г), (Е)-стирилборонової кислоти (0,1 г), дихлориду біс(трифенілфосфін)паладію(II) (4 мг) і розчину 2М Na_2CO_3 (0,5 мл) у 7:2:3 диметоксіетані/етанолі/воді (3 мл) піддавали мікрохвильовому нагріванню (CEM Discover) при 150°C протягом 30 хвилин, гасили за допомогою 1М НСІ (0,4 мл) і екстрагували етилацетатом. Екстракт фільтрували через картридж, що осушує, (MgSO_4 , Alltech Assoc., 2 г) і концентрували. Концентрат очищали за допомогою зворотно-фазової ВЕРХ (Zorbax SB-C18, 20-100 % ацетонітрилу/вода/0,1 % TFA). ^1H ЯМР (400 МГц, DMCO-d_6) δ 13,03 (шир.с, 1H), 11,68 (с, 1H), 8,23 (м, 1H), 8,14 (д, 1H), 7,86 (м, 1H), 7,76 (д, 1H), 7,68 (д, 1H), 7,61 (д, 1H), 7,52 (м, 2H), 7,41 (м, 4H), 7,29 (м, 2H), 7,01 (т, 1H), 6,88 (д, 1H), 4,17 (т, 2H), 2,22 (м, 2H).

ПРИКЛАД 2

3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-феніл-1Н-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання фенілборонової кислоти замість (Е)-стирилборонової кислоти у процедурі Прикладу 1D. ^1H ЯМР (400 МГц, DMCO-d_6) δ

12,97 (с, 1H), 10,29 (с, 1H), 8,23 (м, 1H), 7,86 (м, 1H), 7,69 (д, 1H), 7,64 (м, 2H), 7,52 (м, 4H), 7,41 (м, 3H), 7,25 (м, 1H), 7,10 (т, 1H), 6,89 (д, 1H), 4,20 (т, 2H), 3,37 (м, 2H), 2,24 (м, 2H).

ПРИКЛАД 3

3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-((1E)-3-фенілпроп-1-еніл)-1H-індол-2-карбонова кислота

5 Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання (E)-3-фенілпроп-1-енілборонової кислоти замість (E)-стирилборонової кислоти у процедурі Прикладу 1D. ¹H ЯМР (400 МГц, ДМСО-d₆) δ 13,02 (шир.с, 1H), 11,38 (с, 1H), 8,20 (м, 1H), 7,85 (м, 1H), 7,36 (м, 12H), 6,93 (т, 1H), 6,86 (д, 1H), 6,44 (м, 1H), 4,15 (т, 2H), 3,58 (д, 2H), 2,20 (м, 2H).

ПРИКЛАД 4

7-((E)-2-циклогексилвініл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

10 Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання (E)-2-циклогексилвінілборонової кислоти замість (E)-стирилборонової кислоти у процедурі Прикладу 1D. ¹H ЯМР (400 МГц, ДМСО-d₆) δ 13,02 (шир.с, 1H), 11,37 (с, 1H), 8,21 (м, 1H), 7,85 (м, 1H), 7,51 (м, 3H), 7,44 (м, 1H), 7,36 (м, 2H), 7,19 (д, 1H), 6,89 (м, 2H), 6,30 (м, 1H), 4,15 (т, 2H), 2,19 (м, 3H), 1,77 (м, 5H), 1,27 (м, 5H).

ПРИКЛАД 5

7-(3-(бензилокси)феніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

20 Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 3-(бензилокси)-фенілборонової кислоти замість (E)-стирилборонової кислоти у процедурі Прикладу 1D. ¹H ЯМР (400 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,99 (шир.с, 1H), 10,34 (с, 1H), 8,22 (м, 1H), 7,86 (м, 1H), 7,69 (д, 1H), 7,36 (м, 13H), 7,07 (м, 2H), 6,89 (д, 1H), 5,19 (с, 2H), 4,20 (т, 2H), 3,37 (т, 2H), 2,24 (м, 2H).

ПРИКЛАД 6

7-(4-фторфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

25 Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 4-фторфеніл-боронової кислоти замість (E)-стирилборонової кислоти у процедурі Прикладу 1D. ¹H ЯМР (400 МГц, ДМСО-d₆) δ 13,00 (шир.с, 1H), 10,54 (с, 1H), 8,22 (м, 1H), 7,86 (м, 1H), 7,70 (д, 1H), 7,64 (м, 2H), 7,49 (м, 3H), 7,34 (м, 3H), 7,21 (д, 1H), 7,08 (т, 1H), 6,89 (д, 1H), 4,19 (т, 2H), 3,37 (т, 2H), 2,24 (м, 2H).

ПРИКЛАД 7

7-(2-нафтил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

30 Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 2-нафтилборонової кислоти замість (E)-стирилборонової кислоти у процедурі Прикладу 1D. ¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆) δ 13,01 (шир.с, 1H), 10,69 (с, 1H), 8,25 (м, 1H), 8,17 (с, 1H), 8,01 (м, 3H), 7,87 (м, 1H), 7,74 (м, 2H), 7,55 (м, 4H), 7,45 (д, 1H), 7,36 (м, 2H), 7,13 (т, 1H), 6,90 (д, 1H), 4,21 (т, 2H), 3,39 (т, 2H), 2,26 (м, 2H).

ПРИКЛАД 8

7-(1-нафтил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

40 Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 1-нафтилборонової кислоти замість (E)-стирилборонової кислоти у процедурі Прикладу 1D. ¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,90 (шир.с, 1H), 10,54 (с, 1H), 8,27 (м, 1H), 8,01 (м, 2H), 7,88 (м, 1H), 7,79 (д, 1H), 7,61 (т, 1H), 7,50 (м, 5H), 7,40 (м, 3H), 7,20 (д, 1H), 7,15 (т, 1H), 6,92 (д, 1H), 4,23 (с, 2H), 3,40 (м, 2H), 2,27 (м, 2H).

ПРИКЛАД 9

7-(1,1'-біфеніл-2-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

45 Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання біфеніл-2-ілборонової кислоти замість (E)-стирилборонової кислоти у процедурі Прикладу 1D. ¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,90 (шир.с, 1H), 10,22 (с, 1H), 8,24 (м, 1H), 7,86 (м, 1H), 7,50 (м, 8H), 7,38 (т, 1H), 7,09 (м, 5H), 6,86 (м, 3H), 4,14 (т, 2H), 2,18 (м, 2H).

ПРИКЛАД 10

7-(2-морфолін-4-ілфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

50 Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 2-морфолінофеніл-боронової кислоти замість (E)-стирилборонової кислоти у процедурі Прикладу 1D. ¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆) δ 13,11 (шир.с, 1H), 10,07 (с, 1H), 8,24 (д, 1H), 7,85 (м, 1H), 7,74 (д, 1H), 7,44 (м, 7H), 7,14 (м, 3H), 6,86 (д, 1H), 4,18 (т, 2H), 3,25 (м, 4H), 2,78 (м, 4H), 2,26 (м, 2H).

ПРИКЛАД 11

7-(2-фтор-1,1'-біфеніл-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

55 Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 2-фторбіфеніл-4-ілборонової кислоти замість (E)-стирилборонової кислоти у процедурі Прикладу 1D. ¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆) δ 13,07 (шир.с, 1H), 10,86 (с, 1H), 8,23 (м, 1H), 7,87 (м, 1H), 7,74 (д, 1H), 7,65 (м, 3H),

7,53 (м, 6H), 7,41 (м, 3H), 7,32 (д, 1H), 7,11 (т, 1H), 6,90 (д, 1H), 4,20 (т, 2H), 3,38 (т, 2H), 2,24 (м, 2H).

ПРИКЛАД 12

7-(4-(бензилокси)феніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

5 Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 4-(бензилокси)-фенілборонової кислоти замість (Е)-стирилборонової кислоти у процедурі Прикладу 1D. ¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆) δ 13,04 (шир.с, 1H), 10,27 (с, 1H), 8,23 (м, 1H), 7,87 (м, 1H), 7,65 (д, 1H), 7,54 (м, 6H), 7,39 (м, 5H), 7,18 (м, 3H), 7,07 (т, 1H), 6,90 (д, 1H), 5,19 (с, 2H), 4,19 (т, 2H), 2,23 (м, 2H).

ПРИКЛАД 13

7-(3-морфолін-4-ілфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

10 Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 3-морфолінофеніл-боронової кислоти замість (Е)-стирилборонової кислоти у процедурі Прикладу 1D. ¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆) δ 13,03 (шир.с, 1H), 10,21 (с, 1H), 8,22 (м, 1H), 7,86 (м, 1H), 7,68 (д, 1H), 7,52 (м, 2H), 7,45 (д, 1H), 7,38 (д, 2H), 7,25 (д, 1H), 7,06 (м, 4H), 6,89 (д, 1H), 4,19 (т, 2H), 3,76 (т, 4H), 3,19 (т, 4H), 2,23 (м, 2H).

ПРИКЛАД 14

3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-піридин-3-іл-1H-індол-2-карбонова кислота

20 Сполуку даного прикладу одержували у вигляді TFA солі шляхом використання 3-піридилборонової кислоти замість (Е)-стирилборонової кислоти у процедурі Прикладу 1D. ¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆) δ 13,13 (шир.с, 1H), 11,30 (с, 1H), 8,96 (с, 1H), 8,76 (м, 1H), 8,31 (д, 1H), 8,22 (д, 1H), 7,84 (м, 3H), 7,52 (м, 2H), 7,45 (д, 1H), 7,38 (т, 1H), 7,29 (д, 1H), 7,14 (т, 1H), 6,89 (д, 1H), 4,19 (т, 2H), 3,38 (т, 2H), 2,24 (м, 2H).

ПРИКЛАД 15

3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-піридин-4-іл-1H-індол-2-карбонова кислота

25 Сполуку даного прикладу одержували у вигляді TFA солі шляхом використання 4-піридилборонової кислоти замість (Е)-стирилборонової кислоти у процедурі Прикладу 1D. ¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆) δ 13,18 (шир.с, 1H), 11,18 (с, 1H), 8,84 (м, 2H), 8,21 (д, 1H), 7,98 (м, 2H), 7,86 (д, 2H), 7,45 (м, 5H), 7,16 (м, 1H), 6,89 (д, 1H), 4,19 (т, 2H), 3,39 (т, 2H), 2,24 (м, 2H).

ПРИКЛАД 16

3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-((1Е)-5-фенілпент-1-еніл)-1H-індол-2-карбонова кислота

30 Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання (Е)-5-фенілпент-1-енілборонової кислоти замість (Е)-стирилборонової кислоти у процедурі Прикладу 1D. ¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆) δ 13,00 (шир.с, 1H), 11,38 (с, 1H), 8,22 (м, 1H), 7,85 (м, 1H), 7,52 (м, 3H), 7,40 (м, 3H), 7,23 (м, 6H), 6,94 (т, 1H), 6,85 (д, 1H), 6,37 (м, 1H), 4,15 (т, 2H), 2,66 (т, 2H), 2,28 (м, 2H), 2,19 (м, 2H), 1,82 (м, 2H).

ПРИКЛАД 17

7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

40 Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 2-метилфенілборонової кислоти замість (Е)-стирилборонової кислоти у процедурі Прикладу 1D. ¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,95 (шир.с, 1H), 10,49 (с, 1H), 8,26 (д, 1H), 7,87 (д, 1H), 7,69 (д, 1H), 7,53 (м, 2H), 7,45 (д, 1H), 7,39 (т, 1H), 7,26 (м, 4H), 7,06 (м, 2H), 6,90 (д, 1H), 4,21 (т, 2H), 2,24 (м, 2H), 2,06 (с, 3H).

ПРИКЛАД 18

7-(3-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

45 Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 3-метилфеніл-боронової кислоти замість (Е)-стирилборонової кислоти у процедурі Прикладу 1D. ¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆) δ 13,02 (шир.с, 1H), 10,32 (с, 1H), 8,22 (м, 1H), 7,87 (м, 1H), 7,68 (д, 1H), 7,52 (м, 2H), 7,41 (м, 5H), 7,23 (м, 2H), 7,09 (т, 1H), 6,89 (д, 1H), 4,19 (т, 2H), 2,41 (с, 3H), 2,24 (м, 2H).

ПРИКЛАД 19

7-(4-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

50 Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 4-метилфеніл-боронової кислоти замість (Е)-стирилборонової кислоти у процедурі Прикладу 1D. ¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆) δ 13,05 (шир.с, 1H), 10,25 (с, 1H), 8,22 (м, 1H), 7,86 (м, 1H), 7,67 (д, 1H), 7,50 (м, 5H), 7,36 (м, 3H), 7,22 (д, 1H), 7,08 (т, 1H), 6,89 (д, 1H), 4,19 (т, 2H), 2,39 (с, 3H), 2,23 (м, 2H).

ПРИКЛАД 20

7-(4-карбоксифеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

60 Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 4-(метоксикарбоніл)-фенілборонової кислоти замість (Е)-стирилборонової кислоти у процедурі Прикладу 1D. ¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆) δ 13,01 (шир.с, 2H), 10,73 (с, 1H), 8,23 (м, 1H), 8,06 (д, 2H), 7,87 (м, 1H), 7,74 (м, 3H), 7,50 (м, 3H), 7,38 (т, 1H), 7,11 (т, 1H), 6,89 (д, 1H), 4,19 (т, 2H), 2,24 (м, 2H).

ПРИКЛАД 21

7-(3-карбоксифеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 3-(метоксикарбоніл)-фенілборонової кислоти замість (Е)-стирилборонової кислоти у процедурі Прикладу 1D. ¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆) δ 13,02 (шир.с, 2H), 10,84 (с, 1H), 8,23 (м, 1H), 8,12 (м, 1H), 7,98 (м, 1H), 7,85 (м, 2H), 7,72 (д, 1H), 7,63 (т, 1H), 7,52 (м, 2H), 7,45 (д, 1H), 7,39 (т, 1H), 7,24 (д, 1H), 7,10 (т, 1H), 6,90 (д, 1H), 4,19 (т, 2H), 3,38 (т, 2H), 2,24 (м, 2H).

ПРИКЛАД 22

7-(2-(бензилокси)феніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 2-(бензилокси)-фенілборонової кислоти замість (Е)-стирилборонової кислоти у процедурі Прикладу 1D. ¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,95 (шир.с, 1H), 10,35 (с, 1H), 8,27 (м, 1H), 7,87 (м, 1H), 7,67 (д, 1H), 7,53 (м, 2H), 7,40 (м, 4H), 7,24 (д, 1H), 7,10 (м, 8H), 6,87 (д, 1H), 5,09 (с, 2H), 4,17 (т, 2H), 2,24 (м, 2H).

ПРИКЛАД 23

7-(2-етоксифеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 2-етоксифеніл-боронової кислоти замість (Е)-стирилборонової кислоти у процедурі Прикладу 1D. ¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆) δ 13,01 (шир.с, 1H), 9,93 (с, 1H), 8,25 (м, 1H), 7,87 (м, 1H), 7,70 (д, 1H), 7,44 (м, 6H), 7,17 (м, 2H), 7,06 (м, 2H), 6,89 (д, 1H), 4,19 (т, 2H), 4,09 (кв, 2H), 2,24 (м, 2H), 1,15 (т, 3H).

ПРИКЛАД 24

7-(2-етилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 2-етилфенілборонової кислоти замість (Е)-стирилборонової кислоти у процедурі Прикладу 1D. ¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,93 (шир.с, 1H), 10,40 (с, 1H), 8,26 (м, 1H), 7,87 (м, 1H), 7,69 (д, 1H), 7,53 (м, 2H), 7,45 (д, 1H), 7,38 (м, 3H), 7,26 (м, 1H), 7,18 (д, 1H), 7,05 (м, 2H), 6,91 (д, 1H), 4,21 (т, 2H), 2,33 (м, 4H), 0,94 (т, 3H).

ПРИКЛАД 25

7-(2-метоксифеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 2-метоксифеніл-боронової кислоти замість (Е)-стирилборонової кислоти у процедурі Прикладу 1D. ¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,97 (шир.с, 1H), 10,09 (с, 1H), 8,26 (м, 1H), 7,87 (м, 1H), 7,68 (д, 1H), 7,53 (м, 2H), 7,42 (м, 3H), 7,29 (м, 1H), 7,15 (м, 2H), 7,06 (м, 2H), 6,91 (д, 1H), 4,20 (т, 2H), 3,74 (с, 3H), 2,24 (м, 2H).

ПРИКЛАД 26

7-(2-ізопропоксифеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 2-ізопропоксифеніл-боронової кислоти замість (Е)-стирилборонової кислоти у процедурі Прикладу 1D. ¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆) δ 13,04 (шир.с, 1H), 9,73 (с, 1H), 8,24 (м, 1H), 7,86 (м, 1H), 7,70 (д, 1H), 7,52 (м, 2H), 7,45 (д, 1H), 7,38 (м, 3H), 7,20 (м, 2H), 7,08 (м, 2H), 6,89 (д, 1H), 4,62 (м, 1H), 4,19 (т, 2H), 3,37 (т, 2H), 2,24 (м, 2H), 1,13 (д, 6H).

ПРИКЛАД 27

3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2-феноксифеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 2-феноксифеніл-боронової кислоти замість (Е)-стирилборонової кислоти у процедурі Прикладу 1D. ¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 13,00 (шир.с, 1H), 10,56 (с, 1H), 8,25 (м, 1H), 7,86 (м, 1H), 7,64 (д, 1H), 7,45 (м, 6H), 7,23 (м, 4H), 6,94 (м, 6H), 4,17 (т, 2H), 2,21 (м, 2H).

ПРИКЛАД 28

7-(2-карбоксифеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 2-(діетилкарбамоїл)фенілборонової кислоти замість (Е)-стирилборонової кислоти у процедурі Прикладу 1D. ¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,90 (шир.с, 1H), 12,42 (шир.с, 1H), 10,56 (с, 1H), 8,27 (м, 1H), 7,87 (м, 2H), 7,52 (м, 8H), 7,03 (м, 2H), 6,92 (д, 1H), 4,21 (т, 2H), 2,23 (м, 2H).

ПРИКЛАД 30

3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2-((5,6,7,8-тетрагідронафталін-1-ілокси)метил)феніл)-1H-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 2-((5,6,7,8-тетрагідронафталін-1-ілокси)метил)фенілборонової кислоти замість (Е)-стирилборонової кислоти у процедурі Прикладу 1D. ¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,94 (шир.с, 1H), 10,49 (с, 1H), 8,24 (м, 1H), 7,86 (м, 1H), 7,66 (м, 2H), 7,44 (м, 7H), 7,08 (м, 2H), 6,85 (м, 2H), 6,56 (д, 1H), 6,37 (д, 1H), 4,80 (шир.с, 2H), 4,18 (т, 2H), 2,60 (м, 2H), 2,39 (м, 2H), 2,24 (м, 2H), 1,62 (м, 4H).

ПРИКЛАД 31

7-(4-циклогексилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 4-циклогексилфеніл-боронової кислоти замість (Е)-стирилборонової кислоти у процедурі Прикладу 1D. ¹Н ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 13,04 (шир.с, 1Н), 10,26 (с, 1Н), 8,23 (м, 1Н), 7,86 (м, 1Н), 7,67 (д, 1Н), 7,45 (м, 8Н), 7,23 (м, 1Н), 7,08 (т, 1Н), 6,89 (д, 1Н), 4,19 (т, 2Н), 3,37 (т, 2Н), 2,59 (м, 1Н), 2,24 (м, 2Н), 1,80 (м, 5Н), 1,39 (м, 5Н).

ПРИКЛАД 32

7-(2-хлорфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 2-хлорфеніл-боронової кислоти замість (Е)-стирилборонової кислоти у процедурі Прикладу 1D. ¹Н ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,97 (шир.с, 1Н), 10,91 (с, 1Н), 8,27 (м, 1Н), 7,87 (м, 1Н), 7,73 (м, 1Н), 7,54 (м, 3Н), 7,42 (м, 5Н), 7,08 (м, 2Н), 6,91 (д, 1Н), 4,21 (т, 2Н), 3,37 (т, 2Н), 2,23 (м, 2Н).

ПРИКЛАД 33

7-(3-хлорпіридин-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували у вигляді ТФА солі шляхом використання 2-хлорпіридин-4-ил-боронової кислоти замість (Е)-стирилборонової кислоти у процедурі Прикладу 1D. ¹Н ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆) δ 13,03 (шир.с, 1Н), 11,28 (с, 1Н), 8,72 (с, 1Н), 8,57 (д, 1Н), 8,25 (м, 1Н), 7,87 (м, 1Н), 7,79 (д, 1Н), 7,53 (м, 2Н), 7,45 (м, 2Н), 7,39 (т, 1Н), 7,11 (м, 2Н), 6,91 (д, 1Н), 4,20 (т, 2Н), 2,23 (м, 2Н).

ПРИКЛАД 34

7-(2,5-дихлорфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 2,5-дихлорфеніл-боронової кислоти замість (Е)-стирилборонової кислоти у процедурі Прикладу 1D. ¹Н ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,96 (шир.с, 1Н), 11,43 (с, 1Н), 8,24 (м, 1Н), 7,86 (м, 1Н), 7,65 (д, 1Н), 7,52 (м, 2Н), 7,45 (д, 1Н), 7,38 (м, 2Н), 7,21 (т, 1Н), 6,95 (т, 1Н), 6,87 (д, 1Н), 4,16 (т, 2Н), 2,21 (м, 2Н).

ПРИКЛАД 35

7-(3,5-дихлорфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 3,5-дихлорфеніл-боронової кислоти замість (Е)-стирилборонової кислоти у процедурі Прикладу 1D. ¹Н ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,94 (шир.с, 1Н), 11,02 (с, 1Н), 8,27 (м, 1Н), 7,86 (м, 2Н), 7,67 (м, 2Н), 7,53 (м, 2Н), 7,46 (д, 1Н), 7,39 (м, 2Н), 7,03 (м, 2Н), 6,91 (д, 1Н), 4,21 (т, 2Н), 2,24 (м, 2Н).

ПРИКЛАД 36

7-(2,3-диметоксифеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 2,3-диметоксифеніл-боронової кислоти замість (Е)-стирилборонової кислоти у процедурі Прикладу 1D. ¹Н ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆) δ 13,05 (шир.с, 1Н), 10,03 (с, 1Н), 8,25 (м, 1Н), 7,87 (м, 1Н), 7,71 (д, 1Н), 7,52 (м, 2Н), 7,45 (д, 1Н), 7,39 (т, 1Н), 7,14 (м, 4Н), 6,92 (м, 2Н), 4,20 (т, 2Н), 3,88 (с, 3Н), 3,43 (с, 3Н), 2,24 (м, 2Н).

ПРИКЛАД 37

7-(2,4-диметоксифеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 2,4-диметоксифеніл-боронової кислоти замість (Е)-стирилборонової кислоти у процедурі Прикладу 1D. ¹Н ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,96 (шир.с, 1Н), 9,99 (с, 1Н), 8,27 (м, 1Н), 7,87 (м, 1Н), 7,64 (д, 1Н), 7,53 (м, 2Н), 7,46 (д, 1Н), 7,39 (т, 1Н), 7,21 (м, 1Н), 7,10 (м, 1Н), 7,03 (м, 1Н), 6,90 (м, 1Н), 6,71 (м, 1Н), 6,65 (м, 1Н), 4,19 (т, 2Н), 3,84 (с, 3Н), 3,74 (с, 3Н), 2,24 (м, 2Н).

ПРИКЛАД 38

7-(2,5-диметоксифеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 2,5-диметоксифеніл-боронової кислоти замість (Е)-стирилборонової кислоти у процедурі Прикладу 1D. ¹Н ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,99 (шир.с, 1Н), 10,08 (с, 1Н), 8,26 (м, 1Н), 7,87 (м, 1Н), 7,68 (д, 1Н), 7,53 (м, 2Н), 7,46 (д, 1Н), 7,39 (т, 1Н), 7,17 (д, 1Н), 7,07 (м, 2Н), 6,98 (м, 1Н), 6,90 (д, 1Н), 6,87 (д, 1Н), 4,20 (т, 2Н), 3,75 (с, 3Н), 3,68 (с, 3Н), 2,24 (м, 2Н).

ПРИКЛАД 39

7-(2,6-диметоксифеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 2,6-диметоксифеніл-боронової кислоти замість (Е)-стирилборонової кислоти у процедурі Прикладу 1D. ¹Н ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,87 (шир.с, 1Н), 10,18 (с, 1Н), 8,30 (м, 1Н), 7,88 (м, 1Н), 7,62 (м, 1Н), 7,53 (м, 2Н), 7,46 (д, 1Н), 7,38 (м, 2Н), 7,01 (м, 2Н), 6,93 (д, 1Н), 6,76 (д, 2Н), 4,22 (с, 2Н), 3,62 (с, 6Н), 2,23 (м, 2Н).

ПРИКЛАД 40

7-(4-метоксипіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували у вигляді TFA солі шляхом використання 4-метоксипіридин-3-іл-боронової кислоти замість (Е)-стирилборонової кислоти у процедурі Прикладу 1D. ¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆) δ 13,02 (шир.с, 1H), 10,94 (с, 1H), 8,37 (м, 1H), 8,24 (м, 1H), 7,88 (м, 2H), 7,70 (д, 1H), 7,52 (м, 2H), 7,45 (д, 1H), 7,38 (т, 1H), 7,19 (д, 1H), 7,07 (т, 1H), 6,94 (д, 1H), 6,89 (д, 1H), 4,19 (т, 2H), 3,93 (с, 3H), 2,23 (м, 2H).

ПРИКЛАД 41

7-(2-метоксипіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували у вигляді TFA солі шляхом використання 2-метоксипіридин-3-іл-боронової кислоти замість (Е)-стирилборонової кислоти у процедурі Прикладу 1D. ¹H ЯМР (400 МГц, ДМСО-d₆) δ 13,00 (шир.с, 1H), 10,85 (с, 1H), 8,25 (м, 2H), 7,87 (м, 1H), 7,68 (м, 2H), 7,53 (м, 2H), 7,46 (д, 1H), 7,39 (т, 1H), 7,08 (м, 3H), 6,90 (м, 1H), 4,20 (т, 2H), 3,83 (с, 3H), 2,22 (м, 2H).

ПРИКЛАД 42

3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-хінолін-4-іл-1H-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували у вигляді TFA солі шляхом використання хінолін-4-ілборонової кислоти замість (Е)-стирилборонової кислоти у процедурі Прикладу 1D. ¹H ЯМР (400 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,96 (шир.с, 1H), 11,01 (с, 1H), 9,06 (д, 1H), 8,25 (м, 1H), 8,18 (д, 1H), 7,86 (м, 3H), 7,64 (д, 1H), 7,47 (м, 6H), 7,22 (м, 2H), 6,92 (м, 1H), 4,23 (т, 2H), 2,27 (м, 2H).

ПРИКЛАД 43A

етил 3-(3-(нафталін-1-ілокси)пропіл)-7-(4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-діокса-боролан-2-іл)-1H-індол-2-карбоксилат

Суміш сполуки Прикладу 1C (1,0 г), біс(пінаколато)дибору (674 мг), ацетату калію (998 мг) і (1,1'-біс(дифенілфосфіно)фероцен)дихлорпаладію(II) (81 мг) у DMF (10 мл) нагрівали при 60°C протягом ночі і концентрували. Концентрат розподіляли між дихлорметаном і водою. Екстракт промивали водою і насиченим сольовим розчином, і сушили (Na₂SO₄), фільтрували і концентрували. Концентрат завантажували на картридж з силікагелем та елюювали сумішшю 5 % етилацетату/гексан.

ПРИКЛАД 43B

7-(4-гідрокси-2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

До суміші сполуки Прикладу 43A (50 мг) і 4-бром-3-метилфенолу (22 мг) у ТГФ (2 мл) додавали трис(добензиліденацетон)дипаладій(0) (4,6 мг) і три-трет-бутилфосфітетрафторборат (1,45 мг). Суміш перемішували при температурі навколишнього середовища протягом ночі і розподіляли між етилацетатом (150 мл) і водою (50 мл). Екстракт промивали насиченим сольовим розчином, сушили над сульфатом натрію і фільтрували. Фільтрат концентрували і концентрат завантажували на картридж з силікагелем та елюювали етилацетатом (5 %) у гексані з одержанням продукту, який розчиняли у ТГФ (2 мл), метанолі (1 мл) і воді (1 мл), і гідролізували за допомогою LiOH (100 мг) протягом ночі. Суміш підкислювали за допомогою 5 % водного розчину HCl і екстрагували етилацетатом. Екстракт промивали водою і насиченим сольовим розчином, і сушили (Na₂SO₄), фільтрували і концентрували. Концентрат очищали за допомогою зворотно-фазової ВЕРХ, як описано у Прикладі 1D. ¹H ЯМР (300 МГц, CDCl₃) δ 8,39 (д, 1H), 8,35 (д, 1H), 7,77 (д, 1H), 7,72 (дд, 1H), 7,13-7,50 (м, 6H), 6,85 (д, 1H), 6,76 (т, 2H), 4,21 (т, 2H), 3,47 (т, 2H), 2,38 (м, 2H), 2,13 (с, 3H).

ПРИКЛАД 44

7-(2-(4-метилпіперазин-1-іл)феніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували у вигляді TFA солі шляхом використання сполуки Прикладу 43A замість (Е)-стирилборонової кислоти і використання 1-(2-бромфеніл)-4-метилпіперазину замість сполуки Прикладу 1C у процедурі Прикладу 1D. ¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 13,10 (шир.с, 1H), 10,43 (с, 1H), 8,25 (м, 1H), 7,87 (м, 1H), 7,74 (д, 1H), 7,46 (м, 6H), 7,31 (дд, 1H), 7,15 (м, 3H), 6,90 (м, 1H), 4,19 (т, 2H), 3,19 (м, 4H), 2,82 (м, 2H), 2,59 (с, 3H), 2,25 (м, 2H).

ПРИКЛАД 45

7-(2,4-дихлорфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 2,4-дихлорфеніл-боронової кислоти замість (Е)-стирилборонової кислоти у процедурі Прикладу 1D. ¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆) δ 13,06 (шир.с, 1H), 10,70 (с, 1H), 8,22 (м, 1H), 7,87 (м, 1H), 7,71 (д, 1H), 7,62 (м, 2H), 7,53 (м, 3H), 7,45 (д, 1H), 7,38 (т, 1H), 7,22 (д, 1H), 7,09 (т, 1H), 6,89 (д, 1H), 4,19 (т, 2H), 2,23 (м, 2H).

ПРИКЛАД 46

7-(4-карбокси-2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 4-(метоксикарбоніл)-2-метилфенілборонової кислоти замість (Е)-стирилборонової кислоти у процедурі Прикладу 1D.

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆) δ 13,02 (шир.с, 2H), 10,87 (с, 1H), 8,25 (м, 1H), 7,86 (м, 3H), 7,73 (д, 1H), 7,53 (м, 2H), 7,46 (д, 1H), 7,39 (м, 1H), 7,32 (д, 1H), 7,07 (м, 2H), 6,91 (д, 1H), 4,21 (т, 2H), 2,24 (м, 2H), 2,10 (с, 3H).

ПРИКЛАД 47A

етил 3-(3-гідроксипропіл)-7-(2-метоксифеніл)-1H-індол-2-карбоксилат

Суміш сполуки Прикладу 1B (456 мг) і 2-метоксифенілборонової кислоти (182,4 мг) у ТГФ (10 мл), трис(добензиліденацетон)дипаладію(0) (46 мг), три-трет-бутилфосфінтетрафторборату (15 мг) і CsF (456 мг) перемішували при температурі навколишнього середовища, розбавляли етилацетатом (200 мл), промивали водою і насиченим сольовим розчином, і сушили (Na₂SO₄), фільтрували і концентрували. Концентрат очищали колонковою флеш-хроматографією на силікагелі з використанням суміші 20 % етилацетату у гексані.

ПРИКЛАД 47B

7-(2-метоксифеніл)-3-(3-((2-метил-1-нафтил)окси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

Суміш сполуки Прикладу 47A (71 мг), 2-метил-1-нафтолу (35 мг), трифенілфосфіну (58 мг) у ТГФ (2 мл) і ди-трет-бутилазодикарбоксилату (55 мг) перемішували при температурі навколишнього середовища протягом ночі і розподіляли між етилацетатом (150 мл) і водою (50 мл). Органічний шар промивали насиченим сольовим розчином і сушили (Na₂SO₄), фільтрували і концентрували. Концентрат очищали флеш-хроматографією на силікагелі з використанням суміші 5 % етилацетату у гексані з одержанням проміжної сполуки, яку розчиняли у ТГФ (2 мл), метанолі (1 мл) і воді (1 мл), і гідролізували за допомогою LiOH (100 мг) протягом ночі. Суміш підкислювали за допомогою 5 % HCl і екстрагували етилацетатом. Екстракт промивали водою і насиченим сольовим розчином, і сушили (Na₂SO₄), фільтрували і концентрували. Концентрат очищали за допомогою зворотно-фазової ВЕРХ (C18, 30 → 100 % ацетонітрилу/вода/0,1 % TFA). ¹H ЯМР (300 МГц, CDCl₃) δ 8,74 (с, 1H), 8,12 (дд, 1H), 7,82 (д, 1H), 7,77 (д, 1H), 7,52 (д, 1H), 7,36-7,47 (м, 5H), 7,27 (д, 1H), 7,09 (т, 2H), 4,10 (т, 2H), 3,83 (с, 3H), 3,48 (т, 2H), 2,46 (с, 3H), 2,38 (м, 2H).

ПРИКЛАД 48

7-(4-фтор-2-ізопропоксифеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 4-фтор-2-ізопропоксифенілборонової кислоти замість (Е)-стирилборонової кислоти у процедурі Прикладу 1D. ¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,98 (шир.с, 1H), 10,03 (с, 1H), 8,24 (м, 1H), 7,87 (м, 1H), 7,68 (д, 1H), 7,43 (м, 5H), 7,15 (д, 1H), 7,04 (м, 2H), 6,86 (м, 2H), 4,66 (м, 1H), 4,18 (т, 2H), 2,23 (м, 2H), 1,14 (с, 3H), 1,12 (с, 3H).

ПРИКЛАД 49

7-(2-етокси-1-нафтил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 2-етоксинафталін-1-ілборонової кислоти замість (Е)-стирилборонової кислоти у процедурі Прикладу 1D. ¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,81 (шир.с, 1H), 10,42 (шир.с, 1H), 8,29 (м, 1H), 8,00 (д, 1H), 7,89 (м, 2H), 7,75 (м, 1H), 7,41 (м, 7H), 7,13 (м, 3H), 6,91 (м, 1H), 4,24 (т, 2H), 4,10 (кв, 2H), 3,39 (т, 2H), 2,27 (м, 2H), 1,02 (м, 3H).

ПРИКЛАД 50

7-(4-аміно-2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 4-бром-3-метиланіліну замість 4-бром-3-метилфенолу у процедурі Прикладу 43B. ¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 10,48 (с, 1H), 8,25 (дд, 1H), 7,88 (дд, 1H), 7,71 (д, 1H), 7,37-7,57 (м, 6H), 7,27 (д, 1H), 7,09 (м, 3H), 6,92 (д, 1H), 4,21 (т, 2H), 2,26 (м, 2H), 2,01 (с, 3H).

ПРИКЛАД 51A

4-бром-N-(2-(диметиламіно)етил)-3-метилбензамід

Суміш 4-бром-3-метилбензойної кислоти (430 мг), N, N-диметилетилендіаміну (180 мг), гідрохлориду 1-етил-3-(3-(диметиламіно)пропіл)карбодііміду (600 мг) і 4-диметиламінопіридину (244 мг) у дихлорметані (20 мл) перемішували при температурі навколишнього середовища протягом 4 годин, розбавляли етилацетатом (200 мл), промивали водою і насиченим сольовим розчином, і сушили (Na₂SO₄), фільтрували і концентрували. Концентрат очищали колонковою флеш-хроматографією з використанням суміші 10 % етилацетату у насиченому аміаком дихлорметані.

ПРИКЛАД 51B

7-(4-(((2-(диметиламіно)етил)аміно)карбоніл)-2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували у вигляді TFA солі шляхом використання сполуки Прикладу 51А замість 4-бром-3-метилфенолу у процедурі Прикладу 43В. ¹Н ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 10,65 (с, 1Н), 9,32 (м, 1Н), 8,69 (т, 1Н), 8,25 (дд, 1Н), 7,88 (дд, 1Н), 7,72 (дт, 1Н), 7,33-7,57 (м, 6Н), 7,06 (дд, 2Н), 6,91 (д, 1Н), 4,21 (т, 2Н), 3,63 (м, 2Н), 2,50 (с, 6Н), 2,26 (м, 2Н), 2,12 (с, 3Н).

ПРИКЛАД 52

7-(4-хлор-2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 4-хлор-2-метилфенілборонової кислоти замість (Е)-стирилборонової кислоти у процедурі Прикладу 1D. ¹Н ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,93 (шир.с, 1Н), 10,88 (с, 1Н), 8,25 (м, 1Н), 7,87 (м, 1Н), 7,70 (д, 1Н), 7,46 (м, 5Н), 7,30 (м, 1Н), 7,21 (д, 1Н), 7,05 (м, 2Н), 6,90 (д, 1Н), 4,20 (т, 2Н), 2,23 (м, 2Н), 2,03 (с, 3Н).

ПРИКЛАД 53

7-(2,3-дихлорфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 2,3-дихлорфеніл-боронової кислоти замість (Е)-стирилборонової кислоти у процедурі Прикладу 1D. ¹Н ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,98 (шир.с, 1Н), 11,20 (с, 1Н), 8,26 (м, 1Н), 7,87 (м, 1Н), 7,74 (м, 1Н), 7,68 (м, 1Н), 7,53 (м, 2Н), 7,39 (м, 4Н), 7,06 (м, 2Н), 6,91 (д, 1Н), 4,21 (т, 2Н), 2,24 (м, 2Н).

ПРИКЛАД 54

3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2-(трифторметил)феніл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 2-трифторметил-фенілборонової кислоти замість (Е)-стирилборонової кислоти у процедурі Прикладу 1D. ¹Н ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,93 (шир.с, 1Н), 11,04 (с, 1Н), 8,27 (м, 1Н), 7,86 (м, 2Н), 7,71 (м, 2Н), 7,64 (т, 1Н), 7,53 (м, 2Н), 7,46 (д, 1Н), 7,39 (т, 2Н), 7,04 (т, 2Н), 6,91 (д, 1Н), 4,21 (т, 2Н), 2,24 (м, 2Н).

ПРИКЛАД 55

7-(3-хлор-2-фторфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 3-хлор-2-фтор-фенілборонової кислоти замість (Е)-стирилборонової кислоти у процедурі Прикладу 1D. ¹Н ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆) δ 13,02 (шир.с, 1Н), 11,28 (с, 1Н), 8,26 (м, 1Н), 7,87 (м, 1Н), 7,76 (д, 1Н), 7,62 (м, 1Н), 7,53 (м, 2Н), 7,41 (м, 3Н), 7,30 (т, 1Н), 7,12 (м, 2Н), 6,90 (д, 1Н), 4,20 (т, 2Н), 3,37 (т, 2Н), 2,23 (м, 2Н).

ПРИКЛАД 56

7-(2,3-дифторфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 2,3-дифтор-фенілборонової кислоти замість (Е)-стирилборонової кислоти у процедурі Прикладу 1D. ¹Н ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆) δ 13,04 (шир.с, 1Н), 11,24 (с, 1Н), 8,26 (д, 1Н), 7,87 (д, 1Н), 7,77 (д, 1Н), 7,47 (м, 5Н), 7,28 (м, 2Н), 7,19 (м, 1Н), 7,09 (т, 1Н), 6,90 (д, 1Н), 4,20 (т, 2Н), 3,38 (т, 2Н), 2,24 (м, 2Н).

ПРИКЛАД 57

7-циклопент-1-ен-1-іл-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 1-циклопентен-боронової кислоти замість (Е)-стирилборонової кислоти у процедурі Прикладу 1D. ¹Н ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆) δ 13,10 (шир.с, 1Н), 10,12 (с, 1Н), 8,22 (м, 1Н), 7,85 (м, 1Н), 7,60 (д, 1Н), 7,51 (м, 2Н), 7,45 (д, 1Н), 7,37 (т, 1Н), 7,17 (д, 1Н), 6,98 (т, 1Н), 6,87 (д, 1Н), 6,33 (т, 1Н), 4,16 (т, 2Н), 2,79 (м, 2Н), 2,60 (м, 2Н), 2,21 (м, 2Н), 1,98 (м, 2Н).

ПРИКЛАД 58

7-циклогекс-1-ен-1-іл-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 1-циклогексен-боронової кислоти замість (Е)-стирилборонової кислоти у процедурі Прикладу 1D. ¹Н ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆) δ 13,03 (шир.с, 1Н), 10,44 (с, 1Н), 8,22 (м, 1Н), 7,86 (м, 1Н), 7,46 (м, 5Н), 7,05 (м, 1Н), 6,95 (т, 1Н), 6,88 (д, 1Н), 5,96 (м, 1Н), 4,17 (т, 2Н), 2,38 (м, 2Н), 2,20 (м, 4Н), 1,73 (м, 4Н).

ПРИКЛАД 59А

2-фенілциклогекс-1-еніл трифторметансульфонат

2-Фенілциклогексанон (0,2 г) додавали до суміші 60 % масляної суспензії NaN (0,17 г) у DMF (3 мл) при 0°C. Суміш нагрівали до кімнатної температури і перемішували протягом 30 хвилин, обробляли 1,1,1-трифтор-N-феніл-N-(трифторметилсульфоніл)метансульфонамідом (0,7 г), перемішували протягом 6 годин і обробляли водою (20 мл), і етилацетатом (50 мл). Екстракт промивали насиченим сольовим розчином (20 мл) і водою (20 мл), і сушили (Na₂SO₄), фільтрували і концентрували. Концентрат очищали флеш-хроматографією на силікагелі з використанням суміші 0-30 % етилацетату/гексан.

ПРИКЛАД 59B

3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2-фенілциклогекс-1-ен-1-іл)-1H-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання сполуки Прикладу 43A замість (Е)-стирилборонової кислоти і використання сполуки Прикладу 59A замість сполуки Прикладу 1C у процедурі Прикладу 1D. ^1H ЯМР (500 МГц, DMSO-d_6) δ 12,92 (шир.с, 1H), 10,69 (с, 1H), 8,23 (м, 1H), 7,86 (м, 1H), 7,51 (м, 2H), 7,44 (д, 1H), 7,38 (м, 2H), 6,89 (м, 8H), 4,11 (т, 2H), 3,24 (т, 2H), 2,41 (м, 4H), 2,15 (м, 2H), 1,86 (м, 4H).

ПРИКЛАД 60

7-(2-циклогексилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання сполуки Прикладу 43A замість (Е)-стирилборонової кислоти і використання 1-бром-2-циклогексилбензолу замість сполуки Прикладу 1C у процедурі Прикладу 1D. ^1H ЯМР (500 МГц, DMSO-d_6) δ 12,95 (шир.с, 1H), 10,28 (с, 1H), 8,26 (м, 1H), 7,87 (м, 1H), 7,70 (д, 1H), 7,53 (м, 2H), 7,41 (м, 4H), 7,24 (т, 1H), 7,17 (д, 1H), 7,07 (т, 1H), 7,00 (д, 1H), 6,89 (д, 1H), 4,20 (т, 2H), 2,29 (м, 4H), 1,55 (м, 7H), 1,18 (м, 2H), 0,86 (м, 2H).

ПРИКЛАД 61

7-(6-карбоксипіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання метил 5-бромпіколілату замість 4-бром-3-метилфенолу у процедурі Прикладу 43B. ^1H ЯМР (300 МГц, DMSO-d_6) δ 11,30 (с, 1H), 8,88 (с, 1H), 8,22 (дд, 1H), 8,15 (с, 1H), 7,87 (дд, 1H), 7,79 (д, 1H), 7,29-7,56 (м, 6H), 7,13 (т, 1H), 6,90 (д, 1H), 4,19 (т, 2H), 2,26 (м, 2H).

ПРИКЛАД 62

7-(3-метил-5-нітропіридин-2-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 2-бром-3-метил-5-нітропіридину замість 4-бром-3-метилфенолу у процедурі Прикладу 43B. ^1H ЯМР (300 МГц, CDCl_3) δ 9,90 (м, 1H), 9,43 (д, 1H), 8,52 (д, 1H), 8,39 (д, 1H), 7,95 (м, 1H), 7,80 (дд, 1H), 7,68 (дд, 1H), 7,13-7,60 (м, 8H), 7,00 (д, 1H), 6,68 (т, 2H), 4,21 (т, 2H), 3,10 (т, 2H), 2,67 (с, 3H), 2,18 (м, 2H).

ПРИКЛАД 63

7-(2,3-дигідро-1,4-бензодіоксин-6-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання сполуки Прикладу 1C замість 4-бром-3-метилфенолу і використання 2,3-дигідробензо(b)(1,4)діоксин-6-ілборонової кислоти замість сполуки Прикладу 43A у процедурі Прикладу 43B. ^1H ЯМР (300 МГц, CDCl_3) δ 8,87 (с, 1H), 8,35 (дд, 1H), 7,76 (дд, 1H), 7,70 (дд, 1H), 7,30-7,49 (м, 5H), 7,15 (м, 2H), 7,02 (д, 1H), 6,75 (д, 1H), 4,33 (с, 4H), 4,21 (т, 2H), 3,84 (т, 2H), 2,38 (м, 2H).

ПРИКЛАД 64

7-(1,3-бензодіоксол-5-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання сполуки Прикладу 1C замість 4-бром-3-метилфенолу і використання бензо(d)(1,3)діоксол-5-ілборонової кислоти замість сполуки Прикладу 43A у процедурі Прикладу 43B. ^1H ЯМР (300 МГц, CDCl_3) δ 8,84 (с, 1H), 8,35 (дд, 1H), 7,78 (дд, 1H), 7,70 (д, 1H), 7,30-7,49 (м, 5H), 7,17 (д, 2H), 7,09 (с, 1H), 6,97 (д, 1H), 6,75 (дд, 1H), 6,05 (с, 2H), 4,21 (т, 2H), 3,49 (т, 2H), 2,38 (м, 2H).

ПРИКЛАД 65A

етил 3-(3-(4-хлорнафталін-1-ілокси)пропіл)-7-(2-метоксифеніл)-1H-індол-2-карбоксилат

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання сполуки Прикладу 47A замість сполуки Прикладу 1B і використання 4-хлор-1-нафтолу замість 1-нафтолу у процедурі Прикладу 1D.

ПРИКЛАД 65B

3-(3-(4-хлорнафталін-1-ілокси)пропіл)-7-(2-метоксифеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота

Суміш сполуки Прикладу 65A (70 мг) у ТГФ (2 мл), метанолу (1 мл) і води (1 мл) обробляли за допомогою $\text{LiOH} \cdot \text{H}_2\text{O}$ (100 мг) і перемішували при температурі навколишнього середовища протягом ночі. Суміш підкислювали за допомогою 5 % водного розчину HCl і екстрагували етилацетатом. Екстракт промивали водою, насиченим сольовим розчином і сушили (Na_2SO_4), фільтрували і концентрували. Концентрат розчиняли у суміші 1:1 DMSO /метанол і очищали за допомогою зворотно-фазової ВЕРХ (C_{18} , 20 \rightarrow 100 % ацетонітрилу/вода/0,1 % TFA). ^1H ЯМР (300 МГц, CDCl_3) δ 8,72 (с, 1H), 8,38 (дд, 1H), 8,15 (дд, 1H), 7,72 (д, 1H), 7,35-7,57 (м, 5H), 7,08-7,21 (м, 3H), 6,65 (д, 1H), 4,18 (т, 2H), 3,82 (с, 3H), 3,47 (т, 2H), 2,37 (м, 2H).

ПРИКЛАД 66A

етил 3-(3-(2-бромфеноксипропіл)-7-(2-метоксифеніл)-1H-індол-2-карбоксилат

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання сполуки Прикладу 47А замість сполуки Прикладу 1В і використання 2-бромфенолу замість 1-нафтолу у процедурі Прикладу 1С.

ПРИКЛАД 66В

5 3-(3-(2-бромфеноксипропіл)-7-(2-метоксифеніл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання сполуки Прикладу 66А замість сполуки Прикладу 65А у процедурі Прикладу 65В. ¹Н ЯМР (300 МГц, CDCl₃) δ 8,72 (с, 1Н), 7,79 (д, 1Н), 7,55 (дд, 1Н), 7,43 (т, 1Н), 7,35 (дд, 1Н), 7,22 (м, 3Н), 7,10 (д, 1Н), 6,85 (д, 1Н), 6,77 (д, 1Н), 4,11 (т, 2Н), 3,84 (с, 3Н), 3,43 (т, 2Н), 2,29 (м, 2Н).

10 ПРИКЛАД 67А

4-бром-3-метил-N-(2-морфоліноетил)бензамід

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 2-морфоліноетанаміну замість N1,N1-диметилетан-1,2-діаміну у процедурі Прикладу 51А.

ПРИКЛАД 67В

15 7-(2-метил-4-(((2-морфолін-4-ілетил)аміно)карбоніл)феніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували у вигляді TFA солі шляхом використання сполуки Прикладу 67А замість 4-бром-3-метилфенолу у процедурі Прикладу 43В. ¹Н ЯМР (300 МГц, DMSO-d₆) δ 12,94 (м, 1Н), 10,68 (с, 1Н), 9,82 (м, 1Н), 8,74 (м, 1Н), 8,24 (дд, 2Н), 7,88 (дд, 1Н), 7,82 (д, 1Н), 7,72 (т, 1Н), 7,34-7,55 (м, 5Н), 7,07 (м, 2Н), 6,91 (д, 1Н), 4,11 (т, 2Н), 4,00 (м, 2Н), 3,17-3,67 (м, 8Н), 2,26 (м, 2Н), 2,12 (с, 3Н).

ПРИКЛАД 68

7-(3-метилхінолін-2-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

25 Сполуку даного прикладу одержували у вигляді TFA солі шляхом використання 2-бром-3-метил-хіноліну замість 4-бром-3-метилфенолу у процедурі Прикладу 43В. ¹Н ЯМР (300 МГц, DMSO-d₆) δ 13,05 (м, 1Н), 11,19 (м, 1Н), 8,42 (м, 1Н), 8,28 (дд, 1Н), 8,05 (д, 1Н), 7,37-7,89 (м, 9Н), 7,16 (т, 1Н), 6,91 (д, 1Н), 4,22 (т, 2Н), 2,36 (с, 3Н), 2,26 (м, 2Н).

ПРИКЛАД 69

7-(4-(гідроксиметил)феніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

30 Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 4-(гідроксиметил)-фенілборонової кислоти замість сполуки Прикладу 43А і використання сполуки Прикладу 1С замість 4-бром-3-метилфенолу у процедурі Прикладу 43В. ¹Н ЯМР (300 МГц, DMSO-d₆) δ 13,05 (м, 1Н), 10,28 (м, 1Н), 8,22 (дд, 1Н), 7,87 (дд, 1Н), 7,68 (д, 1Н), 7,36-7,61 (м, 6Н), 7,26 (д, 1Н), 7,09 (т, 1Н), 6,90 (д, 1Н), 5,25 (т, 1Н), 4,59 (д, 2Н), 4,19 (т, 2Н), 2,26 (м, 2Н).

35 ПРИКЛАД 70

7-(3-(гідроксиметил)феніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

40 Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 3-(гідроксиметил)-фенілборонової кислоти замість сполуки Прикладу 43А і використання сполуки Прикладу 1С замість 4-бром-3-метилфенолу у процедурі Прикладу 43В. ¹Н ЯМР (300 МГц, DMSO-d₆) δ 13,05 (м, 1Н), 10,26 (м, 1Н), 8,22 (дд, 1Н), 7,87 (дд, 1Н), 7,69 (д, 1Н), 7,36-7,61 (м, 8Н), 7,26 (д, 1Н), 7,09 (т, 1Н), 6,90 (д, 1Н), 5,22 (т, 1Н), 4,59 (д, 2Н), 4,20 (т, 2Н), 2,25 (м, 2Н).

ПРИКЛАД 71А

етил 7-бром-5-хлор-3-(3-етоксі-3-оксопропіл)-1Н-індол-2-карбоксилат

45 Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 2-бром-4-хлораніліну замість 2-броманіліну у процедурі Прикладу 1А.

ПРИКЛАД 71В

етил 7-бром-5-хлор-3-(3-гідроксипропіл)-1Н-індол-2-карбоксилат

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання сполуки Прикладу 71А замість сполуки Прикладу 1А у процедурі Прикладу 1В.

50 ПРИКЛАД 71С

етил 7-бром-5-хлор-3-(3-(нафталін-1-ілокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбоксилат

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання сполуки Прикладу 71В замість сполуки Прикладу 1В у процедурі Прикладу 1С.

ПРИКЛАД 71D

55 5-хлор-7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання сполуки Прикладу 71С замість сполуки Прикладу 1С і використання 2-метилфенілборонової кислоти замість (Е)-стирилборонової кислоти у процедурі Прикладу 1D. ¹Н ЯМР (400 МГц, DMSO-d₆) δ 10,92 (с, 1Н), 8,27 (м, 1Н), 7,87 (м, 1Н), 7,74 (д, 1Н), 7,51 (м, 3Н), 7,30 (м, 5Н), 6,99 (д, 1Н), 6,91 (д, 1Н), 4,20 (т, 2Н), 2,22 (м, 2Н), 2,05 (с, 3Н).

60

ПРИКЛАД 72

7-(3-метилпіридин-2-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували у вигляді TFA солі шляхом використання 2-бром-3-метилпіридину замість 4-бром-3-метилфенолу у процедурі Прикладу 43В. ¹Н ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 11,20 (с, 1Н), 8,71 (д, 1Н), 8,26 (м, 2Н), 7,88 (м, 3Н), 7,37-7,56 (м, 5Н), 7,17 (т, 1Н), 6,90 (д, 1Н), 4,20 (т, 2Н), 2,27 (с, 3Н), 2,24 (м, 2Н).

ПРИКЛАД 73

7-(2,6-диметилпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували у вигляді TFA солі шляхом використання 3-бром-2,6-диметилпіридину замість 4-бром-3-метилфенолу у процедурі Прикладу 43В. ¹Н ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 13,10 (м, 1Н), 11,31 (с, 1Н), 8,23 (м, 2Н), 7,88 (м, 3Н), 7,36-7,54 (м, 4Н), 7,15 (т, 2Н), 6,90 (д, 1Н), 4,20 (т, 2Н), 2,76 (с, 3Н), 2,36 (с, 3Н), 2,24 (м, 2Н).

ПРИКЛАД 74

7-(6-аміно-2-метилпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували у вигляді TFA солі шляхом використання 6-аміно-3-бром-2-метилпіридину замість 4-бром-3-метилфенолу у процедурі Прикладу 43В. ¹Н ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 13,72 (м, 1Н), 13,05 (м, 1Н), 11,24 (с, 1Н), 8,24 (дд, 1Н), 7,88 (дд, 1Н), 7,73 (м, 4Н), 7,36-7,56 (м, 4Н), 7,10 (д, 2Н), 6,88 (т, 2Н), 4,19 (т, 2Н), 2,25 (м, 2Н), 2,13 (с, 3Н).

ПРИКЛАД 75

3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2-піперазин-1-ілфеніл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували у вигляді TFA солі шляхом використання сполуки Прикладу 43А замість (Е)-стирилборонової кислоти і використання 1-(2-бромфеніл)-піперазину замість сполуки Прикладу 1С у процедурі Прикладу 1D. ¹Н ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 13,12 (шир.с, 1Н), 10,36 (с, 1Н), 8,42 (шир.с, 2Н), 8,25 (м, 1Н), 7,88 (м, 1Н), 7,75 (д, 1Н), 7,46 (м, 6Н), 7,29 (м, 1Н), 7,15 (м, 3Н), 6,89 (м, 1Н), 4,20 (т, 2Н), 2,96 (м, 4Н), 2,25 (м, 2Н).

ПРИКЛАД 76А

етил 7-бром-1-(метоксиметил)-3-(3-(нафталін-1-ілокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбоксилат

До охолодженої на льодяній бані суміші сполуки Прикладу 1С (2,0 г) у ТГФ (20 мл) додавали 60 % масляну дисперсію NaH (265 мг). Суміш перемішували протягом 30 хвилин перед додаванням хлорметилметилового ефіру (0,54 мл). Суміш перемішували протягом 3 годин і протягом ночі при кімнатній температурі, гасили шляхом додавання насиченої суміші NH₄Cl і екстрагували простим діетиловим ефіром. Екстракт промивали водою і насиченим сольовим розчином, і сушили (Na₂SO₄), фільтрували і концентрували. Концентрат очищали колонковою флеш-хроматографією на силікагелі з використанням суміші 5 % етилацетату/гексан.

ПРИКЛАД 76В

7-(4-(3-хлорфеніл)піперазин-1-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

Суміш сполуки Прикладу 76А (100 мг), 1-(3-хлорфеніл)піперазину (48 мг), трис(дибензилденацетон)-дипаладію(0) (9,2 мг), 2,2'-біс(дифенілфосфіно)-1,1'-бінафтилу (13,1 мг) і Cs₂CO₃ (195 мг) у толуолі (5 мл) нагрівали при температурі кипіння зі зворотним холодильником протягом ночі. Суміш розподіляли між етилацетатом (200 мл) і водою (50 мл). Органічний шар промивали насиченим сольовим розчином і сушили (Na₂SO₄), фільтрували і концентрували. Концентрат очищали колонковою хроматографією на силікагелі з використанням суміші 1:4 етилацетат:гексан з одержанням етилового ефіру. Цей складний ефір обробляли за допомогою 2М HCl у простому діетиловому ефірі (5 мл), концентрували і обробляли за допомогою LiOH·H₂O (100 мг) у суміші 2/1/2 ТГФ/метанол/вода, перемішували протягом ночі при кімнатній температурі і концентрували. Продукт очищали за допомогою зворотно-фазової ВЕРХ (C18, 20→100 % ацетонітрилу/вода/0,1 % TFA). ¹Н ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,98 (м, 1Н), 10,90 (с, 1Н), 8,24 (дд, 1Н), 7,86 (дд, 1Н), 7,35-7,54 (м, 5Н), 7,25 (т, 1Н), 6,82-7,03 (м, 6Н), 4,18 (т, 2Н), 3,45 (м, 4Н), 3,15 (м, 4Н), 2,20 (м, 2Н).

ПРИКЛАД 77А

етил 7-бром-1-(2-морфоліно-2-оксоетил)-3-(3-(нафталін-1-ілокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбоксилат

До суміші 60 % масляної дисперсії NaH (0,03 г) у DMF (5 мл) додавали сполуку Прикладу 1С (0,25 г) у DMF (10 мл). Після перемішування при кімнатній температурі протягом 30 хвилин додавали 2-хлор-1-морфоліноетанон (0,1 г) і суміш перемішували протягом трьох годин. Додавали воду (20 мл) і дихлорметан, і органічний шар промивали водою і насиченим сольовим розчином, і концентрували. Концентрат очищали за допомогою препаративної зворотно-фазової ВЕРХ (Zorbax SB, C18 з використанням суміші 30 % → 100 % ацетонітрилу/вода/0,1 % TFA).

ПРИКЛАД 77В

етил 7-бром-1-(2-морфоліноетил)-3-(3-(нафталін-1-ілокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбоксилат

До суміші сполуки Прикладу 77А (0,15 г) у ТГФ (10 мл) додавали 1М $\text{BH}_3 \cdot \text{TGF}$ (1,8 мл). Суміш перемішували при кімнатній температурі протягом 16 годин, гасили за допомогою метанолу (5 мл) і концентрували. Концентрат розчиняли в етанолі (40 мл) і обробляли 12н розчином HCl (0,5 мл). Після перемішування протягом трьох годин, суміш концентрували і концентрат очищали за допомогою препаративної зворотно-фазової ВЕРХ (Zorbax SB, C18, 30 % \rightarrow 100 % ацетонітрилу/вода/0,1 % TFA).

ПРИКЛАД 77С

7-(2-метилфеніл)-1-(2-морфолін-4-ілетил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували у вигляді TFA солі шляхом використання сполуки Прикладу 77В замість сполуки Прикладу 1С і використання 2-метилфенілборонової кислоти замість (Е)-стирилборонової кислоти у процедурі Прикладу 1D. ^1H ЯМР (500 МГц, DMSO-d_6) δ 8,23 (м, 1Н), 7,88 (м, 1Н), 7,81 (д, 1Н), 7,45 (м, 8Н), 7,15 (т, 1Н), 7,01 (д, 1Н), 6,92 (д, 1Н), 4,64 (м, 1Н), 4,24 (т, 2Н), 4,02 (м, 1Н), 3,61 (м, 4Н), 2,23 (м, 2Н), 2,00 (с, 3Н).

ПРИКЛАД 78А

етил 7-бром-3-(3-(5,6,7,8-тетрагідронафталін-1-ілокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбоксилат

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 5,6,7,8-тетрагідронафталін-1-олу замість 1-нафтолу у процедурі Прикладу 1С.

ПРИКЛАД 78В

7-(2-метилфеніл)-3-(3-(5,6,7,8-тетрагідронафталін-1-ілокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання сполуки Прикладу 78А замість сполуки Прикладу 1С і використання 2-метилфенілборонової кислоти замість (Е)-стирилборонової кислоти у процедурі Прикладу 1D. ^1H ЯМР (500 МГц, DMSO-d_6) δ 10,41 (шир.с, 1Н), 7,65 (м, 1Н), 7,27 (м, 4Н), 7,11 (т, 1Н), 7,04 (д, 1Н), 6,99 (т, 1Н), 6,64 (т, 2Н), 3,98 (т, 2Н), 3,25 (т, 2Н), 2,66 (м, 4Н), 2,08 (м, 5Н), 1,71 (м, 4Н).

ПРИКЛАД 79

5-хлор-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-феніл-1Н-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання сполуки Прикладу 71С замість сполуки Прикладу 1С і використання фенілборонової кислоти замість (Е)-стирилборонової кислоти у процедурі Прикладу 1D. ^1H ЯМР (500 МГц, DMSO-d_6) δ 10,41 (с, 1Н), 7,65 (м, 1Н), 7,27 (м, 4Н), 7,11 (т, 1Н), 7,04 (д, 1Н), 6,99 (т, 1Н), 6,64 (т, 2Н), 3,98 (т, 2Н), 3,25 (т, 2Н), 2,66 (м, 4Н), 2,08 (м, 5Н), 1,71 (м, 4Н).

ПРИКЛАД 80

5-хлор-7-(4-хлор-2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання сполуки Прикладу 71С замість сполуки Прикладу 1С і використання 4-хлор-2-метилфенілборонової кислоти замість (Е)-стирилборонової кислоти у процедурі Прикладу 1D. ^1H ЯМР (500 МГц, DMSO-d_6) δ 11,24 (с, 1Н), 8,26 (м, 1Н), 7,87 (м, 1Н), 7,75 (д, 1Н), 7,46 (м, 5Н), 7,31 (м, 1Н), 7,21 (д, 1Н), 7,00 (д, 1Н), 6,91 (д, 1Н), 4,19 (т, 2Н), 2,21 (м, 2Н), 2,03 (с, 3Н).

ПРИКЛАД 81

5-хлор-7-циклопент-1-ен-1-іл-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання сполуки Прикладу 71С замість сполуки Прикладу 1С і використання 1-циклопентенборонової кислоти замість (Е)-стирилборонової кислоти у процедурі Прикладу 1D. ^1H ЯМР (500 МГц, DMSO-d_6) δ 10,49 (с, 1Н), 8,22 (м, 1Н), 7,86 (м, 1Н), 7,62 (д, 1Н), 7,49 (м, 3Н), 7,38 (т, 1Н), 7,09 (д, 1Н), 6,87 (д, 1Н), 6,39 (м, 1Н), 4,15 (т, 2Н), 2,77 (м, 2Н), 2,59 (м, 2Н), 2,19 (м, 2Н), 1,98 (м, 2Н).

ПРИКЛАД 82

7-(3,5-дихлорпіридин-2-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували у вигляді TFA солі шляхом використання 2-бром-3,5-дихлорпіридину замість 4-бром-3-метилфенолу у процедурі Прикладу 43В. ^1H ЯМР (300 МГц, DMSO-d_6) δ 13,05 (м, 1Н), 11,10 (с, 1Н), 8,70 (с, 1Н), 8,35 (с, 1Н), 8,26 (дд, 1Н), 7,87 (дд, 1Н), 7,79 (д, 1Н), 7,53 (м, 2Н), 7,40 (д, 1Н), 7,36 (т, 1Н), 7,30 (д, 1Н), 7,09 (т, 1Н), 6,90 (д, 1Н), 4,20 (т, 2Н), 3,35 (м, 2Н), 2,24 (м, 2Н).

ПРИКЛАД 83

7-(5-(амінокарбоніл)піридин-2-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували у вигляді TFA солі шляхом використання 6-бромнікотинаміду замість 4-бром-3-метилфенолу у процедурі Прикладу 43В. ^1H ЯМР (300 МГц, DMSO-d_6) δ 13,30 (м, 1Н), 11,47 (с, 1Н), 9,27 (с, 1Н), 8,36 (с, 2Н), 8,20 (д, 2Н), 8,13 (д, 1Н), 7,87 (т,

2Н), 7,63 (с, 1Н), 7,50 (м, 3Н), 7,37 (т, 1Н), 7,18 (т, 1Н), 6,88 (д, 1Н), 4,20 (т, 2Н), 3,39 (м, 2Н), 2,27 (м, 2Н).

ПРИКЛАД 84

7-(3-хлор-5-(трифторметил)піридин-2-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували у вигляді TFA солі шляхом використання 2-бром-3-хлор-5-трифторметилпіридину замість 4-бром-3-метилфенолу у процедурі Прикладу 43В. ¹Н ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 13,10 (м, 1Н), 11,17 (с, 1Н), 9,04 (с, 1Н), 8,57 (с, 1Н), 8,26 (м, 1Н), 7,85 (м, 2Н), 7,36-7,57 (м, 5Н), 7,11 (т, 1Н), 6,89 (д, 1Н), 4,20 (т, 2Н), 3,39 (м, 2Н), 2,25 (м, 2Н).

ПРИКЛАД 85

7-(5-аміно-2-(трифторметокси)феніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 3-бром-4-трифторметоксіаніліну замість 4-бром-3-метилфенолу у процедурі Прикладу 43В. ¹Н ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 10,47 (с, 1Н), 8,26 (дд, 1Н), 7,86 (дд, 1Н), 7,70 (д, 1Н), 7,54 (м, 2Н), 7,41 (д, 1Н), 8,37 (т, 1Н), 7,10 (м, 3Н), 6,89 (д, 1Н), 6,69 (д, 1Н), 6,66 (с, 1Н), 4,19 (т, 2Н), 2,23 (м, 2Н).

ПРИКЛАД 86

7-(5-карбокси-2-метоксифеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання метил 3-бром-4-метоксibenзоату замість 4-бром-3-метилфенолу у процедурі Прикладу 43В. ¹Н ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,80 (м, 1Н), 10,65 (с, 1Н), 8,26 (м, 1Н), 8,02 (дд, 1Н), 7,89 (м, 1Н), 7,81 (с, 1Н), 7,70 (д, 1Н), 7,53 (м, 3Н), 7,40 (д, 1Н), 7,36 (т, 1Н), 7,22 (д, 1Н), 7,12 (д, 1Н), 7,05 (т, 1Н), 6,91 (д, 1Н), 4,21 (т, 2Н), 3,80 (т, 3Н), 2,25 (м, 2Н).

ПРИКЛАД 87

7-(4-карбокси-2-нітрофеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання метил 4-бром-3-нітробензоату замість 4-бром-3-метилфенолу у процедурі Прикладу 43В. ¹Н ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 13,60 (м, 1Н), 13,00 (м, 1Н), 11,31 (с, 1Н), 8,56 (с, 1Н), 8,26 (дд, 1Н), 7,88 (м, 1Н), 7,74 (м, 1Н), 7,65 (д, 1Н), 7,53 (м, 3Н), 7,40 (д, 1Н), 7,36 (т, 1Н), 7,22 (д, 1Н), 7,12 (д, 1Н), 7,05 (м, 1Н), 6,91 (д, 1Н), 4,21 (т, 2Н), 3,37 (т, 2Н), 2,25 (м, 2Н).

ПРИКЛАД 88

7-(5-карбокси-2-хлорфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання метил 3-бром-4-хлорбензоату замість 4-бром-3-метилфенолу у процедурі Прикладу 43В. ¹Н ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 13,00 (м, 1Н), 11,18 (с, 1Н), 8,26 (м, 1Н), 7,98 (д, 1Н), 7,88 (м, 1Н), 7,74 (м, 1Н), 7,68 (д, 1Н), 7,53 (м, 3Н), 7,40 (д, 1Н), 7,36 (т, 1Н), 7,09 (м, 2Н), 6,91 (д, 1Н), 4,21 (т, 2Н), 3,37 (т, 2Н), 2,25 (м, 2Н).

ПРИКЛАД 89А

1-бензил-3-метил-1,2,3,6-тетрагідропіридин-4-ілтрифторметансульфонат

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 1-бензил-3-метилпіперидин-4-ону замість 2-фенілциклогексанону у процедурі Прикладу 59А.

ПРИКЛАД 89В

7-(1-бензил-3-метил-1,2,3,6-тетрагідропіридин-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували у вигляді TFA солі шляхом використання сполуки Прикладу 43А замість (Е)-стирилборонової кислоти і використання сполуки Прикладу 89А замість сполуки Прикладу 1С у процедурі Прикладу 1D. ¹Н ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆) δ 13,22 (с, 1Н), 10,77 (10,55) (с, 1Н), 9,99 (9,54) (с, 1Н), 8,22 (д, 1Н), 7,86 (д, 1Н), 7,63 (м, 3Н), 7,45 (м, 8Н), 7,03 (м, 2Н), 6,88 (д, 1Н), 5,82 (м, 1Н), 4,51 (м, 2Н), 4,18 (т, 2Н), 3,80 (м, 2Н), 2,98 (м, 1Н), 2,20 (м, 2Н), 0,92-0,78 (д, 3Н).

ПРИКЛАД 90

7-(4-аміно-2-(трифторметил)феніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 4-бром-3-трифторметиланіліну замість 4-бром-3-метилфенолу у процедурі Прикладу 43В. ¹Н ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,90 (м, 1Н), 10,62 (с, 1Н), 8,26 (м, 1Н), 7,87 (м, 1Н), 7,65 (д, 1Н), 7,53 (м, 3Н), 7,40 (д, 1Н), 7,36 (т, 1Н), 7,09 (м, 3Н), 6,89 (д, 1Н), 6,82 (д, 1Н), 4,20 (т, 2Н), 3,35 (т, 2Н), 2,20 (м, 2Н).

ПРИКЛАД 91

7-(1,4-діокса-8-азаспіро(4,5)дец-8-ил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 1,4-діокса-8-азаспіро(4,5)декану замість 1-(3-хлорфеніл)піперазину у процедурі Прикладу 76В. ¹Н ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 10,88 (с, 1Н), 8,24 (м, 1Н), 7,86 (м, 1Н), 7,35-7,54 (м, 5Н), 6,86 (м, 3Н), 4,16 (т, 2Н), 3,93 (с, 4Н), 3,33 (т, 2Н), 3,17 (м, 4Н), 2,19 (м, 2Н), 1,94 (м, 4Н).

5 ПРИКЛАД 92

7-(3-карбоксипіперидин-1-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання метил піперидин-3-карбоксилату замість 1-(3-хлорфеніл)піперазину у процедурі Прикладу 76В. ¹Н ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 13,00 (м, 1Н), 11,10 (с, 1Н), 8,24 (м, 1Н), 7,86 (м, 1Н), 7,30-7,55 (м, 5Н), 6,86 (м, 2Н), 6,74 (д, 1Н), 4,16 (т, 2Н), 3,70 (м, 1Н), 2,72-3,06 (м, 5Н), 2,20 (м, 4Н), 1,72 (м, 3Н).

10 ПРИКЛАД 93

7-(4-карбоксипіперидин-1-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання метил піперидин-4-карбоксилату замість 1-(3-хлорфеніл)піперазину у процедурі Прикладу 76В. ¹Н ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 11,00 (м, 1Н), 8,22 (м, 1Н), 7,86 (м, 1Н), 7,35-7,54 (м, 5Н), 6,97 (м, 2Н), 6,86 (д, 1Н), 4,16 (т, 2Н), 3,45 (м, 4Н), 3,29 (т, 2Н), 2,90 (м, 1Н), 2,19 (т, 2Н), 2,00 (м, 4Н).

15 ПРИКЛАД 94

3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-піролідин-1-іл-1Н-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання піролідину замість 1-(3-хлорфеніл)піперазину у процедурі Прикладу 76В. ¹Н ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 10,40 (м, 1Н), 8,22 (м, 1Н), 7,86 (м, 1Н), 7,35-7,54 (м, 5Н), 7,21 (д, 1Н), 6,90 (м, 2Н), 6,86 (д, 1Н), 6,70 (м, 1Н), 4,16 (т, 2Н), 3,30 (т, 2Н), 2,19 (т, 2Н), 1,99 (м, 4Н).

20 ПРИКЛАД 95

7-морфолін-4-іл-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання морфоліну замість 1-(3-хлорфеніл)піперазину у процедурі Прикладу 76В. ¹Н ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 10,91 (м, 1Н), 8,22 (м, 1Н), 7,86 (м, 1Н), 7,34-7,53 (м, 5Н), 6,92 (м, 2Н), 6,80 (д, 1Н), 4,16 (т, 2Н), 3,86 (м, 4Н), 3,30 (т, 2Н), 2,98 (м, 4Н), 2,19 (т, 2Н).

25 ПРИКЛАД 96

3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-піперидин-1-іл-1Н-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання піперидину замість 1-(3-хлорфеніл)піперазину у процедурі Прикладу 76В. ¹Н ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 8,21 (м, 1Н), 7,86 (м, 1Н), 7,35-7,56 (м, 6Н), 7,09 (м, 1Н), 6,88 (д, 1Н), 4,16 (т, 2Н), 3,35 (т, 2Н), 2,19 (м, 2Н), 1,87 (м, 4Н), 1,63 (м, 2Н).

30 ПРИКЛАД 97

7-(4-(аміносультоніл)-2-(трифторметил)феніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 4-бром-3-(трифторметил)бензолсульфонаміду замість 4-бром-3-метилфенолу у процедурі Прикладу 43В. ¹Н ЯМР(300 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,98 (м, 1Н), 11,31 (с, 1Н), 8,26 (м, 1Н), 8,23 (с, 1Н), 8,08 (д, 1Н), 7,86 (м, 1Н), 7,76 (дд, 1Н), 7,36-7,63 (м, 7Н), 7,05 (м, 2Н), 6,90 (д, 1Н), 4,21 (т, 2Н), 3,40 (т, 2Н), 2,23 (м, 2Н).

40 ПРИКЛАД 98А

трет-бутил 4-бром-3-метилбензоат

45 До суміші метил 4-бром-3-метилбензоату (4,85 г) і трет-бутилацетату (3 мл) додавали 1М трет-бутоксиду калію у ТГФ (0,3 мл). Суміш перемішували у вакуумі протягом 10 хвилин і обробляли з використанням ще одного еквівалента трет-бутилацетату і 1 мол. % (1,1'-біс(дифенілфосфіно)фероцен)дихлорпаладію(II) у дихлорметані. Цю процедуру повторювали три рази. Суміш розбавляли етилацетатом (40 мл) і промивали 5 % водним розчином HCl, водою і насиченим сольовим розчином. Після сушіння над Na₂SO₄, суміш концентрували.

50 ПРИКЛАД 98В

трет-бутил 3-метил-4-(4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-діоксаборолан-2-іл)бензоат

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання сполуки Прикладу 98А замість сполуки Прикладу 1С у процедурі Прикладу 43А.

55 ПРИКЛАД 98С

етил 7-(4-(трет-бутоксикарбоніл)-2-метилфеніл)-3-(3-(нафталін-1-ілокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбоксилат

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання сполуки Прикладу 98В замість 2-метоксифенілборонової кислоти і використання сполуки Прикладу 1С замість сполуки Прикладу 1В у процедурі Прикладу 47А.

ПРИКЛАД 98D

4-(2-(етоксикарбоніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-7-іл)-3-метилбензойна кислота

Суміш сполуки Прикладу 98C у дихлорметані (5 мл) і TFA (5 мл) перемішували при кімнатній температурі протягом ночі і концентрували. Концентрат розподіляли між водою (50 мл) і етилацетатом (200 мл), і органічну фазу промивали насиченим сольовим розчином і сушили (Na_2SO_4), фільтрували і концентрували. ^1H ЯМР (300 МГц, DMSO-d_6) δ 12,88 (м, 1H), 11,00 (с, 1H), 8,22 (м, 1H), 7,85 (м, 3H), 7,86 (м, 1H), 7,73 (д, 1H), 7,32-7,55 (м, 5H), 7,08 (м, 2H), 6,92 (д, 1H), 4,25 (м, 4H), 3,36 (т, 2H), 2,24 (т, 2H), 2,10 (с, 3H), 1,26 (т, 3H).

ПРИКЛАД 99

7-(2-метил-4-(морфолін-4-ілкарбоніл)феніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

До суміші сполуки Прикладу 98D (75 мг) і морфоліну (32 мг) у дихлорметані (2 мл) додавали гідрохлорид 1-етил-3-(3-(диметиламіно)пропіл)карбодііміду (58 мг) і DMAP (38 мг). Суміш перемішували при кімнатній температурі протягом ночі і концентрували. Концентрат розбавляли етилацетатом (150 мл), промивали 5 % розчином HCl, водою і насиченим сольовим розчином, і сушили (Na_2SO_4), фільтрували і концентрували. Концентрат розчиняли у ТГФ (4 мл), метанолі (2 мл) і воді (2 мл). До суміші додавали $\text{LiOH}\cdot\text{H}_2\text{O}$ (100 мг) і суміш перемішували протягом ночі. Суміш концентрували, концентрат підкислювали за допомогою 5 % розчину HCl і екстрагували етилацетатом. Екстракт промивали насиченим сольовим розчином і сушили (Na_2SO_4), фільтрували і концентрували. Концентрат очищали за допомогою зворотно-фазової ВЕРХ (C_{18} , 30 \rightarrow 100 % ацетонітрилу/вода/0,1 % TFA). ^1H ЯМР (300 МГц, DMSO-d_6) δ 12,95 (м, 1H), 10,79 (с, 1H), 8,25 (м, 1H), 7,87 (м, 1H), 7,71 (д, 1H), 7,35-7,57 (м, 6H), 7,27 (с, 1H), 7,08 (м, 2H), 6,90 (д, 1H), 4,21 (т, 1H), 3,64 (м, 8H), 3,37 (т, 2H), 2,26 (т, 2H), 2,07 (с, 3H).

ПРИКЛАД 100

7-(4-((4-карбоксипіперидин-1-іл)карбоніл)-2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання метил піперидин-4-карбоксилату замість морфоліну у процедурі Прикладу 99. ^1H ЯМР (300 МГц, DMSO-d_6) δ 10,78 (с, 1H), 8,25 (м, 1H), 7,87 (м, 1H), 7,71 (д, 1H), 7,32-7,54 (м, 5H), 7,25 (с, 1H), 7,08 (м, 2H), 6,91 (д, 1H), 4,21 (т, 2H), 3,39 (т, 2H), 3,00 (м, 4H), 2,26 (т, 2H), 2,08 (с, 3H), 1,90 (м, 1H), 1,65 (м, 4H).

ПРИКЛАД 101

7-(4-((3-карбоксипіперидин-1-іл)карбоніл)-2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання метил піперидин-3-карбоксилату замість морфоліну у процедурі Прикладу 99. ^1H ЯМР (300 МГц, DMSO-d_6) δ 10,82 (с, 1H), 8,25 (м, 1H), 7,87 (м, 1H), 7,71 (д, 1H), 7,32-7,54 (м, 5H), 7,26 (с, 1H), 7,08 (м, 2H), 6,91 (д, 1H), 4,21 (т, 2H), 3,38 (т, 2H), 3,05 (м, 4H), 2,26 (т, 2H), 2,08 (с, 3H), 1,86 (м, 5H).

ПРИКЛАД 102

7-(4-(карбоксиметилкарбамоіл)-2-метилфеніл)-3-(3-(нафталін-1-ілокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання метил 2-аміноацетату замість морфоліну у процедурі Прикладу 99. ^1H ЯМР (300 МГц, DMSO-d_6) δ 10,83 (с, 1H), 8,83 (т, 1H), 8,25 (м, 1H), 7,87 (м, 1H), 7,85 (с, 1H), 7,71 (м, 2H), 7,32-7,54 (м, 4H), 7,29 (д, 1H), 7,08 (м, 2H), 6,91 (д, 1H), 4,21 (т, 2H), 3,96 (д, 2H), 3,37 (т, 2H), 2,24 (м, 2H), 2,11 (с, 3H).

ПРИКЛАД 103A

етил 7-бром-3-(3-оксопропіл)-1H-індол-2-карбоксилат

До охолодженої (0°C) суміші сполуки Прикладу 1B (3,26 г) у дихлорметані (5 мл) додавали DMSO (1 мл) і триетиламін (0,835 мл) з подальшим додаванням піридинсульфату (636 мг). Суміш перемішували протягом 2 годин, розбавляли етилацетатом (150 мл) і промивали 5 % розчином HCl, насиченим розчином NaHCO_3 , водою і насиченим сольовим розчином, і сушили (Na_2SO_4), фільтрували і концентрували.

ПРИКЛАД 103B

етил 7-бром-3-(3-(3,4-дигідрохінолін-1-(2H)-іл)пропіл)-1H-індол-2-карбоксилат

До суміші сполуки Прикладу 103A (325 мг) і 1,2,3,4-тетрагідрохіноліну (160 мг) у дихлоретані (10 мл) додавали ацетат натрію (310 мг). Суміш перемішували при температурі навколишнього середовища протягом ночі, розбавляли етилацетатом (200 мл) і промивали 1N розчином NaOH, водою і насиченим сольовим розчином. Після сушіння над сульфатом натрію і концентрування, концентрат завантажували на картридж з силікагелем і елюювали сумішшю 5 % етилацетату у гексані.

ПРИКЛАД 103C

3-(3-(3,4-дигідрохінолін-1(2H)-іл)пропіл)-7-(2-(трифторметил)феніл)-1H-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 2-трифторметил-фенілборонової кислоти замість сполуки Прикладу 43A і використання сполуки Прикладу 103B замість 4-бром-3-метилфенолу у процедурі Прикладу 43B. ^1H ЯМР (300 МГц, CDCl_3) δ 8,43 (т, 1H), 7,85 (дд, 1H), 7,57-7,67 (м, 3H), 7,44 (д, 1H), 7,01-7,26 (м, 4H), 3,43 (м, 4H), 3,26 (т, 2H), 2,85 (т, 2H), 2,10 (м, 4H).

ПРИКЛАД 104A

етил 7-бром-3-(3-(3-феноксифенокси)пропіл)-1H-індол-2-карбоксилат

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 3-феноксифенолу замість 1-нафтолу у процедурі Прикладу 1C.

ПРИКЛАД 104B

7-(2-метилфеніл)-3-(3-(3-феноксифенокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання сполуки Прикладу 104A замість сполуки Прикладу 1C і використання 2-метилфенілборонової кислоти замість (E)-стирилборонової кислоти у процедурі Прикладу 1D. ^1H ЯМР (500 МГц, $\text{DMSO}-d_6$) δ 10,45 (с, 1H), 7,64 (д, 1H), 7,30 (м, 7H), 7,05 (м, 5H), 6,70 (м, 1H), 6,53 (м, 2H), 3,97 (т, 2H), 3,21 (т, 2H), 2,06 (с, 5H).

ПРИКЛАД 105A

етил 7-бром-3-(3-(2,3-диметилфенокси)пропіл)-1H-індол-2-карбоксилат

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 2,3-диметилфенолу замість 1-нафтолу у процедурі Прикладу 1C.

ПРИКЛАД 105B

3-(3-(2,3-диметилфенокси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання сполуки Прикладу 105A замість сполуки Прикладу 1C і використання 2-метилфенілборонової кислоти замість (E)-стирилборонової кислоти у процедурі Прикладу 1D. ^1H ЯМР (500 МГц, $\text{DMSO}-d_6$) δ 12,96 (шир.с, 1H), 10,46 (с, 1H), 7,66 (д, 1H), 7,27 (м, 4H), 7,11 (т, 1H), 7,01 (м, 2H), 6,73 (т, 2H), 3,98 (т, 2H), 3,27 (т, 2H), 2,22 (с, 3H), 2,13 (с, 3H), 2,10 (м, 2H), 2,06 (с, 3H).

ПРИКЛАД 106

7-(4-метилпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували у вигляді TFA солі шляхом використання 4-метил-3-піридилборонової кислоти замість (E)-стирилборонової кислоти у процедурі Прикладу 1D. ^1H ЯМР (300 МГц, $\text{DMSO}-d_6$) δ 12,98 (шир.с, 1H), 11,18 (с, 1H), 8,56 (д, 1H), 8,47 (с, 1H), 8,25 (м, 1H), 7,86 (м, 1H), 7,77 (м, 1H), 7,52 (м, 3H), 7,42 (м, 2H), 7,10 (м, 2H), 6,91 (м, 1H), 4,21 (т, 2H), 2,24 (м, 2H), 2,12 (с, 3H).

ПРИКЛАД 107

7-(2-метилбензил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 2-метилбензилброміду замість сполуки Прикладу 1C і використання сполуки Прикладу 43A замість (E)-стирилборонової кислоти у процедурі Прикладу 1D. ^1H ЯМР (300 МГц, $\text{DMSO}-d_6$) δ 13,00 (шир.с, 1H), 11,30 (с, 1H), 8,24 (м, 1H), 7,86 (м, 1H), 7,45 (м, 5H), 7,13 (м, 3H), 6,89 (м, 3H), 6,68 (д, 1H), 4,27 (с, 2H), 4,18 (т, 2H), 2,22 (м, 5H).

ПРИКЛАД 108

3,3'-біс(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H, 1'H-7,7'-бііндол-2,2'-дикарбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували у вигляді побічного продукту шляхом використання сполуки Прикладу 43A замість (E)-стирилборонової кислоти у процедурі Прикладу 1D. ^1H ЯМР (300 МГц, $\text{DMSO}-d_6$) δ 12,94 (шир.с, 2H), 10,26 (с, 2H), 8,27 (м, 2H), 7,87 (м, 2H), 7,76 (д, 2H), 7,43 (м, 10H), 7,14 (т, 2H), 6,92 (д, 2H), 4,23 (т, 4H), 3,40 (т, 4H), 2,27 (м, 4H).

ПРИКЛАД 109A

етил 7-бром-3-(4-етоксі-4-оксобутил)-1H-індол-2-карбоксилат

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання етил 2-оксоциклогексанкарбоксилату замість етил 2-оксоциклопентанкарбоксилату у процедурі Прикладу 1A.

ПРИКЛАД 109B

етил 7-бром-3-(4-гідроксибутил)-1H-індол-2-карбоксилат

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання сполуки Прикладу 109A замість сполуки Прикладу 1A у процедурі Прикладу 1B.

ПРИКЛАД 109C

етил 7-бром-3-(4-оксобутил)-1H-індол-2-карбоксилат

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання сполуки Прикладу 109В замість сполуки Прикладу 1В у процедурі Прикладу 103А.

ПРИКЛАД 109D

етил 7-бром-3-(4-(3,4-дигідрохінолін-1(2Н)-іл)бутил)-1Н-індол-2-карбоксилат

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання сполуки Прикладу 109С замість сполуки Прикладу 103А у процедурі Прикладу 103В.

ПРИКЛАД 109Е

3-(4-(3,4-дигідрохінолін-1(2Н)-іл)бутил)-7-(2-(трифторметил)феніл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 2-трифторметил-фенілборонової кислоти замість сполуки Прикладу 43А і використання сполуки Прикладу 109D замість 4-бром-3-метилфенолу у процедурі Прикладу 43В. ¹Н ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 10,93 (с, 1Н), 7,83 (дд, 1Н), 7,63 (м, 3Н), 7,39 (д, 1Н), 7,10 (т, 1Н), 7,02 (д, 1Н), 6,95 (т, 1Н), 6,85 (д, 1Н), 6,52 (д, 1Н), 6,42 (т, 1Н), 3,21 (м, 4Н), 2,63 (т, 2Н), 1,84 (м, 2Н), 1,62 (м, 4Н).

ПРИКЛАД 110

7-(4-карбокси-2-метилфеніл)-3-(4-(3,4-дигідрохінолін-1(2Н)-іл)бутил)-1Н-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 4-(метоксикарбоніл)-2-метилфенілборонової кислоти замість сполуки Прикладу 43А і використання сполуки Прикладу 109D замість 4-бром-3-метилфенолу у процедурі Прикладу 43В. ¹Н ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 10,76 (с, 1Н), 7,89 (с, 1Н), 7,82 (дд, 1Н), 7,71 (дд, 1Н), 7,32 (д, 1Н), 7,15 (т, 1Н), 7,06 (д, 1Н), 6,91 (т, 1Н), 6,83 (д, 1Н), 6,50 (д, 1Н), 6,43 (т, 1Н), 3,22 (м, 4Н), 3,64 (т, 2Н), 2,09 (с, 3Н), 1,81 (м, 2Н), 1,61 (м, 4Н).

ПРИКЛАД 111А

етил 7-бром-3-(3-йодпропіл)-1Н-індол-2-карбоксилат

До суміші сполуки Прикладу 1В (1,116 г) у дихлорметані (30 мл) при 0°C додавали йод (1,01 г), трифенілфосфін (1,03 г) та імідазол (0,535 г). Суміш перемішували при 0°C протягом 1 години і обробляли насиченим розчином NaHCO₃ (50 мл). Перемішування продовжували протягом 30 хвилин і органічний шар промивали насиченим водним розчином Na₂S₂O₃ (50 мл), водою (20 мл) і насиченим сольовим розчином (50 мл), і сушили (Na₂SO₄), фільтрували і концентрували. Концентрат очищали колонковою хроматографією на силікагелі (з використанням 0-20 % етилацетату у гексані).

ПРИКЛАД 111В

(3-(7-бром-2-(етоксикарбоніл)-1Н-індол-3-іл)пропіл)трифенілфосфоніййодид

До суміші сполуки Прикладу 111А (0,136 г) у CH₃CN (5 мл) додавали трифенілфосфін (157 мг). Суміш кип'ятили зі зворотним холодильником протягом 48 годин, охолоджували до кімнатної температури, промивали гексаном і концентрували.

ПРИКЛАД 111С

етил 7-бром-3-(4-(нафталін-1-іл)бут-3-еніл)-1Н-індол-2-карбоксилат

Суміш 60 % масляної суспензії гідриду натрію (40 мг) у DMSO (5 мл) нагрівали протягом 1 години при 80°C, охолоджували до 15°C і обробляли за допомогою сполуки Прикладу 111В (0,797 г). Суміш перемішували протягом 10 хвилин, обробляли 1-нафталдегідом (0,156 г) і нагрівали протягом 3 годин при 80°C. Після відстоювання ночі при кімнатній температурі, суміш виливали у насичену суміш NaHSO₄ і екстрагували простим діетиловим ефіром. Екстракт промивали водою і насиченим сольовим розчином, і сушили (MgSO₄), фільтрували і концентрували. Концентрат очищали колонковою флеш-хроматографією на силікагелі з використанням 0-20 % етилацетату у гексані.

ПРИКЛАД 111D

3-(4-(нафталін-1-іл)бут-3-еніл)-7-о-толіл-1Н-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 2-метилфенілборонової кислоти замість (Е)-стирилборонової кислоти і використання сполуки Прикладу 111С замість сполуки Прикладу 1С у процедурі Прикладу 1D.

ПРИКЛАД 111Е

7-(2-метилфеніл)-3-(4-(1-нафтил)бутил)-1Н-індол-2-карбонова кислота

Суміш сполуки Прикладу 111D і Pd/C (каталітичн.) в етилацетаті/етанолі перемішували при кімнатній температурі в атмосфері водню (балон) протягом ночі. Суміш фільтрували, промивали етилацетатом/етанолом і концентрували. Концентрат очищали за допомогою зворотно-фазової ВЕРХ (Zorbax SB-C18, 20→100 % ацетонітрилу/вода/0,1 % TFA). ¹Н ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,82 (шир.с, 1Н), 10,36 (с, 1Н), 8,03 (м, 1Н), 7,90(м, 1Н), 7,75 (д, 1Н), 7,66 (д, 1Н), 7,51 (м, 2Н), 7,31 (м, 6Н), 7,12 (т, 1Н), 7,03 (м, 1Н), 3,17 (м, 2Н), 3,09 (м, 2Н), 2,05 (с, 3Н), 1,78 (м, 4Н).

ПРИКЛАД 112A

етил 7-бром-3-(4-(нафталін-1-ілокси)бутил)-1H-індол-2-карбоксилат

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання сполуки Прикладу 109B замість сполуки Прикладу 1B у процедурі Прикладу 1C.

5 ПРИКЛАД 112B

7-(2-метилфеніл)-3-(4-(1-нафтилокси)бутил)-1H-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 2-метилфенілборонової кислоти замість (E)-стирилборонової кислоти і використання сполуки Прикладу 112A замість сполуки Прикладу 1C у процедурі Прикладу 1D. ¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,87 (шир.с, 1H), 10,42 (с, 1H), 8,12 (д, 1H), 7,85 (д, 1H), 7,70 (д, 1H), 7,37 (м, 8H), 7,12 (т, 1H), 7,05 (м, 1H), 6,94 (д, 1H), 4,19 (м, 2H), 3,22 (м, 2H), 2,06 (с, 3H), 1,93 (м, 4H).

10 ПРИКЛАД 113A

етил 7-бром-3-(3-(2,4-диметилфенокси)пропіл)-1H-індол-2-карбоксилат

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 2,4-диметилфенолу замість 1-нафтолу у процедурі Прикладу 1C.

15 ПРИКЛАД 113B

3-(3-(2,4-диметилфенокси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 2-метилфенілборонової кислоти замість (E)-стирилборонової кислоти і використання сполуки Прикладу 113A замість сполуки Прикладу 1C у процедурі Прикладу 1D. ¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,88 (шир.с, 1H), 10,45 (с, 1H), 7,65 (д, 1H), 7,27 (м, 4H), 7,10 (т, 1H), 7,04 (дд, 1H), 6,92 (м, 2H), 6,73 (д, 1H), 3,97 (т, 2H), 3,25 (т, 2H), 2,19 (с, 3H), 2,17 (с, 3H), 2,07 (м, 5H).

20 ПРИКЛАД 114A

етил 7-бром-3-(3-(2,5-диметилфенокси)пропіл)-1H-індол-2-карбоксилат

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 2,5-диметилфенолу замість 1-нафтолу у процедурі Прикладу 1C.

25 ПРИКЛАД 114B

3-(3-(2,5-диметилфенокси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 2-метилфенілборонової кислоти замість (E)-стирилборонової кислоти і використання сполуки Прикладу 114A замість сполуки Прикладу 1C у процедурі Прикладу 1D. ¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,89 (шир.с, 1H), 10,45 (шир.с, 1H), 7,66 (д, 1H), 7,33 (м, 2H), 7,25 (м, 2H), 7,11 (т, 1H), 7,02 (м, 2H), 6,64 (м, 2H), 4,00 (т, 2H), 3,26 (т, 2H), 2,22 (с, 3H), 2,15 (с, 3H), 2,08 (м, 5H).

30 ПРИКЛАД 115

7-(1,1'-біфеніл-2-іл)-3-(4-(1-нафтилокси)бутил)-1H-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 2-біфенілборонової кислоти замість (E)-стирилборонової кислоти і використання сполуки Прикладу 112A замість сполуки Прикладу 1C у процедурі Прикладу 1D. ¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,82 (шир.с, 1H), 10,12 (с, 1H), 8,11 (д, 1H), 7,85 (д, 1H), 7,48 (м, 9H), 7,08 (м, 5H), 6,90 (м, 3H), 4,16 (м, 2H), 3,15 (м, 2H), 1,87 (м, 4H).

35 ПРИКЛАД 116

7-(4-((2-карбоксипіперидин-1-іл)карбоніл)-2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання метил піперидин-2-карбоксилату замість морфоліну у процедурі Прикладу 99. ¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,96 (м, 1H), 10,84 (с, 1H), 8,25 (м, 1H), 7,87 (м, 1H), 7,71 (д, 1H), 7,25-7,56 (м, 8H), 7,08 (м, 2H), 6,91 (д, 1H), 4,21 (т, 2H), 3,37 (т, 2H), 2,26 (т, 2H), 2,08 (с, 3H), 1,72 (м, 3H), 1,40 (м, 2H).

40 ПРИКЛАД 117

7-(4-((S)-1-карбокси-2-метилпропілкарбамоїл)-2-метилфеніл)-3-(3-(нафталін-1-ілокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання метилового ефіру 2-аміно-3-метил-масляної кислоти замість морфоліну у процедурі Прикладу 99. ¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 10,79 (с, 1H), 8,37 (д, 1H), 8,25 (м, 1H), 7,89 (с, 1H), 7,87 (м, 1H), 7,71 (д, 1H), 7,30-7,56 (м, 4H), 7,29 (д, 1H), 7,06 (м, 2H), 6,91 (д, 1H), 4,36 (т, 1H), 4,21 (т, 2H), 3,37 (т, 2H), 2,26 (м, 2H), 2,08 (с, 3H), 0,99 (т, 6H).

50 ПРИКЛАД 118

N-(4-(2-карбокси-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-7-іл)-3-метилбензоїл)-4-хлорфенілаланін

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання метил 2-аміно-3-(4-хлорфеніл)пропаноату замість морфоліну у процедурі Прикладу 99. ¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆)

δ 12,84 (м, 1H), 10,84 (с, 1H), 8,70 (д, 1H), 8,25 (м, 1H), 7,86 (м, 1H), 7,78 (с, 1H), 7,71 (д, 1H), 7,29-7,54 (м, 8H), 7,26 (д, 1H), 7,06 (м, 2H), 6,90 (д, 1H), 4,70 (м, 1H), 4,20 (т, 2H), 3,36 (т, 2H), 3,21 (дд, 2H), 2,23 (м, 2H), 2,08 (с, 3H).

ПРИКЛАД 119

5 N-(4-(2-карбокси-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-7-іл)-3-метилбензоіл)-1-триптофан

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання метилового ефіру (L)-триптофану замість морфоліну у процедурі Прикладу 99. ¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 10,81 (д, 1H), 8,60 (д, 1H), 8,25 (м, 1H), 7,86 (м, 1H), 7,79 (с, 1H), 7,70 (т, 1H), 7,64 (д, 1H), 7,22-7,54 (м, 9H), 7,04 (м, 4H), 6,90 (д, 1H), 4,75 (м, 1H), 4,20 (т, 2H), 3,36 (т, 2H), 2,23 (м, 2H), 2,08 (с, 3H).

10 ПРИКЛАД 120

(3S)-2-(4-(2-карбокси-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-7-іл)-3-метилбензоіл)-1,2,3,4-тетрагідроізохінолін-3-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання (3S)-метил 1,2,3,4-тетрагідроізохінолінкарбоксилату замість морфоліну у процедурі Прикладу 99. ¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,94 (м, 1H), 10,84 (д, 1H), 8,26 (м, 1H), 7,88 (м, 1H), 7,76 (м, 1H), 7,09-7,55 (м, 13H), 6,91 (д, 1H), 5,20 (т, 1H), 5,05 (д, 1H), 4,90 (м, 1H), 4,70 (дд, 1H), 4,50 (д, 1H), 4,22 (т, 2H), 3,38 (т, 2H), 2,27 (м, 2H), 2,08 (с, 3H).

ПРИКЛАД 121

N-(4-(2-карбокси-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-7-іл)-3-метилбензоіл)-1-тирозин

20 Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання метилового ефіру L-тироzinу замість морфоліну у процедурі Прикладу 99. ¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 10,84 (с, 1H), 9,17 (с, 1H), 8,60 (д, 1H), 8,25 (м, 1H), 7,87 (м, 1H), 7,79 (с, 1H), 7,74 (м, 1H), 7,53 (м, 2H), 7,40 (д, 1H), 7,36 (д, 1H), 7,26 (д, 1H), 7,08 (м, 4H), 6,90 (д, 1H), 6,66 (д, 2H), 4,60 (м, 1H), 4,20 (т, 2H), 3,36 (т, 2H), 3,00 (м, 3H), 2,23 (м, 2H), 2,08 (с, 3H).

25 ПРИКЛАД 122

7-(4-((R)-2-карбоксипіролідін-1-карбоніл)-2-метилфеніл)-3-(3-(нафталін-1-ілокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

30 Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання метилового ефіру L-проліну замість морфоліну у процедурі Прикладу 99. ¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 10,80 (с, 1H), 8,25 (м, 1H), 7,86 (м, 1H), 7,71 (д, 1H), 7,36-7,54 (м, 6H), 7,28 (д, 1H), 7,08 (м, 2H), 6,91 (д, 1H), 4,45 (м, 1H), 4,20 (т, 2H), 3,64 (т, 2H), 2,25 (м, 2H), 2,08 (с, 3H), 1,92 (м, 3H).

ПРИКЛАД 123

7-(4-((S)-1-карбоксіетилкарбамоіл)-2-метилфеніл)-3-(3-(нафталін-1-ілокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

35 Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання метилового ефіру L-аланіну замість морфоліну у процедурі Прикладу 99. ¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 10,81 (с, 1H), 8,66 (д, 1H), 8,25 (м, 1H), 7,87 (м, 2H), 7,78 (д, 1H), 7,71 (д, 1H), 7,36-7,54 (м, 4H), 7,30 (д, 1H), 7,06 (м, 2H), 6,91 (д, 1H), 4,47 (м, 1H), 4,21 (т, 2H), 3,37 (т, 2H), 2,25 (м, 2H), 2,08 (с, 3H), 1,42 (д, 3H).

ПРИКЛАД 124

40 N-(4-(2-карбокси-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-7-іл)-3-метилбензоіл)-4-нітро-1-фенілаланін

45 Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання метил 2-аміно-3-(4-нітрофеніл)пропаноату замість морфоліну у процедурі Прикладу 99. ¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,90 (с, 1H), 10,83 (с, 1H), 8,78 (д, 1H), 8,25 (м, 1H), 8,17 (д, 2H), 7,87 (м, 2H), 7,71 (с, 1H), 7,70 (д, 1H), 7,63 (д, 2H), 7,36-7,54 (м, 4H), 7,26 (д, 1H), 7,06 (м, 2H), 6,91 (д, 1H), 4,80 (м, 1H), 4,20 (т, 2H), 3,36 (т, 2H), 2,23 (м, 2H), 2,08 (с, 3H).

ПРИКЛАД 125

N-(4-(2-карбокси-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-7-іл)-3-метилбензоіл)-1-фенілаланін

50 Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання метилового ефіру L-фенілаланіну замість морфоліну у процедурі Прикладу 99. ¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,80 (м, 1H), 10,84 (с, 1H), 8,68 (д, 1H), 8,25 (м, 1H), 7,87 (м, 1H), 7,78 (с, 1H), 7,72 (д, 1H), 7,22-7,54 (м, 10H), 7,06 (м, 2H), 6,91 (д, 1H), 4,70 (м, 1H), 4,20 (т, 2H), 3,36 (т, 2H), 3,21 (м, 3H), 2,23 (м, 2H), 2,08 (с, 3H).

ПРИКЛАД 126

55 7-(4-(((S)-карбокси(феніл)метил)аміно)карбоніл)-2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання (S)-метил 2-аміно-2-фенілацетату замість морфоліну у процедурі Прикладу 99. ¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,92 (с, 1H), 10,79 (с, 1H), 9,02 (д, 1H), 8,25 (м, 1H), 7,93 (с, 1H), 7,85 (м, 2H), 7,70 (д, 1H), 7,31-7,54 (м,

9H), 7,28 (д, 1H), 7,06 (м, 2H), 6,90 (д, 1H), 5,66 (д, 1H), 4,70 (м, 1H), 4,20 (т, 2H), 3,36 (т, 2H), 2,23 (м, 2H), 2,10 (с, 3H).

ПРИКЛАД 127A

метиловий ефір 3-метил-4-(4,4,5,5-тетраметил-(1,3,2)діоксaborolan-2-іл)-бензойної кислоти
5 Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання метилового ефіру 4-бром-3-метилбензойної кислоти замість сполуки Прикладу 1C у процедурі Прикладу 43A.

ПРИКЛАД 127B

етилловий ефір 3-(3-гідроксипропіл)-7-(4-метоксикарбоніл-2-метил-феніл)-1H-індол-2-карбонової кислоти
10 Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання сполуки Прикладу 1B замість сполуки Прикладу 1C і використання сполуки Прикладу 127A замість 2-метоксифенілборонової кислоти у процедурі Прикладу 47A.

ПРИКЛАД 127C

етилловий ефір 7-(4-метоксикарбоніл-2-метил-феніл)-3-(3-(толуол-4-сульфонілокси)-пропіл)-1H-індол-2-карбонової кислоти
15 До суміші сполуки Прикладу 127B (2,0 г), толуол-2-сульфонілхлориду (1,16 г) у дихлорметані (30 мл) додавали DMAP (0,305 г). Суміш перемішували при кімнатній температурі протягом ночі. Суміш розбавляли етилацетатом (300 мл) і промивали насиченою водною сумішшю бікарбонату натрію, 3 % водним розчином HCl, водою і насиченим сольовим розчином. Після сушіння над
20 Na₂SO₄ і фільтрування суміш концентрували.

ПРИКЛАД 127D

7-(4-карбокси-2-метилфеніл)-3-(3-(2,4,5-трихлорфенокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота
25 До суміші сполуки Прикладу 127C (60 мг) у DMF (1 мл) додавали 2,4,5-трихлорфенол (43 мг) і Cs₂CO₃ (500 мг). Суміш перемішували при кімнатній температурі протягом ночі, розбавляли етилацетатом (150 мл) і промивали водою і насиченим сольовим розчином. Після сушіння над Na₂SO₄ об'єднані органічні шари концентрували і концентрат омилювали за допомогою LiOH, як описано у Прикладі 65B. ¹H ЯМР (300 МГц, DMSO-d₆) δ 12,92 (м, 1H), 10,88 (с, 1H), 7,89 (с, 1H), 7,82 (м, 2H), 7,38 (с, 1H), 7,32 (д, 1H), 7,10 (м, 2H), 4,13 (т, 2H), 3,25 (т, 2H), 2,13 (м, 2H), 2,10 (с, 3H).
30

ПРИКЛАД 128

7-(4-карбокси-2-метилфеніл)-3-(3-(2,3,4-трихлорфенокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота
35 Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 2,3,4-трихлорфенолу замість 2,4,5-трихлорфенолу у процедурі Прикладу 127D. ¹H ЯМР (300 МГц, DMSO-d₆) δ 12,86 (м, 1H), 10,87 (с, 1H), 7,89 (с, 1H), 7,82 (дд, 2H), 7,69 (дд, 1H), 7,56 (д, 1H), 7,32 (д, 1H), 7,06 (м, 3H), 4,13 (т, 2H), 3,25 (т, 2H), 2,13 (м, 2H), 2,10 (с, 3H).

ПРИКЛАД 129

7-(4-карбокси-2-метилфеніл)-3-(3-(2,3,5-триметилфенокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота
40 Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 2,3,5-триметилфенолу замість 2,4,5-трихлорфенолу у процедурі Прикладу 127D. ¹H ЯМР (300 МГц, DMSO-d₆) δ 12,86 (м, 1H), 10,85 (с, 1H), 7,89 (с, 1H), 7,82 (дд, 1H), 7,69 (дд, 1H), 7,32 (д, 1H), 7,13 (т, 1H), 7,06 (д, 1H), 3,97 (т, 2H), 3,26 (т, 2H), 2,13 (м, 2H), 2,14 (с, 3H), 2,10 (с, 3H), 2,08 (с, 3H).

ПРИКЛАД 130

3-(3-(2-трет-бутилфенокси)пропіл)-7-(4-карбокси-2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота
45 Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 2-трет-бутилфенолу замість 2,4,5-трихлорфенолу у процедурі Прикладу 127D. ¹H ЯМР (300 МГц, DMSO-d₆) δ 12,88 (м, 1H), 10,88 (с, 1H), 7,90 (с, 1H), 7,82 (дд, 1H), 7,72 (дд, 1H), 7,32 (д, 1H), 7,22 (д, 1H), 7,17 (т, 1H), 7,06 (д, 1H), 6,80 (м, 2H), 4,07 (т, 2H), 2,14 (м, 2H), 2,11 (с, 3H), 1,41 (с, 9H).

ПРИКЛАД 131

7-(4-карбокси-2-метилфеніл)-3-(3-(2-(трифторметил)фенокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота
55 Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 2-трифторметилфенолу замість 2,4,5-трихлорфенолу у процедурі Прикладу 127D. ¹H ЯМР (300 МГц, DMSO-d₆) δ 12,87 (м, 1H), 10,87 (с, 1H), 7,94 (с, 1H), 7,82 (дд, 1H), 7,61 (м, 4H), 7,32 (д, 1H), 7,20 (д, 1H), 7,06 (м, 4H), 4,15 (т, 2H), 3,24 (т, 2H), 2,10 (с, 3H), 2,07 (м, 2H).

ПРИКЛАД 132

7-(4-карбокси-2-метилфеніл)-3-(3-(хінолін-8-ілокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота
60

Сполуку даного прикладу одержували у вигляді TFA солі шляхом використання хінолін-8-олу замість 2,4,5-трихлорфенолу у процедурі Прикладу 127D. ¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,84 (м, 1H), 10,88 (с, 1H), 9,05 (дд, 1H), 8,76 (м, 1H), 7,89 (с, 1H), 7,67-7,83 (м, 5H), 7,32 (м, 2H), 7,03 (м, 2H), 4,27 (т, 2H), 3,35 (т, 2H), 2,28 (м, 2H), 2,09 (с, 3H).

5 ПРИКЛАД 133

7-(4-карбокси-2-метилфеніл)-3-(3-((5-оксо-5,6,7,8-тетрагідронафталін-1-іл)окси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 5-гідрокси-3,4-дигідро-2H-нафталін-1-ону замість 2,4,5-трихлорфенолу у процедурі Прикладу 127D. ¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,87 (м, 1H), 10,85 (с, 1H), 7,89 (с, 1H), 7,82 (д, 1H), 7,70 (д, 1H), 7,46 (д, 1H), 7,30 (м, 2H), 7,03 (м, 3H), 4,07 (т, 2H), 3,26 (т, 2H), 2,90 (т, 2H), 2,58 (т, 3H), 2,13 (м, 2H), 2,09 (с, 3H).

10 ПРИКЛАД 134

3-(3-(3-бензоїлфенокси)пропіл)-7-(4-карбокси-2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання (3-гідрокси-феніл)-феніл-метанону замість 2,4,5-трихлорфенолу у процедурі Прикладу 127D. ¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,86 (м, 1H), 10,84 (с, 1H), 7,89 (с, 1H), 7,82 (д, 1H), 7,68 (м, 3H), 7,50 (т, 2H), 7,44 (т, 1H), 7,32 (д, 2H), 7,25 (т, 2H), 7,06 (м, 2H), 4,06 (т, 2H), 3,24 (т, 2H), 2,13 (м, 2H), 2,09 (с, 3H).

15 ПРИКЛАД 135 A

етил 7-бром-1-(2-морфоліно-2-оксоетил)-3-(3-(5,6,7,8-тетрагідронафталін-1-ілокси)пропіл)-1H-індол-2-карбоксилат

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання сполуки Прикладу 78A замість сполуки Прикладу 1C у процедурі Прикладу 77A.

20 ПРИКЛАД 135B

етил 7-бром-1-(2-морфоліноетил)-3-(3-(5,6,7,8-тетрагідронафталін-1-ілокси)пропіл)-1H-індол-2-карбоксилат

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання сполуки Прикладу 135A замість сполуки Прикладу 77A у процедурі Прикладу 77B.

25 ПРИКЛАД 135C

7-(2-метилфеніл)-1-(2-морфолін-4-ілетил)-3-(3-(5,6,7,8-тетрагідронафталін-1-ілокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували у вигляді TFA солі шляхом використання 2-метилфенілборонової кислоти замість (Е)-стирилборонової кислоти і використання сполуки Прикладу 135B замість сполуки Прикладу 1C у процедурі Прикладу 1D. ¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆) δ 13,43 (шир.с, 1H), 7,77 (д, 1H), 7,41 (м, 4H), 7,20 (т, 1H), 7,01 (м, 2H), 6,65 (м, 2H), 4,66 (м, 1H), 4,02 (м, 4H), 3,26 (т, 2H), 2,66 (м, 8H), 2,05 (м, 6H), 1,72 (м, 4H).

35 ПРИКЛАД 136

7-(4-(циклогексилокси)феніл)-3-(4-(1-нафтилокси)бутил)-1H-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 4-циклогексилоксифенілборонової кислоти замість (Е)-стирилборонової кислоти і використання сполуки Прикладу 112A замість сполуки Прикладу 1C у процедурі Прикладу 1D. ¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,98 (шир.с, 1H), 10,21 (с, 1H), 8,12 (д, 1H), 7,85 (д, 1H), 7,66 (д, 1H), 7,46 (м, 6H), 7,22 (д, 1H), 7,13 (т, 1H), 7,06 (д, 2H), 6,94 (д, 1H), 4,40 (м, 1H), 4,19 (м, 2H), 3,21 (м, 2H), 1,95 (м, 6H), 1,75 (м, 2H), 1,41 (м, 6H).

40 ПРИКЛАД 137

7-(1,1'-біфеніл-2-іл)-1-(2-морфолін-4-ілетил)-3-(3-(5,6,7,8-тетрагідронафталін-1-ілокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували у вигляді TFA солі шляхом використання 2-біфенілборонової кислоти замість (Е)-стирилборонової кислоти і використання сполуки Прикладу 135B замість сполуки Прикладу 1C у процедурі Прикладу 1D. ¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆) δ 13,17 (шир.с, 1H), 7,57 (м, 5H), 7,05 (м, 8H), 6,62 (м, 2H), 4,69 (м, 1H), 4,03 (м, 1H), 3,87 (т, 2H), 3,15 (т, 2H), 2,76 (м, 10H), 1,96 (м, 2H), 1,71 (м, 4H).

45 ПРИКЛАД 138A

етил 7-бром-3-(3-(3,4-диметилфенокси)пропіл)-1H-індол-2-карбоксилат

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 3,4-диметилфенолу замість 1-нафтолу у процедурі Прикладу 1C.

50 ПРИКЛАД 138B

3-(3-(3,4-диметилфенокси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 2-метилфенілборонової кислоти замість (Е)-стирилборонової кислоти і використання сполуки Прикладу 138A замість сполуки Прикладу 1C у процедурі Прикладу 1D. ¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,90 (шир.с, 1H),

10,47 (с, 1H), 7,66 (д, 1H), 7,27 (м, 4H), 7,05 (м, 3H), 6,66 (м, 2H), 3,95 (т, 2H), 3,22 (т, 2H), 2,17 (с, 3H), 2,13 (с, 3H), 2,05 (м, 5H).

ПРИКЛАД 139A

етил 7-бром-3-(3-(3,5-диметилфенокси)пропіл)-1H-індол-2-карбоксилат

- 5 Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 3,5-диметилфенолу замість 1-нафтолу у процедурі Прикладу 1C.

ПРИКЛАД 139B

3-(3-(3,5-диметилфенокси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота

- 10 Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 2-метилфенілборонової кислоти замість (Е)-стирилборонової кислоти і використання сполуки Прикладу 139A замість сполуки Прикладу 1C у процедурі Прикладу 1D. ¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,88 (шир.с, 1H), 10,48 (с, 1H), 7,67 (д, 1H), 7,28 (м, 4H), 7,08 (м, 2H), 6,52 (м, 3H), 3,96 (т, 2H), 3,22 (т, 2H), 2,21 (с, 6H), 2,06 (м, 5H).

ПРИКЛАД 140A

етил 7-бром-3-(3-(2,3-диметоксифенокси)пропіл)-1H-індол-2-карбоксилат

- 15 Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 2,3-диметоксифенолу замість 1-нафтолу у процедурі Прикладу 1C.

ПРИКЛАД 140B

3-(3-(2,3-диметоксифенокси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота

- 20 Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 2-метилфенілборонової кислоти замість (Е)-стирилборонової кислоти і використання сполуки Прикладу 140A замість сполуки Прикладу 1C у процедурі Прикладу 1D. ¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆) δ 9,92 (шир.с, 1H), 7,65 (м, 1H), 7,28 (м, 4H), 7,09 (м, 1H), 7,01 (д, 1H), 6,94 (м, 1H), 6,61 (м, 2H), 4,02 (т, 2H), 3,77 (с, 3H), 3,73 (с, 3H), 3,25 (т, 2H), 2,08 (м, 5H).

ПРИКЛАД 141A

етил 7-бром-3-(3-(нафталін-1-іламіно)-3-оксопропіл)-1H-індол-2-карбоксилат

- 25 Суміш 3-(7-бром-2-(етоксикарбоніл)-1H-індол-3-іл)пропанової кислоти (0,68 г), нафталін-1-аміну (0,294 г), DMAP (0,363 г) і гідрохлориду 1-етил-3-(3-(диметиламіно)пропіл)карбодііміду (0,576 г) перемішували протягом 3 днів при кімнатній температурі. Відбувалося осадження продукту, і його фільтрували, промивали дихлорметаном і сушили у вакуумі.

ПРИКЛАД 141B

етил 7-бром-3-(3-(нафталін-1-іламіно)пропіл)-1H-індол-2-карбоксилат

- 30 До сполуки Прикладу 141A (0,465 г) додавали суміш 1M BH₃·ТГФ (4 мл) і суміш перемішували протягом 16 годин, гасили метанолом і концентрували. Концентрат обробляли за допомогою HCl і етанолу, і суміш концентрували. Концентрат розподіляли між насиченим розчином бікарбонату натрію і дихлорметаном. Органічний шар сушили (Na₂SO₄), фільтрували і концентрували. Концентрат очищали колонковою флеш-хроматографією на силікагелі з використанням суміші 0-30 % етилацетату/гексану.

ПРИКЛАД 141C

7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтиламіно)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

- 40 Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 2-метилфенілборонової кислоти замість (Е)-стирилборонової кислоти і використання сполуки Прикладу 141B замість сполуки Прикладу 1C у процедурі Прикладу 1D. ¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,99 (шир.с, 1H), 10,46 (с, 1H), 8,14 (д, 1H), 7,73 (м, 2H), 7,25 (м, 10H), 6,47 (д, 1H), 3,26 (м, 4H), 2,09 (м, 5H).

ПРИКЛАД 142A

етил 7-бром-1-(2-метоксі-2-оксоетил)-3-(3-(нафталін-1-ілокси)пропіл)-1H-індол-2-карбоксилат

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання метил 2-хлорацетату замість 2-хлор-1-морфоліноетанону у процедурі Прикладу 77A.

ПРИКЛАД 142B

1-(карбоксиметил)-7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

- 50 Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 2-метилфенілборонової кислоти замість (Е)-стирилборонової кислоти і використання сполуки Прикладу 142A замість сполуки Прикладу 1C у процедурі Прикладу 1D. ¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 13,15 (шир.с, 1H), 12,37 (шир.с, 1H), 8,26 (м, 1H), 7,88 (м, 1H), 7,78 (м, 1H), 7,39 (м, 7H), 7,12 (м, 2H), 6,94 (м, 2H), 4,77 (шир.с, 1H), 4,49 (шир.с, 1H), 4,23 (т, 2H), 2,23 (м, 2H), 1,96 (с, 3H).

ПРИКЛАД 143A

етил 7-бром-3-(3-(3-диметиламінофенокси)пропіл)-1H-індол-2-карбоксилат

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 3-диметиламінофенолу замість 1-нафтолу у процедурі Прикладу 1С.

ПРИКЛАД 143В

3-(3-(3-(диметиламіно)фенокси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 2-метилфенілборонової кислоти замість (Е)-стирилборонової кислоти і використання сполуки Прикладу 143А замість сполуки Прикладу 1С у процедурі Прикладу 1D. ¹Н ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,90 (шир.с, 1Н), 10,48 (с, 1Н), 7,68 (м, 1Н), 7,26 (м, 4Н), 7,07 (м, 3Н), 6,37 (м, 3Н), 3,99 (т, 2Н), 3,22 (т, 2Н), 2,90 (с, 6Н), 2,06 (м, 5Н).

ПРИКЛАД 144А

морфоліно(4-нітро-3-(трифторметил)феніл)метанон

До суміші 4-нітро-3-трифторметилбензойної кислоти (10 г), морфоліну (3,7 г) у дихлорметані (300 мл) додавали DMAP (5,2 г) і гідрохлорид 1-етил-3-(3-(диметиламіно)пропіл)-карбодііміду (12,3 г). Суміш перемішували при кімнатній температурі протягом ночі, промивали 5 % водним розчином HCl, водою і насиченим сольовим розчином, і концентрували.

ПРИКЛАД 144В

(4-аміно-3-(трифторметил)феніл)(морфоліно)метанон

Суміш сполуки Прикладу 144А (13 г) і Pd/C (1,3 г, 10 %) в етанолі (300 мл) перемішували в атмосфері водню при кімнатній температурі протягом двох днів. Каталізатор відфільтровували і розчинник випарювали з одержанням кінцевої сполуки.

ПРИКЛАД 144С

(4-бром-3-(трифторметил)феніл)(морфоліно)метанон

До суміші сполуки Прикладу 144В (8,3 г) додавали воду (75 мл) і H₂SO₄ (25 мл). Суміш перемішували при 0°C і при цьому додавали NaNO₂ (3,13 г) у воді (30 мл). Після перемішування протягом 1 години суміш додавали до CuBr (5,45 г) у 48 % розчині HBr (200 мл). Цю суміш перемішували при 60°C протягом 3 годин, охолоджували до кімнатної температури і розподіляли між водою і етилацетатом. Органічний шар промивали водним розчином Na₂CO₃ і сушили (Na₂SO₄), фільтрували і концентрували.

ПРИКЛАД 144D

етилловий ефір 3-(4-оксо-бутил)-7-(4,4,5,5-тетраметил-(1,3,2)діоксaborолан-2-іл)-1Н-індол-2-карбонової кислоти

Суміш сполуки Прикладу 109С (2,3 г), біс(пінаколато)дибору (2,1 г), ацетату калію (3,34 г) і (1,1'-біс(дифенілфосфіно)фероцен)дихлорпаладію(II) (278 мг) у DMF (40 мл) перемішували при 60°C протягом ночі і концентрували. Концентрат розподіляли між дихлорметаном і водою. Водну фазу далі екстрагували дихлорметаном. Екстракт промивали водою і насиченим сольовим розчином, і сушили (Na₂SO₄), фільтрували і концентрували. Концентрат очищали флеш-хроматографією на силікагелі з використанням суміші 5 % етилацетату у гексані.

ПРИКЛАД 144Е

етил 7-(4-(морфолін-4-карбоніл)-2-(трифторметил)феніл)-3-(4-оксобутил)-1Н-індол-2-карбоксилат

До суміші сполуки Прикладу 144D (1,67 г) і сполуки Прикладу 144С (1,53 г) у диметоксигетані (80 мл) додавали трис(добензиліденацетон)дипаладій(0) (201 мг), три-трет-бутилфосфін тетрафторборат (128 мг) і CsF (1,97 г). Суміш перемішували при температурі навколишнього середовища протягом ночі, розбавляли етилацетатом (200 мл), промивали водою і насиченим сольовим розчином, і сушили (Na₂SO₄), фільтрували і концентрували. Концентрат очищали на силікагелі з використанням суміші 20 % етилацетату у гексані.

ПРИКЛАД 144F

3-(4-(3,4-дигідрохінолін-1(2Н)-іл)бутил)-7-(4-(морфолін-4-ілкарбоніл)-2-(трифторметил)феніл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

До суміші сполуки Прикладу 144Е (52 мг) і 1,2,3,4-тетрагідрохіноліну (27 мг) у дихлоретані (2 мл) додавали триацетоксиборогідрид натрію (50 мг). Суміш перемішували при температурі навколишнього середовища протягом ночі, розбавляли етилацетатом (200 мл), промивали водою і насиченим сольовим розчином, і сушили над сульфатом натрію. Випарювання розчинника і очищення колонковою флеш-хроматографією на силікагелі з використанням суміші 20 % етилацетату у гексані давали сполуку етилового ефіру, яку омилювали за допомогою LiOH, як описано у Прикладі 65В. ¹Н ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 11,09 (с, 1Н), 8,29 (с, 1Н), 8,21 (дд, 1Н), 7,74 (д, 1Н), 7,54 (д, 1Н), 7,13 (д, 1Н), 7,05 (д, 1Н), 6,90 (т, 1Н), 6,86 (д, 1Н), 6,52 (д, 1Н), 6,43 (т, 1Н), 3,20 (м, 12Н), 2,64 (т, 2Н), 1,81 (м, 2Н), 1,61 (м, 6Н).

ПРИКЛАД 145

3-(4-(2-метил-3,4-дигідрохінолін-1(2H)-іл)бутил)-7-(4-(морфолін-4-ілкарбоніл)-2-(трифторметил)феніл)-1H-індол-2-карбонова кислота

5 Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 2-метил-1,2,3,4-тетрагідрохіноліну замість 1,2,3,4-тетрагідрохіноліну у процедурі Прикладу 144F. ¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 11,09 (с, 1H), 8,29 (с, 1H), 8,22 (дд, 1H), 7,74 (д, 1H), 7,54 (д, 1H), 7,13 (т, 1H), 7,05 (д, 1H), 6,93 (т, 1H), 6,86 (д, 1H), 6,45 (м, 2H), 3,35 (м, 4H), 3,17 (м, 12H), 2,72 (м, 2H), 1,69 (м, 6H), 1,04 (д, 3H).

ПРИКЛАД 146

10 3-(4-(6-метил-3,4-дигідрохінолін-1(2H)-іл)бутил)-7-(4-(морфолін-4-ілкарбоніл)-2-(трифторметил)феніл)-1H-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 6-метил-1,2,3,4-тетрагідрохіноліну замість 1,2,3,4-тетрагідрохіноліну у процедурі Прикладу 144F. ¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 11,09 (с, 1H), 8,29 (с, 1H), 8,21 (дд, 1H), 7,72 (д, 1H), 7,53 (д, 1H), 7,12 (т, 1H), 7,05 (д, 1H), 6,75 (д, 1H), 6,69 (с, 1H), 6,48 (м, 1H), 3,17 (м, 12H), 2,62 (т, 2H), 2,11 (с, 3H), 1,83 (т, 2H), 1,63 (м, 4H).

ПРИКЛАД 147

3-(4-(6-метокси-3,4-дигідрохінолін-1(2H)-іл)бутил)-7-(4-(морфолін-4-ілкарбоніл)-2-(трифторметил)феніл)-1H-індол-2-карбонова кислота

20 Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 6-метокси-1,2,3,4-тетрагідрохіноліну замість 1,2,3,4-тетрагідрохіноліну у процедурі Прикладу 144F. ¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 11,11 (с, 1H), 8,29 (с, 1H), 8,21 (дд, 1H), 7,75 (д, 1H), 7,53 (д, 1H), 7,13 (т, 1H), 7,06 (д, 1H), 6,61 (м, 3H), 3,65 (с, 3H), 3,17 (м, 12H), 2,69 (м, 2H), 1,86 (м, 2H), 1,6 (м, 4H).

ПРИКЛАД 148

25 3-(4-(етил(1-нафтил)аміно)бутил)-7-(4-(морфолін-4-ілкарбоніл)-2-(трифторметил)феніл)-1H-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання етил-нафталін-1-іл-аміну замість 1,2,3,4-тетрагідрохіноліну у процедурі Прикладу 144F. ¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 11,06 (с, 1H), 8,29 (с, 1H), 8,21 (дд, 1H), 7,20-8,00 (м, 8H), 7,04 (м, 3H), 3,17 (м, 12H), 1,63 (м, 5H), 0,95 (т, 3H).

ПРИКЛАД 149

30 3-(4-(2,3-дигідро-1H-індол-1-іл)бутил)-7-(4-(морфолін-4-ілкарбоніл)-2-(трифторметил)феніл)-1H-індол-2-карбонова кислота

35 Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 2,3-дигідро-1H-індолу замість 1,2,3,4-тетрагідрохіноліну у процедурі Прикладу 144F. ¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 11,09 (с, 1H), 8,29 (с, 1H), 8,21 (дд, 1H), 7,74 (д, 1H), 7,54 (д, 1H), 6,93-7,14 (м, 4H), 6,55 (т, 1H), 6,47 (д, 1H), 3,14 (м, 12H), 2,85 (м, 3H), 1,67 (м, 5H).

ПРИКЛАД 150

40 3-(4-(2-метил-2,3-дигідро-1H-індол-1-іл)бутил)-7-(4-(морфолін-4-ілкарбоніл)-2-(трифторметил)феніл)-1H-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 2,3-дигідро-2-метил-1H-індолу замість 1,2,3,4-тетрагідрохіноліну у процедурі Прикладу 144F. ¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 11,09 (с, 1H), 8,29 (с, 1H), 8,21 (дд, 1H), 7,74 (д, 1H), 7,54 (д, 1H), 7,12 (т, 1H), 7,07 (д, 1H), 6,49 (т, 1H), 6,33 (д, 1H), 3,62 (м, 2H), 3,14 (м, 12H), 1,70 (м, 5H), 1,18 (д, 3H).

ПРИКЛАД 151

45 7-(4-(морфолін-4-ілкарбоніл)-2-(трифторметил)феніл)-3-(4-(5-нітро-2,3-дигідро-1H-індол-1-іл)бутил)-1H-індол-2-карбонова кислота

50 Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 2,3-дигідро-5-нітро-1H-індолу замість 1,2,3,4-тетрагідрохіноліну у процедурі Прикладу 144F. ¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 11,09 (с, 1H), 8,29 (с, 1H), 8,21 (дд, 1H), 7,96 (дд, 1H), 7,79 (с, 1H), 7,74 (д, 1H), 7,53 (д, 1H), 7,06 (м, 3H), 6,42 (д, 1H), 3,61 (т, 3H), 3,14 (м, 10H), 3,04 (т, 2H), 1,67 (м, 5H).

ПРИКЛАД 152

3-(4-(5-бром-2,3-дигідро-1H-індол-1-іл)бутил)-7-(4-(морфолін-4-ілкарбоніл)-2-(трифторметил)феніл)-1H-індол-2-карбонова кислота

55 Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 5-бром-2,3-дигідро-1H-індолу замість 1,2,3,4-тетрагідрохіноліну у процедурі Прикладу 144F. ¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 11,10 (с, 1H), 8,29 (с, 1H), 8,22 (дд, 1H), 7,74 (д, 1H), 7,54 (д, 1H), 7,06 (м, 4H), 6,38 (д, 1H), 3,17 (м, 10H), 3,04 (т, 2H), 2,86 (т, 2H), 1,67 (м, 5H).

ПРИКЛАД 153

60 3-(4-(2,3-дигідро-4H-1,4-бензоксазин-4-іл)бутил)-7-(4-(морфолін-4-ілкарбоніл)-2-(трифторметил)феніл)-1H-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 3,4-дигідро-2Н-бензо(1,4)оксазину замість 1,2,3,4-тетрагідрохіноліну у процедурі Прикладу 144F. ¹Н ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 11,09 (с, 1Н), 8,29 (с, 1Н), 8,21 (дд, 1Н), 7,74 (д, 1Н), 7,53 (д, 1Н), 7,12 (т, 1Н), 7,05 (д, 1Н), 6,71 (т, 1Н), 6,65 (д, 2Н), 6,46 (т, 1Н), 4,12 (т, 2Н), 3,14 (м, 10Н), 1,65 (м, 6Н).

5 ПРИКЛАД 154А

етил 7-бром-3-(3-(2,3,5-триметилфенокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбоксилат

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 2,3,5-триметилфенолу замість 1-нафтолу у процедурі Прикладу 1С.

ПРИКЛАД 154В

10 7-(2-метилфеніл)-3-(3-(2,3,5-триметилфенокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 2-метилфенілборонової кислоти замість (Е)-стирилборонової кислоти і використання сполуки Прикладу 154А замість сполуки Прикладу 1С у процедурі Прикладу 1D. ¹Н ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,89 (шир.с, 1Н), 10,47 (с, 1Н), 7,66 (д, 1Н), 7,27 (м, 4Н), 7,11 (т, 1Н), 7,04 (д, 1Н), 6,54 (д, 2Н), 3,97 (т, 2Н), 3,26 (т, 2Н), 2,18 (с, 3Н), 2,17 (с, 3Н), 2,07 (м, 8Н).

15 ПРИКЛАД 155А

етил 7-бром-3-(3-(2,3,6-триметилфенокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбоксилат

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 2,3,6-триметилфенолу замість 1-нафтолу у процедурі Прикладу 1С.

20 ПРИКЛАД 155В

7-(2-метилфеніл)-3-(3-(2,3,6-триметилфенокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 2-метилфенілборонової кислоти замість (Е)-стирилборонової кислоти і використання сполуки Прикладу 155А замість сполуки Прикладу 1С у процедурі Прикладу 1D. ¹Н ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,89 (шир.с, 1Н), 10,47 (с, 1Н), 7,71 (д, 1Н), 7,28 (м, 4Н), 7,15 (т, 1Н), 7,05 (д, 1Н), 6,89 (д, 1Н), 6,80 (д, 1Н), 3,76 (т, 2Н), 3,27 (т, 2Н), 2,16 (с, 3Н), 2,16 (с, 3Н), 2,11 (м, 5Н), 2,06 (с, 3Н).

25 ПРИКЛАД 156А

етил 7-бром-3-(3-(2,3-дихлорфенокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбоксилат

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 2,3-дихлорфенолу замість 1-нафтолу у процедурі Прикладу 1С.

30 ПРИКЛАД 156В

3-(3-(2,3-дихлорфенокси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання 2-метилфенілборонової кислоти замість (Е)-стирилборонової кислоти і використання сполуки Прикладу 156А замість сполуки Прикладу 1С у процедурі Прикладу 1D. ¹Н ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆) δ 10,48 (шир.с, 1Н), 7,66 (д, 1Н), 7,30 (м, 4Н), 7,21 (м, 2Н), 7,06 (м, 3Н), 4,12 (т, 2Н), 3,27 (т, 2Н), 2,12 (м, 2Н), 2,05 (с, 3Н).

ПРИКЛАД 157А

етиловий ефір 7-бром-3-(4-етоксикарбоніл-бутил)-1Н-індол-2-карбонової кислоти

40 Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання етилового ефіру 2-оксо-циклопентанкарбонової кислоти замість етилового ефіру 2-оксо-циклопентанкарбонової кислоти у процедурі Прикладу 1А.

ПРИКЛАД 157В

етиловий ефір 7-бром-3-(5-гідрокси-пентил)-1Н-індол-2-карбонової кислоти

45 Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання сполуки Прикладу 157А замість сполуки Прикладу 1А у процедурі Прикладу 1В.

ПРИКЛАД 157С

етиловий ефір 7-бром-3-(5-(5,6,7,8-тетрагідро-нафталін-1-ілокси)-пентил)-1Н-індол-2-карбонової кислоти

50 Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання сполуки Прикладу 157А замість сполуки Прикладу 1В і використання 5,6,7,8-тетрагідронафтолу замість 1-нафтолу у процедурі Прикладу 1С.

ПРИКЛАД 157D

55 7-(2-метилфеніл)-3-(5-(5,6,7,8-тетрагідронафталін-1-ілокси)пентил)-1Н-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання сполуки Прикладу 157С замість сполуки Прикладу 1С і використання 2-метилфенілборонової кислоти замість (Е)-стирилборонової кислоти у процедурі Прикладу 1D. ¹Н ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,82 (шир.с, 1Н), 10,35 (с, 1Н), 7,66 (д, 1Н), 7,28 (м, 4Н), 7,13 (т, 1Н), 7,01 (м, 2Н), 6,67 (д, 1Н), 6,61 (д, 1Н), 3,91 (т, 2Н), 3,11 (т, 2Н), 2,66 (м, 2Н), 2,06 (с, 3Н), 1,72 (м, 8Н), 1,53 (м, 2Н).

60

ПРИКЛАД 158A

етиловий ефір 7-бром-3-(5-(нафталін-1-ілокси)-пентил)-1H-індол-2-карбонової кислоти

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання сполуки Прикладу 157B замість сполуки Прикладу 1B у процедурі Прикладу 1C.

5 ПРИКЛАД 158B

7-(2-метилфеніл)-3-(5-(1-нафтилокси)пентил)-1H-індол-2-карбонова кислота

Сполуку даного прикладу одержували шляхом використання сполуки Прикладу 158A замість сполуки Прикладу 1C і використання 2-метилфенілборонової кислоти замість (E)-стирилборонової кислоти у процедурі Прикладу 1D. ¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,81 (шир.с, 1H), 10,37 (с, 1H), 8,12 (д, 1H), 7,85 (д, 1H), 7,68 (д, 1H), 7,46 (м, 4H), 7,28 (м, 4H), 7,12 (м, 1H), 7,04 (м, 1H), 6,95 (д, 1H), 4,15 (т, 2H), 3,15 (т, 2H), 2,06 (с, 3H), 1,92 (м, 2H), 1,77 (м, 2H), 1,63 (м, 2H).

ПРИКЛАД 159

7-(2,3-диметилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

15 ¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,92 (с, 1H), 10,35 (с, 1H), 8,25 (м, 1H), 7,87 (м, 1H), 7,69 (дд, 1H), 7,52 (м, 2H), 7,42 (м, 2H), 7,19 (м, 2H), 7,04 (м, 3H), 6,91 (дд, 1H), 4,21 (т, 2H), 3,37 (м, 2H), 2,32 (с, 3H), 2,24 (м, 2H), 1,94 (с, 3H).

ПРИКЛАД 160

7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1-(піридин-4-ілметил)-1H-індол-2-карбонова кислота

20 ¹H ЯМР (400 МГц, ДМСО-d₆) δ 8,37-8,45 (м, 2H), 8,19-8,26 (м, 1H), 7,84-7,91 (м, 2H), 7,36-7,57 (м, 4H), 7,13-7,28 (м, 3H), 6,83-7,00 (м, 4H), 6,59-6,67 (м, 2H), 5,52-5,63 (м, 1H), 5,17-5,30 (м, 1H), 4,26 (т, 2H), 2,24-2,35 (м, 2H), 1,76 (с, 3H).

ПРИКЛАД 162

7-(2-(4-фторфеніл)циклогекс-1-ен-1-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

25 ¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 12,95 (с, 1H), 10,78 (с, 1H), 8,23-8,24 (м, 1H), 7,85-7,87 (м, 1H), 7,35-7,54 (м, 5H), 7,02-7,05 (м, 2H), 6,84 (д, J=7,63 Гц, 1H), 6,76-6,79 (м, 4H), 4,42 (т, J=6,87 Гц, 2H), 4,10-4,13 (м, 2H), 3,25 (шир, 2H), 2,39-2,42 (м, 4H), 2,21-2,26 (м, 2H), 1,86 (шир, 4H).

ПРИКЛАД 163

7-(3,5-диметил-1-(2-(2-оксопіролідін-1-іл)етил)-1H-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

30 ¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 12,96 (с, 1H), 10,42 (с, 1H), 8,25-8,27 (м, 1H), 7,86-7,88 (м, 1H), 7,65 (д, J=7,63 Гц, 1H), 7,38-7,55 (м, 4H), 7,25-7,28 (м, 1H), 7,01-7,07 (м, 2H), 6,91 (д, J=7,63 Гц, 1H), 4,16-4,22 (м, 4H), 4,03 (шир, 4H), 3,34-3,37 (м, 2H), 2,21-2,26 (м, 2H), 2,11-2,14 (м, 2H), 2,05 (с, 3H), 1,98 (с, 3H), 1,87-1,93 (м, 2H).

ПРИКЛАД 164

1-(трет-бутоксикарбоніл)-7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)бензил)-1H-індол-2-карбонова кислота

40 ПРИКЛАД 164A

7-бром-1H-індол

1-бром-2-нітробензол (6,000 г, 29,7 ммоль) додавали до тетрагідрофурану (65 мл) і охолоджували до -40 °C. Швидко додавали вінілмагнійбромід (1M у тетрагідрофурани, 89 мл). Розчин перемішували протягом 20 хвилин і потім виливали у насичений водний розчин хлориду амонію. Розчин екстрагували простим діетиловим ефіром і сушили за допомогою насиченого сольового розчину і безводного сульфату натрію. Розчин концентрували і очищали колонковою флеш-хроматографією на силікагелі з використанням суміші 5 % етилацетату у гексані з одержанням зазначеної у заголовку сполуки.

ПРИКЛАД 164B

50 7-о-толіл-1H-індол

Сполуку Прикладу 164A (2,500 г), о-толілборонову кислоту (1,907 г) і карбонат натрію (2M водний розчин, 19,13 мл) додавали до діоксану (43 мл). Розчин дегазували і продували азотом три рази. Додавали дихлор(1,1'-біс(дифенілфосфіно)фероцен)паладій(II) у вигляді продукту приєднання з дихлорметаном (833 мг) і розчин нагрівали при 80 °C протягом ночі. Розчин охолоджували, додавали до водного розчину 1M HCl, екстрагували сумішшю 20 % етилацетату/гексан і сушили за допомогою насиченого сольового розчину і безводного сульфату натрію. Розчин концентрували і очищали колонковою флеш-хроматографією на силікагелі з використанням суміші 5 % етилацетату у гексані з одержанням зазначеної у заголовку сполуки.

60 ПРИКЛАД 164C

3-(нафталін-1-ілокси)бензальдегід

1-йоднафталін (2,000 г) і 3-гідроксибензальдегід (1,442 г) додавали до діоксану (25 мл). Розчин дегазували і продували азотом три рази. Додавали карбонат цезію (5,13 г), гідрохлорид N, N-диметилгліцину (82 мг) і йодид міді (I) (30 мг) і розчин нагрівали при 90 °C протягом ночі. Розчин охолоджували, додавали до водного розчину 1М HCl, екстрагували простим діетиловим ефіром, сушили за допомогою насиченого сольового розчину і безводного сульфату натрію. Розчин концентрували і очищали колонковою флеш-хроматографією на силікагелі з використанням суміші 10 % етилацетату у гексані з одержанням зазначеної у заголовку сполуки.

ПРИКЛАД 164D

3-(3-(нафталін-1-ілокси)бензил)-7-о-толіл-1H-індол

Сполуку Прикладу 164B (133 мг) і сполуку Прикладу 164C (175 мг) розчиняли у дихлорметані (3 мл) і додавали по краплях до розчину трифтороцтової кислоти (0,074 мл, 110 мг) і триетилсилану (0,307 мл, 224 мг) у дихлорметані (3 мл), що був охолоджений до 0 °C. Розчин перемішували протягом однієї години при 0 °C, гасили за допомогою насиченого водного розчину хлориду амонію, екстрагували етилацетатом і сушили за допомогою насиченого сольового розчину і безводного сульфату натрію. Розчин концентрували і очищали колонковою флеш-хроматографією на силікагелі з використанням суміші 5 % → 10 % етилацетату у гексані з одержанням зазначеної у заголовку сполуки.

ПРИКЛАД 164E

трет-бутил 3-(3-(нафталін-1-ілокси)бензил)-7-о-толіл-1H-індол-1-карбоксилат

Сполуку Прикладу 164D (158 мг) і 4-диметиламінопіридин (4,4 мг) додавали до ацетонітрилу (3 мл). Додавали ди-трет-бутил дикарбонат (0,088 мл, 82 мг) і розчин перемішували при температурі навколишнього середовища протягом 30 хвилин. Розчин концентрували і очищали колонковою флеш-хроматографією на силікагелі з використанням суміші 5 % етилацетату у гексані з одержанням зазначеної у заголовку сполуки.

ПРИКЛАД 164F

1-трет-бутил 2-метил 3-(3-(нафталін-1-ілокси)бензил)-7-о-толіл-1H-індол-1,2-дикарбоксилат

Сполуку Прикладу 164E (161 мг) додавали до тетрагідрофурану (3 мл). Розчин охолоджували до -78 °C і повільно додавали трет-бутиллітій (1,7М у пентані, 0,193 мл). Розчин перемішували при -78 °C протягом 45 хвилин і додавали метилхлорформіат (0,025 мл, 30,5 мг). Розчин перемішували при -78 °C протягом 30 хвилин і давали нагрітися до температури навколишнього середовища. Розчин концентрували і очищали колонковою флеш-хроматографією на силікагелі з використанням суміші 5 % етилацетату у гексані з одержанням зазначеної у заголовку сполуки.

ПРИКЛАД 164G

1-(трет-бутоксикарбоніл)-7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)бензил)-1H-індол-2-карбонова кислота

Сполуку Прикладу 164F (35 мг, 0,059 ммоль) розчиняли у суміші тетрагідрофурану (0,6 мл), води (0,2 мл) і метанолу (0,2 мл). Додавали моногідрат гідроксиду літію (9,8 мг, 0,234 ммоль) і розчин перемішували протягом ночі при температурі навколишнього середовища. Розчин злегка підкислювали з використанням 1М HCl, екстрагували етилацетатом і сушили за допомогою безводного сульфату натрію. Розчинник видаляли у вакуумі з одержанням зазначеної у заголовку сполуки. ¹H ЯМР (300 МГц, DMSO-d₆) δ 13,72 (шир.с, 1H), 8,05 (дд, 1H), 7,98 (дд, 1H), 7,73 (д, 1H), 7,66 (дд, 1H), 7,61-7,49 (м, 2H), 7,44 (т, 1H), 7,31-7,18 (м, 5H), 7,12 (дд, 2H), 7,06 (тд, 2H), 6,95 (дд, 1H), 6,78 (дд, 1H), 4,35 (с, 2H), 1,99 (д, 3H), 1,17 (с, 9H).

ПРИКЛАД 165

7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)бензил)-1H-індол-2-карбонова кислота

Сполуку Прикладу 164G (35 мг) розчиняли у дихлорметані (2 мл). Додавали триетилсилан (0,011 мл, 7,7 мг) і трифтороцтову кислоту (0,018 мл, 27 мг), і розчин перемішували протягом ночі при температурі навколишнього середовища. Розчин концентрували і очищали колонковою флеш-хроматографією на силікагелі з використанням суміші 50 % етилацетату у гексані з одержанням зазначеної у заголовку сполуки. ¹H ЯМР (300 МГц, DMSO-d₆) δ 12,98 (шир.с, 1H), 10,61 (с, 1H), 8,05 (дд, 1H), 7,98 (дд, 1H), 7,71 (д, 1H), 7,63-7,49 (м, 3H), 7,43 (т, 1H), 7,35-7,19 (м, 6H), 7,14-7,07 (м, 2H), 7,04 (дд, 1H), 6,93 (дд, 1H), 6,75 (ддд, 1H), 4,48 (с, 2H), 1,99 (с, 3H).

ПРИКЛАД 166

7-(2-метилфеніл)-4-((E)-2-фенілвініл)-1H-індол-2-карбонова кислота

ПРИКЛАД 166A

(Z)-етил 2-азидо-3-(5-бром-2-хлорфеніл)акрилат

До розчину етоксиду натрію в етанолі (15 мл), охолодженого до -10 °C, додавали по краплях розчин 5-бром-2-хлорбензальдегіду (1,0 г) і етил 2-азидоацетату (11 мл, 18 ммоль) в етанолі-

тетрагідрофурані (15 мл-3 мл). Реакційну суміш перемішували при -10 °С протягом 3 годин, давали нагрітися до 10 °С протягом 3 годин і виливали на подрібнений лід. Тверду речовину збирали фільтруванням і сушили у вакуумній печі з одержанням зазначеної у заголовку сполуки.

ПРИКЛАД 166B

5 етил 7-бром-4-хлор-1H-індол-2-карбоксилат

При кип'ятінні зі зворотним холодильником до розчину 1,2-дихлорбензолу (17 мл) додавали по краплях сполуку Прикладу 166A (1,2 г, 3,7 ммоль) протягом 3 годин. Розчин нагрівали при температурі кипіння зі зворотним холодильником ще протягом 2 годин. Розчинник видаляли при зниженому тиску і залишок очищали флеш-хроматографією (0-20 % етилацетату у гексані) з одержанням зазначеної у заголовку сполуки.

ПРИКЛАД 166C

етил 4-хлор-7-о-толіл-1H-індол-2-карбоксилат

10 До розчину сполуки Прикладу 166B (610 мг), о-толілборонової кислоти (330 мг), фториду цезію (930 мг) у діоксані (5 мл) додавали тетракіс(трифенілфосфін)паладій (240 мг). Одержану суміш нагрівали при температурі кипіння зі зворотним холодильником протягом ночі і концентрували. Залишок розбавляли етилацетатом і насиченим розчином ацетату амонію і шари розділяли. Водний шар екстрагували етилацетатом (×2) і об'єднані органічні шари промивали насиченим сольовим розчином, сушили над MgSO₄, фільтрували і концентрували. Залишок очищали флеш-хроматографією (0-20 % етилацетату у гексані) з одержанням зазначеної у заголовку сполуки.

ПРИКЛАД 166D

20 До розчину сполуки Прикладу 166C (80 мг), (Е)-стирилборонової кислоти (76 мг), фториду цезію (120 мг) у діоксані-метанолі (0,4 мл-0,1 мл) додавали ацетат паладію (5,7 мг) і (2-біфеніл)дициклогексилфосфін (18 мг). Одержану суміш нагрівали при температурі кипіння зі зворотним холодильником протягом ночі, обробляли водним розчином гідроксиду літію (0,5 мл, 2н), нагрівали при температурі кипіння зі зворотним холодильником протягом 5 годин і концентрували. Залишок розбавляли етилацетатом і насиченим розчином ацетату амонію, і шари розділяли. Водний шар екстрагували етилацетатом (×2) і об'єднані органічні шари промивали насиченим сольовим розчином, сушили над MgSO₄, фільтрували і концентрували. Залишок очищали флеш-хроматографією (0-20 % етилацетату у гексані) з одержанням зазначеної у заголовку сполуки. ¹H ЯМР (500 МГц, DMSO-d₆) δ 12,88 (шир, 1H), 11,18 (с, 1H), 7,76 (м, 3H), 7,69 (д, 1H), 7,53 (д, 1H), 7,41 (м, 3H), 7,34 (д, 2H), 7,27 (м, 3H), 7,08 (д, 1H), 2,08 (с, 3H).

ПРИКЛАД 167

35 7-(2-метилфеніл)-4-(1-нафтил)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, DMSO-d₆) δ 11,32 (с, 1H), 8,04 (т, 2H), 7,71 (д, 1H), 7,66 (м, 1H), 7,61 (м, 1H), 7,56 (м, 1H), 7,46 (м, 1H), 7,34 (м, 4H), 7,22 (м, 2H), 6,60 (д, 1H), 2,18 (с, 3H).

ПРИКЛАД 168

40 7-(2-метилфеніл)-4-(2-нафтил)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, DMSO-d₆) δ 12,93 (шир, 1H), 11,35 (с, 1H), 8,25 (с, 1H), 8,08 (м, 2H), 8,00 (м, 1H), 7,90 (дд, 1H), 7,57 (м, 2H), 7,36 (м, 3H), 7,31 (м, 3H), 7,19 (д, 1H), 2,13 (с, 3H).

ПРИКЛАД 169

7-(2-метилфеніл)-4-(3-(2-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

ПРИКЛАД 169A

45 До розчину 2-(алілокси)нафталіну (71 мг) у тетрагідрофурані при кімнатній температурі додавали 9-борабіцикло(3,3,1)нонан (0,5 М, 1,5 мл). Розчин перемішували при 50°C протягом 2 годин і охолоджували до кімнатної температури. Додавали сполуку Прикладу 166C (100 мг), ацетат паладію (7,2 мг), (2-біфеніл)дициклогексилфосфін (22 мг) і фторид калію (56 мг), і одержану суміш нагрівали при температурі кипіння зі зворотним холодильником протягом ночі. Реакційну суміш розбавляли етилацетатом і насиченим розчином хлориду амонію і шари розділяли. Водний шар екстрагували етилацетатом (×2) і об'єднані органічні шари промивали насиченим сольовим розчином, сушили над MgSO₄, фільтрували і концентрували. Залишок очищали флеш-хроматографією (20 % етилацетату у гексані) з одержанням зазначеної у заголовку сполуки.

ПРИКЛАД 169B

55 До розчину сполуки Прикладу 169A (45 мг) у діоксані (1,0 мл) додавали водний розчин гідроксиду літію (2 н, 0,15 мл). Одержану суміш нагрівали при 60°C протягом ночі і розбавляли етилацетатом і насиченим розчином хлориду амонію. Шари розділяли і водний шар екстрагували етилацетатом (×2). Об'єднані органічні шари сушили над MgSO₄, фільтрували і концентрували. Залишок очищали флеш-хроматографією (0-5 % метанолу у дихлорметані) з одержанням зазначеної у заголовку сполуки.

одержанням зазначеної у заголовку сполуки. ^1H ЯМР(400 МГц, DMCO-d_6) δ 12,82 (шир, 1H), 11,10 (с, 1H), 7,83 (д, 2H), 7,78 (д, 1H), 7,45 (м, 1H), 7,35 (м, 1H), 7,31 (м, 4H), 7,27 (м, 1H), 7,22 (м, 2H), 7,02 (м, 1H), 6,97 (м, 1H), 4,20 (т, 2H), 3,12 (т, 2H), 2,24 (м, 2H), 2,05 (с, 3H).

ПРИКЛАД 170

- 5 7-(2-метилфеніл)-4-(4-(1-нафтилокси)бутил)-1H-індол-2-карбонова кислота
 ^1H ЯМР (500 МГц, DMCO-d_6) δ 12,81 (шир, 1H), 11,02 (с, 1H), 8,14 (д, 1H), 7,85 (д, 1H), 7,49 (м, 3H), 7,40 (м, 1H), 7,31 (м, 3H), 7,26 (м, 1H), 7,21 (м, 1H), 7,01 (м, 1H), 6,96 (м, 2H), 4,21 (т, 2H), 3,04 (т, 2H), 2,05 (с, 3H), 2,00 (м, 4H).

ПРИКЛАД 171

- 10 7-(2-метилфеніл)-4-(4-(2-нафтилокси)бутил)-1H-індол-2-карбонова кислота
 ^1H ЯМР (500 МГц, DMCO-d_6) δ 12,81 (шир, 1H), 11,01 (с, 1H), 7,80 (м, 3H), 7,44 (м, 1H), 7,31 (м, 5H), 7,25 (м, 1H), 7,20 (м, 1H), 7,17 (дд, 1H), 7,00 (м, 1H), 6,96 (м, 1H), 4,16 (т, 2H), 3,00 (т, 2H), 2,05 (с, 3H), 1,91 (м, 4H).

ПРИКЛАД 172

- 15 7-(2-метилфеніл)-4-(2-(2-нафтил)етил)-1H-індол-2-карбонова кислота
 ^1H ЯМР (500 МГц, DMCO-d_6) δ 12,83 (шир, 1H), 11,05 (с, 1H), 7,86 (м, 3H), 7,80 (с, 1H), 7,53 (дд, 1H), 7,46 (м, 2H), 7,37 (д, 1H), 7,31 (д, 2H), 7,26 (м, 1H), 7,21 (м, 1H), 7,01 (м, 1H), 6,95 (д, 1H), 3,29 (м, 2H), 3,19 (м, 2H), 2,06 (с, 3H).

ПРИКЛАД 173

- 20 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-тієн-3-іл-1H-індол-2-карбонова кислота
 ^1H ЯМР (500 МГц, DMCO-d_6): δ 13,07 (шир, 1H), 10,23 (с, 1H), 8,22-8,24 (м, 1H), 7,93 (дд, $J=2,9$, 1,37 Гц, 1H), 7,85-7,87 (м, 1H), 7,72 (дд, $J=4,88$, 2,75 Гц, 1H), 7,67 (д, $J=7,93$ Гц, 1H), 7,79-7,55 (м, 3H), 7,44-7,46 (м, 1H), 7,36-7,40 (м, 2H), 7,05-7,08 (м, 1H), 6,89 (д, $J=7,02$ Гц, 1H), 4,18 (т, $J=6,1$ Гц, 2H), 3,75-3,78 (м, 2H), 2,21-2,26 (м, 2H).

- 25 ПРИКЛАД 174

7-((3-(амінокарбоніл)феніл)аміно)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота
 ^1H ЯМР (500 МГц, DMCO-d_6): δ 13,07 (шир, 1H), 11,22 (с, 1H), 10,23 (с, 1H), 8,20-8,24 (м, 2H), 7,92 (с, 1H), 7,85-7,87 (м, 1H), 7,68 (с, 1H), 7,49-7,54 (м, 2H), 7,44-7,46 (м, 1H), 7,30-7,40 (м, 5H), 7,23 (д, $J=8,24$ Гц, 1H), 7,13 (д, $J=7,63$ Гц, 1H), 6,88-6,93 (м, 2H), 4,18 (т, $J=5,95$ Гц, 2H), 3,31 (м, 2H), 2,19-2,25 (м, 2H).

ПРИКЛАД 175

7-((3-ціанофеніл)аміно)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

ПРИКЛАД 175A

етил 7-(3-ціанофеніламіно)-3-(3-(нафталін-1-ілокси)пропіл)-1H-індол-2-карбоксилат

- 35 Суміш етил 7-бром-3-(3-(нафталін-1-ілокси)пропіл)-1H-індол-2-карбоксилату (ПРИКЛАД 1C) (45,2 мг), 3-амінобензонітрилу (14,2 мг), 2'-(дициклогексилфосфіно)-N, N-диметилбіфеніл-2-аміну (Су-тар) (5,9 мг), трис(дибензиліденацетон)дипаладію(0) (4,6 мг) і Cs_2CO_3 (46 мг) у діоксані (1 мл) дегазували шляхом повторення три рази циклу вакуум-азот. Реакційну суміш нагрівали при 100°C протягом 16 годин. Реакційну суміш розподіляли між водою і етилацетатом. Органічний шар відділяли і водний шар екстрагували додатковою кількістю етилацетату. Об'єднані органічні шари промивали насиченим сольовим розчином, сушили над MgSO_4 , фільтрували і концентрували у вакуумі. Залишок очищали за допомогою флеш-хроматографії (1:9 EtOAc/Hex) з одержанням зазначеної у заголовку сполуки.

ПРИКЛАД 175B

- 45 7-((3-ціанофеніл)аміно)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота
 Сполуку Прикладу 175A (28 мг) обробляли за допомогою діоксану (3 мл) і 1,0 н розчину LiOH (1 мл). Реакційну суміш нагрівали при 100°C протягом 3 годин. Розчинники видаляли у вакуумі і залишок очищали за допомогою 3Ф-ВЕРХ з одержанням чистих сполук прикладу 175B і прикладу 174. ^1H ЯМР (500 МГц, DMCO-d_6): δ 13,12 (с, 1H), 11,21 (с, 1H), 8,33 (с, 1H), 8,20-8,22 (м, 1H), 7,85-7,87 (м, 1H), 7,49-7,54 (м, 2H), 7,37-7,46 (м, 5H), 7,32 (д, $J=7,93$ Гц, 1H), 7,23-7,25 (м, 1H), 7,17 (д, $J=7,32$ Гц, 1H), 6,95 (т, $J=7,78$ Гц, 1H), 6,88 (д, $J=7,63$ Гц, 1H), 4,18 (т, $J=6,1$ Гц, 2H), 3,31 (м, 2H), 2,20-2,24 (м, 2H).

ПРИКЛАД 176

- 55 7-((2-бензилфеніл)аміно)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота
 ^1H ЯМР(500 МГц, DMCO-d_6): δ 13,01 (с, 1H), 11,31 (с, 1H), 8,21-8,23 (м, 1H), 7,84-7,86 (м, 1H), 7,36-7,54 (м, 5H), 7,07-7,29 (м, 9H), 6,96-7,00 (м, 1H), 6,89 (д, $J=7,36$ Гц, 1H), 6,79 (т, $J=7,83$ Гц, 1H), 6,57 (д, $J=7,67$ Гц, 1H), 4,19 (т, $J=6,14$ Гц, 2H), 4,05 (с, 2H), 3,31 (м, 2H), 2,20-2,25 (м, 2H).

ПРИКЛАД 177

7-(1,1'-біфеніл-2-іламіно)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 12,93 (с, 1H), 11,28 (с, 1H), 8,21-8,24 (м, 1H), 7,28-7,55 (м, 13H), 7,12-7,16 (м, 1H), 6,89 (д, J=7,36 Гц, 1H), 7,01 (д, J=7,61 Гц, 1H), 6,89 (д, J=6,75 Гц, 1H), 6,81 (т, J=7,67 Гц, 1H), 6,74-6,76 (м, 1H), 4,18 (т, J=6,14 Гц, 2H), 3,31 (м, 2H), 2,17-2,24 (м, 2H).

ПРИКЛАД 178

5 7-((2-етилфеніл)аміно)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 13,04 (с, 1H), 11,36 (с, 1H), 8,22-8,24 (м, 1H), 7,85-7,88 (м, 1H), 7,15-7,54 (м, 8H), 7,02-7,09 (м, 2H), 6,89 (д, J=7,63 Гц, 1H), 6,78 (т, J=7,78 Гц, 1H), 6,50 (д, J=7,32 Гц, 1H), 4,19 (т, J=5,95 Гц, 2H), 3,31 (м, 2H), 2,68 (кв, J=7,53 Гц, 2H), 2,19-2,25 (м, 2H), 1,15 (т, J=7,48 Гц, 3H).

10 ПРИКЛАД 179

3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-((2-пропілфеніл)аміно)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 13,03 (с, 1H), 11,36 (с, 1H), 8,22-8,24 (м, 1H), 7,85-7,87 (м, 1H), 7,50-7,54 (м, 2H), 7,44-7,46 (м, 1H), 7,39 (т, J=7,93 Гц, 1H), 7,33 (с, 1H), 7,23-7,27 (м, 1H), 7,16 (т, J=6,87 Гц, 1H), 7,08 (д, J=7,93 Гц, 1H), 7,02 (т, J=7,02 Гц, 1H), 6,89 (д, J=7,63 Гц, 1H), 6,77 (т, J=7,78 Гц, 1H), 6,50 (д, J=7,32 Гц, 1H), 4,19 (т, J=6,1 Гц, 2H), 3,31 (м, 2H), 2,63-2,66 (м, 2H), 2,19-2,25 (м, 2H), 1,55-1,59 (м, 2H), 0,88 (т, J=7,32 Гц, 3H).

ПРИКЛАД 180

7-(5-карбокси-3-метилтієн-2-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

20 ¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 13,01 (с, 1H), 11,02 (с, 1H), 8,22-8,24 (м, 1H), 7,86-7,88 (м, 1H), 7,77 (д, J=7,93 Гц, 1H), 7,65 (с, 1H), 7,45-7,53 (м, 1H), 7,39 (т, J=7,78 Гц, 1H), 7,21 (д, J=6,81 Гц, 1H), 7,08 (т, J=7,63 Гц, 1H), 6,90 (д, J=7,63 Гц, 1H), 4,20 (т, J=6,1 Гц, 2H), 3,34-3,38 (м, 2H), 2,21-2,26 (м, 2H).

ПРИКЛАД 181

7-((2-карбоксифеніл)аміно)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

25 ¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 12,89 (с, 1H), 11,57 (с, 1H), 9,22 (с, 1H), 8,22-8,24 (м, 1H), 7,90-7,91 (м, 1H), 7,85-7,87 (м, 1H), 7,50-7,54 (м, 2H), 7,44-7,46 (м, 2H), 7,38 (т, J=7,93 Гц, 1H), 7,29-7,32 (м, 1H), 7,14 (д, J=7,32 Гц, 1H), 6,93-6,97 (м, 2H), 6,89 (д, J=7,63 Гц, 1H), 6,76 (т, J=7,32 Гц, 1H), 4,18 (т, J=5,95 Гц, 2H), 3,34-3,38 (м, 2H), 2,21-2,25 (м, 2H).

ПРИКЛАД 182

7-((3-карбоксифеніл)аміно)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

30 ¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 12,99 (с, 1H), 11,22 (с, 1H), 8,26 (с, 1H), 8,22-8,23 (м, 1H), 7,85-7,87 (м, 1H), 7,76 (с, 1H), 7,49-7,54 (м, 2H), 7,37-7,46 (м, 5H), 7,26 (д, J=8,06 Гц, 1H), 7,14 (д, J=7,33 Гц, 1H), 6,94 (т, J=7,69 Гц, 1H), 4,18 (т, J=5,95 Гц, 2H), 3,34-3,38 (м, 2H), 2,21-2,25 (м, 2H).

ПРИКЛАД 183

35 7-(2-морфолін-4-іл-5-нітропіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

40 ¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 13,03 (с, 1H), 11,27 (с, 1H), 9,09 (д, J=2,76 Гц, 1H), 8,22-8,24 (м, 1H), 8,16 (д, J=2,76 Гц, 1H), 7,85-7,87 (м, 1H), 7,77 (д, J=7,98 Гц, 1H), 7,44-7,55 (м, 3H), 7,37 (т, J=7,98 Гц, 1H), 7,30 (д, J=7,06 Гц, 1H), 7,09 (т, J=7,67 Гц, 1H), 6,86 (д, J=7,36 Гц, 1H), 4,17 (т, J=6,14 Гц, 2H), 3,05-3,35 (м, 10H), 2,23-2,26 (м, 2H).

ПРИКЛАД 184

7-(5-аміно-2-морфолін-4-ілпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

45 ¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 10,96 (с, 1H), 8,23-8,25 (м, 1H), 7,86-7,88 (м, 1H), 7,79 (д, J=7,93 Гц, 1H), 7,75 (с, 1H), 7,49-7,55 (м, 2H), 7,43-7,46 (м, 2H), 7,37 (т, J=7,93 Гц, 1H), 7,30 (д, J=7,32 Гц, 1H), 7,10-7,13 (м, 1H), 6,86 (д, J=7,32 Гц, 1H), 4,17 (т, J=6,14 Гц, 2H), 3,05-3,35 (м, 10H), 2,23-2,26 (м, 2H).

ПРИКЛАД 185

7-((3-хлорпіридин-4-іл)аміно)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

50 ¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 13,20 (с, 1H), 11,72 (с, 1H), 9,77 (с, 1H), 8,73 (с, 1H), 8,24-8,27 (м, 1H), 8,10 (д, J=6,71 Гц, 1H), 7,86-7,88 (м, 1H), 7,76 (д, J=7,93 Гц, 1H), 7,51-7,56 (м, 2H), 7,45-7,47 (м, 1H), 7,39 (т, J=7,93 Гц, 1H), 7,22 (д, J=7,32 Гц, 1H), 7,10 (т, J=7,78 Гц, 1H), 6,89 (д, J=7,32 Гц, 1H), 6,45 (д, J=6,71 Гц, 1H), 4,19 (т, J=6,1 Гц, 2H), 3,36-3,39 (м, 2H), 2,23-2,25 (м, 2H).

ПРИКЛАД 186

55 7-((2-ізопропілфеніл)аміно)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 12,99 (с, 1H), 11,32 (с, 1H), 8,21-8,23 (м, 1H), 7,85-7,87 (м, 1H), 7,37-7,52 (м, 6H), 7,03-7,22 (м, 4H), 6,89 (д, J=7,36 Гц, 1H), 6,75 (т, J=7,83 Гц, 1H), 6,35 (д, J=7,67 Гц, 1H), 4,19 (т, J=6,1 Гц, 2H), 3,29-3,35 (м, 2H), 2,23-2,25 (м, 3H), 1,17 (д, J=6,44 Гц, 6H).

ПРИКЛАД 187

60 7-(2-морфолін-4-ілпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 13,16 (с, 1H), 11,02 (с, 1H), 8,31 (дд, J=5,19, 1,83 Гц, 1H), 8,23-8,25 (м, 1H), 7,86-7,89 (м, 2H), 7,78 (д, J=7,93 Гц, 1H), 7,49-7,55 (м, 2H), 7,44-7,46 (м, 1H), 7,38 (д, J=7,93 Гц, 1H), 7,35 (т, J=7,32 Гц, 1H), 7,18-7,20 (м, 1H), 7,11-7,14 (м, 1H), 6,86 (д, J=7,63 Гц, 1H), 4,17 (т, J=6,1 Гц, 2H), 3,39 (т, J=7,32 Гц, 2H), 3,2 (шир, 4H), 2,97 (шир, 4H), 2,21-2,27 (м, 2H).

5 ПРИКЛАД 188

7-(5-(амінокарбоніл)-1,2-диметил-6-оксо-1,6-дигідропіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 13,03 (с, 1H), 11,18 (с, 1H), 9,21(д, J=4,58 Гц, 1H), 8,22-8,24 (м, 1H), 8,06 (с, 1H), 7,86-7,88 (м, 1H), 7,72-7,74 (м, 1H), 7,49-7,55 (м, 4H), 7,44-7,46 (м, 1H), 7,69 (т, J=7,93 Гц, 1H), 7,06-7,10 (м, 2H), 6,90 (д, J=7,32 Гц, 1H), 4,20 (т, J=6,1 Гц, 2H), 3,63 (с, 3H), 3,32-3,37 (м, 2H), 2,21-2,26 (м, 2H), 2,17 (с, 3H).

ПРИКЛАД 189

7-(5-ціано-1,2-диметил-6-оксо-1,6-дигідропіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

15 ¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 13,07 (с, 1H), 11,23 (с, 1H), 8,22-8,24 (м, 1H), 7,93 (с, 1H), 7,86-7,88 (м, 1H), 7,74 (дд, J=7,02, 2,14 Гц, 1H), 7,49-7,55 (м, 2H), 7,44-7,46 (м, 1H), 7,39 (т, J=7,39 Гц, 1H), 7,06-7,10 (м, 2H), 6,89 (д, J=7,32 Гц, 1H), 4,19 (т, J=6,1 Гц, 2H), 3,56 (с, 3H), 3,32-3,37 (м, 2H), 2,21-2,26 (м, 2H), 2,13 (с, 3H).

ПРИКЛАД 190

20 7-(5-аміно-4-хлор-2-морфолін-4-ілпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 13,07 (с, 1H), 10,65 (с, 1H), 8,24 (д, J=7,63 Гц, 1H), 7,86 (д, J=7,32 Гц, 1H), 7,74 (д, J=7,93 Гц, 1H), 7,49-7,54 (м, 2H), 7,45 (д, J=8,24 Гц, 1H), 7,37 (т, J=7,93 Гц, 1H), 7,28 (д, J=7,02 Гц, 1H), 7,25 (с, 1H), 7,09 (т, J=7,48 Гц, 1H), 6,86 (д, J=7,63 Гц, 1H), 4,17 (т, J=6,1 Гц, 2H), 3,39 (т, J=7,32 Гц, 2H), 3,24 (шир, 4H), 2,75 (шир, 4H), 2,23-2,25 (м, 2H).

ПРИКЛАД 191

2-метил-3'-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-2,3-дигідро-1'H-1,7'-бііндол-2'-карбонова кислота

30 ¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 13,01 (с, 1H), 10,89 (с, 1H), 8,25-8,27 (м, 1H), 7,86-7,88 (м, 1H), 7,58 (д, J=7,93 Гц, 1H), 7,50-7,55 (м, 2H), 7,45-7,47 (м, 1H), 7,39 (т, J=7,93 Гц, 1H), 7,17 (д, J=7,02 Гц, 1H), 7,12 (д, J=7,02 Гц, 1H), 7,05 (т, J=7,78 Гц, 1H), 6,91 (д, J=7,63 Гц, 1H), 6,86 (т, J=7,63 Гц, 1H), 6,60 (т, J=7,32 Гц, 1H), 5,97 (д, J=7,93 Гц, 1H), 4,51-4,54 (м, 1H), 4,21 (т, J=6,1 Гц, 2H), 3,38 (т, J=7,32 Гц, 2H), 2,79 (дд, J=15,1, 8,09 Гц, 1H), 2,21-2,27 (м, 2H).

ПРИКЛАД 192

7-(2-фтор-5-метилпіридин-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

35 ПРИКЛАД 192A

метил 7-(2-фтор-5-метилпіридин-4-іл)-3-(3-(нафталін-1-ілокси)пропіл)-1H-індол-2-карбоксилат

40 Суміш сполуки Прикладу 43A (0,40 г), 2-фтор-4-йод-5-метилпіридину (0,209 г), тетракіс(трифенілфосфін)паладію (46 мг) і фториду цезію (0,365 г) у диметоксітані (3 мл) і метанолі (1,5 мл) нагрівали при 120°C протягом 20 хвилин в умовах мікрохвильового опромінення (CEM Discovery). Після охолодження до кімнатної температури, реакційну суміш завантажували на катридж з силікагелем. Катридж сушили у вакуумній печі протягом 1 години і елюювали сумішшю 1:4 етилацетат/гексан з одержанням бажаного продукту. ¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): 11,33 (с, 1H), 8,23-8,25 (м, 1H), 8,17 (с, 1H), 7,86-7,88 (м, 1H), 7,79-7,81 (м, 1H), 7,45-7,56 (м, 3H), 7,39 (т, J=7,93 Гц, 1H), 7,12-7,14 (м, 2H), 7,04 (д, J=2,14 Гц, 1H), 6,91 (д, J=7,32 Гц, 1H), 4,20 (т, J=5,95 Гц, 2H), 3,78 (с, 3H), 3,37 (т, J=7,48 Гц, 2H), 2,20-2,26 (м, 2H), 2,00 (с, 3H).

ПРИКЛАД 192B

7-(2-фтор-5-метилпіридин-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

50 Зазначену у заголовку сполуку синтезували відповідно до процедури Прикладу 175B, заміщуючи сполуку Прикладу 175A Сполукою Прикладу 192A. ¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): 13,00 (с, 1H), 11,21 (с, 1H), 8,23-8,25 (м, 1H), 8,16 (с, 1H), 7,86-7,88 (м, 1H), 7,76-7,79 (м, 1H), 7,50-7,55 (м, 2H), 7,45-7,47 (м, 1H), 7,39 (т, J=7,93 Гц, 1H), 7,09-7,11 (м, 2H), 7,03 (д, J=1,83 Гц, 1H), 6,90 (д, J=7,63 Гц, 1H), 4,20 (т, J=6,1 Гц, 2H), 3,37 (т, J=7,32 Гц, 2H), 2,21-2,27 (м, 2H).

ПРИКЛАД 193

55 7-((2-метоксипіридин-3-іл)аміно)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 13,04 (шир, 1H), 11,58 (с, 1H), 8,22-8,24 (м, 1H), 7,85-7,87 (м, 1H), 7,70 (дд, J=4,88, 1,53 Гц, 1H), 7,50-7,55 (м, 3H), 7,44-7,46 (м, 1H), 7,38 (т, J=7,93 Гц, 1H), 7,23 (д, J=7,93 Гц, 1H), 6,94 (д, J=7,02 Гц, 1H), 6,68-6,91 (м, 3H), 4,18 (т, J=6,1 Гц, 2H), 3,98 (с, 3H), 3,33 (т, J=7,32 Гц, 2H), 2,19-2,24 (м, 2H).

60 ПРИКЛАД 194

7-(5-метил-2-оксо-1,2-дигідропіридин-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

Сполуку Прикладу 192 (50 мг) в оцтовій кислоті (10 мл) і воді (1 мл) нагрівали при 100°C протягом 16 годин. Розчинники видаляли і залишок очищали за допомогою зворотно-фазової(3Ф) ВЕРХ з одержанням зазначеної у заголовку сполуки. ¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 13,04 (шир, 1H), 11,73 (шир, 1H), 11,16 (с, 1H), 8,23-8,25 (м, 1H), 7,86-7,88 (м, 1H), 7,72 (д, J=6,1 Гц, 1H), 7,50-7,55 (м, 2H), 7,45-7,46 (м, 1H), 7,39 (т, J=7,93 Гц, 1H), 7,32 (с, 1H), 7,04-7,08 (м, 2H), 6,90 (д, J=7,32 Гц, 1H), 6,24 (с, 1H), 4,20 (т, J=5,95 Гц, 2H), 3,36 (т, J=7,32 Гц, 2H), 2,20-2,25 (м, 2H), 1,71 (с, 3H).

ПРИКЛАД 195

7-(5-метил-2-(2-піролідін-1-ілетокси)піридин-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

2-(Піролідін-1-іл)етанол (36,9 мг) у діоксані (2 мл) у 4-мл флаконі обробляли за допомогою 60 % NaN (12,8 мг) при кімнатній температурі. Після того як виділення бульбашок припинялося, до розчину додавали сполуку Прикладу 192 (50 мг). Флакон закривали кришкою і нагрівали при 105°C протягом 3 годин. Розчинник видаляли і залишок очищали за допомогою 3Ф-ВЕРХ з одержанням зазначеної у заголовку сполуки. ¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 11,00 (с, 1H), 11,16 (с, 1H), 9,78 (с, 1H), 8,23-8,25 (м, 1H), 8,12 (с, 1H), 7,86-7,88 (м, 1H), 7,76 (д, J=7,32 Гц, 1H), 7,50-7,55 (м, 2H), 7,45-7,47 (м, 1H), 7,39 (т, J=7,93 Гц, 1H), 7,06-7,12 (м, 2H), 6,90 (д, J=7,63 Гц, 1H), 6,76 (с, 1H), 4,58 (с, 2H), 4,20 (т, J=5,95 Гц, 2H), 3,60-3,61 (м, 4H), 3,36 (т, J=7,32 Гц, 2H), 3,13 (шир, 2H), 2,20-2,25 (м, 2H), 1,97-2,01 (м, 5H), 1,87-1,91 (м, 2H).

ПРИКЛАД 196

7-(2-(диметиламіно)-5-нітропіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 13,07 (с, 1H), 11,00 (с, 1H), 11,32 (с, 1H), 9,04 (д, J=2,44 Гц, 1H), 8,21-8,23 (м, 1H), 8,00 (д, J=2,75 Гц, 1H), 7,86-7,87 (м, 1H), 7,74 (д, J=7,63 Гц, 1H), 7,49-7,55 (м, 2H), 7,44-7,46 (м, 1H), 7,38 (т, J=7,78 Гц, 1H), 7,11-7,13 (м, 1H), 7,04-7,08 (м, 1H), 6,88 (д, J=7,63 Гц, 1H), 4,19 (т, J=5,95 Гц, 2H), 3,36 (т, J=7,32 Гц, 2H), 2,75 (с, 6H), 2,21-2,27 (м, 2H).

ПРИКЛАД 197

7-(2-(2-(диметиламіно)етокси)-5-метилпіридин-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 12,93 (шир, 1H), 11,01 (с, 1H), 9,69 (с, 1H), 8,23-8,25 (м, 1H), 8,12 (с, 1H), 7,86-7,88 (м, 1H), 7,76 (д, J=7,32 Гц, 1H), 7,45-7,55 (м, 3H), 7,39 (т, J=7,93 Гц, 1H), 7,06-7,12 (м, 2H), 6,90 (д, J=7,63 Гц, 1H), 6,74 (с, 1H), 4,60 (шир, 2H), 4,20 (т, J=6,1 Гц, 2H), 3,60 (шир, 2H), 3,36 (т, J=7,32 Гц, 2H), 2,88 (с, 6H), 2,21-2,26 (м, 2H), 1,97 (с, 3H).

ПРИКЛАД 198

7-(5-метил-2-(2-морфолін-4-ілетокси)піридин-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 11,00 (с, 1H), 10,24 (с, 1H), 8,24-8,26 (м, 1H), 8,13 (с, 1H), 7,86-7,88 (м, 1H), 7,76 (д, J=6,71 Гц, 1H), 7,45-7,55 (м, 3H), 7,39 (т, J=7,93 Гц, 1H), 7,06-7,12 (м, 2H), 6,90 (д, J=7,32 Гц, 1H), 6,77 (с, 1H), 4,64 (шир, 2H), 4,20 (т, J=6,1 Гц, 2H), 3,97 (шир, 2H), 3,72 (шир, 2H), 3,60 (т, J=4,88 Гц, 2H), 3,60 (шир, 2H), 3,37 (т, J=7,32 Гц, 2H), 3,22 (шир, 2H), 2,21-2,26 (м, 2H), 1,98 (с, 3H).

ПРИКЛАД 199

7-(2-(1,4-діокса-8-азаспіро(4,5)дец-8-ил)-5-нітропіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 13,02 (с, 1H), 11,25 (с, 1H), 9,07 (д, J=2,75 Гц, 1H), 8,22-8,24 (м, 1H), 8,13 (д, J=2,75 Гц, 1H), 7,85-7,87 (м, 1H), 7,76 (д, J=7,93 Гц, 1H), 7,44-7,54 (м, 3H), 7,37 (т, J=7,78 Гц, 1H), 7,29 (д, J=7,32 Гц, 1H), 7,09-7,12 (м, 1H), 6,85 (д, J=7,32 Гц, 1H), 4,17 (т, J=6,1 Гц, 2H), 3,72 (с, 4H), 3,37 (м, 2H), 3,14 (шир, 2H), 2,21-2,26 (м, 2H), 1,35 (шир, 2H), 1,10 (шир, 2H).

ПРИКЛАД 200

3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(5-нітро-2-(4-оксопіперидин-1-іл)піридин-3-іл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 11,39 (с, 1H), 9,12 (д, J=2,75 Гц, 1H), 8,22-8,24 (м, 1H), 8,17 (д, J=2,75 Гц, 1H), 7,85-7,87 (м, 1H), 7,78 (д, J=7,93 Гц, 1H), 7,44-7,54 (м, 3H), 7,37 (т, J=7,93 Гц, 1H), 7,31 (д, J=6,41 Гц, 1H), 7,09-7,12 (м, 1H), 6,86 (д, J=7,32 Гц, 1H), 4,17 (т, J=6,1 Гц, 2H), 3,61 (шир, 2H), 3,37 (м, 2H), 2,17-2,26 (м, 4H), 1,93 (шир, 2H).

ПРИКЛАД 201

7-(5-аміно-2-(диметиламіно)піридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 11,15 (шир, 1H), 8,24-8,26 (м, 1H), 7,86-7,88 (м, 1H), 7,78 (д, J=7,93 Гц, 1H), 7,44-7,54 (м, 3H), 7,38 (т, J=7,93 Гц, 1H), 7,22 (д, J=7,02 Гц, 1H), 7,08-7,12 (м 1H), 6,88 (д, J=7,02 Гц, 1H), 4,18 (т, J=6,1 Гц, 2H), 3,37 (м, 2H), 2,57 (шир, 6H), 2,21-2,27 (м, 2H).

ПРИКЛАД 202

5 7-(2-(4-гідроксипіридин-1-іл)-5-нітропіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 13,00 (с, 1H), 11,19 (шир, 1H), 9,05 (д, J=2,44 Гц, 1H), 8,23-8,25 (м, 1H), 8,09 (д, J=2,45 Гц, 1H), 7,86-7,88 (м, 1H), 7,75 (д, J=7,93 Гц, 1H), 7,44-7,54 (м, 3H), 7,37 (т, J=7,78 Гц, 1H), 7,25 (д, J=6,41 Гц, 1H), 7,06-7,10 (м 1H), 6,86 (д, J=7,32 Гц, 1H), 4,17 (т, J=6,1 Гц, 2H), 3,75 (шир, 6H), 3,49-3,52 (м, 1H), 3,40 (шир, 2H) 2,90 (шир, 2H), 2,21-2,27 (м, 2H).

ПРИКЛАД 203

7-(6-метокси-4-метилпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

15 ¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 11,05 (с, 1H), 8,24-8,26 (м, 1H), 7,94 (д, J=2,45 Гц, 1H), 7,86-7,88 (м, 1H), 7,71 (д, J=7,63 Гц, 1H), 7,45-7,55 (м, 3H), 7,39 (т, J=7,93 Гц, 1H), 7,03-7,09 (м, 2H), 6,91 (д, J=7,63 Гц, 1H), 6,80 (с, 1H), 4,20 (т, J=6,1 Гц, 2H), 3,90 (с, 3H), 3,35 (м, 2H), 2,21-2,27 (м, 2H), 2,00 (с, 3H).

ПРИКЛАД 204

7-(2-фтор-5-метилпіридин-4-іл)-1-(2-морфолін-4-ілетил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

20 ¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 8,22-8,24 (м, 1H), 7,87-7,91 (м, 2H), 7,46-7,56 (м, 3H), 7,39-7,42 (м, 2H), 7,19-7,22 (м, 1H), 7,08 (д, J=6,41 Гц, 1H), 6,91 (д, J=7,32 Гц, 1H), 4,77 (шир, 1H), 4,23 (т, J=5,95 Гц, 2H), 3,91 (шир, 1H), 3,36-3,39 (м, 2H), 2,80 (шир, 4H), 2,20-2,26 (м, 2H), 1,94 (с, 3H).

ПРИКЛАД 205

3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(1,3,5-триметил-1H-піразол-4-іл)-1H-індол-2-карбонова кислота

25 ¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 10,56 (с, 1H), 8,24-8,26 (м, 1H), 7,86-7,88 (м, 1H), 7,66 (д, J=7,32 Гц, 1H), 7,46-7,55 (м, 3H), 7,39 (т, J=7,93 Гц, 1H), 7,02-7,07 (м, 2H), 6,91 (д, J=7,32 Гц, 1H), 4,21 (т, J=6,1 Гц, 2H), 3,75 (с, 3H), 3,34-3,37 (м, 2H), 2,21-2,26 (м, 2H), 2,05 (с, 3H), 2,01 (с, 3H).

ПРИКЛАД 206

7-((2-морфолін-4-ілпіридин-3-іл)аміно)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

30 ¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 13,05 (шир, 1H), 11,14 (с, 1H), 8,22-8,24 (м, 1H), 7,92 (д, J=3,66 Гц, 1H), 7,86-7,87 (м, 1H), 7,44-7,56 (м, 5H), 7,38 (т, J=7,93 Гц, 1H), 7,24 (д, J=7,93 Гц, 1H), 7,00 (дд, J=7,78, 5,03 Гц, 1H), 6,85-6,88 (м, 2H), 6,74 (д, J=7,32 Гц, 1H), 4,18 (т, J=5,95 Гц, 2H), 3,63-3,64 (м, 4H), 3,33 (т, J=7,32 Гц, 2H), 3,23 (м, 4H), 2,20-2,24 (м, 2H).

ПРИКЛАД 207

7-(5-метил-2-(2-фенілетокси)піридин-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

40 ¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 10,98 (с, 1H), 8,17 (д, J=7,63 Гц, 1H), 8,02 (с, 1H), 7,90 (д, J=7,02 Гц, 1H), 7,67 (д, J=7,02 Гц, 1H), 7,22-7,47 (м, 8H), 7,15 (т, J=6,41 Гц, 1H), 6,98-7,03 (м, 2H), 6,83 (д, J=7,32 Гц, 1H), 6,59 (с, 1H), 4,42 (т, J=6,41 Гц, 2H), 4,13 (т, J=5,64 Гц, 2H), 3,28-3,31 (м, 2H), 2,99 (т, J=6,71 Гц, 2H), 2,20-2,24 (м, 2H), 1,86 (с, 3H).

ПРИКЛАД 208

7-(5-метил-2-(2-піридин-3-ілетокси)піридин-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

45 ¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 10,98 (с, 1H), 8,17 (д, J=7,63 Гц, 1H), 8,02 (с, 1H), 7,90 (д, J=7,02 Гц, 1H), 7,68 (д, J=7,02 Гц, 1H), 7,22-7,47 (м, 7H), 7,14 (т, J=6,41 Гц, 1H), 6,98-7,03 (м, 2H), 6,82 (д, J=7,32 Гц, 1H), 6,59 (с, 1H), 4,42 (т, J=6,41 Гц, 2H), 4,13 (т, J=5,64 Гц, 2H), 3,28-3,31 (м, 2H), 2,99 (т, J=6,71 Гц, 2H), 2,20-2,24 (м, 2H), 1,86 (с, 3H).

ПРИКЛАД 209

7-((2-морфолін-4-ілфеніл)аміно)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

50 ¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 11,50 (с, 1H), 8,17 (с, 1H), 7,79 (с, 1H), 6,75-7,45 (м, 12H), 4,41 (шир, 2H), 2,81 (шир, 4H), 2,44 (м, 5H), 2,15 (шир, 2H).

ПРИКЛАД 210

7-((4-карбоксипіридин-3-іл)аміно)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

55 ¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 13,53 (шир, 1H), 13,04 (шир, 1H), 11,68 (с, 1H), 8,87 (с, 1H), 8,23 (с, 1H), 8,20-8,22 (м, 1H), 8,00 (д, J=4,88 Гц, 1H), 7,85-7,87 (м, 1H), 7,69 (д, J=5,19 Гц, 1H), 7,44-7,54 (м, 4H), 7,38 (т, J=7,93 Гц, 1H), 7,17 (д, J=7,32 Гц, 1H), 6,98 (т, J=7,78 Гц, 1H), 6,89 (д, J=7,32 Гц, 1H), 4,19 (т, J=6,41 Гц, 2H), 3,34-3,37 (м, 2H), 2,20-2,25 (м, 2H).

ПРИКЛАД 211

3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-((4-(трифторметил)піридин-3-іл)аміно)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 13,11 (шир, 1H), 11,59 (с, 1H), 8,55 (с, 1H), 8,37 (д, J=5,19 Гц, 1H), 8,21-8,23 (м, 1H), 7,85-7,87 (м, 1H), 7,68 (д, J=5,19 Гц, 1H), 7,66 (с, 1H), 7,44-7,54 (м, 3H), 7,39 (т, J=7,93 Гц, 1H), 7,33 (д, J=7,93 Гц, 1H), 6,86-6,90 (м, 2H), 6,73 (д, J=7,32 Гц, 1H), 4,19 (т, J=6,1 Гц, 2H), 3,34-3,37 (м, 2H), 2,20-2,25 (м, 2H).

ПРИКЛАД 212

7-(2-(3-амінопропокси)-5-метилпіридин-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 11,01 (с, 1H), 8,23-8,25 (м, 1H), 8,08 (с, 1H), 7,86-7,88 (м, 1H), 7,74-7,76 (м, 4H), 7,45-7,55 (м, 3H), 7,39 (т, J=7,93 Гц, 1H), 7,05-7,11 (м, 2H), 6,90 (д, J=7,32 Гц, 1H), 6,68 (с, 1H), 4,35 (т, J=6,1 Гц, 2H), 4,20 (т, J=6,1 Гц, 2H), 3,37 (т, J=7,48 Гц, 2H), 2,94-3,01 (м, 2H), 2,52 (м, 2H), 2,20-2,26 (м, 2H), 2,00-2,06 (м, 2H), 1,95 (с, 3H).

ПРИКЛАД 213

7-(5-метил-2-(тетрагідрофуран-3-ілметокси)піридин-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 11,07 (с, 1H), 8,24 (д, J=7,32 Гц, 1H), 8,07 (с, 1H), 7,86-7,88 (м, 1H), 7,74 (д, J=7,32 Гц, 1H), 7,45-7,54 (м, 3H), 7,39 (т, J=7,78 Гц, 1H), 7,05-7,10 (м, 2H), 6,90 (д, J=7,32 Гц, 1H), 6,67 (с, 1H), 4,16-4,27 (м, 2H), 3,75-3,80 (м, 2H), 3,67 (кв, J=7,83 Гц, 1H), 3,55 (дд, J=8,54, 5,49 Гц, 1H), 3,36 (т, J=7,32 Гц, 2H), 2,67-2,71 (м, 1H), 2,21-2,26 (м, 2H), 1,99-2,04 (м, 1H), 1,93 (с, 3H), 1,64-1,70 (м, 1H).

ПРИКЛАД 214

7-(5-метил-2-(4-фенілбутоксипіридин-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 12,96 (с, 1H), 11,05 (с, 1H), 8,23-8,25 (м, 1H), 8,05 (с, 1H), 7,86-7,87 (м, 1H), 7,73 (д, J=7,02 Гц, 1H), 7,45-7,54 (м, 3H), 7,39 (т, J=7,93 Гц, 1H), 7,15-7,29 (м, 5H), 7,04-7,09 (м, 2H), 6,90 (д, J=7,63 Гц, 1H), 6,63 (с, 1H), 4,29 (т, J=5,95 Гц, 2H), 4,20 (т, J=5,95 Гц, 2H), 3,36 (т, J=7,32 Гц, 2H), 2,65 (д, J=6,87 Гц, 1H), 2,21-2,26 (м, 2H), 1,92 (с, 3H), 1,70-1,78 (м, 4H).

ПРИКЛАД 215

7-(2-(3-метоксифеніл)циклогекс-1-ен-1-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 12,92 (с, 1H), 10,74 (с, 1H), 8,23-8,25 (м, 1H), 7,85-7,87 (м, 1H), 7,48-7,54 (м, 2H), 7,36-7,45 (м, 3H), 6,78-6,89 (м, 4H), 6,61 (д, J=7,63 Гц, 1H), 6,58 (д, J=7,63 Гц, 1H), 6,44 (дд, J=8,24, 1,83 Гц, 1H), 4,11 (т, J=6,1 Гц, 2H), 3,34 (с, 3H), 3,25 (т, J=7,32 Гц, 2H), 2,23-2,45 (м, 4H), 2,11-2,17 (м, 2H), 1,86 (м, 4H).

ПРИКЛАД 216

7-(1-(карбоксиметил)-3,5-диметил-1H-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 12,98 (с, 1H), 10,32 (с, 1H), 8,24-8,26 (м, 1H), 7,86-7,88 (м, 1H), 7,66 (дд, J=7,32, 1,83 Гц, 1H), 7,45-7,55 (м, 3H), 7,39 (д, J=7,93 Гц, 1H), 7,05-7,09 (м, 2H), 6,91 (д, J=7,32 Гц, 1H), 4,88 (с, 2H), 4,21 (т, J=6,1 Гц, 2H), 3,34-3,37 (м, 2H), 2,21-2,26 (м, 2H), 2,03 (с, 3H), 2,01 (с, 3H).

ПРИКЛАД 217

7-(1-бензил-1H-імідазол-5-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 13,23 (с, 1H), 11,54 (с, 1H), 9,35 (с, 1H), 8,24-8,26 (м, 1H), 7,83-7,88 (м, 3H), 7,60-7,64 (м, 1H), 7,45-7,57 (м, 4H), 7,38 (д, J=7,93 Гц, 1H), 7,14-7,20 (м, 3H), 7,04-7,05 (м, 1H), 6,97-7,01 (м, 1H), 6,85-6,89 (м, 3H), 5,14 (с, 2H), 4,17 (т, J=6,1 Гц, 2H), 3,37 (т, J=7,32 Гц, 2H), 2,20-2,26 (м, 2H).

ПРИКЛАД 218

7-(2-(2-метилфеніл)циклогекс-1-ен-1-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 12,94 (с, 1H), 10,91 і 10,68 (с, 1H), 8,20-8,24 (м, 1H), 7,85-7,86 (м, 1H), 7,33-7,45 (м, 5H), 6,70-7,06 (м, 7H), 4,10-4,13 (м, 2H), 3,21-3,25 (м, 2H), 2,24-2,44 (м, 4H), 2,21-2,26 (м, 5H), 1,87 (шир, 4H).

ПРИКЛАД 219

7-(3,5-диметил-1-(2-морфолін-4-ілетил)-1H-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 12,98 (с, 1H), 10,46 (с, 1H), 8,24-8,26 (м, 1H), 7,86-7,88 (м, 1H), 7,67 (д, J=7,63 Гц, 1H), 7,45-7,55 (м, 3H), 7,39 (т, J=7,93 Гц, 1H), 7,08 (т, J=7,48 Гц, 1H), 7,03-7,04

(м, 1Н), 6,91 (д, J=7,63 Гц, 1Н), 4,42 (т, J=6,87 Гц, 2Н), 4,21 (т, J=6,1 Гц, 2Н), 3,87 (шир, 4Н), 3,61 (т, J=6,87 Гц, 2Н), 3,34-3,37 (м, 2Н), 2,21-2,26 (м, 2Н), 2,09 (с, 3Н), 2,04 (с, 3Н).

ПРИКЛАД 221

3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2-(4-нітрофеніл)циклогекс-1-ен-1-іл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹Н ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 11,04 (с, 1Н), 8,21-8,22 (м, 1Н), 7,81-7,85 (м, 3Н), 7,40-7,52 (м, 4Н), 7,32-7,35 (м, 1Н), 7,25 (д, J=8,85 Гц, 2Н), 6,81 (д, J=7,63 Гц, 2Н), 6,73-6,75 (м, 2Н), 4,08 (т, J=5,95 Гц, 2Н), 3,23 (шир, 2Н), 2,45 (шир, 2Н), 2,10-2,15 (м, 2Н), 1,87 (шир, 4Н).

ПРИКЛАД 222

7-(4,4-диметил-2-фенілциклогекс-1-ен-1-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹Н ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 12,97 (с, 1Н), 10,58 (с, 1Н), 8,22-8,24 (м, 1Н), 7,85-7,87 (м, 1Н), 7,35-7,54 (м, 5Н), 6,89-7,00 (м, 5Н), 6,84 (д, J=7,63 Гц, 2Н), 6,77 (д, J=4,27 Гц, 2Н), 4,11 (т, J=6,1 Гц, 2Н), 3,25 (т, J=7,32 Гц, 2Н), 2,37 (шир, 2Н), 2,25 (шир, 2Н), 2,12-2,17 (м, 2Н), 1,64 (шир, 2Н), 1,09 (с, 6Н).

ПРИКЛАД 223

1-етил-7-(етил(феніл)аміно)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

ПРИКЛАД 223А

етил 1-етил-7-(етил(феніл)аміно)-3-(3-(нафталін-1-ілокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбоксилат

20 Сполуку Прикладу 224 (139 мг) в N, N-диметилформаміді (2 мл) обробляли за допомогою 60 % NaH (36 мг, 0,9 ммоль) при кімнатній температурі. Після того як виділення бульбашок припинялося, додавали йодметан (140 мг, 0,9 ммоль). Реакційну суміш перемішували протягом 3 годин. Реакційну суміш розподіляли між водою і етилацетатом. Органічний шар відділяли і водний шар екстрагували додатковою кількістю етилацетату. Об'єднані органічні шари промивали насиченим сольовим розчином, сушили над MgSO₄, фільтрували і концентрували у вакуумі. Залишок очищали за допомогою флеш-хроматографії на силікагелі (етилацетат у гексані) з одержанням сполуки Прикладу 223А.

ПРИКЛАД 223В

1-етил-7-(етил(феніл)аміно)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

30 Зазначену у заголовку сполуку синтезували, як описано у Прикладі 175В, з використанням сполуки Прикладу 223А замість сполуки Прикладу 175А. ¹Н ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 13,20 (с, 1Н), 8,22-8,24 (м, 1Н), 7,86-7,88 (м, 1Н), 7,72 (дд, J=7,17, 1,98 Гц, 1Н), 7,45-7,55 (м, 3Н), 7,40 (т, J=7,78 Гц, 1Н), 7,08-7,14 (м, 4Н), 6,91 (д, J=7,32 Гц, 1Н), 6,64 (т, J=7,32 Гц, 1Н), 6,53 (д, J=8,24 Гц, 2Н), 4,48-4,62 (м, 2Н), 4,22 (т, J=6,1 Гц, 2Н), 3,88-3,95 (м, 1Н), 3,44-3,51 (м, 1Н), 2,19-2,24 (м, 2Н), 1,18 (т, J=7,02 Гц, 3Н), 0,94 (т, J=6,87 Гц, 3Н).

ПРИКЛАД 224

7-аніліно-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

40 ¹Н ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 13,07 (с, 1Н), 11,22 (с, 1Н), 8,22-8,24 (м, 1Н), 8,06 (с, 1Н), 7,85-7,87 (м, 1Н), 7,44-7,54 (м, 3Н), 7,38 (т, J=7,93 Гц, 1Н), 7,27-7,30 (м, 2Н), 7,18-7,20 (м, 3Н), 7,09 (д, J=7,32 Гц, 1Н), 6,86-6,90 (м, 3Н), 4,18 (т, J=5,95 Гц, 2Н), 3,32 (м, 2Н), 2,19-2,24 (м, 2Н).

ПРИКЛАД 225

7-(5-метил-2-(тетрагідро-2Н-піран-3-ілметокси)піридин-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

45 ¹Н ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 12,95 (с, 1Н), 11,07 (с, 1Н), 8,23-8,25 (м, 1Н), 8,06 (с, 1Н), 7,86-7,88 (м, 1Н), 7,74 (д, J=6,71 Гц, 1Н), 7,45-7,54 (м, 3Н), 7,39 (т, J=7,93 Гц, 1Н), 7,05-7,11 (м, 2Н), 7,18-7,20 (м, 3Н), 7,09 (д, J=7,32 Гц, 1Н), 6,90 (д, J=7,32 Гц, 1Н), 6,65 (с, 1Н), 4,09-4,21 (м, 4Н), 3,87-3,90 (м, 2Н), 3,73-3,75 (м, 2Н), 3,24-3,37 (м, 4Н), 2,21-2,26 (м, 2Н), 2,01-2,05 (м, 1Н), 1,93 (с, 3Н), 1,93-1,95 (м, 1Н), 1,59-1,60 (м, 1Н), 1,51-1,53 (м, 1Н), 1,36-1,39 (м, 1Н).

ПРИКЛАД 226

50 7-(5-метил-2-(2-(2-оксопіролідін-1-іл)етокси)піридин-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

55 ¹Н ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 13,03 (шир, 1Н), 11,06 (с, 1Н), 8,23-8,25 (м, 1Н), 8,09 (с, 1Н), 7,86-7,88 (м, 1Н), 7,74 (дд, J=7,17, 1,68 Гц, 1Н), 7,45-7,54 (м, 3Н), 7,39 (т, J=7,93 Гц, 1Н), 7,06-7,10 (м, 2Н), 6,90 (д, J=7,32 Гц, 1Н), 6,68 (с, 1Н), 4,38 (т, J=5,49 Гц, 2Н), 4,20 (т, J=6,1 Гц, 2Н), 3,56 (т, J=5,64 Гц, 2Н), 3,46 (т, J=7,02 Гц, 2Н), 3,37 (т, J=7,48 Гц, 2Н), 2,19-2,25 (м, 4Н), 1,89-1,95 (м, 5Н).

ПРИКЛАД 227

7-(5-метил-2-(2-(4-метилпіперазин-1-іл)етокси)піридин-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 11,01 (с, 1H), 8,24-8,25 (м, 1H), 8,09 (с, 1H), 7,86-7,88 (м, 1H), 7,75 (д, J=7,63 Гц, 1H), 7,45-7,54 (м, 3H), 7,39 (т, J=7,93 Гц, 1H), 7,05-7,11 (м, 2H), 6,90 (д, J=7,32 Гц, 1H), 6,69 (с, 1H), 4,47 (с, 2H), 4,20 (т, J=6,1 Гц, 2H), 3,77 (шир, 8H), 3,35-3,38 (м, 2H), 3,09 (м, 2H), 2,78 (с, 3H), 2,21-2,26 (м, 2H), 1,96 (с, 3H).

5 ПРИКЛАД 228

3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2-(2-оксоциклогексил)піридин-3-іл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 11,13 (с, 1H), 8,72-8,73 (м, 1H), 8,24-8,26 (м, 1H), 7,86-7,88 (м, 2H), 7,76 (д, J=8,24 Гц, 1H), 7,45-7,54 (м, 4H), 7,37-7,41 (м, 1H), 7,05 (т, J=7,48 Гц, 1H), 6,87-6,91 (м, 2H), 4,20 (т, J=5,8 Гц, 2H), 3,30-3,55 (шир, 6H), 1,40-2,24 (м, 7H).

10 ПРИКЛАД 229

7-(2-фтор-5-метилпіридин-4-іл)-1-(2-(4-метилпіперазин-1-іл)етил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 9,37 (с, 1H), 8,19-8,21 (м, 2H), 7,87 (т, J=7,02 Гц, 1H), 7,45-7,56 (м, 4H), 7,40 (т, J=7,93 Гц, 1H), 7,32 (д, J=1,83 Гц, 1H), 7,15-7,18 (м, 1H), 7,04 (д, J=6,1 Гц, 1H), 6,90 (д, J=7,32 Гц, 1H), 4,46-4,50 (м, 1H), 4,21 (т, J=6,1 Гц, 2H), 3,59-3,61 (м, 1H), 2,75 (шир, 2H), 2,71 (с, 3H), 2,09-2,25 (м, 6H), 1,95 (с, 3H).

ПРИКЛАД 230

7-(5,5-диметил-2-фенілциклогекс-1-ен-1-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 12,95 (с, 1H), 10,24 (с, 1H), 8,21-8,23 (м, 2H), 7,85-7,86 (м, 1H), 7,35-7,54 (м, 5H), 7,01-7,03 (м, 2H), 6,95 (т, J=7,48 Гц, 1H), 6,88-6,91 (м, 1H), 6,83 (д, J=7,02 Гц, 1H), 6,80-6,81 (м, 2H), 4,10 (т, J=6,1 Гц, 2H), 3,22-3,25 (м, 2H), 2,11-2,25 (м, 6H), 1,6 (шир, 2H), 1,06 (с, 6H).

25 ПРИКЛАД 231

3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(піридин-3-іламіно)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 13,18 (с, 1H), 11,27 (с, 1H), 8,67 (с, 1H), 8,36 (д, J=2,44 Гц, 1H), 8,21-8,23 (м, 1H), 8,17 (д, J=4,58 Гц, 1H), 7,86-7,87 (м, 1H), 7,77 (дд, J=8,54, 1,83 Гц, 1H), 7,61 (дд, J=8,54, 5,19 Гц, 1H), 7,43-7,54 (м, 4H), 7,39 (т, J=7,78 Гц, 1H), 7,20 (д, J=7,32 Гц, 1H), 7,00 (т, J=7,78 Гц, 1H), 6,89 (д, J=7,32 Гц, 1H), 4,18 (т, J=6,1 Гц, 2H), 3,24 (т, J=7,32 Гц, 2H), 2,20-2,25 (м, 2H).

ПРИКЛАД 232

3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(феніл(пропіл)аміно)-1-пропіл-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 13,20 (с, 1H), 8,22 (д, J=7,63 Гц, 1H), 7,87 (д, J=7,02 Гц, 1H), 7,70-7,72 (м, 1H), 7,45-7,54 (м, 3H), 7,08-7,13 (м, 4H), 6,90 (д, J=7,63 Гц, 1H), 6,64 (т, J=7,17 Гц, 1H), 6,53 (д, J=7,93 Гц, 2H), 4,44-4,50 (м, 1H), 4,32-4,37 (м, 1H), 4,21 (т, J=5,95 Гц, 2H), 3,76-3,82 (м, 1H), 2,19-2,23 (м, 2H), 1,74 (м, 1H), 1,58-1,60 (м, 1H), 1,38-1,40 (м, 1H), 1,18-1,23 (м, 1H), 0,88 (т, J=7,32 Гц, 3H), 0,45 (т, J=7,17 Гц, 3H).

ПРИКЛАД 233

7-(3-циклогекс-1-ен-1-ілпіридин-2-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 13,21 (с, 1H), 11,12 (с, 1H), 8,76 (д, J=5,19 Гц, 1H), 8,27-8,29 (м, 1H), 8,15 (с, 1H), 7,85-7,88 (м, 2H), 7,78 (с, 1H), 7,45-7,55 (м, 4H), 7,38 (т, J=7,93 Гц, 1H), 7,11 (т, J=7,63 Гц, 1H), 6,86 (д, J=7,63 Гц, 1H), 5,72 (с, 1H), 4,44-4,50 (м, 1H), 4,16 (т, J=6,1 Гц, 2H), 3,40 (т, J=7,32 Гц, 2H), 2,22-2,27 (м, 2H), 1,92 (шир, 2H), 1,82 (шир, 2H), 1,34-1,35 (м, 4H).

45 ПРИКЛАД 234

3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2-піридин-3-ілциклогекс-1-ен-1-іл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 11,07 (с, 1H), 8,33-8,35 (м, 2H), 8,22-8,23 (м, 1H), 7,93 (д, J=7,93 Гц, 1H), 7,85-7,87 (м, 1H), 7,44-7,54 (м, 5H), 7,38 (т, J=7,78 Гц, 1H), 6,89-6,90 (м, 1H), 6,82-6,86 (м, 2H), 4,11 (т, J=6,1 Гц, 2H), 3,27 (шир, 2H), 2,10-2,16 (м, 2H), 1,91 (шир, 4H).

ПРИКЛАД 235

3-(3-((8-хлорхіназолін-4-іл)окси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 12,95 (с, 1H), 10,48 (с, 1H), 8,85 (с, 1H), 8,13 (дд, J=7,63, 1,22 Гц, 1H), 8,10 (дд, J=8,24, 1,22 Гц, 1H), 7,70 (д, J=7,93 Гц, 1H), 7,64 (т, J=7,93 Гц, 1H), 7,25-7,34 (м, 3H), 7,19 (д, J=7,32 Гц, 1H), 7,07-7,10 (м, 1H), 7,02-7,02 (м, 1H), 4,60 (т, J=6,1 Гц, 2H), 3,34 (т, J=7,02 Гц, 2H), 2,23-2,29 (м, 2H), 2,04 (с, 3H).

ПРИКЛАД 236

1-бутил-7-(бутил(феніл)аміно)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 8,21 (д, J=7,67 Гц, 1H), 7,86 (д, J=7,67 Гц, 1H), 7,69-7,71 (м, 1H), 7,36-7,55 (м, 4H), 7,09-7,13 (м, 4H), 6,89 (д, J=7,67 Гц, 1H), 6,63 (т, J=7,06 Гц, 1H), 6,52 (д, J=7,98 Гц, 2H), 4,49-4,53 (м, 1H), 4,37 (м, 1H), 4,21 (т, J=5,52 Гц, 2H), 3,61 (м, 1H), 2,17-2,25 (м, 2H), 0,78-1,72 (м, 9H), 0,54 (т, J=7,36 Гц, 3H).

5 ПРИКЛАД 237

3-(3-(7-хлор-1H-піроло(2,3-с)піридин-1-іл)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 10,46 (с, 1H), 7,87 (д, J=5,22 Гц, 1H), 7,78 (д, J=3,07 Гц, 1H), 7,54-7,57 (м, 2H), 7,20-7,33 (м, 4H), 7,10-7,13 (м, 1H), 7,03-7,05 (м, 1H), 6,62 (д, J=3,07 Гц, 1H), 4,57-4,61 (м, 2H), 3,16 (т, J=7,36 Гц, 2H), 2,12-2,20 (м, 2H), 2,06 (с, 3H).

10

ПРИКЛАД 238

7-(3-циклогексилпіридин-2-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 11,27 (с, 1H), 8,70 (д, J=4,91 Гц, 1H), 8,41 (с, 1H), 8,28-8,30 (м, 1H), 7,86-7,91 (м, 3H), 7,45-7,57 (м, 3H), 7,39 (т, J=7,98 Гц, 1H), 7,29 (д, J=7,06 Гц, 1H), 7,16-7,18 (м, 1H), 6,89 (д, J=7,36 Гц, 1H), 4,20 (т, J=6,14 Гц, 2H), 3,39-3,42 (м, 2H), 2,46 (м, 2H), 2,21-2,28 (м, 2H), 0,91-1,78 (м, 10H).

15

ПРИКЛАД 239

3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(1-(1,3-тіазол-5-ілметил)-1H-піроло(2,3-с)піридин-3-іл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 13,14 (с, 1H), 10,95 (с, 1H), 9,61 (с, 1H), 9,10 (с, 1H), 8,78 (с, 1H), 8,38 (д, J=6,41 Гц, 1H), 8,22-8,24 (м, 1H), 8,15 (с, 1H), 7,93 (т, J=6,41 Гц, 1H), 7,86-7,88 (м, 1H), 7,78 (д, J=7,93 Гц, 1H), 7,35-7,54 (м, 5H), 7,12-7,16 (м, 1H), 6,90 (д, J=7,63 Гц, 1H), 6,12 (с, 2H), 4,21 (т, J=5,95 Гц, 2H), 3,40 (т, J=7,32 Гц, 2H), 2,23-2,28 (м, 2H).

20

ПРИКЛАД 240

7-(1-(3,3-диметил-2-оксобутил)-1H-піроло(2,3-с)піридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 13,14 (с, 1H), 10,74 (с, 1H), 9,18 (с, 1H), 8,39 (с, 1H), 8,34 (д, J=6,1 Гц, 1H), 8,22-8,24 (м, 1H), 7,93 (д, J=6,1 Гц, 1H), 7,86-7,88 (м, 1H), 7,76 (д, J=8,24 Гц, 1H), 7,35-7,53 (м, 5H), 7,14-7,18 (м, 1H), 6,90 (д, J=7,32 Гц, 1H), 5,81 (с, 2H), 4,21 (т, J=5,95 Гц, 2H), 3,39-3,41 (м, 2H), 2,23-2,28 (м, 2H), 1,30 (с, 9H).

25

ПРИКЛАД 241

7-(4-циклогекс-1-ен-1-ілпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 13,07 (с, 1H), 11,09 (с, 1H), 8,76-8,78 (м, 2H), 8,26-8,28 (м, 1H), 7,86-7,88 (м, 1H), 7,78 (д, J=7,93 Гц, 1H), 7,74 (д, J=5,8 Гц, 1H), 7,36-7,56 (м, 5H), 7,14 (д, J=6,1 Гц, 1H), 7,06-7,09 (м, 1H), 6,84-6,85 (м, 1H), 5,76 (с, 1H), 4,15 (т, J=6,1 Гц, 2H), 3,38 (т, J=7,32 Гц, 2H), 2,21-2,27 (м, 2H), 1,76-1,85 (м, 4H), 1,25-1,26 (м, 1H).

35

ПРИКЛАД 242

7-(1-(3,5-дифторбензил)-1H-піроло(2,3-с)піридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 10,95 (с, 1H), 9,46 (с, 1H), 8,75 (с, 1H), 8,36 (д, J=6,41 Гц, 1H), 8,23-8,25 (м, 1H), 7,91 (д, J=6,41 Гц, 1H), 7,86-7,88 (м, 1H), 7,78 (д, J=8,24 Гц, 1H), 7,37-7,54 (м, 5H), 7,13-7,25 (м, 4H), 6,90 (д, J=7,63 Гц, 1H), 5,83 (с, 2H), 4,21 (т, J=6,1 Гц, 2H), 3,39-3,41 (м, 2H), 2,24-2,29 (м, 2H).

40

ПРИКЛАД 243

3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(1-фенілвініл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 13,03 (с, 1H), 9,82 (с, 1H), 8,22-8,24 (м, 1H), 7,91 (д, J=6,41 Гц, 1H), 7,86-7,88 (м, 1H), 7,45-7,55 (м, 3H), 7,30-7,40 (м, 6H), 7,09-7,11 (м, 1H), 7,04-7,07 (м, 1H), 6,90 (д, J=7,32 Гц, 1H), 5,85 (с, 1H), 5,51 (с, 1H), 4,19 (т, J=6,1 Гц, 2H), 3,34-3,36 (м, 2H), 2,20-2,25 (м, 2H).

50

ПРИКЛАД 244

3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(1H-піроло(2,3-с)піридин-7-іл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 12,58 (с, 1H), 11,65 (с, 1H), 8,31-8,32 (м, 2H), 8,13-8,16 (м, 2H), 8,04 (д, J=7,93 Гц, 1H), 7,88-7,90 (м, 1H), 7,63 (д, J=7,62 Гц, 1H), 7,45-7,57 (м, 3H), 7,39-7,43 (м, 1H), 7,26-7,29 (м, 1H), 7,03 (с, 1H), 6,92 (д, J=7,32 Гц, 1H), 4,22 (т, J=6,1 Гц, 2H), 3,43-3,45 (м, 2H), 2,24-2,30 (м, 2H).

55

ПРИКЛАД 245

7-(4-циклогексилпіридин-3-іл)-3-(3-феноксипропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 13,09 (с, 1H), 11,33 (с, 1H), 8,81 (д, J=6,1 Гц, 1H), 8,72 (с, 1H), 8,26-8,28 (м, 1H), 7,90 (д, J=5,8 Гц, 1H), 7,83-7,98 (м, 2H), 7,45-7,54 (м, 3H), 7,39 (т, J=7,93 Гц,

60

1Н), 7,12-7,16 (м, 1Н), 6,89 (д, J=7,63 Гц, 1Н), 4,19 (т, J=6,26 Гц, 2Н), 3,42-3,46 (м, 2Н), 3,32-3,37 (м, 2Н), 2,37-2,45 (м, 1Н), 2,22-2,27 (м, 2Н), 1,45-1,76 (м, 7Н), 1,15-1,20 (м, 1Н), 0,81-0,99 (м, 2Н).

ПРИКЛАД 246

- 5 7-(2,4-диметил-1,3-тіазол-5-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота
¹Н ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 10,95 (с, 1Н), 8,21-8,23 (м, 1Н), 7,85-7,97 (м, 2Н), 7,75 (д, J=7,98 Гц, 1Н), 7,36-7,55 (м, 4Н), 7,19 (т, J=6,44 Гц, 1Н), 7,06-7,09 (м, 1Н), 6,89 (д, J=7,37 Гц, 1Н), 4,19 (т, J=6,14 Гц, 2Н), 3,37 (т, J=7,52 Гц, 2Н), 2,70 (с, 1Н), 2,20-2,27 (м, 2Н), 2,17 (с, 3Н).

ПРИКЛАД 247

- 10 7-(1-(карбоксиметил)-1Н-піроло(2,3-с)піридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота
¹Н ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 10,22 (с, 1Н), 8,90 (с, 1Н), 8,20-8,23 (м, 2Н), 8,06 (с, 1Н), 7,85-7,87 (м, 1Н), 7,66-7,68 (м, 1Н), 7,58-7,60 (м, 1Н), 7,36-7,55 (м, 5Н), 7,12-7,15 (м, 1Н), 6,90 (д, J=7,67 Гц, 1Н), 5,22 (с, 2Н), 4,21 (т, J=6,1 Гц, 2Н), 3,28 (т, J=7,52 Гц, 2Н), 2,20-2,27 (м, 2Н).

ПРИКЛАД 248

- 15 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(1-фенілетил)-1Н-індол-2-карбонова кислота
¹Н ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 11,09 (с, 1Н), 8,23 (д, J=7,67 Гц, 1Н), 7,85-7,87 (м, 1Н), 7,66-7,68 (м, 1Н), 7,35-7,53 (м, 7Н), 7,26 (т, J=7,52 Гц, 2Н), 7,10-7,17 (м, 2Н), 6,96 (т, J=7,67 Гц, 1Н), 6,78 (д, J=7,37 Гц, 1Н), 5,00 (д, J=7,06 Гц, 1Н), 4,16 (т, J=5,98 Гц, 2Н), 3,28 (т, J=7,52 Гц, 2Н), 2,15-2,22 (м, 2Н), 1,85 (м, 1Н), 1,60 (д, J=7,06 Гц, 3Н).

20 ПРИКЛАД 249

7-(1-бензил-3,5-диметил-1Н-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

- 25 ¹Н ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 10,57 (с, 1Н), 8,24-8,26 (м, 1Н), 7,85-7,87 (м, 1Н), 7,65 (дд, J=7,06, 1,53 Гц, 1Н), 7,26-7,52 (м, 8Н), 7,03-7,08 (м, 2Н), 6,90 (д, J=7,67 Гц, 1Н), 5,31 (д, J=7,06 Гц, 1Н), 4,21 (т, J=5,98 Гц, 2Н), 3,34-3,37 (м, 2Н), 2,18-2,27 (м, 2Н), 2,04 (с, 6Н).

ПРИКЛАД 250

7-(2-(2-хлорфеніл)циклогекс-1-ен-1-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

- 30 ¹Н ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 10,93 (с, 1Н), 8,21-8,23 (м, 1Н), 7,84-7,86 (м, 1Н), 7,34-7,54 (м, 8Н), 7,20-7,22 (м, 1Н), 7,09 (дд, J=7,36, 1,84 Гц, 1Н), 6,82-6,98 (м, 4Н), 6,71-6,75 (м, 1Н), 5,31 (д, J=7,06 Гц, 1Н), 4,12 (т, J=6,14 Гц, 2Н), 3,20-3,26 (м, 4Н), 2,21-2,28 (м, 4Н), 1,82-1,96 (м, 4Н).

ПРИКЛАД 251

3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н, 1'Н-7,7'-бііндол-2-карбонова кислота

- 35 ¹Н ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 13,02 (с, 1Н), 10,70 (с, 1Н), 9,88 (с, 1Н), 8,27-8,29 (м, 1Н), 7,87-7,89 (м, 1Н), 7,76 (д, J=7,93 Гц, 1Н), 7,62 (д, J=7,63 Гц, 1Н), 7,37-7,56 (м, 5Н), 7,27 (т, J=2,9 Гц, 1Н), 7,21 (д, J=7,02 Гц, 1Н), 7,13-7,18 (м, 2Н), 6,92 (д, J=7,63 Гц, 1Н), 6,55 (дд, J=3,05, 1,83 Гц, 1Н), 4,23 (т, J=6,26 Гц, 2Н), 3,39-3,42 (м, 2Н), 2,25-2,30 (м, 2Н).

ПРИКЛАД 252

- 40 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(1-(2-(2-оксопіролідін-1-іл)етил)-1Н-піроло(2,3-с)піридин-7-іл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

- 45 ¹Н ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 15,03 (с, 1Н), 11,85 (с, 1Н), 8,35 (д, J=6,1 Гц, 1Н), 8,31-8,32 (м, 1Н), 8,22 (д, J=6,41 Гц, 1Н), 8,20 (д, J=3,05 Гц, 1Н), 8,08 (д, J=7,93 Гц, 1Н), 7,88-7,90 (м, 1Н), 7,61 (д, J=7,02 Гц, 1Н), 7,39-7,55 (м, 5Н), 7,25-7,28 (м, 1Н), 7,07 (д, J=3,05 Гц, 1Н), 6,92 (д, J=7,32 Гц, 1Н), 4,20 (т, J=6,1 Гц, 2Н), 3,83-3,88 (м, 2Н), 3,56-3,60 (м, 2Н), 3,42-3,45 (м, 2Н), 2,23-2,28 (м, 2Н), 1,94-1,98 (м, 2Н), 1,64-1,71 (м, 2Н).

ПРИКЛАД 254

7-(5-метил-3-феніл-1Н-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

- 50 ¹Н ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 10,53 (с, 1Н), 8,26-8,28 (м, 1Н), 7,86-7,88 (м, 1Н), 7,68 (дд, J=6,87, 2,29 Гц, 1Н), 7,45-7,54 (м, 3Н), 7,39 (т, J=7,78 Гц, 1Н), 7,29-7,31 (м, 2Н), 7,15-7,17 (м, 3Н), 7,01-7,05 (м, 2Н), 6,90 (д, J=7,32 Гц, 1Н), 4,20 (т, J=6,1 Гц, 2Н), 3,33-3,36 (м, 2Н), 2,21-2,26 (м, 2Н), 2,03 (с, 3Н).

ПРИКЛАД 255

7-(2-метилфеніл)-4-(2-(1-нафтилокси)етил)-1Н-індол-2-карбонова кислота

55 ПРИКЛАД 255А

етил 4-(1-етокси-1,3-діоксобутан-2-іл)-7-о-толіл-1Н-індол-2-карбоксилат

- 60 Суміш етил 4-хлор-7-о-толіл-1Н-індол-2-карбоксилату (ПРИКЛАД 166С) (0,93 г), етил 3-оксобутаноату (0,849 г), ди-трет-бутил(2'-метилбіфеніл-2-іл)фосфіну (0,093 мг), K₃PO₄ (3,46 г) і ацетату паладію(II) (0,033 г) у толуолі (8 мл) дегазували шляхом повторення три рази циклу вакуум/азот. Реакційну суміш нагрівали при 93°C протягом 14 годин. Реакційну суміш

розподіляли між водою і етилацетатом. Органічний шар відділяли і водний шар екстрагували додатковою кількістю етилацетату. Об'єднані органічні шари промивали насиченим сольовим розчином, сушили над MgSO_4 , фільтрували і концентрували. Залишок очищали за допомогою флеш-хроматографії на силікагелі (етилацетат у гексані) з одержанням зазначеної у заголовку сполуки.

ПРИКЛАД 255B

метил 4-(2-метоксі-2-оксоетил)-7-о-толіл-1H-індол-2-карбоксилат

Сполуку Прикладу 255A (неочищену) в етанолі (35 мл) обробляли за допомогою 20 % КОН (15 мл). Суміш нагрівали при 100 °C протягом 1 години. Розчинник видаляли і залишок розчиняли в етилацетаті. Після додавання концентрованої HCl органічний шар відділяли і водний шар екстрагували додатковою кількістю етилацетату. Об'єднані органічні шари сушили і концентрували. Залишок обробляли за допомогою діазометану у CH_2Cl_2 і декількох крапель метанолу. Після того як виділення бульбашок припинялося, розчинники випарювали і сполуку очищали флеш-хроматографією (15:85 EtOAc /гексан) з одержанням чистої сполуки Прикладу 255B. ^1H ЯМР (500 МГц, DMCO-d_6): δ 11,14 (с, 1H), 7,26-7,34 (м, 4H), 7,21 (д, $J=7,32$ Гц, 1H), 7,00-7,05 (м, 2H), 3,99 (с, 2H), 3,83 (с, 3H), 3,64 (с, 3H), 2,05 (с, 3H).

ПРИКЛАД 255C

7-(2-метилфеніл)-4-(2-(1-нафтилокси)етил)-1H-індол-2-карбонова кислота

Зазначену у заголовку сполуку одержували відповідно до процедури Прикладу 164G з використанням сполуки Прикладу 255B замість сполуки Прикладу 164F. ^1H ЯМР (500 МГц, DMCO-d_6): δ 11,05 (с, 1H), 8,13 (д, $J=7,98$ Гц, 1H), 7,84 (д, $J=7,98$ Гц, 1H), 7,31-7,51 (м, 7H), 7,18-7,27 (м, 3H), 7,01 (д, $J=6,75$ Гц, 1H), 4,50 (т, $J=6,44$ Гц, 2H), 3,52 (т, $J=6,44$ Гц, 2H), 2,05 (с, 3H).

ПРИКЛАД 256

7-(2-метилфеніл)-4-(2-(2-нафтилокси)етил)-1H-індол-2-карбонова кислота

^1H ЯМР (500 МГц, DMCO-d_6): δ 11,06 (с, 1H), 7,78-7,83 (м, 3H), 7,13-7,46 (м, 10H), 7,01 (д, $J=7,06$ Гц, 1H), 4,46 (т, $J=6,9$ Гц, 2H), 3,45 (т, $J=6,75$ Гц, 2H), 2,06 (с, 3H).

ПРИКЛАД 257

4-(2-(2,3-дихлорфенокси)етил)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота

^1H ЯМР (500 МГц, DMCO-d_6): δ 11,02 (с, 1H), 7,36 (д, $J=1,84$ Гц, 1H), 7,17-7,32 (м, 7H), 7,12 (д, $J=7,06$ Гц, 1H), 7,00 (д, $J=7,36$ Гц, 1H), 4,40 (т, $J=6,6$ Гц, 2H), 3,28-3,34 (м, 2H), 2,21-2,29 (м, 2H), 2,06 (с, 3H).

ПРИКЛАД 258

3-(3-(1H-індол-4-ілокси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота

^1H ЯМР (500 МГц, DMCO-d_6): δ 11,02 (с, 1H), 10,41 (с, 1H), 7,71 (д, $J=7,98$ Гц, 1H), 7,20-7,33 (м, 5H), 6,93-7,11 (м, 4H), 6,47-6,49 (м, 1H), 6,42 (д, $J=6,44$ Гц, 1H), 4,12 (т, $J=6,44$ Гц, 2H), 3,40-3,42 (м, 2H), 2,06 (с, 3H).

ПРИКЛАД 259

4-(2-(2-хлор-3-(трифторметил)фенокси)етил)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота

^1H ЯМР (500 МГц, DMCO-d_6): δ 11,03 (с, 1H), 7,45-7,53 (м, 2H), 7,19-7,39 (м, 6H), 7,13 (д, $J=7,36$ Гц, 1H), 6,99 (д, $J=7,06$ Гц, 1H), 4,49 (т, $J=6,75$ Гц, 2H), 3,41-3,44 (м, 2H), 2,05 (с, 3H).

ПРИКЛАД 260

1-метил-3-(3-((1-метил-1H-індол-4-іл)окси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота

^1H ЯМР (500 МГц, DMCO-d_6): δ 13,07 (с, 1H), 7,74 (д, $J=7,98$ Гц, 1H), 7,27-7,37 (м, 4H), 7,20 (д, $J=3,07$ Гц, 1H), 7,09 (т, $J=7,52$ Гц, 1H), 6,98-7,05 (м, 3H), 6,49 (д, $J=1,43$ Гц, 1H), 6,47 (д, $J=2,76$ Гц, 1H), 4,13 (т, $J=6,14$ Гц, 2H), 3,76 (с, 3H), 3,24-3,27 (м, 2H), 2,10-2,17 (м, 2H), 2,00 (с, 3H).

ПРИКЛАД 261

7-(2-(4-етилфеніл)циклогекс-1-ен-1-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

^1H ЯМР (500 МГц, DMCO-d_6): δ 10,56 (с, 1H), 8,22-8,24 (м, 1H), 7,84-7,86 (м, 1H), 7,34-7,54 (м, 5H), 6,92 (д, $J=8,29$ Гц, 1H), 6,84 (д, $J=7,67$ Гц, 2H), 6,67-6,80 (м, 4H), 4,11 (т, $J=6,14$ Гц, 2H), 3,23-3,27 (м, 2H), 2,31-2,43 (м, 6H), 2,11-2,18 (м, 2H), 1,85 (шир, 4H), 0,98 (т, $J=7,52$ Гц, 3H).

ПРИКЛАД 262

7-(2-(4-ізопропілфеніл)циклогекс-1-ен-1-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

^1H ЯМР (500 МГц, DMCO-d_6): δ 10,43 (с, 1H), 8,22-8,24 (м, 1H), 7,84-7,86 (м, 1H), 7,34-7,54 (м, 5H), 6,93 (д, $J=7,98$ Гц, 1H), 6,79-6,84 (м, 5H), 4,10 (т, $J=6,14$ Гц, 2H), 3,22-3,26 (м, 2H), 2,57-2,64 (м, 1H), 2,11-2,44 (м, 6H), 1,85 (шир, 4H), 0,99 (д, $J=6,75$ Гц, 6H).

ПРИКЛАД 263

7-(1,3-диметил-5-феніл-1Н-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹Н ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 12,85 (с, 1Н), 10,42 (с, 1Н), 8,25 (д, J=7,63 Гц, 1Н), 7,85-7,87 (м, 1Н), 7,44-7,58 (м, 4Н), 7,38 (т, J=7,93 Гц, 1Н), 7,25-7,30 (м, 5Н), 6,93-6,97 (м, 2Н), 6,88 (д, J=7,63 Гц, 1Н), 4,17 (т, J=6,1 Гц, 2Н), 3,73 (с, 3Н), 3,27-3,30 (м, 2Н), 2,16-2,20 (м, 2Н), 2,00 (с, 3Н).

ПРИКЛАД 264

7-(1,5-диметил-3-феніл-1Н-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹Н ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 12,87 (с, 1Н), 10,60 (с, 1Н), 8,26-8,28 (м, 1Н), 7,86-7,88 (м, 1Н), 7,69 (д, J=7,63 Гц, 1Н), 7,45-7,55 (м, 3Н), 7,39 (т, J=7,78 Гц, 1Н), 7,28 (дд, J=7,32, 2,44 Гц, 2Н), 7,11-7,13 (м, 3Н), 6,97-7,04 (м, 2Н), 6,90 (д, J=7,63 Гц, 1Н), 4,20 (т, J=6,1 Гц, 2Н), 3,85 (с, 3Н), 3,36 (шир, 2Н), 2,21-2,27 (м, 2Н), 2,01 (с, 3Н).

ПРИКЛАД 265

7-(3,5-диметил-1-((3-метилоксетан-3-іл)метил)-1Н-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹Н ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 13,24 (с, 1Н), 11,06 (с, 1Н), 8,23 (д, J=7,63 Гц, 1Н), 7,81-7,88 (м, 2Н), 7,39-7,55 (м, 4Н), 7,13-7,17 (м, 2Н), 6,91 (д, J=7,32 Гц, 1Н), 5,50 (м, 1Н), 4,41-4,49 (м, 2Н), 4,22-4,29 (м, 4Н), 3,56 (с, 3Н), 2,20-2,26 (м, 8Н), 1,93 (с, 3Н).

ПРИКЛАД 266

7-(3,5-диметил-1-тетрагідрофуран-3-іл-1Н-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹Н ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 12,98 (с, 1Н), 10,59 (с, 1Н), 8,25-8,26 (м, 1Н), 7,86-7,88 (м, 1Н), 7,65 (д, J=7,93 Гц, 1Н), 7,45-7,55 (м, 3Н), 7,39 (т, J=7,93 Гц, 1Н), 7,07-7,07 (м, 2Н), 6,91 (д, J=7,63 Гц, 1Н), 4,96-5,01 (м, 1Н), 4,21 (т, J=6,1 Гц, 2Н), 4,03-4,07 (м, 2Н), 3,83-3,88 (м, 2Н), 3,34-3,37 (м, 2Н), 2,31-2,41 (м, 4Н), 2,21-2,26 (м, 2Н), 2,07 (с, 3Н), 2,02 (с, 3Н).

ПРИКЛАД 267

7-(3,5-диметил-1-піридин-2-іл-1Н-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹Н ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 10,98 (с, 1Н), 8,48 (д, J=4,58 Гц, 1Н), 8,25-8,28 (м, 1Н), 7,86-8,00 (м, 3Н), 7,70 (дд, J=7,17, 1,68 Гц, 1Н), 7,45-7,55 (м, 3Н), 7,38-7,41 (м, 1Н), 7,31-7,33 (м, 1Н), 7,07-7,12 (м, 2Н), 6,91 (д, J=7,32 Гц, 1Н), 4,22 (т, J=5,95 Гц, 2Н), 3,37 (т, J=7,63 Гц, 2Н), 2,43 (с, 3Н), 2,21-2,27 (м, 2Н), 2,09 (с, 3Н).

ПРИКЛАД 268

7-(2-хлор-4-метилпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹Н ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 12,99 (с, 1Н), 11,40 (с, 1Н), 8,26-8,31 (м, 2Н), 8,25-8,28 (м, 2Н), 7,86-7,88 (м, 1Н), 7,76 (д, J=7,93 Гц, 1Н), 7,38-7,55 (м, 5Н), 7,09-7,12 (м, 1Н), 7,03 (д, J=7,02 Гц, 1Н), 6,91 (д, J=7,63 Гц, 1Н), 4,22 (т, J=6,1 Гц, 2Н), 3,37 (т, J=7,63 Гц, 2Н), 2,22-2,27 (м, 2Н), 1,96 (с, 3Н).

ПРИКЛАД 269

7-(4-метил-2-(2-(2-оксопіролідін-1-іл)етокси)піридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹Н ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 11,10 (с, 1Н), 8,27-8,30 (м, 1Н), 8,05 (д, J=5,22 Гц, 1Н), 7,86-7,88 (м, 1Н), 7,68 (д, J=7,98 Гц, 1Н), 7,37-7,55 (м, 4Н), 7,03-7,07 (м, 1Н), 6,96-6,98 (м, 1Н), 6,90 (д, J=7,36 Гц, 1Н), 4,15-4,30 (м, 4Н), 3,34 (м, 2Н), 3,24 (т, J=4,91 Гц, 1Н), 2,55-2,65 (м, 2Н), 2,22-2,27 (м, 2Н), 1,96 (с, 3Н), 1,90 (т, J=8,13 Гц, 2Н), 1,43-1,49 (м, 2Н).

ПРИКЛАД 270

7-(3,5-диметил-1-(тетрагідрофуран-3-ілметил)-1Н-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹Н ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 10,51 (с, 1Н), 8,24-8,26 (м, 1Н), 7,86-7,88 (м, 1Н), 7,85-7,88 (м, 1Н), 7,64-7,66 (м, 1Н), 7,44-7,55 (м, 3Н), 7,39 (т, J=7,83 Гц, 1Н), 7,02-7,08 (м, 2Н), 6,91 (д, J=7,36 Гц, 1Н), 4,21 (т, J=5,98 Гц, 2Н), 3,95-4,05 (м, 2Н), 3,80-3,86 (м, 2Н), 3,64-3,74 (м, 4Н), 3,35 (т, J=7,52 Гц, 1Н), 2,74-2,81 (м, 1Н), 2,20-2,27 (м, 2Н), 1,96-2,03 (м, 6Н), 1,69-1,75 (м, 1Н).

ПРИКЛАД 271

7-(1-циклопентил-3,5-диметил-1Н-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹Н ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 10,47 (с, 1Н), 8,24-8,26 (м, 1Н), 7,85-7,88 (м, 1Н), 7,85-7,88 (м, 1Н), 7,65 (д, J=6,75 Гц, 1Н), 7,45-7,55 (м, 3Н), 7,39 (т, J=7,83 Гц, 1Н), 7,01-7,07 (м, 2Н), 6,91 (д, J=7,36 Гц, 1Н), 4,64-4,70 (м, 1Н), 4,21 (т, J=6,14 Гц, 2Н), 3,33-3,37 (м, 2Н), 2,21-2,26 (м, 2Н), 2,02-2,08 (м, 10Н), 1,85-1,88 (м, 2Н), 1,64-1,66 (м, 2Н).

ПРИКЛАД 272

7-(1-((2,2-диметил-1,3-діоксолан-4-іл)метил)-3,5-диметил-1H-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 10,34 (с, 1H), 8,23-8,26 (м, 1H), 7,85-7,88 (м, 1H), 7,65 (д, J=7,67 Гц, 1H), 7,37-7,55 (м, 4H), 7,02-7,08 (м, 2H), 6,91 (д, J=7,36 Гц, 1H), 4,44-4,47 (м, 1H), 4,09-4,23 (м, 5H), 3,87-3,91 (м, 1H), 3,34-3,37 (м, 2H), 2,21-2,27 (м, 2H), 2,09 (с, 3H), 2,01 (с, 3H), 1,33 (с, 3H), 1,29 (с, 3H).

ПРИКЛАД 273

7-(4-метил-2-(2-морфолін-4-ілетокси)піридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 11,11 (с, 1H), 8,91 (с, 1H), 8,26-8,28 (м, 1H), 8,10 (д, J=5,22 Гц, 1H), 7,85-7,88 (м, 1H), 7,71 (д, J=7,98 Гц, 1H), 7,45-7,55 (м, 4H), 7,39 (т, J=7,83 Гц, 1H), 7,05-7,09 (м, 1H), 6,91 (д, J=7,36 Гц, 1H), 4,55-4,59 (м, 1H), 4,40-4,46 (м, 1H), 4,21 (т, J=5,98 Гц, 2H), 3,33-3,37 (м, 2H), 2,93 (шир, 2H), 2,73 (шир, 2H), 2,20-2,25 (м, 2H), 1,98 (с, 3H).

ПРИКЛАД 274

7-(4-метил-2-морфолін-4-ілпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 11,28 (с, 1H), 8,27-8,29 (м, 1H), 8,20 (д, J=5,83 Гц, 1H), 7,86-7,88 (м, 1H), 7,79 (д, J=7,98 Гц, 1H), 7,45-7,55 (м, 4H), 7,37 (т, J=7,98 Гц, 1H), 7,20-7,24 (м, 2H), 7,09-7,13 (м, 1H), 6,86 (д, J=7,37 Гц, 1H), 4,18 (т, J=6,14 Гц, 2H), 3,39 (т, J=6,14 Гц, 2H), 2,87-3,17 (м, 8H), 2,21-2,28 (м, 2H), 2,12 (с, 3H).

ПРИКЛАД 275

7-(2-хлор-4-метилпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1-(піридин-3-ілметил)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 8,51 (д, J=4,3 Гц, 1H), 8,25-8,29 (м, 2H), 7,93 (д, J=7,98 Гц, 1H), 7,87-7,89 (м, 1H), 7,74 (с, 1H), 7,39-7,56 (м, 5H), 7,19-7,24 (м, 2H), 7,10 (д, J=7,98 Гц, 1H), 6,99 (д, J=7,36 Гц, 1H), 6,94 (д, J=6,75 Гц, 1H), 5,29-5,46 (м, 2H), 4,28 (т, J=5,98 Гц, 2H), 3,42-3,45 (м, 2H), 2,27-2,33 (м, 2H), 1,66 (с, 3H).

ПРИКЛАД 276

7-(2-(1H-імідазол-1-іл)-4-метилпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 11,37 (с, 1H), 8,75 (с, 1H), 8,60 (д, J=5,22 Гц, 1H), 8,25-8,28 (м, 1H), 7,86-7,88 (м, 1H), 7,74 (д, J=7,98 Гц, 1H), 7,70 (д, J=5,22 Гц, 1H), 7,45-7,54 (м, 3H), 7,39 (т, J=7,98 Гц, 1H), 7,30 (д, J=7,36 Гц, 2H), 7,02-7,09 (м, 2H), 6,88 (д, J=7,36 Гц, 1H), 4,17 (т, J=6,14 Гц, 2H), 3,27-3,39 (м, 2H), 2,18-2,25 (м, 2H), 2,06 (с, 3H).

ПРИКЛАД 277

7-(1-(2,3-дигідроксипропіл)-3,5-диметил-1H-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 10,47 (с, 1H), 8,24-8,26 (м, 1H), 7,86-7,88 (м, 1H), 7,67 (д, J=7,36 Гц, 1H), 7,37-7,53 (м, 4H), 7,03-7,09 (м, 2H), 6,91 (д, J=7,67 Гц, 1H), 4,15-4,23 (м, 4H), 3,34-3,46 (м, 2H), 2,21-2,26 (м, 2H), 2,07 (с, 3H), 2,03 (с, 3H).

ПРИКЛАД 278

3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(3-феніл-5-(2-фенілетил)-1H-піразол-4-іл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 10,40 (с, 1H), 8,26-8,29 (м, 1H), 7,85-7,88 (м, 1H), 7,68 (д, J=8,29 Гц, 1H), 7,44-7,55 (м, 3H), 7,31-7,39 (м, 3H), 7,00-7,17 (м, 7H), 6,89-6,95 (м, 4H), 4,19 (т, J=6,14 Гц, 2H), 3,34-3,46 (м, 2H), 2,65-2,74 (м, 4H), 2,21-2,26 (м, 2H).

ПРИКЛАД 279

7-(4-метил-2-фенілпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 11,29 (с, 1H), 8,81 (д, J=5,52 Гц, 1H), 8,24-8,26 (м, 1H), 7,85-7,90 (м, 2H), 7,64-7,66 (м, 1H), 7,31-7,39 (м, 3H), 7,35-7,45 (м, 4H), 7,15-7,28 (м, 5H), 6,92-6,97 (м, 2H), 6,84 (д, J=7,67 Гц, 1H), 4,12 (т, J=6,14 Гц, 2H), 3,28-3,34 (м, 2H), 2,17-2,21 (м, 2H), 2,15 (с, 3H).

ПРИКЛАД 280

7-(4-метил-2-вінілпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 11,22 (с, 1H), 8,65 (д, J=5,83 Гц, 1H), 8,25-8,27 (м, 1H), 7,86-7,88 (м, 1H), 7,81 (д, J=7,98 Гц, 1H), 7,62-7,64 (м, 1H), 7,45-7,54 (м, 3H), 7,39 (т, J=7,98 Гц, 1H), 7,04 (д, J=6,44 Гц, 1H), 6,91 (д, J=7,67 Гц, 1H), 6,16-6,29 (м, 2H), 5,47-5,49 (м, 1H), 4,22 (т, J=6,14 Гц, 2H), 3,28-3,34 (м, 2H), 2,21-2,28 (м, 2H), 2,04 (с, 3H).

ПРИКЛАД 281

7-(4-метил-2-((1E)-проп-1-еніл)піридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 11,24 (с, 1H), 8,65 (д, J=5,83 Гц, 1H), 8,25-8,28 (м, 1H), 7,82-7,88 (м, 2H), 7,70 (д, J=5,83 Гц, 1H), 7,45-7,55 (м, 3H), 7,39 (т, J=7,98 Гц, 1H), 7,14-7,18 (м, 1H), 7,05 (д, J=7,14 Гц, 1H), 6,90 (д, J=7,36 Гц, 1H), 6,16-6,29 (м, 2H), 6,82 (дд, J=15,65, 6,75 Гц, 1H), 5,92 (дд, J=15,65, 1,53 Гц, 1H), 4,22 (т, J=6,14 Гц, 2H), 3,36-3,40 (м, 2H), 2,22-2,28 (м, 2H), 2,04 (с, 3H), 1,69-1,71 (м, 3H).

ПРИКЛАД 282

7-(2-етил-4-метилпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 11,30 (с, 1H), 8,76 (д, J=5,83 Гц, 1H), 8,25-8,27 (м, 1H), 7,84-7,88 (м, 2H), 7,45-7,56 (м, 3H), 7,39 (т, J=7,83 Гц, 1H), 7,12-7,20 (м, 2H), 6,90 (д, J=7,67 Гц, 1H), 4,22 (т, J=6,14 Гц, 2H), 3,36-3,40 (м, 2H), 2,59-2,65 (м, 1H), 2,42-2,48 (м, 1H), 2,21-2,27 (м, 2H), 2,10 (с, 3H).

ПРИКЛАД 283

7-(3,5-диметил-1-(піридин-3-ілметил)-1H-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 10,95 (с, 1H), 8,60-8,65 (м, 2H), 8,24-8,26 (м, 1H), 7,94 (д, J=7,98 Гц, 1H), 7,85-7,87 (м, 1H), 7,62-7,67 (м, 2H), 7,44-7,53 (м, 3H), 7,39 (т, J=7,98 Гц, 1H), 7,03-7,08 (м, 2H), 6,91 (д, J=7,36 Гц, 1H), 5,41 (с, 2H), 4,21 (т, J=5,98 Гц, 2H), 3,34-3,38 (м, 2H), 2,21-2,26 (м, 2H), 2,08 (с, 3H), 2,02 (с, 3H).

ПРИКЛАД 284

7-(2-ізопропеніл-4-метилпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 11,26 (с, 1H), 8,71 (д, J=5,52 Гц, 1H), 8,26-8,28 (м, 1H), 7,80-7,88 (м, 2H), 7,77 (д, J=7,67 Гц, 1H), 7,45-7,55 (м, 3H), 7,38 (т, J=7,83 Гц, 1H), 7,04-7,11 (м, 2H), 6,88 (д, J=7,37 Гц, 1H), 5,15 (с, 1H), 5,13 (с, 1H), 4,20 (т, J=6,14 Гц, 2H), 3,33-3,37 (м, 2H), 2,21-2,26 (м, 2H), 2,10 (с, 3H), 1,67 (с, 3H).

ПРИКЛАД 285

7-(4-метил-2-пентилпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 11,23 (с, 1H), 8,74 (д, J=5,83 Гц, 1H), 8,25-8,28 (м, 1H), 7,83-7,88 (м, 3H), 7,45-7,55 (м, 3H), 7,38 (т, J=7,83 Гц, 1H), 7,11-7,18 (м, 2H), 6,87 (д, J=7,67 Гц, 1H), 4,20 (т, J=6,19 Гц, 2H), 3,33-3,37 (м, 2H), 2,54-2,62 (м, 1H), 2,29-2,46 (м, 1H), 2,22-2,28 (м, 2H), 2,12 (с, 3H), 1,35-1,40 (м, 2H), 0,88-0,99 (м, 4H), 0,58 (т, J=7,06 Гц, 3H).

ПРИКЛАД 286

7-(4-метил-2-пропілпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 11,30 (с, 1H), 8,73 (д, J=5,83 Гц, 1H), 8,26-8,28 (м, 1H), 7,82-7,88 (м, 2H), 7,79 (д, J=5,83 Гц, 1H), 7,45-7,55 (м, 3H), 7,38 (т, J=7,83 Гц, 1H), 7,10-7,18 (м, 2H), 6,89 (д, J=7,36 Гц, 1H), 4,21 (т, J=5,98 Гц, 2H), 3,37-3,40 (м, 2H), 2,54-2,64 (м, 1H), 2,34-2,42 (м, 1H), 2,22-2,28 (м, 2H), 2,09 (с, 3H), 1,39-1,49 (м, 2H), 0,65 (т, J=7,36 Гц, 3H).

ПРИКЛАД 287

7-(2-ізопропіл-4-метилпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 11,26 (с, 1H), 8,65 (д, J=5,83 Гц, 1H), 8,22-8,24 (м, 1H), 7,84-7,86 (м, 1H), 7,80 (д, J=7,98 Гц, 1H), 7,72 (д, J=6,14 Гц, 1H), 7,35-7,45 (м, 3H), 7,37 (т, J=7,98 Гц, 1H), 7,15 (т, J=7,52 Гц, 1H), 7,07-7,08 (м, 1H), 6,88 (д, J=7,36 Гц, 1H), 4,20 (т, J=5,98 Гц, 2H), 3,36 (м, 2H), 2,67-2,70 (м, 2H), 2,22-2,28 (м, 2H), 2,02 (с, 3H), 1,12 (дд, J=6,75, 5,22 Гц, 6H).

ПРИКЛАД 288

7-(3,5-діізопропіл-1-метил-1H-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 10,43 (с, 1H), 8,27-8,29 (м, 1H), 7,86-7,88 (м, 1H), 7,66 (д, J=7,06 Гц, 1H), 7,45-7,55 (м, 3H), 7,36-7,40 (м, 1H), 6,99-7,06 (м, 2H), 6,89 (д, J=7,06 Гц, 1H), 4,20 (т, J=6,14 Гц, 2H), 3,82 (с, 3H), 3,32-3,36 (м, 2H), 2,89-2,94 (м, 1H), 2,43-2,50 (м, 1H), 2,19-2,26 (м, 2H), 1,03-1,06 (м, 6H), 0,96 (д, J=6,75, Гц, 3H), 0,91 (д, J=7,06 Гц, 3H).

ПРИКЛАД 289

7-(5-карбокси-1,3-диметил-1H-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 10,61 (с, 1H), 8,28-8,30 (м, 1H), 7,86-7,88 (м, 1H), 7,64 (д, J=7,06, 2,15 Гц, 1H), 7,45-7,55 (м, 3H), 7,40 (т, J=7,83 Гц, 1H), 7,00-7,05 (м, 2H), 6,92 (д, J=7,36 Гц, 1H), 4,22 (т, J=6,14 Гц, 2H), 4,09 (с, 3H), 3,33-3,36 (м, 2H), 2,21-2,26 (м, 2H), 1,92 (с, 3H).

ПРИКЛАД 290

7-(4-метил-2-(2-метилпроп-1-еніл)піридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 11,20 (с, 1H), 8,70 (д, J=5,83 Гц, 1H), 8,25-8,27 (м, 1H), 7,86-7,88 (м, 1H), 7,80 (д, J=7,67 Гц, 1H), 7,45-7,55 (м, 3H), 7,38 (т, J=7,83 Гц, 1H), 7,11-7,14 (м, 1H), 7,04-7,06 (м, 1H), 6,88 (д, J=7,67 Гц, 1H), 5,78 (с, 1H), 4,20 (т, J=5,98 Гц, 2H), 3,33-3,36 (м, 2H), 2,20-2,28 (м, 2H), 2,11 (с, 3H), 1,78 (с, 3H), 1,60 (с, 3H).

ПРИКЛАД 291

7-(4-карбокси-1-феніл-1H-піразол-5-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 11,40 (с, 1H), 8,27-8,29 (м, 1H), 8,16 (с, 1H), 7,85-7,88 (м, 1H), 7,69 (д, J=7,98 Гц, 1H), 7,44-7,55 (м, 3H), 7,38 (т, J=7,98 Гц, 1H), 7,19-7,23 (м, 5H), 7,02 (д, J=6,75 Гц, 1H), 6,93 (т, J=7,67 Гц, 1H), 6,87 (д, J=7,36 Гц, 1H), 5,78 (с, 1H), 4,16 (т, J=6,14 Гц, 2H), 3,28-3,34 (м, 2H), 2,16-2,24 (м, 2H).

ПРИКЛАД 292

7-(2-ізобутил-4-метилпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота
¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 11,31 (с, 1H), 8,75 (д, J=6,14 Гц, 1H), 8,26-8,28 (м, 1H), 7,83-7,88 (м, 1H), 7,44-7,56 (м, 3H), 7,37 (т, J=7,98 Гц, 1H), 7,12-7,17 (м, 2H), 6,87 (д, J=7,36 Гц, 1H), 4,19 (т, J=6,14 Гц, 2H), 3,28-3,34 (м, 2H), 2,54-2,61 (м, 1H), 2,22-2,32 (м, 3H), 2,12 (м, 3H), 1,72-1,78 (м, 1H), 0,66 (д, J=6,44 Гц, 3H), 0,62 (д, J=6,75 Гц, 3H).

ПРИКЛАД 293

7-(4-метил-2,3'-біпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 11,32 (с, 1H), 8,71 (д, J=5,22 Гц, 1H), 8,43 (с, 1H), 8,36 (д, J=6,1 Гц, 1H), 8,25-8,27 (м, 1H), 7,85-7,88 (м, 1H), 7,71 (д, J=7,98 Гц, 1H), 7,61-7,65 (м, 2H), 7,44-7,55 (м, 3H), 7,38 (т, J=7,98 Гц, 1H), 7,26 (дд, J=7,98, 5,22 Гц, 1H), 6,93-6,96 (м, 2H), 6,86 (д, J=7,36 Гц, 1H), 4,14 (т, J=6,14 Гц, 2H), 3,30-3,34 (м, 2H), 2,16-2,20 (м, 2H), 2,06 (с, 3H).

ПРИКЛАД 294

7-(2-(4-метоксифеніл)-4-метилпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 11,28 (с, 1H), 8,75 (д, J=5,83 Гц, 1H), 8,25-8,27 (м, 1H), 7,83-7,88 (м, 2H), 7,68 (дд, J=7,06, 2,15 Гц, 1H), 7,44-7,55 (м, 3H), 7,37 (т, J=7,83 Гц, 1H), 7,20 (д, J=8,59 Гц, 1H), 6,94-6,99 (м, 2H), 6,85 (д, J=7,67 Гц, 1H), 6,74 (д, J=8,59 Гц, 1H), 4,14 (т, J=6,29 Гц, 2H), 3,63 (с, 3H), 3,31-3,35 (м, 2H), 2,18-2,24 (м, 2H), 2,11 (с, 3H).

ПРИКЛАД 295

7-(4-метил-2-(1-метил-1H-піразол-4-іл)піридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 11,28 (с, 1H), 8,66 (д, J=5,19 Гц, 1H), 8,27-8,29 (м, 1H), 7,84-7,88 (м, 2H), 7,86 (с, 1H), 7,45-7,55 (м, 3H), 7,37 (т, J=7,83 Гц, 1H), 7,37-7,40 (м, 1H), 7,07-7,15 (м, 2H), 6,88 (д, J=7,63 Гц, 1H), 6,78 (с, 1H), 4,18 (т, J=6,26 Гц, 2H), 3,63 (с, 3H), 3,29-3,33 (м, 2H), 2,21-2,27 (м, 2H), 2,08 (с, 3H).

ПРИКЛАД 296

7-(3-(гідроксиметил)-1,5-диметил-1H-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

ПРИКЛАД 296A

Етил 4-бром-5-метил-1H-піразол-3-карбоксилат

Етил 5-метил-1H-піразол-3-карбоксилат (3,24 г) у CH₃CN (25 мл) обробляли за допомогою N-бромсукциніміду (3,92 г) при 0°C. Розчин перемішували при кімнатній температурі протягом 2 годин. Розчинник видаляли і залишок очищали флеш-хроматографією на силікагелі (етилацетат у гексані) з одержанням зазначеної у заголовку сполуки. ¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 13,61 (с, 1H), 4,27 (кв, J=6,75 Гц, 2H), 2,21 (с, 3H), 1,28 (т, J=7,06 Гц, 3H).

ПРИКЛАД 296B

Етил 4-бром-1,5-диметил-1H-піразол-3-карбоксилат

Сполуку Прикладу 296A (2,33 г) в N, N-диметилформаміді обробляли за допомогою 60 % NaN (0,8 г) при 0°C. Через 10 хвилин до цього розчину додавали йодметан (1,703 г). Розчин перемішували при кімнатній температурі протягом 3 годин. Водна обробка з подальшим сушінням, фільтруванням і флеш-хроматографією (етилацетат у гексані) давали зазначену у заголовку сполуку. ¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): 4,26 (кв, J=7,06 Гц, 2H), 3,86 (с, 3H), 2,27 (с, 3H), 1,28 (т, J=7,06 Гц, 3H).

ПРИКЛАД 296C

(4-бром-1,5-диметил-1H-піразол-3-іл)метанол

Сполуку Прикладу 296В (1,43 г) у тетрагідрофурані (10 мл) обробляли за допомогою 1н розчину LiAlH_4 у тетрагідрофурані (5,79 мл) при 0°C . Розчин перемішували протягом 10 хвилин. Водна обробка з подальшою флеш-хроматографією (етилацетат у гексані) давали зазначену у заголовку сполуку. ^1H ЯМР (500 МГц, DMSO-d_6): 4,91 (т, $J=5,68$ Гц, 1Н), 4,30 (д, $J=5,52$ Гц, 2Н), 3,73 (с, 3Н), 2,21 (с, 3Н).

ПРИКЛАД 296D

Метил 7-(3-(гідроксиметил)-1,5-диметил-1Н-піразол-4-іл)-3-(3-(нафталін-1-ілокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбоксилат

Зазначену у заголовку сполуку синтезували відповідно до процедури Прикладу 192А із заміщенням 2-фтор-4-йод-5-метилпіридину сполукою Прикладу 296С. ^1H ЯМР (500 МГц, DMSO-d_6): δ 11,06 (с, 1Н), 8,25-8,26 (м, 1Н), 7,86-7,88 (м, 1Н), 7,65 (дд, $J=7,02$, 1,83 Гц, 1Н), 7,45-7,55 (м, 3Н), 7,39 (т, $J=7,93$ Гц, 1Н), 7,05-7,09 (м, 2Н), 6,91 (д, $J=7,63$ Гц, 1Н), 6,78 (с, 1Н), 4,24 (с, 2Н), 4,21 (т, $J=6,1$ Гц, 2Н), 3,83 (с, 3Н), 3,34-3,37 (м, 2Н), 2,21-2,26 (м, 2Н), 2,15 (с, 3Н).

ПРИКЛАД 296E

7-(3-(гідроксиметил)-1,5-диметил-1Н-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

Зазначену у заголовку сполуку синтезували відповідно до процедури Прикладу 175В із заміщенням сполуки Прикладу 175А сполукою Прикладу 296D. ^1H ЯМР (500 МГц, DMSO-d_6): δ 11,06 (с, 1Н), 8,25-8,26 (м, 1Н), 7,86-7,88 (м, 1Н), 7,65 (дд, $J=7,02$, 1,83 Гц, 1Н), 7,45-7,55 (м, 3Н), 7,39 (т, $J=7,93$ Гц, 1Н), 7,05-7,09 (м, 2Н), 6,91 (д, $J=7,63$ Гц, 1Н), 6,78 (с, 1Н), 4,24 (с, 2Н), 4,21 (т, $J=6,1$ Гц, 2Н), 3,83 (с, 3Н), 3,34-3,37 (м, 2Н), 2,21-2,26 (м, 2Н), 2,15 (с, 3Н).

ПРИКЛАД 297

3-бром-7-(1,3-диметил-5-феніл-1Н-піразол-4-іл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

ПРИКЛАД 297A

4-бром-1,3-диметил-5-феніл-1Н-піразол

Зазначену у заголовку сполуку синтезували відповідно до процедури Прикладу 296В із заміщенням етил 5-метил-1Н-піразол-3-карбоксилату 5-метил-3-феніл-1Н-піразолом. ^1H ЯМР (500 МГц, DMSO-d_6): δ 7,46-7,56 (м, 5Н), 3,70 (с, 3Н), 2,18 (с, 3Н).

ПРИКЛАД 297B

Етиловий ефір 7-(4,4,5,5-тетраметил-(1,3,2)діоксаборолан-2-іл)-1Н-індол-2-карбонової кислоти

Суміш етил 1Н-індол-2-карбоксилату (1,89 г), 5,5'-ди-трет-бутил-2,2'-біпіридину (0,081 г) та $(\text{Ir}(\text{OMe})(\text{COD}))_2$ (0,152 г) у гексані (30 мл) обробляли за допомогою 4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-діоксаборолану (1,66 г) через шприц. Реакційну суміш дегазували шляхом повторення три рази циклу вакуум/азот. Реакційну суміш нагрівали при 62°C протягом 12 годин. Після цього розчинник видаляли і залишок очищали флеш-хроматографією на силікагелі, елюючи сумішшю 1:9 етилацетат/гексан, з одержанням зазначеної у заголовку сполуки. ^1H ЯМР (500 МГц, DMSO-d_6): 9,75 (с, 1Н), 7,87 (д, $J=7,93$ Гц, 1Н), 7,64-7,65 (м, 1Н), 7,24 (с, 1Н), 7,16-7,17 (м, 1Н), 4,36 (кв, $J=7,02$ Гц, 2Н), 1,38 (с, 12Н), 1,35 (кв, $J=7,02$ Гц, 3Н).

ПРИКЛАД 297C

Метильовий ефір 7-(1,3-диметил-5-феніл-1Н-піразол-4-іл)-1Н-індол-2-карбонової кислоти

Зазначену у заголовку сполуку синтезували відповідно до процедури Прикладу 192 із заміщенням сполуки Прикладу 43А і 2-фтор-4-йод-5-метилпіридину сполукою Прикладу 297В і сполукою Прикладу 297А, відповідно.

ПРИКЛАД 297D

3-бром-7-(1,3-диметил-5-феніл-1Н-піразол-4-іл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

Суміш сполуки Прикладу 279С (60 мг) і N-бромсукцинімиду (32 мг) в ацетонітрилі (2 мл) перемішували протягом 3 годин при кімнатній температурі. Бажаний продукт очищали флеш-хроматографією на силікагелі. Потім його гідролізували за допомогою 1,0 н LiOH і очищали препаративною ВЕРХ з одержанням зазначеної у заголовку сполуки. ^1H ЯМР (500 МГц, DMSO-d_6): δ 13,22 (с, 1Н), 11,44 (с, 1Н), 7,41 (д, $J=7,93$ Гц, 1Н), 7,24-7,30 (м, 5Н), 7,11-7,14 (м, 2Н), 7,04 (д, $J=7,02$ Гц, 1Н), 3,73 (с, 3Н), 1,98 (с, 3Н).

ПРИКЛАД 298

7-(1,3-диметил-5-(феноксиметил)-1Н-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

^1H ЯМР (500 МГц, DMSO-d_6): δ 12,96 (с, 1Н), 10,45 (с, 1Н), 8,23-8,25 (м, 2Н), 7,85-7,87 (м, 2Н), 7,65 (д, $J=7,93$ Гц, 1Н), 7,44-7,54 (м, 3Н), 7,38 (т, $J=7,93$ Гц, 1Н), 7,17-7,20 (м, 3Н), 7,10 (д, $J=7,02$ Гц, 1Н), 7,01-7,04 (м, 1Н), 6,85-6,90 (м, 4Н), 4,78 (с, 2Н), 4,19 (т, $J=6,1$ Гц, 2Н), 3,82 (с, 3Н), 3,32-3,35 (м, 2Н), 2,19-2,24 (м, 2Н), 2,09 (с, 3Н).

ПРИКЛАД 299

7-(1-метил-1Н-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 10,21 (с, 1H), 8,29 (с, 1H), 8,22-8,24 (м, 1H), 7,84-7,87 (м, 2H), 7,59 (д, J=7,98 Гц, 1H), 7,44-7,54 (м, 3H), 7,39 (т, J=7,67 Гц, 1H), 7,33-7,35 (м, 1H), 7,01-7,04 (м, 1H), 6,88 (д, J=7,67 Гц, 1H), 4,18 (т, J=5,98 Гц, 2H), 3,93 (с, 3H), 3,35 (т, J=7,36 Гц, 2H), 2,19-2,26 (м, 2H).

5

ПРИКЛАД 300

3-бром-7-(2-((Е)-2-циклогексилвініл)-4-метилпіридин-3-іл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 11,90 (с, 1H), 8,61 (д, J=5,52 Гц, 1H), 7,67 (д, J=7,98 Гц, 1H), 7,62 (с, 1H), 7,33-7,36 (м, 1H), 7,17 (д, J=7,06 Гц, 1H), 6,70 (дд, J=15,8, 7,21 Гц, 1H), 5,81 (д, J=15,65 Гц, 1H), 2,04 (с, 3H), 1,95 (м, 2H), 1,43-1,54 (м, 5H), 0,99-1,16 (м, 5H).

10

ПРИКЛАД 301

7-(3-ізопропіл-1-метил-5-(феноксиметил)-1Н-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 10,33 (с, 1H), 8,23-8,25 (м, 1H), 7,85-7,87 (м, 1H), 7,69 (дд, J=7,32, 1,53 Гц, 1H), 7,44-7,54 (м, 3H), 7,37 (т, J=7,98 Гц, 1H), 7,18 (т, J=7,93 Гц, 1H), 7,05-7,09 (м, 2H), 6,89 (т, J=8,09 Гц, 1H), 6,83 (т, J=7,93 Гц, 1H), 4,85-4,87 (м, 1H), 4,75-4,77 (м, 1H), 4,19 (т, J=6,26 Гц, 2H), 3,87 (с, 3H), 3,32-3,35 (м, 2H), 2,73-2,79 (м, 1H), 2,19-2,26 (м, 2H), 1,09 (д, J=6,71 Гц, 3H), 1,06 (д, J=7,02 Гц, 3H).

15

ПРИКЛАД 302

7-(1,5-диметил-3-(феноксиметил)-1Н-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

Суміш сполуки Прикладу 296 (0,060 г), фенолу (13 мг) і трифенілфосфіну (48,8 мг) у тетрагідрофурані (2 мл) охолоджували до 0°C. До цього розчину додавали (Е)-ди-трет-бутилдіазен-1,2-дикарбоксилат (34,3 мг). Розчин перемішували при кімнатній температурі протягом 15 годин. Розчинник видаляли і залишок гідролізували в 1,0 н LiOH/діоксан. Неочищену кислоту очищали за допомогою ЗФ-ВЕРХ з одержанням зазначеної у заголовку сполуки. ¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 10,40 (с, 1H), 8,22-8,24 (м, 1H), 7,85-7,87 (м, 1H), 7,65 (д, J=7,67 Гц, 1H), 7,44-7,54 (м, 3H), 7,37 (т, J=7,98 Гц, 1H), 7,16-7,20 (м, 2H), 7,09-7,11 (м, 1H), 7,01-7,05 (м, 1H), 6,84-6,90 (м, 4H), 4,48 (с, 2H), 4,19 (т, J=6,41 Гц, 2H), 3,82 (с, 3H), 3,31-3,35 (м, 2H), 2,73-2,79 (м, 1H), 2,18-2,25 (м, 2H), 2,09 (с, 3H).

25

30

ПРИКЛАД 303

7-(4-(анілінокарбоніл)-1-феніл-1Н-піразол-5-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 13,01 (с, 1H), 11,37 (с, 1H), 9,45 (с, 1H), 8,49 (с, 1H), 8,27-8,29 (м, 1H), 7,86-7,88 (м, 1H), 7,73 (д, J=7,93 Гц, 1H), 7,44-7,54 (м, 5H), 7,21-7,24 (м, 7H), 7,07 (д, J=7,32 Гц, 1H), 6,94-7,00 (м, 2H), 6,87 (д, J=7,63 Гц, 1H), 4,16 (т, J=6,1 Гц, 2H), 3,31-3,35 (м, 2H), 2,18-2,23 (м, 2H).

35

ПРИКЛАД 304

7-(3-((3-хлорфенокси)метил)-1,5-диметил-1Н-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 10,41 (с, 1H), 8,22-8,24 (м, 1H), 7,85-7,87 (м, 1H), 7,65 (д, J=7,67 Гц, 1H), 7,44-7,54 (м, 3H), 7,37 (т, J=7,98 Гц, 1H), 7,19 (т, J=8,13 Гц, 1H), 7,07-7,09 (м, 1H), 7,01-7,05 (м, 1H), 6,84-6,95 (м, 4H), 4,82 (с, 2H), 4,19 (т, J=6,14 Гц, 2H), 3,82 (с, 3H), 3,32-3,36 (м, 2H), 2,19-2,25 (м, 2H), 2,09 (с, 3H).

40

45

ПРИКЛАД 305

7-(1,5-диметил-3-((3-феноксифенокси)метил)-1Н-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 10,43 (с, 1H), 8,23-8,25 (м, 1H), 7,85-7,87 (м, 1H), 7,64 (д, J=7,98 Гц, 1H), 7,34-7,54 (м, 6H), 6,95-7,18 (м, 6H), 6,89 (д, J=7,36 Гц, 1H), 6,67 (дд, J=8,29, 2,46 Гц, 1H), 6,57 (т, J=2,3 Гц, 1H), 6,46 (дд, J=8,13, 2,3 Гц, 1H), 4,78 (с, 2H), 4,19 (т, J=6,14 Гц, 2H), 3,80 (с, 3H), 3,31-3,35 (м, 2H), 2,17-2,25 (м, 2H), 2,08 (с, 3H).

50

ПРИКЛАД 306

3-бром-4-(2-((4-бром-1-нафтил)окси)етил)-7-(2-метилфеніл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 13,29 (с, 1H), 11,32 (с, 1H), 8,22 (д, J=8,29 Гц, 1H), 8,05 (д, J=8,59 Гц, 1H), 7,73 (д, J=8,29 Гц, 1H), 7,67-7,70 (м, 1H), 7,56-7,60 (м, 1H), 7,26-7,33 (м, 3H), 7,23 (д, J=7,06 Гц, 1H), 7,19 (д, J=7,36 Гц, 1H), 7,06 (д, J=7,36 Гц, 1H), 7,00 (д, J=8,29 Гц, 1H), 4,53 (т, J=6,9 Гц, 2H), 3,89 (шир, 2H), 3,12 (с, 3H).

55

ПРИКЛАД 307

7-(1,5-диметил-3-((4-морфолін-4-ілфенокси)метил)-1Н-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

60

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 10,39 (с, 1H), 8,22-8,24 (м, 1H), 7,85-7,87 (м, 1H), 7,66 (д, J=7,67 Гц, 1H), 7,44-7,54 (м, 3H), 7,37 (т, J=7,98 Гц, 1H), 7,02-7,11 (м, 2H), 6,79-6,89 (м, 5H), 4,73 (с, 2H), 4,19 (т, J=6,14 Гц, 2H), 3,81 (с, 3H), 3,71-3,73 (м, 4H), 3,34 (т, J=7,52 Гц, 2H), 3,01-3,02 (м, 4H), 2,18-2,26 (м, 2H), 2,09 (с, 3H).

5 ПРИКЛАД 308

7-(3-(((5-хлорпіридин-3-іл)окси)метил)-1,5-диметил-1H-піразол-4-іл)-3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 10,38 (с, 1H), 8,16-8,18 (м, 1H), 8,10 (д, J=2,4 Гц, 1H), 8,06 (д, J=2,15 Гц, 1H), 7,78-7,80 (м, 1H), 7,58 (д, J=7,36 Гц, 1H), 7,37-7,47 (м, 4H), 7,29-7,33 (м, 1H), 6,94-7,02 (м, 2H), 6,82 (д, J=7,06 Гц, 1H), 4,86 (с, 2H), 4,12 (т, J=6,14 Гц, 2H), 3,75 (с, 3H), 3,25-3,28 (м, 2H), 2,11-2,17 (м, 2H), 2,02 (с, 3H).

10 ПРИКЛАД 309

7-(3,5-диметил-1-(2-нітрофеніл)-1H-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 13,00 (с, 1H), 10,77 (с, 1H), 8,25-8,27 (м, 1H), 8,11 (д, J=7,63 Гц, 1H), 7,86-7,95 (м, 3H), 7,71-7,76 (м, 2H), 7,45-7,55 (м, 3H), 7,40 (т, J=7,78 Гц, 1H), 7,10-7,16 (м, 2H), 6,92 (д, J=7,63 Гц, 1H), 4,23 (т, J=6,1 Гц, 2H), 3,36-3,39 (м, 2H), 2,23-2,28 (м, 2H), 2,06 (с, 3H), 2,05 (с, 3H).

20 ПРИКЛАД 310

3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-((2-(фенілтіо)етил)аміно)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 11,15 (с, 1H), 8,21-8,23 (м, 1H), 7,85-7,87 (м, 1H), 7,43-7,53 (м, 3H), 7,32-7,40 (м, 5H), 7,21 (т, J=7,32 Гц, 1H), 6,91 (д, J=7,93 Гц, 1H), 6,86 (д, J=7,32 Гц, 1H), 6,77 (т, J=7,63 Гц, 1H), 6,24 (д, J=7,32 Гц, 1H), 4,14 (т, J=6,1 Гц, 2H), 3,42 ((т, J=6,87 Гц, 2H), 3,23-3,29 (м, 4H), 2,15-2,21 (м, 2H), 2,06 (с, 3H), 2,05 (с, 3H).

25 ПРИКЛАД 311

7-(3-((2-ціанофенокси)метил)-1,5-диметил-1H-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 12,94 (с, 1H), 10,62 (с, 1H), 8,23-8,24 (м, 1H), 7,86 (д, J=8,63 Гц, 1H), 7,64-7,66 (м, 2H), 7,44-7,54 (м, 4H), 7,39 (т, J=7,93 Гц, 1H), 7,22 (д, J=8,54 Гц, 1H), 7,18 (д, J=7,02 Гц, 1H), 6,99-7,03 (м, 2H), 6,89 (д, J=7,32 Гц, 1H), 5,07 (шир, 1H), 4,83 (шир, 1H), 4,19 (т, J=6,1 Гц, 2H), 3,83 (с, 3H), 3,35 (т, J=7,48 Гц, 2H), 2,19-2,14 (м, 2H), 2,08 (с, 3H).

30 ПРИКЛАД 312

7-(3-((4-(4-ацетилпіперазин-1-іл)фенокси)метил)-1,5-диметил-1H-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 10,39 (с, 1H), 8,22-8,24 (м, 1H), 7,85-7,87 (м, 2H), 7,65 (д, J=7,98 Гц, 1H), 7,44-7,54 (м, 3H), 7,38 (т, J=7,83 Гц, 1H), 7,09-7,10 (м, 1H), 7,03 (т, J=7,52 Гц, 1H), 6,80-7,91 (м, 5H), 4,73 (с, 2H), 4,19 (т, J=6,14 Гц, 2H), 3,81 (с, 3H), 3,56-3,57 (м, 2H), 3,34 (т, J=7,52 Гц, 2H), 2,99-3,05 (м, 4H), 2,18-2,15 (м, 2H), 2,09 (с, 3H), 2,02 (с, 3H).

40 ПРИКЛАД 313

3-бром-7-(2-метилфеніл)-4-(2-(1-нафтилокси)етил)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 11,36 (с, 1H), 8,15 (д, J=8,24 Гц, 1H), 7,85 (д, J=7,93 Гц, 1H), 7,45-7,53 (м, 3H), 7,39 (т, J=7,83 Гц, 1H), 7,28-7,35 (м, 2H), 7,24-7,28 (м, 2H), 7,20 (д, J=7,32 Гц, 1H), 7,07 (д, J=7,32 Гц, 1H), 7,01 (д, J=7,63 Гц, 1H), 4,52 (т, J=6,87 Гц, 2H), 3,92 (шир, 1H), 3,85 (шир, 1H), 3,34 (т, J=7,52 Гц, 2H), 2,03 (с, 3H).

45 ПРИКЛАД 314

7-(1-(2-амінофеніл)-3,5-диметил-1H-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 11,01 (с, 1H), 8,25-8,27 (м, 1H), 7,86-7,88 (м, 3H), 7,68 (д, J=7,63 Гц, 1H), 7,45-7,55 (м, 3H), 7,39 (т, J=7,93 Гц, 1H), 7,07-7,20 (м, 4H), 6,91 (д, J=7,32 Гц, 1H), 6,96 (д, J=7,93 Гц, 1H), 6,67 (т, J=7,48 Гц, 1H), 4,22 (т, J=6,1 Гц, 2H), 3,37 (т, J=7,48 Гц, 2H), 2,22-2,29 (м, 2H), 2,09 (с, 3H), 1,88 (с, 3H).

50 ПРИКЛАД 315

7-(3-(1H-імідазол-1-ілметил)-1,5-диметил-1H-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 13,01 (с, 1H), 10,88 (с, 1H), 8,45 (с, 1H), 8,25-8,27 (м, 1H), 7,86-7,88 (м, 1H), 7,68 (д, J=7,93 Гц, 1H), 7,37-7,55 (м, 6H), 7,96-7,05 (м, 2H), 5,18-5,27 (м, 2H), 4,20 (т, J=6,1 Гц, 2H), 3,81 (с, 3H), 3,34-3,37 (м, 2H), 2,19-2,26 (м, 2H), 2,05 (с, 3H).

55 ПРИКЛАД 316

7-(2-метилфеніл)-4-(2-(1-нафтилокси)етил)-3-вініл-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 12,92 (с, 1H), 10,66 (с, 1H), 8,04 (д, J=8,24 Гц, 1H), 7,84 (д, J=7,93 Гц, 1H), 7,43-7,51 (м, 3H), 7,38 (т, J=7,78 Гц, 1H), 7,26-7,33 (м, 4H), 7,22 (т, J=7,48 Гц, 1H), 7,18 (д, J=7,32 Гц, 1H), 7,03 (д, J=7,32 Гц, 1H), 6,99 (д, J=7,32 Гц, 1H), 5,47-5,53 (м, 2H), 4,41 (т, J=6,87 Гц, 2H), 3,86 (шир, 2H), 2,05 (с, 3H).

5 ПРИКЛАД 317

7-(4-((бензиламіно)карбоніл)-1-феніл-1H-піразол-5-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 11,22 (с, 1H), 8,22 (с, 1H), 8,20 (д, J=4,3 Гц, 1H), 7,88 (т, J=6,14 Гц, 1H), 7,78-7,81 (м, 1H), 7,61 (д, J=7,98 Гц, 1H), 7,37-7,48 (м, 3H), 7,30 (т, J=7,83 Гц, 1H), 7,09-7,17 (м, 8H), 7,00 (д, J=7,06 Гц, 1H), 6,96 (д, J=7,36 Гц, 1H), 6,92-6,96 (м, 1H), 6,78 (д, J=7,67 Гц, 1H), 4,21-4,23 (м, 2H), 4,07 (т, J=6,14 Гц, 2H), 3,24 (м, 2H), 2,18-2,25 (м, 2H).

10 ПРИКЛАД 318

3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(1-феніл-4-(((3-піролідин-1-ілпропіл)аміно)карбоніл)-1H-піразол-5-іл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 11,26 (с, 1H), 9,24 (с, 1H), 8,27-8,29 (м, 1H), 8,10 (т, J=5,98 Гц, 1H), 7,86-7,88 (м, 5H), 7,70 (д, J=7,36 Гц, 1H), 7,45-7,56 (м, 3H), 7,39 (т, J=7,98 Гц, 1H), 7,16-7,25 (м, 8H), 6,87-6,99 (м, 3H), 4,18 (т, J=5,98 Гц, 2H), 3,17-3,19 (м, 2H), 3,00 (т, J=6,9 Гц, 1H), 2,82 (шир, 1H), 2,17-2,23 (м, 2H), 1,72-2,08 (м, 6H).

20 ПРИКЛАД 319

7-(4,6-диметилпіримідин-5-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 11,37 (с, 1H), 8,95 (с, 1H), 8,26-8,28 (м, 1H), 7,86-7,88 (м, 1H), 7,77 (д, J=7,67 Гц, 1H), 7,45-7,56 (м, 3H), 7,39 (т, J=7,98 Гц, 1H), 7,06-7,14 (м, 2H), 6,90 (д, J=7,67 Гц, 1H), 4,22 (т, J=6,14 Гц, 2H), 3,35-3,39 (м, 2H), 2,22-2,28 (м, 2H), 2,08 (с, 6H).

25 ПРИКЛАД 320

7-(4,6-диметилпіримідин-5-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1-(піридин-3-ілметил)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 8,86 (с, 1H), 8,48 (д, J=4,6 Гц, 1H), 8,26-8,28 (м, 1H), 7,94 (д, J=7,98 Гц, 1H), 7,87-7,89 (м, 1H), 7,67 (с, 1H), 7,46-7,56 (м, 3H), 7,42 (т, J=7,67 Гц, 1H), 7,35-7,39 (м, 1H), 7,19-7,23 (м, 1H), 7,02 (д, J=7,36 Гц, 1H), 6,97 (д, J=7,67 Гц, 1H), 6,94 (д, J=7,36 Гц, 1H), 5,31 (с, 2H), 4,29 (т, J=5,98 Гц, 2H), 3,42-3,46 (м, 2H), 2,28-2,35 (м, 2H), 1,78 (с, 6H).

30 ПРИКЛАД 321

7-(2-етил-4-метилпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1-(піридин-3-ілметил)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 8,61 (д, J=4,6 Гц, 1H), 8,43 (с, 1H), 8,25-8,27 (м, 1H), 7,96 (д, J=7,98 Гц, 1H), 7,87-7,89 (м, 1H), 7,61 (с, 1H), 7,46-7,56 (м, 4H), 7,41 (т, J=7,83 Гц, 1H), 7,20-7,26 (м, 1H), 7,02 (д, J=6,44 Гц, 1H), 6,93 (д, J=7,36 Гц, 1H), 6,86 (д, J=8,29 Гц, 1H), 5,13-5,37 (м, 2H), 4,28 (т, J=6,14 Гц, 2H), 3,42-3,46 (м, 2H), 2,19-2,25 (м, 2H), 1,92-2,08 (м, 2H), 1,81 (с, 3H), 0,87 (т, J=7,52 Гц, 3H).

40 ПРИКЛАД 322

7-(2-етил-4-метилпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1-(1,3-тіазол-4-ілметил)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 8,82 (д, J=1,84 Гц, 1H), 8,61 (д, J=5,52 Гц, 1H), 8,22-8,25 (м, 1H), 7,93 (д, J=7,67 Гц, 1H), 7,86-7,88 (м, 1H), 7,46-7,56 (м, 4H), 7,40 (т, J=7,83 Гц, 1H), 7,21 (т, J=7,52 Гц, 1H), 7,02 (д, J=6,75 Гц, 1H), 6,91 (д, J=7,36 Гц, 1H), 6,47 (с, 1H), 5,21-5,36 (м, 2H), 4,27 (т, J=5,98 Гц, 2H), 3,39-3,43 (м, 2H), 2,25-2,33 (м, 2H), 2,15-2,21 (м, 2H), 1,87 (с, 3H), 0,94 (т, J=7,52 Гц, 3H).

45 ПРИКЛАД 323

7-(2-хлор-4-((4-морфолін-4-ілфенокси)метил)піридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 11,50 (с, 1H), 8,47 (д, J=4,91 Гц, 1H), 8,26-8,29 (м, 1H), 7,85-7,88 (м, 1H), 7,77 (дд, J=7,06, 1,84, Гц, 1H), 7,57 (д, J=7,22, Гц, 1H), 7,44-7,55 (м, 3H), 7,37 (т, J=7,83 Гц, 1H), 7,07-7,12 (м, 2H), 6,87 (д, J=7,36 Гц, 1H), 6,77 (д, J=8,9 Гц, 2H), 6,63 (д, J=8,9 Гц, 2H), 4,72 (д, J=14,12 Гц, 1H), 4,50 (д, J=13,81 Гц, 1H), 4,20 (т, J=6,29 Гц, 2H), 3,65-3,68 (м, 4H), 3,35-3,39 (м, 2H), 2,90-2,92 (м, 4H), 2,21-2,27 (м, 2H).

50 ПРИКЛАД 324

7-(5-ізопропіл-1-метил-3-((4-морфолін-4-ілфенокси)метил)-1H-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 10,20 (с, 1H), 8,25-8,27 (м, 1H), 7,85-7,87 (м, 1H), 7,65 (дд, J=7,06, 2,15, Гц, 1H), 7,44-7,55 (м, 3H), 7,36 (т, J=7,98 Гц, 1H), 7,00-7,05 (м, 2H), 6,85 (д, J=7,67 Гц, 1H), 6,81 (д, J=8,59 Гц, 2H), 6,65 (д, J=8,9 Гц, 2H), 4,54-4,60 (м, 2H), 4,17 (т, J=6,29 Гц, 1H),

3,89 (с, 3H), 3,66-3,69 (м, 4H), 3,28-3,37 (м, 2H), 2,96-3,04 (м, 5H), 2,18-2,25 (м, 2H), 1,12 (д, J=7,06 Гц, 3H), 0,96 (д, J=7,06 Гц, 3H).

ПРИКЛАД 325

7-(3-ізопропіл-1-метил-5-((4-морфолін-4-ілфенокси)метил)-1H-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 10,20 (с, 1H), 8,23-8,25 (м, 1H), 7,85-7,87 (м, 1H), 7,69 (д, J=6,44, Гц, 1H), 7,44-7,55 (м, 3H), 7,37 (т, J=7,83 Гц, 1H), 7,03-7,10 (м, 2H), 6,88 (д, J=7,36 Гц, 1H), 6,81-6,83 (м, 2H), 6,72-6,75 (м, 2H), 4,69-4,82 (м, 2H), 4,19 (т, J=6,29 Гц, 1H), 3,87 (с, 3H), 3,69-3,72 (м, 4H), 3,32-3,36 (м, 2H), 2,97-2,99 (м, 4H), 2,72-2,79 (м, 1H), 2,18-2,25 (м, 2H), 1,08 (д, J=6,75 Гц, 3H), 1,06 (д, J=7,06 Гц, 3H).

ПРИКЛАД 326

7-(2-ізопропеніл-4-метилпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1-(піридин-2-ілметил)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 8,56 (д, J=5,22 Гц, 1H), 8,25-8,28 (м, 2H), 7,86-7,88 (м, 2H), 7,44-7,55 (м, 3H), 7,39 (т, J=7,98 Гц, 1H), 7,33 (д, J=4,6 Гц, 2H), 7,12-7,16 (м, 2H), 7,00 (д, J=7,06 Гц, 1H), 6,89 (д, J=7,36 Гц, 1H), 6,27 (д, J=7,98 Гц, 1H), 5,75 (д, J=17,8 Гц, 1H), 4,83-5,05 (м, 3H), 4,23 (т, J=6,29 Гц, 2H), 3,40 (т, J=7,52 Гц, 2H), 2,25-2,34 (м, 2H), 1,64 (с, 3H), 1,58 (с, 3H).

ПРИКЛАД 327

7-(1,5-диметил-3-((4-морфолін-4-ілфенокси)метил)-1H-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1-(піридин-3-ілметил)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 8,50 (д, J=4,6 Гц, 1H), 8,24-8,27 (м, 1H), 7,86-7,88 (м, 1H), 7,79-7,84 (м, 2H), 7,44-7,54 (м, 4H), 7,38-7,40 (м, 1H), 7,06-7,10 (м, 2H), 6,93-6,94 (м, 1H), 6,88 (д, J=7,36 Гц, 1H), 6,77 (д, J=9,21 Гц, 2H), 6,60 (д, J=9,21 Гц, 2H), 5,50-5,69 (м, 2H), 4,51 (з 2H), 4,22 (т, J=6,44 Гц, 2H), 3,64-3,66 (м, 7H), 3,35-3,43 (м, 2H), 2,90-2,92 (м, 4H), 2,23-2,29 (м, 2H), 1,47 (с, 3H).

ПРИКЛАД 328

7-(2-етил-4-((4-морфолін-4-ілфенокси)метил)піридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 11,40 (с, 1H), 8,84 (д, J=5,83 Гц, 1H), 8,25-8,27 (м, 1H), 7,84-7,89 (м, 4H), 7,44-7,55 (м, 3H), 7,37 (т, J=7,98 Гц, 1H), 7,14-7,21 (м, 2H), 6,87 (д, J=7,67 Гц, 1H), 6,77 (д, J=8,9 Гц, 2H), 6,64 (д, J=9,21 Гц, 2H), 4,87 (д, J=15,65 Гц, 1H), 4,52 (д, J=15,34 Гц, 1H), 4,20 (т, J=6,14 Гц, 2H), 3,66-3,68 (м, 7H), 3,36-3,39 (м, 2H), 2,89-2,92 (м, 4H), 2,59-2,62 (м, 1H), 2,24-2,48 (м, 1H), 2,21-2,28 (м, 2H), 1,03 (т, J=7,52 Гц, 3H).

ПРИКЛАД 329

7-(4-метил-2-піримідин-5-ілпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 11,36 (с, 1H), 8,99 (с, 1H), 8,72 (д, J=5,19 Гц, 1H), 8,54 (с, 2H), 8,26-8,28 (м, 1H), 7,86-7,88 (м, 1H), 7,68 (дд, J=7,32, 1,53 Гц, 1H), 7,60 (д, J=5,19 Гц, 1H), 7,45-7,55 (м, 3H), 7,38 (т, J=7,93 Гц, 1H), 6,96-7,01 (м, 2H), 6,86 (д, J=7,32 Гц, 1H), 4,14 (т, J=6,26 Гц, 2H), 3,26-3,37 (м, 2H), 2,16-2,22 (м, 2H), 2,06 (с, 3H).

ПРИКЛАД 330

7-(4-метил-6'-морфолін-4-іл-2,3'-біпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 13,11 (с, 1H), 11,33 (с, 1H), 8,78 (д, J=5,8 Гц, 1H), 8,25-8,27 (м, 1H), 8,01 (д, J=2,14 Гц, 1H), 7,82-7,86 (м, 2H), 7,72-7,75 (м, 1H), 7,45-7,55 (м, 3H), 7,34-7,39 (м, 2H), 7,03 (д, J=4,88 Гц, 2H), 6,86 (д, J=7,32 Гц, 1H), 6,61 (д, J=9,15 Гц, 1H), 4,16 (т, J=6,41 Гц, 2H), 3,32-3,39 (м, 10H), 2,18-2,24 (м, 2H), 2,10 (с, 3H).

ПРИКЛАД 331

7-(4,6-диметилпіримідин-5-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1-(піридин-2-ілметил)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 8,84 (с, 1H), 8,26-8,30 (м, 2H), 7,87-7,92 (м, 2H), 7,46-7,62 (м, 4H), 7,40 (т, J=7,93 Гц, 1H), 7,17-7,24 (м, 2H), 6,99 (д, J=6,1 Гц, 1H), 6,93 (д, J=7,63 Гц, 1H), 6,34 (д, J=7,93 Гц, 1H), 5,36 (с, 2H), 4,27 (т, J=6,1 Гц, 2H), 3,42-3,45 (м, 10H), 2,29-2,33 (м, 2H), 1,79 (с, 6H).

ПРИКЛАД 332

7-(4,6-диметилпіримідин-5-іл)-1-(2-(4-метилпіперазин-1-іл)-2-оксоетил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 13,27 (с, 1H), 9,94 (с, 1H), 9,02 (с, 1H), 8,26-8,28 (м, 1H), 7,86-7,89 (м, 2H), 7,46-7,56 (м, 3H), 7,40 (т, J=7,78 Гц, 1H), 7,16-7,19 (м, 1H), 7,03 (д, J=6,41 Гц, 1H),

6,92 (д, J=7,63 Гц, 1Н), 6,34 (д, J=7,93 Гц, 1Н), 4,24 (т, J=6,26 Гц, 2Н), 3,42-3,45 (м, 2Н), 2,64-2,81 (м, 7Н), 2,07-2,11 (м, 6Н).

ПРИКЛАД 333

1-(2-(диметиламіно)-2-оксоетил)-7-(4,6-диметилпіримідин-5-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹Н ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 8,98 (с, 1Н), 8,27-8,29 (м, 1Н), 7,84-7,89 (м, 2Н), 7,46-7,55 (м, 3Н), 7,40 (т, J=7,93 Гц, 1Н), 7,14-7,17 (м, 1Н), 7,01 (д, J=7,02 Гц, 1Н), 6,92 (д, J=7,32 Гц, 1Н), 4,92 (с, 2Н), 4,24 (т, J=6,1 Гц, 2Н), 3,36-3,39 (м, 2Н), 2,63 (с, 3Н), 2,41 (с, 3Н), 2,21-2,27 (м, 2Н), 2,08 (с, 6Н).

ПРИКЛАД 334

7-(3-((4-(1,1-діоксидотіоморфолін-4-іл)фенокси)метил)-1,5-диметил-1Н-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹Н ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 10,43 (с, 1Н), 8,98 (с, 1Н), 8,24 (д, J=7,93 Гц, 1Н), 7,85-7,87 (м, 2Н), 7,65 (д, J=7,93 Гц, 1Н), 7,44-7,54 (м, 3Н), 7,38 (т, J=7,93 Гц, 1Н), 7,02-7,11 (м, 2Н), 6,85-6,90 (м, 3Н), 6,87-6,90 (м, 2Н), 4,72 (с, 2Н), 4,19 (т, J=6,1 Гц, 2Н), 3,81 (с, 3Н), 3,54-3,56 (м, 2Н), 3,32-3,35 (м, 2Н), 3,38-3,10 (м, 4Н), 2,18-2,25 (м, 2Н), 2,09 (с, 3Н).

ПРИКЛАД 335

7-(4,6-диметилпіримідин-5-іл)-1-(2-морфолін-4-ілетил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹Н ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 9,04 (с, 1Н), 8,23-8,25 (м, 1Н), 7,86-7,91 (м, 2Н), 7,45-7,56 (м, 3Н), 7,40 (т, J=7,83 Гц, 1Н), 7,22 (т, J=7,67 Гц, 1Н), 7,11 (д, J=7,37 Гц, 1Н), 6,92 (д, J=7,36 Гц, 1Н), 4,23-4,33 (м, 4Н), 3,36-3,40 (м, 2Н), 2,84 (шир, 4Н), 2,18-2,25 (м, 2Н), 2,20-2,26 (м, 8Н).

ПРИКЛАД 336

7-(1,5-диметил-3-((4-піперазин-1-іл)фенокси)метил)-1Н-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹Н ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 10,40 (с, 1Н), 8,69 (с, 2Н), 8,22-8,24 (м, 1Н), 7,85-7,87 (м, 1Н), 7,65 (д, J=7,98 Гц, 1Н), 7,44-7,55 (м, 3Н), 7,38 (т, J=7,83 Гц, 1Н), 7,01-7,11 (м, 2Н), 6,89 (д, J=7,06 Гц, 1Н), 6,79-6,85 (м, 4Н), 4,72 (с, 2Н), 4,20 (т, J=6,14 Гц, 2Н), 3,81 (с, 3Н), 3,34 (т, J=7,52 Гц, 2Н), 3,15-3,19 (м, 8Н), 2,19-2,25 (м, 2Н), 2,09 (с, 3Н).

ПРИКЛАД 337

7-(3-((4-(4-ацетилпіперазин-1-іл)фенокси)метил)-1,5-диметил-1Н-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1-(піридин-3-ілметил)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹Н ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 8,51 (д, J=4,91 Гц, 1Н), 8,24-8,27 (м, 1Н), 7,79-7,89 (м, 3Н), 7,45-7,55 (м, 4Н), 7,38 (т, J=7,83 Гц, 1Н), 7,06-7,12 (м, 2Н), 6,93 (д, J=6,75 Гц, 1Н), 6,88 (д, J=7,36 Гц, 1Н), 6,80 (д, J=9,21 Гц, 2Н), 6,61 (д, J=9,21 Гц, 2Н), 5,50-5,65 (м, 2Н), 4,52 (с, 2Н), 4,22 (т, J=6,44 Гц, 2Н), 3,66 (с, 3Н), 3,37-3,53 (м, 6Н), 2,86-2,95 (м, 4Н), 2,23-2,30 (м, 2Н), 1,99 (с, 3Н), 1,47 (с, 3Н).

ПРИКЛАД 338

7-(4,6-диметилпіримідин-5-іл)-1-(2-(4-метилпіперазин-1-іл)етил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹Н ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 10,06 (с, 1Н), 9,00 (с, 1Н), 8,23-8,25 (м, 1Н), 7,84-7,88 (м, 2Н), 7,45-7,56 (м, 3Н), 7,40 (т, J=7,83 Гц, 1Н), 7,17-7,21 (м, 1Н), 7,08 (д, J=7,06 Гц, 1Н), 6,91 (д, J=7,67 Гц, 1Н), 4,23 (т, J=5,98 Гц, 2Н), 4,00-4,04 (м, 2Н), 3,25-3,36 (м, 4Н), 2,85 (шир, 2Н), 2,70 (с, 3Н), 2,18-2,25 (м, 10Н).

ПРИКЛАД 339

7-(3-((4-(4-трет-бутоксикарбоніл)піперазин-1-іл)фенокси)метил)-1,5-диметил-1Н-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹Н ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 10,38 (с, 1Н), 9,00 (с, 1Н), 8,22-8,24 (м, 1Н), 7,85-7,87 (м, 1Н), 7,65 (д, J=7,98 Гц, 1Н), 7,45-7,56 (м, 3Н), 7,37 (т, J=7,98 Гц, 1Н), 7,01-7,10 (м, 2Н), 6,78-6,89 (м, 5Н), 4,72 (с, 2Н), 4,19 (т, J=6,14 Гц, 2Н), 3,81 (с, 3Н), 3,42-3,45 (м, 4Н), 3,34 (т, J=7,36 Гц, 2Н), 2,94-2,97 (м, 2Н), 2,18-2,26 (м, 2Н), 2,09 (с, 3Н), 1,41 (с, 9Н).

ПРИКЛАД 340

1-(2-(диметиламіно)етил)-7-(4,6-диметилпіримідин-5-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹Н ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 8,96 (с, 1Н), 8,16-8,18 (м, 1Н), 7,79-7,84 (м, 2Н), 7,38-7,49 (м, 3Н), 7,33 (т, J=7,83 Гц, 1Н), 7,16 (т, J=7,52 Гц, 1Н), 7,04 (д, J=7,06 Гц, 1Н), 6,85 (д, J=7,67 Гц, 1Н), 4,16-4,23 (м, 4Н), 3,51 (шир, 6Н), 3,30-3,34 (м, 2Н), 2,77-2,81 (м, 2Н), 2,43 (м, 2Н), 2,13-2,26 (м, 8Н).

ПРИКЛАД 341

3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(4-(1Н-піразол-1-іл)феніл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆): δ 13,03 (с, 1H), 10,59 (с, 1H), 8,58 (д, 1H), 8,23 (м, 1H), 7,98 (ддд, 2H), 7,86 (м, 1H), 7,75 (м, 4H), 7,51 (м, 3H), 7,39 (м, 1H), 7,28 (м, 1H), 7,11 (м, 1H), 6,89 (м, 1H), 6,58 (м, 1H), 4,20 (т, 2H), 3,38 (т, 2H), 2,24 (м, 2H).

ПРИКЛАД 342

5 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2,3,4-трифторфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆): δ 13,05 (с, 1H), 11,23 (с, 1H), 8,25 (м, 1H), 7,86 (м, 1H), 7,77 (д, 1H), 7,51 (м, 2H), 7,38 (м, 3H), 7,28 (м, 1H), 7,18 (м, 1H), 7,08 (м, 1H), 6,89 (м, 1H), 4,19 (т, 2H), 3,37 (т, 2H), 2,24 (м, 2H).

ПРИКЛАД 343

10 7-(4-гідрокси-3-метоксифеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆): δ 13,01 (с, 1H), 10,23 (с, 1H), 9,10 (с, 1H), 8,23 (тд, 7,87 (м, 1H), 7,63 (д, 1H), 7,51 (м, 3H), 7,38 (м, 1H), 7,21 (дд, 1H), 7,12 (д, 1H), 7,05 (м, 2H), 6,90 (м, 2H), 4,18 (т, 2H), 3,83 (с, 3H), 3,36 (м, 2H), 2,23 (м, 2H).

ПРИКЛАД 344

15 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(3,4,5-триметоксифеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆): δ 13,00 (с, 1H), 10,58 (с, 1H), 8,24 (м, 1H), 7,87 (м, 1H), 7,67 (д, 1H), 7,52 (м, 2H), 7,41 (м, 2H), 7,26 (дд, 1H), 7,07 (дд, 1H), 6,89 (дд, 1H), 6,85 (с, 2H), 4,19 (т, 2H), 3,84 (с, 6H), 3,73 (с, 3H), 3,37 (м, 2H), 2,24 (м, 2H).

ПРИКЛАД 345

20 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(4-(трифторметокси)феніл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆): δ 13,05 (с, 1H), 10,78 (с, 1H), 8,23 (м, 1H), 7,87 (м, 1H), 7,72 (м, 3H), 7,51 (м, 5H), 7,38 (м, 1H), 7,24 (дд, 1H), 7,09 (м, 1H), 6,89 (м, 1H), 4,19 (т, 2H), 3,37 (м, 2H), 2,24 (м, 2H).

ПРИКЛАД 346

25 7-(2-метокси-5-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆): δ 12,97 (с, 1H), 9,97 (с, 1H), 8,25 (м, 1H), 7,87 (м, 1H), 7,67 (д, 1H), 7,51 (м, 3H), 7,40 (д, 1H), 7,21 (м, 1H), 7,12 (м, 2H), 7,04 (м, 2H), 6,90 (дд, 1H), 4,20 (т, 2H), 3,70 (с, 3H), 3,35 (м, 2H), 2,30 (с, 3H), 2,24 (м, 2H).

ПРИКЛАД 347

30 7-(3-фтор-4-метоксифеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆): δ 13,05 (с, 1H), 10,61 (с, 1H), 8,23 (м, 1H), 7,87 (м, 1H), 7,67 (д, 1H), 7,51 (м, 2H), 7,40 (м, 4H), 7,29 (т, 1H), 7,21 (дд, 1H), 7,06 (м, 1H), 6,89 (дд, 1H), 4,18 (т, 2H), 3,91 (с, 3H), 3,36 (м, 2H), 2,24 (м, 2H).

ПРИКЛАД 348

35 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(4-(5-оксо-2,5-дигідро-1H-піразол-3-іл)феніл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆): δ 12,94 (с, 1H), 12,22 (с, 1H), 10,55 (с, 1H), 9,74 (с, 1H), 8,23 (м, 1H), 7,87 (м, 1H), 7,81 (д, 2H), 7,70 (д, 1H), 7,66 (д, 2H), 7,52 (м, 2H), 7,45 (м, 1H), 7,39 (т, 1H), 7,28 (дд, 1H), 7,10 (м, 1H), 6,90 (д, 1H), 5,96 (с, 1H), 4,19 (т, 2H), 3,39 (м, 2H), 2,24 (м, 2H).

40 ПРИКЛАД 349

7-(3-(морфолін-4-ілметил)феніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆): δ 10,58 (с, 1H), 8,24 (м, 1H), 7,87 (м, 1H), 7,73 (м, 3H), 7,62 (т, 1H), 7,51 (м, 4H), 7,39 (м, 1H), 7,27 (дд, 1H), 7,12 (м, 1H), 6,89 (дд, 1H), 4,45 (с, 2H), 4,19 (т, 2H), 3,97 (м, 2H), 3,63 (т, 2H), 3,41 (м, 2H), 3,38 (м, 3H), 3,17 (м, 3H), 2,24 (м, 2H).

45 ПРИКЛАД 350

7-(4-(морфолін-4-ілметил)феніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆): δ 13,12 (с, 1H), 10,39 (с, 1H), 8,22 (м, 1H), 7,87 (м, 1H), 7,74 (д, 3H), 7,62 (д, 2H), 7,51 (м, 2H), 7,46 (м, 1H), 7,38 (м, 1H), 7,27 (дд, 1H), 7,12 (м, 1H), 6,89 (дд, 1H), 4,44 (с, 2H), 4,20 (т, 2H), 4,00 (м, 2H), 3,66 (т, 2H), 3,38 (м, 3H), 3,21 (м, 3H), 2,24 (м, 2H).

50 ПРИКЛАД 351

7-(4-ізопропокси-2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆): δ 12,92 (с, 1H), 10,37 (с, 1H), 8,25 (м, 1H), 7,87 (м, 1H), 7,66 (дд, 1H), 7,52 (м, 2H), 7,42 (м, 2H), 7,04 (м, 3H), 6,88 (м, 2H), 6,81 (дд, 1H), 4,65 (септет, 1H), 4,20 (т, 2H), 3,36 (м, 2H), 2,23 (м, 2H), 2,02 (с, 3H), 1,31 (д, 6H).

55 ПРИКЛАД 352

3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(4-(1H-піразол-5-іл)феніл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆): δ 13,01 (с, 1H), 10,46 (с, 1H), 8,24 (м, 1H), 7,94 (д, 2H), 7,87 (м, 1H), 7,71 (м, 4H), 7,50 (м, 3H), 7,39 (м, 1H), 7,28 (м, 1H), 7,10 (м, 1H), 6,89 (м, 1H), 6,78 (д, 1H), 4,20 (т, 2H), 3,38 (т, 2H), 2,25 (м, 2H).

60 ПРИКЛАД 354

7-(2,5-диметилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота
¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆): δ 12,93 (с, 1H), 10,36 (с, 1H), 8,24 (м, 1H), 7,87 (м, 1H), 7,68 (дд, 1H), 7,50 (м, 3H), 7,40 (д, 1H), 7,16 (м, 2H), 7,04 (м, 3H), 6,90 (д, 1H), 4,20 (т, 2H), 3,36 (м, 2H), 2,31 (с, 3H), 2,23 (м, 2H), 2,01 (с, 3H).

5 ПРИКЛАД 355

3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2,4,5-триметилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота
¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆): δ 12,91 (с, 1H), 10,25 (с, 1H), 8,24 (м, 1H), 7,87 (м, 1H), 7,66 (дд, 1H), 7,52 (м, 2H), 7,41 (м, 2H), 7,04 (м, 4H), 6,90 (м, 1H), 4,20 (т, 2H), 3,36 (м, 2H), 2,26 (с, 3H), 2,24 (м, 2H), 2,22 (с, 3H), 1,99 (с, 3H).

10 ПРИКЛАД 356

3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(3-(трифторметокси)феніл)-1H-індол-2-карбонова кислота
¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆): δ 13,05 (с, 1H), 10,80 (с, 1H), 8,21 (м, 1H), 7,86 (м, 1H), 7,73 (д, 1H), 7,62 (м, 2H), 7,47 (м, 6H), 7,26 (д, 1H), 7,10 (т, 1H), 6,89 (д, 1H), 4,19 (т, 2H), 3,37 (м, 2H), 2,22 (м, 2H).

15 ПРИКЛАД 357

7-(2-метил-4-пропоксифеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота
¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆): δ 12,92 (с, 1H), 10,38 (с, 1H), 8,25 (м, 1H), 7,87 (м, 1H), 7,66 (дд, 1H), 7,52 (м, 2H), 7,41 (м, 2H), 7,04 (м, 3H), 6,91 (м, 2H), 6,82 (дд, 1H), 4,20 (т, 2H), 3,98 (т, 2H), 3,36 (м, 2H), 2,23 (м, 2H), 2,03 (с, 3H), 1,76 (м, 2H), 1,01 (т, 3H).

20 ПРИКЛАД 358

7-(3-ціанофеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота
¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆): δ 11,07 (с, 1H), 8,22 (м, 1H), 8,02 (т, 1H), 7,87 (м, 3H), 7,71 (ддд, 2H), 7,51 (м, 3H), 7,40 (д, 1H), 7,26 (дд, 1H), 7,10 (м, 1H), 6,89 (дд, 1H), 4,19 (т, 2H), 3,37 (м, 2H), 2,24 (м, 2H).

25 ПРИКЛАД 359

3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2,3,5,6-тетраметилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота
¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆): δ 10,22 (с, 1H), 8,28 (м, 1H), 7,87 (м, 1H), 7,68 (д, 1H), 7,53 (м, 2H), 7,42 (м, 2H), 7,08 (дд, 1H), 7,03 (с, 1H), 6,89 (ддд, 2H), 4,22 (т, 2H), 3,39 (м, 2H), 2,25 (м, 2H), 2,22 (с, 6H), 1,73 (с, 6H).

30 ПРИКЛАД 360

7-(3-ціано-2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота
¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆): δ 11,04 (с, 1H), 8,24 (м, 1H), 7,85 (м, 2H), 7,74 (м, 1H), 7,47 (м, 6H), 7,06 (м, 2H), 6,90 (д, 1H), 4,20 (т, 2H), 3,38 (м, 2H), 2,23 (м, 2H), 2,19 (с, 3H).

ПРИКЛАД 361

35 7-(3-етиніл-2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆): δ 12,93 (с, 1H), 10,87 (с, 1H), 8,26 (м, 1H), 7,87 (м, 1H), 7,70 (дд, 1H), 7,51 (м, 4H), 7,40 (д, 1H), 7,24 (м, 2H), 7,04 (м, 2H), 6,90 (дд, 1H), 4,38 (с, 1H), 4,20 (т, 2H), 3,37 (м, 2H), 2,23 (м, 2H), 2,12 (с, 3H).

ПРИКЛАД 362

40 7-(5-(((3-(диметиламіно)пропіл)аміно)карбоніл)-2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆): δ 10,79 (с, 1H), 9,21 (с, 1H), 8,53 (т, 1H), 8,27 (м, 1H), 7,86 (м, 2H), 7,73 (м, 2H), 7,49 (м, 4H), 7,07 (м, 2H), 6,90 (м, 1H), 4,21 (т, 2H), 3,30 (м, 4H), 3,06 (м, 2H), 2,76 (д, 6H), 2,24 (м, 2H), 2,11 (с, 3H), 1,85 (м, 2H).

45 ПРИКЛАД 363

7-(2-ізопропілфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота
¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆): δ 12,93 (с, 1H), 10,35 (с, 1H), 8,26 (м, 1H), 7,87 (м, 1H), 7,69 (д, 1H), 7,53 (м, 2H), 7,41 (м, 4H), 7,25 (тд, 1H), 7,15 (м, 1H), 7,04 (м, 2H), 6,91 (дд, 1H), 4,22 (т, 2H), 3,39 (м, 2H), 2,69 (м, 1H), 2,26 (м, 2H), 1,06 (дд, 6H).

50 ПРИКЛАД 364

7-(5-(((2-(диметиламіно)етил)аміно)карбоніл)-2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆): δ 12,97 (с, 1H), 10,77 (с, 1H), 9,24 (с, 1H), 8,59 (м, 1H), 8,27 (м, 1H), 7,87 (м, 2H), 7,74 (м, 2H), 7,50 (м, 4H), 7,07 (м, 2H), 6,90 (м, 1H), 4,20 (т, 2H), 3,58 (м, 2H), 3,38 (м, 2H), 3,23 (м, 2H), 2,82 (д, 6H), 2,25 (м, 2H), 2,12 (с, 3H).

55 ПРИКЛАД 365

7-(2-метил-5-(((2-морфолін-4-ілетил)аміно)карбоніл)феніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,98 (с, 1H), 10,77 (с, 1H), 9,54 (с, 1H), 8,61 (м, 1H), 8,27 (м, 1H), 7,87 (м, 2H), 7,74 (м, 2H), 7,53 (м, 2H), 7,43 (м, 2H), 7,08 (м, 2H), 6,91 (дд, 1H), 4,21 (т, 2H), 3,98 (м, 2H), 3,55 (м, 5H), 3,39 (м, 7H), 2,26 (м, 2H), 2,12 (с, 3H).

ПРИКЛАД 366

5 7-(2-метил-5-(((3-морфолін-4-ілпропіл)аміно)карбоніл)феніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,97 (с, 1H), 10,79 (с, 1H), 9,50 (с, 1H), 8,55 (т, 1H), 8,27 (м, 1H), 7,86 (м, 2H), 7,73 (м, 2H), 7,53 (м, 2H), 7,42 (м, 2H), 7,07 (м, 2H), 6,91 (дд, 1H), 4,20 (т, 2H), 3,95 (м, 2H), 3,61 (тд, 2H), 3,38 (м, 2H), 3,32 (м, 4H), 3,09 (м, 4H), 2,23 (м, 2H), 2,11 (с, 3H), 1,88 (м, 2H).

ПРИКЛАД 367

10 7-(2-метил-5-(((2-фенілетил)аміно)карбоніл)феніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,94 (с, 1H), 10,83 (с, 1H), 8,49 (т, 1H), 8,28 (м, 1H), 7,87 (м, 1H), 7,81 (дд, 1H), 7,71 (м, 2H), 7,53 (м, 2H), 7,46 (м, 1H), 7,39 (ддд, 2H), 7,22 (м, 5H), 7,08 (м, 2H), 6,91 (дд, 1H), 4,20 (т, 2H), 3,46 (м, 2H), 3,37 (м, 2H), 2,82 (т, 2H), 2,24 (м, 2H), 2,09 (с, 3H).

ПРИКЛАД 368

20 7-(1H-індазол-5-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 13,11 (с, 1H), 13,02 (с, 1H), 10,44 (с, 1H), 8,24 (м, 1H), 8,15 (д, 1H), 8,00 (дд, 1H), 7,87 (м, 1H), 7,67 (м, 2H), 7,58 (дд, 1H), 7,52 (м, 2H), 7,39 (м, 1H), 7,27 (дд, 1H), 7,10 (дд, 1H), 6,90 (дд, 1H), 4,20 (т, 2H), 3,38 (м, 2H), 2,25 (м, 2H).

ПРИКЛАД 369

25 7-(5-(((1S, 4R)-біцикло(2,2,1)гепт-2-илметил)аміно)карбоніл)-2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,92 (с, 1H), 10,82 (с, 1H), 8,34 (м, 2H), 7,85 (м, 2H), 7,72 (м, 2H), 7,53 (м, 2H), 7,41 (м, 3H), 7,06 (м, 2H), 6,91 (д, 1H), 4,21 (т, 2H), 3,39 (м, 2H), 3,23 (м, 2H), 3,02 (м, 1H), 2,26 (м, 2H), 2,14 (м, 2H), 2,09 (м, 3H), 2,04 (м, 1H), 1,65 (м, 3H), 1,27 (м, 2H), 1,07 (м, 2H).

ПРИКЛАД 370

30 7-(2-метил-5-(((3-фенілпропіл)аміно)карбоніл)феніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,93 (с, 1H), 10,83 (с, 1H), 8,41 (т, 1H), 8,27 (м, 1H), 7,85 (м, 2H), 7,73 (тд, 2H), 7,53 (м, 2H), 7,41 (м, 3H), 7,21 (м, 5H), 7,07 (м, 2H), 6,90 (дд, 1H), 4,21 (м, 2H), 3,43 (м, 2H), 3,27 (м, 2H), 2,60 (м, 2H), 2,24 (м, 2H), 2,09 (с, 3H), 1,81 (м, 2H).

ПРИКЛАД 371

35 7-(2-((2-ізопропіл-5-метилфенокси)метил)феніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,97 (с, 1H), 10,56 (с, 1H), 8,24 (м, 1H), 7,86 (м, 1H), 7,71 (д, 1H), 7,65 (дд, 1H), 7,49 (м, 5H), 7,37 (м, 2H), 7,14 (м, 1H), 7,06 (м, 1H), 6,97 (д, 1H), 6,88 (дд, 1H), 6,61 (д, 1H), 6,38 (д, 1H), 4,82 (м, 2H), 4,19 (т, 2H), 3,37 (м, 2H), 3,07 (септет, 1H), 2,23 (м, 2H), 2,07 (с, 3H), 1,04 (д, 6H).

ПРИКЛАД 372

40 7-(2-хлор-6-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,92 (с, 1H), 11,00 (с, 1H), 8,29 (м, 1H), 7,87 (м, 1H), 7,71 (д, 1H), 7,53 (м, 2H), 7,37 (м, 5H), 7,09 (дд, 1H), 6,96 (дд, 1H), 6,91 (дд, 1H), 4,22 (т, 2H), 3,37 (м, 2H), 2,25 (м, 2H), 1,94 (с, 3H).

ПРИКЛАД 373

50 7-(2-бензилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,94 (с, 1H), 10,41 (с, 1H), 8,26 (м, 1H), 7,87 (м, 1H), 7,69 (дд, 1H), 7,52 (м, 2H), 7,38 (м, 4H), 7,24 (м, 2H), 7,05 (м, 5H), 6,90 (дд, 1H), 6,83 (м, 2H), 4,20 (т, 2H), 3,81 (м, 1H), 3,66 (м, 1H), 3,37 (м, 2H), 2,25 (м, 2H).

ПРИКЛАД 374

55 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2,4,6-триізопропілфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,92 (с, 1H), 10,23 (с, 1H), 8,28 (м, 1H), 7,87 (м, 1H), 7,67 (д, 1H), 7,51 (м, 3H), 7,39 (м, 1H), 7,08 (м, 3H), 6,93 (м, 2H), 4,23 (т, 2H), 3,37 (м, 2H), 2,95 (м, 1H), 2,33 (м, 2H), 2,25 (м, 2H), 1,29 (д, 6H), 0,99 (дд, 12H).

ПРИКЛАД 375

3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(1-оксо-2,3-дигідро-1H-інден-4-іл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,98 (с, 1H), 10,99 (с, 1H), 8,25 (м, 1H), 7,87 (м, 1H), 7,75 (дд, 1H), 7,71 (дд, 1H), 7,63 (м, 1H), 7,50 (м, 5H), 7,14 (м, 2H), 6,91 (дд, 1H), 4,21 (т, 2H), 3,38 (м, 2H), 2,82 (м, 2H), 2,58 (м, 2H), 2,24 (м, 2H).

ПРИКЛАД 376

5 7-(2-циклопентилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,95 (с, 1H), 10,24 (с, 1H), 8,25 (м, 1H), 7,87 (м, 1H), 7,69 (д, 1H), 7,52 (м, 2H), 7,40 (м, 4H), 7,24 (тд, 1H), 7,16 (м, 1H), 7,05 (м, 2H), 6,90 (д, 1H), 4,21 (м, 2H), 3,38 (м, 2H), 2,74 (м, 1H), 2,25 (м, 2H), 1,72 (м, 4H), 1,37 (м, 4H).

ПРИКЛАД 377

10 7-(2',6'-диметокси-1,1'-біфеніл-2-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 13,07 (с, 1H), 8,93 (с, 1H), 8,22 (м, 1H), 7,86 (м, 1H), 7,45 (м, 8H), 7,25 (м, 1H), 6,94 (м, 3H), 6,82 (м, 1H), 6,41 (д, 2H), 4,07 (т, 2H), 3,42 (с, 6H), 3,24 (м, 2H), 2,14 (м, 2H).

15 ПРИКЛАД 378

3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(5,6,7,8-тетрагідронафталін-1-іл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,91 (с, 1H), 10,43 (с, 1H), 8,25 (м, 1H), 7,87 (м, 1H), 7,67 (м, 1H), 7,52 (м, 2H), 7,42 (м, 2H), 7,14 (м, 2H), 7,02 (м, 3H), 6,91 (дд, 1H), 4,21 (т, 2H), 3,38 (тд, 2H), 2,82 (т, 2H), 2,29 (м, 4H), 1,73 (м, 2H), 1,60 (м, 2H).

ПРИКЛАД 379

7-(4'-трет-бутил-1,1'-біфеніл-2-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,85 (с, 1H), 9,87 (с, 1H), 8,23 (м, 1H), 7,86 (м, 1H), 7,50 (м, 9H), 7,06 (ддд, 4H), 6,91 (м, 2H), 6,85 (м, 1H), 4,13 (т, 2H), 3,25 (м, 2H), 2,18 (м, 2H), 1,12 (с, 9H).

25 ПРИКЛАД 380

7-(5-фтор-2-метил-3-((метилсульфоніл)метил)феніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,95 (с, 1H), 10,76 (с, 1H), 8,24 (м, 1H), 7,87 (м, 1H), 7,71 (дд, 1H), 7,52 (м, 2H), 7,41 (м, 2H), 7,28 (дд, 1H), 7,05 (м, 3H), 6,90 (дд, 1H), 4,64 (с, 2H), 4,21 (т, 2H), 3,40 (м, 2H), 3,06 (с, 3H), 2,24 (м, 2H), 2,04 (с, 3H).

30 ПРИКЛАД 381

7-(5-(((2-гідрокси-1,1-диметилетил)аміно)карбоніл)-2,3,4-триметилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 8,24 (м, 1H), 7,86 (м, 1H), 7,63 (д, 1H), 7,51 (м, 4H), 7,38 (м, 1H), 7,03 (м, 1H), 6,95 (м, 2H), 6,89 (д, 1H), 4,87 (с, 1H), 4,20 (т, 2H), 3,46 (с, 2H), 3,39 (м, 2H), 2,29 (с, 3H), 2,26 (м, 2H), 2,24 (с, 3H), 1,99 (с, 3H), 1,26 (с, 6H).

ПРИКЛАД 382

7-(2-(4-(етоксикарбоніл)піперазин-1-іл)феніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

40 ¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 13,08 (с, 1H), 10,05 (с, 1H), 8,25 (м, 1H), 7,86 (м, 1H), 7,74 (д, 1H), 7,43 (м, 7H), 7,15 (м, 3H), 6,84 (м, 1H), 4,16 (т, 2H), 3,93 (кв, 2H), 3,39 (м, 2H), 2,97 (м, 4H), 2,76 (м, 4H), 2,24 (м, 2H), 1,08 (т, 3H).

ПРИКЛАД 383

7-(2-метил-6-нітрофеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

45 ¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 13,01 (с, 1H), 11,04 (с, 1H), 8,28 (м, 1H), 7,86 (м, 2H), 7,65 (м, 2H), 7,54 (м, 3H), 7,41 (м, 2H), 7,02 (м, 1H), 6,89 (ддд, 2H), 4,22 (т, 2H), 3,38 (м, 2H), 2,24 (м, 2H), 1,94 (с, 3H).

ПРИКЛАД 384

3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2-(4-пропіонілпіперазин-1-іл)феніл)-1H-індол-2-карбонова кислота

50 ¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 13,10 (с, 1H), 10,09 (с, 1H), 8,24 (м, 1H), 7,86 (м, 1H), 7,75 (д, 1H), 7,51 (м, 2H), 7,39 (м, 5H), 7,15 (тд, 3H), 6,85 (дд, 1H), 4,16 (т, 2H), 3,39 (м, 2H), 3,17 (м, 2H), 2,94 (м, 2H), 2,75 (м, 4H), 2,24 (м, 2H), 2,12 (кв, 2H), 0,85 (т, 3H).

ПРИКЛАД 385

7-(2-метил-6-тієн-2-ілфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

55 ¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,89 (с, 1H), 10,76 (с, 1H), 8,29 (м, 1H), 7,86 (м, 1H), 7,66 (д, 1H), 7,51 (м, 4H), 7,35 (м, 3H), 7,16 (дд, 1H), 6,96 (дд, 1H), 6,86 (ддд, 2H), 6,72 (м, 1H), 6,67 (м, 1H), 4,17 (т, 2H), 3,38 (м, 2H), 2,23 (м, 2H), 1,93 (с, 3H).

ПРИКЛАД 386

3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2-(4-(1,3-тіазол-4-ілметил)піперазин-1-іл)феніл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹Н ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 13,00 (с, 1Н), 10,21 (с, 1Н), 9,12 (д, 1Н), 8,27 (м, 1Н), 7,87 (м, 1Н), 7,79 (с, 1Н), 7,72 (д, 1Н), 7,53 (м, 2Н), 7,40 (м, 4Н), 7,28 (дд, 1Н), 7,17 (т, 2Н), 7,10 (дд, 1Н), 6,90 (дд, 1Н), 4,29 (с, 2Н), 4,21 (т, 2Н), 3,39 (м, 6Н), 3,16 (м, 2Н), 2,90 (м, 2Н), 2,25 (м, 2Н).

ПРИКЛАД 387

7-(2-(4-(2-гідроксіетил)піперазин-1-іл)феніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹Н ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 13,02 (с, 1Н), 9,91 (с, 1Н), 8,24 (тд, 1Н), 7,86 (м, 1Н), 7,73 (д, 1Н), 7,51 (м, 2Н), 7,38 (м, 5Н), 7,14 (м, 3Н), 6,85 (дд, 1Н), 4,30 (с, 1Н), 4,17 (т, 2Н), 3,40 (м, 6Н), 2,76 (м, 4Н), 2,21 (м, 6Н).

ПРИКЛАД 388

7-(2-(4-(метилсульфоніл)піперазин-1-іл)феніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹Н ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 13,21 (с, 1Н), 10,13 (с, 1Н), 8,24 (м, 1Н), 7,86 (м, 1Н), 7,73 (д, 1Н), 7,52 (м, 2Н), 7,41 (м, 4Н), 7,33 (м, 1Н), 7,14 (м, 3Н), 6,87 (дд, 1Н), 4,18 (т, 2Н), 3,39 (м, 3Н), 2,85 (м, 4Н), 2,72 (м, 3Н), 2,64 (с, 3Н), 2,23 (м, 2Н).

ПРИКЛАД 389

7-(2-((4-(трет-бутоксикарбоніл)піперазин-1-іл)сульфоніл)феніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹Н ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 10,33 (с, 1Н), 8,28 (м, 1Н), 8,07 (дд, 1Н), 7,87 (м, 1Н), 7,73 (тд, 1Н), 7,65 (тд, 2Н), 7,53 (м, 2Н), 7,42 (м, 3Н), 7,09 (дд, 1Н), 6,97 (м, 1Н), 6,89 (д, 1Н), 4,17 (м, 2Н), 3,42 (м, 2Н), 3,18 (м, 2Н), 2,82 (м, 2Н), 2,58 (м, 2Н), 2,42 (м, 2Н), 2,20 (м, 2Н), 1,28 (с, 9Н).

ПРИКЛАД 390

7-(2-((4-етилпіперазин-1-іл)сульфоніл)феніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹Н ЯМР(300 МГц, ДМСО-d₆) δ 13,04 (с, 1Н), 11,19 (с, 1Н), 8,27 (м, 1Н), 8,08 (м, 1Н), 7,89 (м, 1Н), 7,75 (м, 3Н), 7,54 (м, 2Н), 7,45 (м, 3Н), 7,11 (м, 2Н), 6,93 (д, 1Н), 4,23 (т, 2Н), 3,47 (м, 2Н), 3,18 (м, 3Н), 2,72 (м, 4Н), 2,36 (м, 2Н), 2,23 (м, 2Н), 1,49 (м, 1Н), 1,00 (т, 3Н).

ПРИКЛАД 391

3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2-((4-(2-оксопіролідін-1-іл)піперидин-1-іл)сульфоніл)феніл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹Н ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,95 (с, 1Н), 11,08 (с, 1Н), 8,27 (м, 1Н), 8,07 (дд, 1Н), 7,87 (м, 1Н), 7,67 (м, 3Н), 7,53 (м, 2Н), 7,41 (м, 3Н), 7,17 (дд, 1Н), 7,03 (дд, 1Н), 6,89 (дд, 1Н), 4,19 (м, 2Н), 3,45 (м, 3Н), 2,95 (м, 4Н), 2,25 (м, 4Н), 2,09 (м, 2Н), 1,77 (дкв, 2Н), 1,10 (м, 3Н), 0,31 (м, 1Н).

ПРИКЛАД 392

7-(3-((1S, 4R)-2-гідроксибіцикло(2,2,1)гепт-2-ил)-2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹Н ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,97 (м, 1Н), 10,55 (с, 0,5Н), 9,78 (с, 0,5Н), 8,24 (м, 1Н), 7,87 (д, 1Н), 7,69 (м, 1Н), 7,48 (м, 4Н), 7,39 (т, 1Н), 7,19 (м, 1Н), 7,07 (м, 2,5Н), 6,92 (м, 1,5Н), 4,75 (д, 1Н), 4,21 (т, 2Н), 3,38 (м, 2Н), 2,83 (м, 1Н), 2,24 (м, 4Н), 2,15 (д, 3Н), 1,98 (м, 1Н), 1,50 (м, 6Н).

ПРИКЛАД 393

7-((1E)-1-етилбут-1-еніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹Н ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 13,01 (с, 1Н), 10,41 (с, 1Н), 8,23 (м, 1Н), 7,86 (м, 1Н), 7,51 (м, 4Н), 7,39 (д, 1Н), 6,98 (м, 2Н), 6,89 (дд, 1Н), 5,50 (т, 1Н), 4,18 (т, 2Н), 3,39 (м, 2Н), 2,53 (м, 2Н), 2,22 (м, 4Н), 1,05 (т, 3Н), 0,83 (т, 3Н).

ПРИКЛАД 394

7-((Z)-2-карбокси-1-пентилвініл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹Н ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,97 (с, 1Н), 12,13 (с, 1Н), 11,07 (с, 1Н), 8,23 (м, 1Н), 7,86 (м, 1Н), 7,66 (д, 1Н), 7,51 (м, 2Н), 7,41 (м, 2Н), 7,12 (м, 1Н), 6,99 (м, 1Н), 6,89 (м, 1Н), 5,90 (с, 1Н), 4,18 (т, 2Н), 3,40 (м, 2Н), 3,07 (м, 2Н), 2,21 (м, 2Н), 1,23 (м, 6Н), 0,76 (м, 3Н).

ПРИКЛАД 395

7-(5,7-диметилпіразоло(1,5-а)піримідин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹Н ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 13,56 (с, 1Н), 13,08 (с, 1Н), 8,92 (с, 1Н), 8,25 (м, 1Н), 7,86 (м, 2Н), 7,59 (д, 1Н), 7,52 (м, 2Н), 7,41 (м, 2Н), 7,03 (м, 2Н), 6,89 (дд, 1Н), 4,19 (т, 2Н), 3,39 (м, 2Н), 2,75 (с, 3Н), 2,72 (с, 3Н), 2,25 (м, 2Н).

ПРИКЛАД 396

7-(4-(4-фторфеніл)-5-(4-(метилсульфоніл)феніл)тієн-2-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 13,17 (с, 1H), 10,87 (с, 1H), 8,22 (м, 1H), 7,89 (м, 3H), 7,76 (д, 1H), 7,71 (с, 1H), 7,48 (м, 8H), 7,26 (ддд, 2H), 7,11 (м, 1H), 6,90 (дд, 1H), 4,20 (т, 2H), 3,40 (м, 2H), 3,24 (с, 3H), 2,24 (м, 2H).

ПРИКЛАД 397

5 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1-(піридин-4-ілметил)-7-(2-(трифторметил)феніл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 13,29 (с, 1H), 8,40 (д, 2H), 8,23 (м, 1H), 7,90 (м, 2H), 7,77 (д, 1H), 7,53 (м, 5H), 7,31 (т, 1H), 7,16 (дд, 1H), 7,03 (т, 2H), 6,93 (дд, 1H), 6,63 (д, 2H), 5,61 (д, 1H), 5,01 (д, 1H), 4,26 (т, 2H), 3,42 (м, 2H), 2,29 (м, 2H).

10 ПРИКЛАД 398

7-(5-(((2-(диметиламіно)етил)(піридин-2-іл)аміно)метил)тієн-2-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆) δ 9,77 (с, 1H), 8,16 (м, 2H), 7,82 (д, 1H), 7,68 (м, 1H), 7,59 (м, 1H), 7,44 (м, 4H), 7,35 (дд, 2H), 7,14 (т, 1H), 7,07 (тд, 1H), 6,91 (д, 1H), 6,87 (м, 1H), 6,72 (м, 1H), 4,94 (с, 1H), 4,77 (с, 1H), 4,21 (м, 2H), 3,94 (т, 1H), 3,36 (м, 4H), 2,89 (с, 6H), 2,24 (м, 3H).

15 ПРИКЛАД 399

7-(2-морфолін-4-іл-6-(трифторметил)феніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

20 ¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,81 (с, 1H), 10,77 (с, 1H), 8,31 (м, 1H), 7,87 (м, 1H), 7,69 (дд, 1H), 7,55 (м, 4H), 7,40 (м, 3H), 7,00 (м, 2H), 6,83 (д, 1H), 4,16 (м, 2H), 3,40 (д, 2H), 2,92 (м, 2H), 2,75 (м, 2H), 2,62 (м, 4H), 2,24 (м, 2H).

ПРИКЛАД 400

7-(4-метокси-2-феніл-1-бензофуран-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

25 ¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,81 (с, 1H), 10,99 (с, 1H), 8,31 (м, 1H), 7,87 (м, 1H), 7,75 (д, 1H), 7,53 (м, 2H), 7,46 (м, 1H), 7,34 (м, 5H), 7,21 (м, 4H), 7,06 (м, 1H), 6,88 (д, 1H), 6,73 (м, 1H), 4,19 (т, 2H), 3,42 (с, 3H), 3,38 (д, 2H), 2,26 (м, 2H).

ПРИКЛАД 401

4-фтор-7-(2-морфолін-4-ілфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

30 ¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 13,29 (с, 1H), 10,36 (с, 1H), 8,17 (дд, 1H), 7,85 (м, 1H), 7,43 (м, 6H), 7,30 (дд, 1H), 7,14 (м, 2H), 6,96 (дд, 1H), 6,89 (дд, 1H), 4,22 (т, 2H), 3,48 (м, 2H), 3,23 (м, 4H), 2,75 (м, 4H), 2,25 (м, 2H).

ПРИКЛАД 402

4-фтор-7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

35 ПРИКЛАД 402A

етил 7-бром-3-(3-етоксі-3-оксопропіл)-4-фтор-1H-індол-2-карбоксилат

40 Суміш 2-бром-5-фтораніліну (5 г) в етанолі (17,5 мл) і 1,6М НСІ (50 мл) при -5°C обробляли за допомогою 2,5М NaNO₂ (10,5 мл). Потім додавали 4,5М ацетату калію (29,2 мл) з подальшим додаванням етил 2-оксоциклопентанкарбоксилату (3,8 мл). Реакційну суміш перемішували при 0°C протягом 15 хвилин, нагрівали до 20°C протягом 1,5 години, екстрагували дихлорметаном, концентрували і сушили у вакуумі. Залишок розчиняли у 67 мл суміші (H₂SO₄/етанол, 17:50), кип'ятили зі зворотним холодильником протягом 2 днів, охолоджували до кімнатної температури, гасили водою і екстрагували дихлорметаном. Об'єднані екстракти промивали насиченим сольовим розчином, сушили (MgSO₄), фільтрували і концентрували. Концентрат очищали колонковою хроматографією на силікагелі з використанням суміші 5-20 % етилацетату у гексані. Продукт піддавали подальшому очищенню шляхом розтирання у порошок з етанолом.

ПРИКЛАД 402B

3-(7-бром-2-(етоксикарбоніл)-4-фтор-1H-індол-3-іл)пропанова кислота

50 До суміші сполуки Прикладу 402A (2,3 г) в оцтовій кислоті (40 мл) додавали концентровану хлористоводневу кислоту (3 мл). Суміш нагрівали при 80 °C протягом 4 годин. Після охолодження до кімнатної температури відбувалося осадження продукту. Додавали воду (50 мл), щоб викликати більше осадження. Тверду речовину фільтрували, промивали водою і сушили у вакуумі.

ПРИКЛАД 402C

55 7-бром-4-фтор-3-(3-гідроксипропіл)-1H-індол-2-карбоксилат

60 До суспензії сполуки Прикладу 402B (1,9 г) у тетрагідрофурані (10 мл) додавали 1М боран•тетрагідрофуран (5,8 мл). Реакційну суміш перемішували при температурі навколишнього середовища протягом ночі. Додавали додаткову кількість 1М боран.тетрагідрофурану (2,0 мл) і перемішування продовжували протягом 3 годин. Реакційну суміш гасили метанолом і концентрували. Концентрат розчиняли у гарячому етанолі (30 мл) і 1

мл концентрованої HCl, і перемішували протягом 1 години. Відбувалося осадження продукту. Додавали воду (20 мл), щоб викликати більше осадження. Тверду речовину фільтрували, промивали водою і сушили.

ПРИКЛАД 402D

5 етил 7-бром-4-фтор-3-(3-(нафталін-1-ілокси)пропіл)-1H-індол-2-карбоксилат

До суміші сполуки Прикладу 402C (1,03 г), нафталін-1-олу (519 мг) і трифенілфосфіну (905 мг) у тетрагідрофурані (15 мл) при -10 °C повільно додавали ди-трет-бутилазодикарбоксилат (794 мг). Після проходження однієї години реакційній суміші давали нагрітися до кімнатної температури. Перемішування продовжували протягом двох годин при кімнатній температурі. Реакційну суміш концентрували. Концентрат очищали колонковою хроматографією на силікагелі з використанням суміші 0-4 % етилацетату у гексані.

ПРИКЛАД 402E

4-фтор-7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

Суміш сполуки Прикладу 402D (47 мг), о-толілборонової кислоти (19 мг),
15 трис(добензилдінацетон)дипаладію(0) (4,6 мг), тетрафторборату три-трет-бутил-фосфонію (3,5 мг), фториду цезію (45,6 мг) і тетрагідрофурану (1,5 мл) перемішували при температурі навколишнього середовища в атмосфері азоту протягом ночі. Додавали додаткові кількості о-толілборонової кислоти (9,5 мг), трис(добензилдінацетон)дипаладію(0) (2,3 мг), тетрафторборату три-трет-бутил-фосфонію (1,8 мг) і фториду цезію (23 мг), і перемішування
20 продовжували при температурі навколишнього середовища протягом ночі. Додавали LiOH-H₂O (42 мг) і воду (0,5 мл), і суміш нагрівали протягом ночі при 60°C. Реакційну суміш підкислювали за допомогою 1 М HCl (водн.), екстрагували (3×5 мл) етилацетатом, сушили (MgSO₄), фільтрували і концентрували. Концентрат суспендували у метанолі і фільтрували через фільтрувальний шприц. Фільтрат концентрували. Концентрат очищали за допомогою зворотно-
25 фазової ВЕРХ (50-95 % ацетонітрилу/вода/0,1 % трифтороцтової кислоти). ¹H ЯМР (300 МГц, DMSO-d₆) δ 13,10 (с, 1H), 10,86 (с, 1H), 8,20 (м, 1H), 7,86 (м, 1H), 7,48 (м, 4H), 7,28 (м, 4H), 6,99 (м, 1H), 6,90 (м, 2H), 4,23 (т, 2H), 3,45 (т, 2H), 2,25 (м, 2H), 2,05 (с, 3H).

ПРИКЛАД 403

7-(2-((2-адамантиламіно)карбоніл)-6-метилімідазо(1,2-а)піридин-8-іл)-3-(3-(1-

30 нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (300 МГц, DMSO-d₆) δ 13,03 (с, 1H), 10,76 (с, 1H), 8,48 (д, 2H), 8,22 (м, 1H), 7,85 (м, 2H), 7,59 (м, 1H), 7,49 (м, 5H), 7,37 (м, 1H), 7,16 (дд, 1H), 6,87 (дд, 1H), 4,19 (т, 2H), 3,95 (м, 1H), 3,41 (м, 2H), 2,39 (д, 3H), 2,26 (м, 2H), 1,86 (м, 2H), 1,78 (м, 6H), 1,62 (м, 4H), 1,43 (м, 2H).

ПРИКЛАД 404

35 7-(1-(1-адамантил)-3-карбокси-1H-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (300 МГц, DMSO-d₆) δ 12,86 (с, 1H), 12,22 (с, 1H), 10,59 (с, 1H), 8,26 (м, 1H), 7,99 (с, 1H), 7,87 (м, 1H), 7,62 (д, 1H), 7,51 (м, 3H), 7,40 (д, 1H), 7,10 (д, 1H), 6,98 (т, 1H), 6,90 (д, 1H), 4,19 (т, 2H), 3,37 (м, 2H), 2,24 (м, 2H), 2,20 (с, 9H), 1,75 (с, 6H).

40 ПРИКЛАД 405

7-(2-(1-гідрокси-4-метоксициклогексил)-1-бензотієн-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

45 ¹H ЯМР (300 МГц, DMSO-d₆) δ 12,93 (с, 1H), 10,63 (с, 1H), 8,29 (м, 1H), 7,91 (м, 2H), 7,76 (м, 1H), 7,51 (м, 2H), 7,42 (м, 2H), 7,28 (ддд, 1H), 7,11 (м, 2H), 6,88 (м, 1H), 6,64 (д, 1H), 6,07 (с, 1H), 5,57 (с, 1H), 4,21 (м, 2H), 3,40 (с, 2H), 3,06 (с, 3H), 2,64 (м, 1H), 2,26 (м, 2H), 1,62 (м, 6H).

ПРИКЛАД 406

7-(5-хлор-3-метил-1-тетрагідро-2H-піран-2-іл)-1H-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

50 ¹H ЯМР (300 МГц, DMSO-d₆) δ 10,71 (с, 1H), 8,25 (м, 1H), 7,87 (м, 1H), 7,69 (дт, 1H), 7,52 (м, 2H), 7,41 (дт, 2H), 7,05 (м, 2H), 6,91 (д, 1H), 5,44 (дд, 1H), 4,20 (т, 2H), 3,94 (д, 1H), 3,69 (м, 1H), 3,46 (м, 2H), 2,25 (м, 3H), 2,13 (с, 3H), 1,99 (м, 2H), 1,73 (м, 1H), 1,55 (м, 2H).

ПРИКЛАД 407

3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2,2,4-триметил-1-(фенілсульфоніл)-1,2-дигідрохінолін-3-іл)-1H-індол-2-карбонова кислота

55 ¹H ЯМР (300 МГц, DMSO-d₆) δ 13,01 (с, 1H), 11,27 (с, 1H), 8,23 (м, 1H), 7,86 (м, 1H), 7,67 (м, 1H), 7,52 (м, 7H), 7,34 (м, 6H), 6,85 (м, 2H), 6,43 (м, 1H), 4,95 (с, 1H), 4,17 (т, 2H), 3,76 (с, 2H), 3,37 (м, 2H), 2,20 (м, 2H), 1,33 (с, 6H).

ПРИКЛАД 408

60 7-(7,8-диметил-2-(1-метил-1-фенілетил)імідазо(1,2-а)піридин-6-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 13,50 (с, 1H), 11,16 (с, 1H), 8,67 (с, 1H), 8,26 (м, 1H), 8,16 (с, 1H), 7,85 (м, 2H), 7,53 (м, 2H), 7,38 (м, 7H), 7,16 (м, 2H), 6,91 (дд, 1H), 4,21 (т, 2H), 3,42 (м, 2H), 2,56 (с, 3H), 2,25 (м, 2H), 2,07 (с, 3H), 1,81 (с, 6H).

ПРИКЛАД 409

5 7-(1-(4-((2-фторбензоїл)аміно)феніл)-3-(трифторметил)-1H-піразол-5-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (400 МГц, ДМСО-d₆) δ 11,33 (с, 1H), 10,48 (с, 1H), 8,23 (д, 1H), 7,85 (д, 1H), 7,74 (д, 1H), 7,62 (м, 3H), 7,53 (м, 3H), 7,44 (м, 1H), 7,33 (м, 5H), 7,09 (м, 2H), 6,98 (т, 1H), 6,87 (д, 1H), 4,16 (т, 2H), 3,38 (м, 2H), 2,20 (м, 2H).

10 ПРИКЛАД 410

7-(5-аміно-3-(піперидин-1-ілкарбоніл)-1H-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆) δ 13,03 (с, 1H), 10,30 (с, 1H), 8,27 (м, 1H), 7,86 (м, 1H), 7,61 (д, 1H), 7,53 (м, 2H), 7,45 (д, 1H), 7,38 (т, 1H), 7,10 (м, 1H), 7,00 (м, 1H), 6,86 (д, 1H), 5,17 (с, 2H), 4,16 (т, 2H), 3,59 (м, 2H), 3,01 (м, 2H), 2,22 (ддд, 2H), 1,28 (м, 4H), 0,76 (м, 2H).

15 ПРИКЛАД 411

7-(3-метил-1-(2-нітрофеніл)-5-феніл-1H-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,99 (с, 1H), 10,72 (с, 1H), 8,26 (м, 1H), 8,04 (дд, 1H), 7,87 (м, 1H), 7,65 (с, 3H), 7,50 (м, 3H), 7,37 (м, 2H), 7,13 (м, 3H), 7,04 (м, 2H), 6,98 (м, 2H), 6,90 (дд, 1H), 4,20 (т, 2H), 3,41 (м, 2H), 2,22 (м, 2H), 2,03 (с, 3H).

20 ПРИКЛАД 412

7-(5-метил-1-(2-оксо-2-((2-фенілетил)аміно)етил)-3-(трифторметил)-1H-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (400 МГц, ДМСО-d₆) δ 10,80 (с, 1H), 8,26 (м, 1H), 8,22 (т, 1H), 7,87 (тд, 1H), 7,73 (м, 1H), 7,52 (м, 2H), 7,46 (м, 1H), 7,39 (т, 1H), 7,24 (м, 4H), 7,16 (м, 1H), 7,08 (м, 2H), 6,91 (д, 1H), 4,89 (с, 2H), 4,22 (т, 2H), 3,49 (м, 4H), 2,79 (м, 2H), 2,23 (м, 2H), 1,84 (с, 3H).

25 ПРИКЛАД 413

7-(2-(1-адамантил)імідазо(1,2-а)піридин-5-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (400 МГц, ДМСО-d₆) δ 11,30 (с, 1H), 8,17 (дд, 1H), 8,01 (д, 1H), 7,94 (м, 2H), 7,87 (м, 1H), 7,49 (м, 5H), 7,39 (м, 1H), 7,25 (дд, 1H), 7,02 (с, 1H), 6,90 (д, 1H), 4,22 (т, 2H), 3,80 (м, 2H), 2,27 (квд, 2H), 2,01 (м, 3H), 1,88 (м, 6H), 1,70 (м, 6H).

30 ПРИКЛАД 414

7-(1,1-діоксидо-1-бензотієн-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (400 МГц, ДМСО-d₆) δ 11,54 (с, 1H), 8,24 (м, 1H), 7,92 (д, 1H), 7,87 (м, 2H), 7,61 (м, 2H), 7,52 (м, 2H), 7,46 (м, 2H), 7,39 (м, 1H), 7,32 (д, 1H), 7,11 (м, 2H), 6,90 (д, 1H), 4,20 (т, 2H), 3,40 (м, 2H), 2,25 (м, 2H).

35 ПРИКЛАД 415

7-(2-циклогексил-6-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,87 (с, 1H), 10,39 (с, 1H), 8,29 (м, 1H), 7,87 (м, 1H), 7,69 (д, 1H), 7,53 (м, 2H), 7,45 (м, 1H), 7,37 (м, 1H), 7,25 (м, 2H), 7,09 (м, 2H), 6,88 (м, 2H), 4,19 (т, 2H), 3,38 (м, 2H), 2,25 (м, 2H), 2,02 (м, 1H), 1,83 (с, 3H), 1,54 (м, 5H), 1,33 (м, 2H), 1,09 (м, 1H), 0,82 (м, 1H), 0,71 (м, 1H).

40 ПРИКЛАД 416

7-(4-(((2-(2-(2-аміноетокси)етокси)етил)аміно)карбоніл)-2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,94 (с, 1H), 10,71 (с, 1H), 8,51 (т, 1H), 8,24 (м, 1H), 7,87 (ддд, 1H), 7,74 (м, 5H), 7,52 (м, 3H), 7,40 (д, 1H), 7,30 (д, 1H), 7,06 (м, 2H), 6,90 (м, 1H), 4,21 (т, 2H), 3,59 (м, 8H), 3,47 (м, 2H), 3,39 (м, 2H), 2,98 (м, 2H), 2,24 (м, 2H), 2,10 (с, 3H).

50 ПРИКЛАД 417

7-(1-метил-3,5-дифеніл-1H-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,85 (с, 1H), 10,75 (с, 1H), 8,26 (м, 1H), 7,86 (м, 1H), 7,60 (д, 1H), 7,50 (м, 3H), 7,31 (м, 8H), 7,11 (м, 3H), 7,05 (дд, 1H), 6,93 (дд, 1H), 6,84 (м, 1H), 4,13 (т, 2H), 3,82 (с, 3H), 3,25 (м, 2H), 2,18 (м, 2H).

55 ПРИКЛАД 418

7-((Z)-2-(1H-імідазол-1-іл)-1-фенілвініл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 13,20 (м, 1H), 11,04 (м, 1H), 8,25 (м, 1H), 7,87 (м, 1H), 7,76 (м, 1H), 7,52 (м, 4H), 7,35 (м, 6H), 7,22 (м, 2H), 7,11 (м, 1H), 7,00 (м, 2H), 6,89 (д, 1H), 4,19 (т, 2H), 3,54 (м, 2H), 2,23 (м, 2H).

ПРИКЛАД 419

5 7-(1-бензил-2-метил-4-нітро-1H-імідазол-5-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР(300 МГц, ДМСО-d₆) δ 13,05 (с, 1H), 11,61 (с, 1H), 8,26 (м, 1H), 7,87 (м, 1H), 7,80 (д, 1H), 7,51 (м, 2H), 7,41 (м, 2H), 7,20 (м, 4H), 7,03 (м, 1H), 6,92 (м, 3H), 5,07 (д, 1H), 4,75 (д, 1H), 4,19 (т, 2H), 3,39 (м, 2H), 2,30 (с, 3H), 2,20 (м, 2H).

10 ПРИКЛАД 420

3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2-проп-1-інілфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота

ПРИКЛАД 420A

1-бром-2-(проп-1-ініл)бензол

15 Розчин 1M гексаметилдисилазиду літію (6 мл) додавали до 1-бром-2-етинілбензолу (1 г) у 20 мл тетрагідрофурану при кімнатній температурі і реакційну суміш перемішували протягом 30 хвилин. Додавали (CH₃)₂SO₄ (0,58 мл) і реакційну суміш перемішували протягом 30 хвилин. Реакційну суміш виливали у 20 мл води, екстрагували 2× 50 мл простого ефіру і об'єднані органічні шари сушили над Na₂SO₄, фільтрували і фільтрат концентрували.

ПРИКЛАД 420B

20 2-(проп-1-ініл)фенілборонова кислота

2,5M н-бутиллітію (1,92 мл) додавали до сполуки Прикладу 420A (850 мг) у 15 мл тетрагідрофурану при -78°C. Реакційну суміш перемішували протягом 1 хвилини, додавали триметилборат (0,974 мл) і реакційній суміші давали нагрітися до кімнатної температури. Реакційну суміш виливали у 20 мл 1M HCl, екстрагували 3× 50 мл простого ефіру і органічні шари концентрували. Здійснювали поглинання неочищеної речовини у 50 мл 1M NaOH і промивали 2× 50 мл простого ефіру. Водний шар підкислювали за допомогою концентрованої HCl, екстрагували 3× 50 мл простого ефіру і об'єднані екстракти промивали насиченим сольовим розчином, сушили над Na₂SO₄ і концентрували. Неочищений продукт розтирали у порошок з простим ефіром/гексаном.

30 ПРИКЛАД 420C

3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2-проп-1-інілфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота

35 Суспензію сполуки Прикладу 1C (0,034 г, 0,075 ммоль), сполуки Прикладу 420B (0,1 г, 0,68 ммоль), тетракіс(трифенілфосфін)паладію (0,004 г, 0,006 ммоль) і розчину Na₂CO₃ (2M, 0,5 мл, 1 ммоль) у диметоксіетані/EtOH/H₂O (7/2/3, 3 мл) піддавали мікрохвильовому нагріванню при 150°C протягом 30 хвилин. Реакційну суміш гасили водним розчином HCl (1M, 0,4 мл) і продукт екстрагували етилацетатом (3×7 мл). Органічні фази фільтрували через картридж, що осушує, (MgSO₄, Alltech Asoc, 2 г) і концентрували при зниженому тиску. Неочищений продукт очищали за допомогою хроматографії на SiO₂ з використанням 1 % AcOH в EtOAc як елюенту. ¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,39 (шир. с, 1H), 10,28 (с, 1H), 8,25 (дд, 1H), 7,87 (д, 1H), 7,71 (д, 1H), 7,38-7,56 (м, 8H), 7,21 (д, 1H), 7,09 (дд, 1H), 6,89 (д, 1H), 4,20 (м, 2H), 3,38 (м, 2H), 2,24 (м, 2H), 1,91 (с, 3H).

40 ПРИКЛАД 421

3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2-(фенілетиніл)феніл)-1H-індол-2-карбонова кислота

45 ¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,85 (шир с, 1H), 10,66 (с, 1H), 8,28 (дд, 1H), 7,87 (д, 1H), 7,78 (д, 1H), 7,68 (д, 1H), 7,40-7,58 (м, 8H), 7,18-7,26 (м, 3H), 7,08 (дд, 1H), 6,89 (м, 3H), 4,21 (т, 2H), 3,40 (т, 2H), 2,26 (м, 2H).

ПРИКЛАД 422

3,7-біс(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

50 ¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,80 (шир с, 1H), 11,35 (с, 1H), 8,21 (дд, 2H), 7,86 (д, 2H), 7,35-7,55 (м, 8H), 7,08 (д, 1H), 6,86-6,96 (м, 4H), 4,18 (м, 4H), 3,37 (м, 4H), 2,21 (м, 4H).

ПРИКЛАД 423

1-(2-(диметиламіно)-2-оксоетил)-7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

55 ¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) 13,02 (с, 1H), 8,24-8,31 (м, 1H), 7,84-7,91 (м, 1H), 7,75 (дд, J=8,1, 1,4 Гц, 1H), 7,50-7,56 (м, 2H), 7,46 (д, J=8,1 Гц, 1H), 7,41 (д, J=7,1 Гц, 1H), 7,31-7,39 (м, 2H), 7,20-7,28 (м, 1H), 7,02-7,12 (м, 2H), 6,91 (дд, J=6,8, 4,4 Гц, 2H), 5,05 (д, J=17,3 Гц, 1H), 4,70 (д, J=17,6 Гц, 1H), 4,23 (т, J=6,1 Гц, 2H), 3,32-3,40 (м, 2H), 2,63 (с, 3H), 2,28 (с, 3H), 2,18-2,27 (м, 2H), 1,95 (с, 3H).

ПРИКЛАД 424

1-(2-метилбензил)-7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) 13,13 (с, 1H), 8,22-8,30 (м, 1H), 7,81-7,91 (м, 2H), 7,49-7,56 (м, 1H), 7,44-7,49 (м, 1H), 7,36-7,44 (м, 1H), 7,23-7,31 (м, 1H), 7,07-7,19 (м, 2H), 6,99-7,04 (м, 1H), 6,92-6,99 (м, 3H), 6,84-6,92 (м, 2H), 6,74-6,82 (м, 2H), 5,50 (д, J=7,8 Гц, 1H), 5,34 (д, J=17,6 Гц, 1H), 5,17 (д, J=17,6 Гц, 1H), 4,26 (т, J=6,1 Гц, 2H), 3,37-3,49 (м, 2H), 2,22-2,36 (м, 2H), 1,61 (с, 3H), 1,57 (с, 3H).

ПРИКЛАД 425

1-(3-метилбензил)-7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) 13,18 (с, 1H), 8,20-8,29 (м, 1H), 7,83-7,91 (м, 1H), 7,80 (д, J=8,3 Гц, 1H), 7,48-7,58 (м, 2H), 7,43-7,48 (м, 1H), 7,34-7,42 (м, 1H), 7,30 (т, J=7,3 Гц, 1H), 7,21 (д, J=7,1 Гц, 1H), 7,06-7,17 (м, 2H), 7,00 (д, J=7,5 Гц, 1H), 6,82-6,96 (м, 4H), 6,04 (с, 1H), 5,98 (д, J=6,7 Гц, 1H), 5,29 (д, J=16,6 Гц, 1H), 5,19 (д, J=16,6 Гц, 1H), 4,22 (т, J=6,1 Гц, 2H), 3,34-3,43 (м, 2H), 2,19-2,33 (м, 2H), 2,06 (с, 3H), 1,70 (с, 3H).

ПРИКЛАД 426

1-(4-метилбензил)-7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) 13,13 (с, 1H), 8,21-8,29 (м, 1H), 7,84-7,92 (м, 2H), 7,80 (д, J=6,7 Гц, 1H), 7,50-7,58 (м, 2H), 7,47 (д, J=8,7 Гц, 2H), 7,35-7,42 (м, 1H), 7,26-7,33 (м, 1H), 7,23 (д, J=7,1 Гц, 1H), 7,08-7,16 (м, 2H), 7,03 (д, J=6,1 Гц, 1H), 6,95 (д, J=5,9 Гц, 1H), 6,89 (д, J=6,7 Гц, 1H), 6,83 (д, J=7,9 Гц, 2H), 6,14 (д, J=8,3 Гц, 2H), 5,29 (д, J=16,7 Гц, 1H), 5,11 (д, J=16,7 Гц, 1H), 4,21 (т, J=6,1 Гц, 2H), 3,34-3,42 (м, 2H), 2,18-2,32 (м, 2H), 2,14 (с, 3H), 1,76 (с, 3H).

ПРИКЛАД 427

7-(2-метилфеніл)-1-(3-морфолін-4-ілпропіл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) 13,31 (с, 1H), 9,43 (с, 1H), 8,19-8,27 (м, 1H), 7,83-7,91 (м, 1H), 7,79 (дд, J=8,1, 1,4 Гц, 1H), 7,49-7,58 (м, 2H), 7,47 (д, J=8,4 Гц, 1H), 7,34-7,44 (м, 5H), 7,10-7,18 (м, 1H), 7,00 (д, J=5,8 Гц, 1H), 6,92 (д, J=6,4 Гц, 1H), 4,26-4,40 (м, 1H), 4,23 (т, J=5,9 Гц, 2H), 3,88 (шс, 2H), 3,48-3,65 (м, 4H), 3,29-3,39 (м, 4H), 2,85 (шс, 2H), 1,99 (с, 3H), 1,60 (шс, 2H).

ПРИКЛАД 428

7-(2-метилфеніл)-1-(2-(4-метилпіперазин-1-іл)-2-оксоетил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) 13,07 (с, 1H), 9,69 (с, 1H), 8,22-8,32 (м, 1H), 7,84-7,92 (м, 1H), 7,77 (дд, J=8,1, 1,4 Гц, 1H), 7,50-7,58 (м, 2H), 7,47 (д, J=8,1 Гц, 1H), 7,33-7,43 (м, 4H), 7,23-7,32 (м, 1H), 7,05-7,13 (м, 1H), 6,92 (д, J=7,5 Гц, 2H), 5,39 (шс, 1H), 4,93 (шс, 1H), 4,23 (т, J=6,1 Гц, 2H), 3,36-3,44 (м, 4H), 2,72-2,86 (м, 4H), 2,17-2,30 (м, 2H), 1,93 (с, 3H).

ПРИКЛАД 429

7-(2-метилфеніл)-1-(2-(4-метилпіперазин-1-іл)етил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) 13,17 (с, 1H), 9,20 (с, 1H), 8,17-8,25 (м, 1H), 7,84-7,90 (м, 1H), 7,76 (дд, J=8,1, 1,4 Гц, 1H), 7,49-7,58 (м, 1H), 7,46 (д, J=8,4 Гц, 1H), 7,37-7,43 (м, 1H), 7,25-7,36 (м, 4H), 7,07-7,16 (м, 1H), 6,96 (дд, J=7,1, 1,4 Гц, 1H), 4,27-4,40 (м, 1H), 4,22 (т, J=5,9 Гц, 2H), 3,70-3,85 (м, 1H), 3,27-3,40 (м, 2H), 3,21 (д, J=12,5 Гц, 2H), 2,70-2,88 (м, 2H), 2,69 (с, 3H), 2,39 (д, J=14,6 Гц, 2H), 2,14-2,30 (м, 2H), 2,06 (м, 4H), 2,00 (с, 3H).

ПРИКЛАД 430

1-(1,1'-біфеніл-2-ілметил)-7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) 12,97 (с, 1H), 8,18-8,26 (м, 1H), 7,82-7,91 (м, 2H), 7,43-7,58 (м, 3H), 7,35-7,43 (м, 1H), 7,29-7,36 (м, 4H), 7,26 (д, J=7,1 Гц, 1H), 7,03-7,19 (м, 3H), 6,87-7,02 (м, 5H), 6,65-6,75 (м, 2H), 5,52 (д, J=7,5 Гц, 1H), 5,29 (д, J=17,8 Гц, 1H), 5,10 (д, J=17,8 Гц, 1H), 4,23 (т, J=6,1 Гц, 2H), 3,36-3,45 (м, 2H), 2,27 (квт, J=7,3 Гц, 2H), 1,76 (с, 3H).

ПРИКЛАД 431

1-(1,1'-біфеніл-3-ілметил)-7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) 13,23 (с, 1H), 8,20-8,30 (м, 1H), 7,84-7,91 (м, 1H), 7,81 (д, J=7,8 Гц, 1H), 7,48-7,59 (м, 2H), 7,46 (д, J=8,1 Гц, 1H), 7,32-7,41 (м, 6H), 7,22-7,32 (м, 2H), 7,06-7,20 (м, 4H), 7,01 (д, J=6,8 Гц, 1H), 6,94 (д, J=7,1 Гц, 1H), 6,87 (д, J=7,5 Гц, 1H), 6,44 (с, 1H), 6,22 (д, J=8,1 Гц, 1H), 5,39 (д, J=16,6 Гц, 1H), 5,27 (д, J=16,6 Гц, 1H), 4,23 (т, J=6,3 Гц, 2H), 3,39 (т, J=7,5 Гц, 2H), 2,21-2,36 (м, 2H), 1,70 (с, 3H).

ПРИКЛАД 432

1-(1,1'-біфеніл-4-ілметил)-7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹Н ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) 13,20 (с, 1Н), 8,17-8,27 (м, 1Н), 7,80-7,90 (м, 2Н), 7,48-7,57 (м, 4Н), 7,46 (д, J=8,1 Гц, 1Н), 7,34-7,43 (м, 3Н), 7,26-7,34 (м, 4Н), 7,23 (д, J=7,1 Гц, 1Н), 7,08-7,18 (м, 2Н), 7,03 (д, J=6,8 Гц, 1Н), 6,96 (д, J=6,1 Гц, 1Н), 6,90 (д, J=6,8 Гц, 1Н), 6,31 (д, J=8,1 Гц, 2Н), 5,38 (д, J=17,3 Гц, 1Н), 5,25 (д, J=17,3 Гц, 1Н), 4,23 (т, J=6,1 Гц, 2Н), 3,35-3,45 (м, 2Н), 2,21-2,35 (м, 2Н), 1,75 (с, 3Н).

ПРИКЛАД 433

10 1-(2,4-диметилбензил)-7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹Н ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) 13,07 (с, 1Н), 8,21-8,30 (м, 1Н), 7,85-7,91 (м, 1Н), 7,83 (д, J=7,9 Гц, 1Н), 7,49-7,57 (м, 2Н), 7,48 (д, J=8,1 Гц, 1Н), 7,36-7,44 (м, 1Н), 7,27 (т, J=7,3 Гц, 1Н), 7,17 (д, J=7,1 Гц, 1Н), 7,07-7,14 (м, 1Н), 7,02 (т, J=7,3 Гц, 1Н), 6,91 (д, J=7,5 Гц, 1Н), 6,88 (д, J=7,1 Гц, 1Н), 6,81 (д, J=7,5 Гц, 1Н), 6,76 (с, 1Н), 6,56 (д, J=7,9 Гц, 1Н), 5,38 (д, J=7,9 Гц, 1Н), 5,28 (д, J=17,4 Гц, 1Н), 5,09 (д, J=17,4 Гц, 1Н), 4,25 (т, J=6,1 Гц, 2Н), 3,41 (т, J=7,3 Гц, 2Н), 2,22-2,36 (м, 2Н), 2,11 (с, 3Н), 1,64 (с, 3Н), 1,54 (с, 3Н).

ПРИКЛАД 434

20 1-(4-карбоксибензил)-7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹Н ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 13,09 (с, 1Н), 12,79 (с, 1Н), 8,19-8,30 (м, 1Н), 7,85-7,91 (м, 1Н), 7,83 (д, J=7,9 Гц, 1Н), 7,62 (д, J=8,3 Гц, 2Н), 7,49-7,58 (м, 2Н), 7,46 (д, J=8,3 Гц, 1Н), 7,35-7,43 (м, 1Н), 7,28 (т, J=7,5 Гц, 1Н), 7,19 (д, J=7,5 Гц, 1Н), 7,09-7,16 (м, 1Н), 7,06 (т, J=7,5 Гц, 1Н), 6,89-7,01 (м, 3Н), 6,33 (д, J=8,3 Гц, 2Н), 5,43 (д, J=17,1 Гц, 1Н), 5,25 (д, J=17,1 Гц, 1Н), 4,23 (т, J=6,1 Гц, 2Н), 3,36-3,46 (м, 2Н), 2,19-2,35 (м, 2Н), 1,71 (с, 3Н).

ПРИКЛАД 435

1-(1,1'-біфеніл-2-ілметил)-7-(2-морфолін-4-ілфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹Н ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,90 (с, 1Н), 8,23-8,31 (м, 1Н), 7,85-7,89 (м, 1Н), 7,82 (дд, J=7,5, 2,0 Гц, 1Н), 7,48-7,58 (м, 2Н), 7,42-7,48 (м, 2Н), 7,32-7,42 (м, 5Н), 7,04-7,15 (м, 4Н), 6,96-7,04 (м, 2Н), 6,88-6,96 (м, 1Н), 6,86 (д, J=7,5 Гц, 1Н), 6,62-6,72 (м, 2Н), 5,55 (д, J=18,0 Гц, 1Н), 5,47 (д, J=7,8 Гц, 1Н), 5,16 (д, J=18,0 Гц, 1Н), 4,19 (т, J=6,1 Гц, 2Н), 3,31-3,51 (м, 4Н), 3,00-3,10 (м, 2Н), 2,73-2,84 (м, 2Н), 2,20-2,31 (м, 4Н).

ПРИКЛАД 436

35 1-(1,1'-біфеніл-3-ілметил)-7-(2-морфолін-4-ілфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹Н ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 13,23 (с, 1Н), 8,21-8,33 (м, 1Н), 7,83-7,91 (м, 1Н), 7,77 (дд, J=7,1, 2,4 Гц, 1Н), 7,49-7,57 (м, 2Н), 7,45 (д, J=8,3 Гц, 1Н), 7,26-7,41 (м, 8Н), 7,18 (дд, J=7,5, 1,6 Гц, 1Н), 7,05-7,14 (м, 4Н), 7,00 (т, J=7,3 Гц, 1Н), 6,81 (д, J=7,5 Гц, 1Н), 6,60 (с, 1Н), 6,30 (д, J=7,9 Гц, 1Н), 5,82 (д, J=16,7 Гц, 1Н), 5,02 (д, J=16,7 Гц, 1Н), 4,16 (т, J=5,9 Гц, 2Н), 3,33-3,45 (м, 2Н), 3,15-3,26 (м, 4Н), 2,89 (с, 2Н), 2,53-2,70 (м, 2Н), 2,13-2,31 (м, 2Н).

ПРИКЛАД 437

1-(1,1'-біфеніл-4-ілметил)-7-(2-морфолін-4-ілфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

45 ¹Н ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 13,20 (с, 1Н), 8,22-8,31 (м, 1Н), 7,83-7,91 (м, 1Н), 7,75-7,82 (м, 1Н), 7,50-7,57 (м, 2Н), 7,33-7,50 (м, 6Н), 7,24-7,33 (м, 3Н), 7,21 (дд, J=7,5, 1,7 Гц, 1Н), 6,97-7,15 (м, 4Н), 6,83 (д, J=6,8 Гц, 1Н), 6,40 (д, J=8,1 Гц, 2Н), 5,79 (д, J=16,3 Гц, 1Н), 4,99 (д, J=16,3 Гц, 1Н), 4,17 (т, J=6,1 Гц, 2Н), 3,29-3,52 (м, 2Н), 3,15-3,28 (м, 2Н), 2,90 (с, 2Н), 2,53-2,71 (м, 4Н), 2,18-2,30 (м, 2Н).

ПРИКЛАД 438

50 1-(2,4-диметилбензил)-7-(2-морфолін-4-ілфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

55 ¹Н ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 13,05 (с, 1Н), 8,23-8,34 (м, 1Н), 7,84-7,92 (м, 1Н), 7,80 (дд, J=7,5, 1,7 Гц, 1Н), 7,49-7,59 (м, 2Н), 7,46 (д, J=8,5 Гц, 1Н), 7,30-7,41 (м, 2Н), 7,00-7,13 (м, 3Н), 6,88-6,98 (м, 2Н), 6,86 (д, J=6,4 Гц, 1Н), 6,52 (д, J=8,1 Гц, 1Н), 5,65 (д, J=17,0 Гц, 1Н), 5,41 (д, J=8,1 Гц, 1Н), 4,99 (д, J=17,0 Гц, 1Н), 4,20 (т, J=6,3 Гц, 2Н), 3,38-3,53 (м, 2Н), 3,12-3,25 (м, 2Н), 2,79-3,01 (м, 2Н), 2,51-2,60 (м, 4Н), 2,17-2,35 (м, 2Н), 2,02-2,10 (м, 3Н), 1,59 (с, 3Н).

ПРИКЛАД 439

60 1-(2,6-дихлорбензил)-7-(2-морфолін-4-ілфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

- ¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) 12,90 (с, 1H), 8,23-8,31 (м, 1H), 7,83-7,90 (м, 1H), 7,74 (дд, J=7,5, 1,7 Гц, 1H), 7,48-7,57 (м, 2H), 7,45 (д, J=8,5 Гц, 1H), 7,30-7,42 (м, 2H), 7,27 (дд, J=7,6, 1,5 Гц, 1H), 7,15-7,23 (м, 3H), 6,98-7,14 (м, 4H), 6,80 (д, J=6,8 Гц, 1H), 5,80 (д, J=16,3 Гц, 1H), 4,97 (д, J=15,9 Гц, 1H), 4,06-4,18 (м, 2H), 3,19-3,34 (м, 4H), 2,95 (шс, 2H), 2,60-2,70 (м, 4H), 2,10-2,24 (м, 2H).
- 5 ПРИКЛАД 440
1-(4-карбоксибензил)-7-(2-морфолін-4-ілфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота
- ¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) 13,14 (с, 1H), 12,79 (с, 1H), 8,23-8,32 (м, 1H), 7,83-7,91 (м, 1H), 7,79 (дд, J=5,8, 3,4 Гц, 1H), 7,55-7,61 (м, 2H), 7,49-7,55 (м, 2H), 7,45 (д, J=8,5 Гц, 2H), 7,32-7,41 (м, 2H), 7,01-7,14 (м, 4H), 6,95 (т, J=8,0 Гц, 1H), 6,84 (д, J=6,8 Гц, 1H), 6,37 (д, J=8,5 Гц, 2H), 5,86 (д, J=17,3 Гц, 1H), 5,02 (д, J=17,0 Гц, 1H), 4,16 (т, J=6,1 Гц, 2H), 3,38-3,50 (м, 2H), 3,13-3,27 (м, 2H), 2,81-2,97 (м, 2H), 2,52-2,70 (м, 4H), 2,16-2,31 (м, 2H).
- 10 ПРИКЛАД 441
7-(6,6-диметилциклогекс-1-ен-1-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота
- 15 ¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) 12,98 (с, 1H), 10,41 (с, 1H), 8,15-8,33 (м, 1H), 7,78-7,95 (м, 1H), 7,34-7,58 (м, 5H), 6,86-6,99 (м, 3H), 5,46 (т, J=3,6 Гц, 1H), 4,19 (т, J=6,1 Гц, 2H), 3,33-3,38 (м, 2H), 2,10-2,28 (м, 4H), 1,62-1,82 (м, 4H), 0,97 (с, 6H).
- 20 ПРИКЛАД 442
7-(5,5-диметилциклопент-1-ен-1-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота
- 25 ¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) 13,04 (с, 1H), 10,19 (с, 1H), 8,16-8,30 (м, 1H), 7,79-7,92 (м, 1H), 7,42-7,63 (м, 4H), 7,34-7,42 (м, 1H), 6,93-7,08 (м, 2H), 6,90 (д, J=6,4 Гц, 1H), 5,78 (т, J=2,4 Гц, 1H), 4,19 (т, J=6,1 Гц, 2H), 3,33-3,42 (м, 2H), 2,42-2,49 (м, 2H), 2,13-2,29 (м, 2H), 1,90 (т, J=7,0 Гц, 2H), 1,11 (с, 6H).
- ПРИКЛАД 443
3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(7-фенілциклогепт-1-ен-1-іл)-1H-індол-2-карбонова кислота
- 30 ¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) 13,02 (с, 1H), 10,25 (с, 1H), 8,13-8,24 (м, 1H), 7,80-7,90 (м, 1H), 7,32-7,58 (м, 7H), 7,24 (т, J=7,6 Гц, 2H), 7,10 (т, J=7,1 Гц, 1H), 6,97 (д, J=6,1 Гц, 1H), 6,80-6,90 (м, 2H), 6,29 (т, J=6,3 Гц, 1H), 4,21 (т, J=4,7 Гц, 1H), 4,14 (т, J=5,9 Гц, 2H), 3,21-3,32 (м, 2H), 2,31-2,45 (м, 2H), 2,10-2,24 (м, 4H), 1,50-1,85 (м, 3H), 1,30-1,49 (м, 1H).
- ПРИКЛАД 444
3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-трицикло(4.3.1.1^{3,8})ундец-4-ен-4-іл-1H-індол-2-карбонова кислота
- 35 ¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) 13,15 (с, 1H), 9,53 (с, 1H), 8,12-8,32 (м, 1H), 7,72-7,93 (м, 1H), 7,27-7,62 (м, 5H), 7,01-7,07 (м, 1H), 6,93-7,01 (м, 1H), 6,87 (д, J=6,4 Гц, 1H), 6,30-6,42 (м, 1H), 4,17 (т, J=6,1 Гц, 2H), 3,33-3,41 (м, 2H), 2,63-2,71 (м, 1H), 2,11-2,26 (м, 4H), 1,70-2,06 (м, 11H).
- ПРИКЛАД 445
3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2-фенілциклогепт-1-ен-1-іл)-1H-індол-2-карбонова кислота
- 40 ¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) 12,94 (с, 1H), 10,53 (с, 1H), 8,17-8,26 (м, 1H), 7,81-7,89 (м, 1H), 7,47-7,56 (м, 2H), 7,32-7,47 (м, 3H), 6,87-6,98 (м, 5H), 6,85 (д, J=6,4 Гц, 1H), 6,65-6,77 (м, 2H), 4,13 (т, J=6,1 Гц, 2H), 3,18-3,30 (м, 2H), 2,73-3,07 (м, 2H), 2,24-2,44 (м, 2H), 2,16 (т, J=6,6 Гц, 2H), 1,38-2,05 (м, 6H).
- ПРИКЛАД 446
3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2,6,6-триметилциклогекс-1-ен-1-іл)-1H-індол-2-карбонова кислота
- 45 ¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) 12,96 (с, 1H), 10,46 (с, 1H), 8,19-8,36 (м, 1H), 7,77-7,97 (м, 1H), 7,48-7,60 (м, 3H), 7,46 (д, J=8,1 Гц, 1H), 7,34-7,42 (м, 1H), 6,94-7,01 (м, 1H), 6,89 (д, J=6,8 Гц, 1H), 6,83 (д, J=6,1 Гц, 1H), 4,20 (т, J=6,1 Гц, 2H), 3,22-3,33 (м, 2H), 2,12-2,31 (м, 3H), 1,91-2,05 (м, 1H), 1,69-1,84 (м, 3H), 1,45-1,59 (м, 1H), 1,17 (с, 3H), 1,05 (с, 3H), 0,74 (с, 3H).
- 50 ПРИКЛАД 447
3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-((1R, 4R)-1,7,7-триметилбіцикло(2.2.1)гепт-2-ен-2-іл)-1H-індол-2-карбонова кислота
- 55 ¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) 13,18 (с, 1H), 9,34 (с, 1H), 8,16-8,27 (м, 1H), 7,81-7,90 (м, 1H), 7,47-7,59 (м, 3H), 7,45 (д, J=8,1 Гц, 1H), 7,33-7,41 (м, 1H), 7,07 (д, J=7,3 Гц, 1H), 7,00 (т, J=7,5 Гц, 1H), 6,89 (д, J=7,5 Гц, 1H), 6,38 (д, J=3,6 Гц, 1H), 4,18 (т, J=5,9 Гц, 2H), 3,32-3,39 (м, 2H), 2,54 (т, J=3,4 Гц, 1H), 2,15-2,28 (м, 2H), 1,89-2,04 (м, 1H), 1,64-1,78 (м, 1H), 1,30-1,45 (м, 1H), 1,07-1,19 (м, 1H), 1,04 (с, 3H), 0,98 (с, 3H), 0,86 (с, 3H).
- ПРИКЛАД 448

7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-4-(трифторметил)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹Н ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) 13,23 (с, 1Н), 11,20 (с, 1Н), 8,21-8,37 (м, 1Н), 7,83-7,90 (м, 1Н), 7,62 (д, J=7,8 Гц, 1Н), 7,22-7,58 (м, 8Н), 7,20 (д, J=1,5 Гц, 1Н), 6,99 (д, J=7,1 Гц, 1Н), 4,25 (т, J=5,8 Гц, 2Н), 3,35-3,48 (м, 2Н), 2,09-2,23 (м, 2Н), 2,05 (с, 3Н).

ПРИКЛАД 449

7-(2-морфолін-4-ілфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-4-(трифторметил)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹Н ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) 13,51 (с, 1Н), 10,79 (с, 1Н), 8,23-8,38 (м, 1Н), 7,82-7,91 (м, 1Н), 7,67 (д, J=7,8 Гц, 1Н), 7,35-7,57 (м, 7Н), 7,15-7,27 (м, 2Н), 6,94-7,04 (м, 1Н), 4,25 (т, J=5,9 Гц, 2Н), 3,37-3,51 (м, 2Н), 3,07-3,36 (м, 4Н), 2,71-2,87 (м, 4Н), 2,17 (с, 2Н).

ПРИКЛАД 450

1-(2-(диметиламіно)етил)-7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹Н ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) 8,14-8,30 (м, 1Н), 7,84-7,92 (м, 1Н), 7,80 (д, J=1,9 Гц, 1Н), 7,32-7,59 (м, 8Н), 7,15 (т, J=7,7 Гц, 1Н), 6,99 (д, J=5,9 Гц, 1Н), 6,92 (д, J=6,3 Гц, 1Н), 4,45-4,78 (м, 1Н), 4,23 (т, J=5,6 Гц, 2Н), 3,42 (с, 3Н), 3,35-3,41 (м, 2Н), 3,19-3,23 (м, 3Н), 2,70-2,75 (м, 2Н), 2,17-2,35 (м, 4Н), 2,00 (с, 3Н).

ПРИКЛАД 451

7-(1,1'-біфеніл-2-ілметил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹Н ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) 12,99 (с, 1Н), 11,25 (с, 1Н), 8,15-8,33 (м, 1Н), 7,76-7,95 (м, 1Н), 7,47-7,57 (м, 2Н), 7,23-7,47 (м, 11Н), 7,05-7,11 (м, 1Н), 6,80-6,91 (м, 2Н), 6,58 (д, J=6,7 Гц, 1Н), 4,26 (с, 2Н), 4,17 (т, J=5,9 Гц, 2Н), 3,28-3,36 (м, 2Н), 2,15-2,26 (м, 2Н).

ПРИКЛАД 452

7-(1,1'-біфеніл-3-ілметил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹Н ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) 13,05 (с, 1Н), 11,39 (с, 1Н), 8,06-8,34 (м, 1Н), 7,81-7,89 (м, 1Н), 7,68 (с, 1Н), 7,61 (д, J=7,1 Гц, 2Н), 7,30-7,56 (м, 12Н), 7,23-7,30 (м, 1Н), 7,07 (д, J=6,3 Гц, 1Н), 6,89-6,97 (м, 1Н), 6,87 (д, J=1,5 Гц, 1Н), 4,38 (с, 2Н), 4,16 (т, J=5,9 Гц, 2Н), 3,27-3,31 (м, 2Н), 2,14-2,23 (м, 2Н).

ПРИКЛАД 453

7-(1-(2-(1-нафтилокси)етил)вініл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹Н ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) 13,03 (с, 1Н), 10,51 (с, 1Н), 8,14-8,30 (м, 1Н), 7,92 (д, J=1,5 Гц, 1Н), 7,83-7,89 (м, 1Н), 7,81 (д, J=1,5 Гц, 1Н), 7,62 (д, J=8,1 Гц, 1Н), 7,28-7,54 (м, 8Н), 7,18 (д, J=6,1 Гц, 1Н), 6,94-7,03 (м, 1Н), 6,87 (д, J=1,5 Гц, 2Н), 5,51 (с, 1Н), 5,37 (д, J=1,7 Гц, 1Н), 4,11-4,26 (м, 4Н), 3,32-3,37 (м, 2Н), 3,16 (т, J=6,1 Гц, 2Н), 2,15-2,26 (м, 2Н).

ПРИКЛАД 454

3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2-(феноксиметил)бензил)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹Н ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) 13,01 (с, 1Н), 11,24 (с, 1Н), 8,09-8,34 (м, 1Н), 7,72-7,94 (м, 1Н), 7,41-7,58 (м, 5Н), 7,32-7,41 (м, 1Н), 7,17-7,30 (м, 4Н), 7,00 (дд, J=6,6, 2,5 Гц, 1Н), 6,87-6,96 (м, 5Н), 6,79-6,87 (м, 1Н), 5,13 (с, 2Н), 4,39 (с, 2Н), 4,17 (т, J=6,1 Гц, 2Н), 3,32-3,40 (м, 2Н), 2,15-2,25 (м, 2Н).

ПРИКЛАД 455

3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2-(2-феноксіетил)феніл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹Н ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) 12,95 (с, 1Н), 10,60 (с, 1Н), 10,60 (с, 1Н), 8,17-8,32 (м, 1Н), 7,82-7,91 (м, 1Н), 7,70-7,78 (м, 1Н), 7,29-7,58 (м, 7Н), 7,20-7,27 (м, 1Н), 7,04-7,15 (м, 4Н), 6,89 (д, J=6,4 Гц, 1Н), 6,79 (т, J=7,5 Гц, 1Н), 6,52 (д, J=7,8 Гц, 2Н), 4,21 (т, J=6,1 Гц, 2Н), 3,93 (т, J=7,6 Гц, 2Н), 3,36-3,45 (м, 2Н), 2,70-2,95 (м, 2Н), 2,16-2,31 (м, 2Н).

ПРИКЛАД 456

3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(3-(2-феноксіетил)феніл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹Н ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) 13,06 (с, 1Н), 10,34 (с, 1Н), 8,10-8,33 (м, 1Н), 7,80-7,98 (м, 1Н), 7,70 (д, J=7,8 Гц, 1Н), 7,59 (с, 1Н), 7,34-7,56 (м, 8Н), 7,22-7,31 (м, 3Н), 7,05-7,13 (м, 1Н), 6,95 (д, J=8,8 Гц, 2Н), 6,85-6,93 (м, 2Н), 4,26 (т, J=6,8 Гц, 2Н), 4,19 (т, J=5,9 Гц, 2Н), 3,35-3,43 (м, 2Н), 3,14 (т, J=6,8 Гц, 2Н), 2,16-2,32 (м, 2Н).

ПРИКЛАД 457

3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2-(3-феноксипропіл)феніл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹Н ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) 12,92 (с, 1Н), 10,50 (с, 1Н), 8,09-8,41 (м, 1Н), 7,82-8,01 (м, 1Н), 7,70 (дд, J=6,4, 2,7 Гц, 1Н), 7,47-7,57 (м, 2Н), 7,45 (д, J=8,5 Гц, 1Н), 7,33-7,42 (м, 2Н), 7,25-7,32 (м, 1Н), 7,18-7,24 (м, 2Н), 7,12-7,18 (м, 2Н), 7,01-7,09 (м, 2Н), 6,88 (д, J=7,5 Гц, 1Н), 6,83 (т, J=7,3 Гц, 1Н), 6,66 (д, J=7,8 Гц, 2Н), 4,20 (т, J=6,1 Гц, 2Н), 3,56-3,75 (м, 2Н), 3,29-3,41 (м, 2Н), 2,63 (д, J=6,1 Гц, 2Н), 2,18-2,31 (м, 2Н), 1,68-1,84 (м, 2Н).

ПРИКЛАД 458

3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(3-(3-феноксипропіл)феніл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) 13,03 (с, 1H), 10,32 (с, 1H), 8,05-8,32 (м, 1H), 7,80-7,98 (м, 1H), 7,69 (д, J=7,8 Гц, 1H), 7,34-7,56 (м, 7H), 7,22-7,32 (м, 3H), 7,20 (д, J=6,1 Гц, 1H), 7,03-7,11 (м, 1H), 6,86-6,97 (м, 4H), 4,19 (т, J=6,1 Гц, 2H), 4,01 (т, J=6,4 Гц, 2H), 3,37 (т, J=7,5 Гц, 2H), 2,80-2,90 (м, 2H), 2,16-2,32 (м, 2H), 2,01-2,16 (м, 2H).

ПРИКЛАД 459

3-(3-(3-гідрокси-2-метилфеноксипропіл)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) 12,88 (шир.с, 1H), 10,44 (шир.с, 1H), 9,17 (с, 1H), 7,66 (д, 1H), 7,20-7,36 (м, 4H), 7,11 (т, 1H), 7,02-7,06 (м, 1H), 6,88 (т, 1H), 6,42 (д, 1H), 6,35 (д, 1H), 3,96 (т, 2H), 3,25 (т, 2H), 2,04-2,12 (м, 5H), 2,02 (с, 3H).

ПРИКЛАД 460

3-(3-(3-(2-метоксіетокси)-2-метилфеноксипропіл)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) 12,91 (шир.с, 1H), 10,46 (с, 1H), 7,65 (д, 1H), 7,19-7,37 (м, 4H), 7,01-7,14 (м, 3H), 6,51-6,61 (м, 2H), 4,05-4,09 (м, 2H), 4,00 (т, 2H), 3,65-3,69 (м, 2H), 3,33 (с, 3H), 3,23-3,29 (м, 2H), 2,02-2,15 (м, 8H).

ПРИКЛАД 461

7-(1,2-диметилпроп-1-еніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) 12,95 (шир.с, 1H), 10,63 (с, 1H), 8,22-8,29 (м, 1H), 7,83-7,90 (м, 1H), 7,33-7,59 (м, 5H), 6,84-7,00 (м, 3H), 4,18 (т, 2H), 3,27-3,37 (м, 2H), 2,16-2,26 (м, 2H), 1,94 (с, 3H), 1,84 (с, 3H), 1,40 (с, 3H).

ПРИКЛАД 462

3-(3-(2-метил-3-(2-морфолін-4-ілетокси)феноксипропіл)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) 12,88 (шир.с, 1H), 10,50 (с, 1H), 7,65 (д, 1H), 7,16-7,36 (м, 4H), 7,02-7,16 (м, 3H), 6,58-6,68 (м, 2H), 4,33 (т, 2H), 3,99-4,04 (м, 4H), 3,49-3,75 (м, 6H), 3,23-3,28 (м, 4H), 2,07-2,14 (м, 5H), 2,05 (с, 3H).

ПРИКЛАД 463

3-(3-(2,3-дихлорфеноксипропіл)-7-(2-морфолін-4-ілфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) 13,04 (шир.с, 1H), 10,04 (с, 1H), 7,71 (д, 1H), 7,31-7,45 (м, 3H), 7,27 (т, 1H), 7,09-7,22 (м, 4H), 7,00-7,07 (м, 1H), 4,09 (т, 2H), 3,18-3,34 (м, 6H), 2,73-2,81 (м, 4H), 2,09-2,19 (м, 2H).

ПРИКЛАД 464

1-(2-морфолін-4-ілетил)-7-(2-морфолін-4-ілфеніл)-3-(3-(5,6,7,8-тетрагідронафталін-1-ілокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) 13,31 (шир.с, 1H), 7,71-7,80 (м, 1H), 7,50-7,56 (м, 1H), 7,40-7,46 (м, 1H), 7,14-7,23 (м, 3H), 7,07 (д, 1H), 6,99 (т, 1H), 6,59-6,65 (м, 2H), 3,96 (т, 2H), 3,19-3,35 (м, 10H), 3,08-3,18 (м, 4H), 2,55-2,89 (м, 10H), 2,00-2,14 (м, 3H), 1,56-1,85 (м, 5H).

ПРИКЛАД 465

7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилтіо)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) 12,89 (шир.с, 1H), 10,48 (с, 1H), 8,23-8,28 (м, 1H), 7,92-7,97 (м, 1H), 7,78 (д, 1H), 7,54-7,64 (м, 3H), 7,46-7,50 (м, 1H), 7,42 (т, 1H), 7,30-7,35 (м, 2H), 7,24-7,29 (м, 1H), 7,19-7,23 (м, 1H), 7,08 (т, 1H), 7,01-7,05 (м, 1H), 3,24 (т, 2H), 3,11 (т, 2H), 2,04 (с, 3H), 1,94-2,02 (м, 2H).

ПРИКЛАД 466

3-(3-(3-(2-метоксіетокси)-5-метилфеноксипропіл)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) 12,86 (шир.с, 1H), 10,41 (с, 1H), 7,67 (д, 1H), 7,31-7,34 (м, 2H), 7,20-7,30 (м, 2H), 7,11 (т, 1H), 7,02-7,06 (м, 1H), 6,30-6,35 (м, 2H), 6,25-6,28 (м, 1H), 4,00-4,05 (м, 2H), 3,96 (т, 2H), 3,59-3,65 (м, 2H), 3,21 (т, 2H), 2,21 (с, 3H), 2,00-2,11 (м, 5H).

ПРИКЛАД 467

7-(2-морфолін-4-ілфеніл)-3-(3-(5,6,7,8-тетрагідронафталін-1-ілокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) 13,04 (шир.с, 1H), 10,02 (с, 1H), 7,70 (д, 1H), 7,33-7,45 (м, 3H), 7,12-7,22 (м, 3H), 6,97 (т, 1H), 6,61 (т, 2H), 3,96 (т, 2H), 3,20-3,30 (м, 6H), 2,73-2,82 (м, 4H), 2,69 (т, 2H), 2,62 (т, 2H), 2,04-2,16 (м, 2H), 1,63-1,80 (м, 4H).

ПРИКЛАД 468

3-(3-(3-метил-5-(3-морфолін-4-ілпропокси)феноксипропіл)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, CDCl₃) δ 8,41 (с, 1H), 7,71 (с, 1H), 7,27-7,40 (м, 4H), 7,16-7,24 (м, 2H), 6,34 (с, 1H), 6,21-6,29 (м, 2H), 3,99-4,09 (м, 6H), 3,93 (т, 2H), 3,65-3,74 (м, 2H), 3,23-3,39 (м, 4H), 2,85-2,98 (м, 2H), 2,11-2,30 (м, 10H).

ПРИКЛАД 469

5 3-(3-(3-(3-циклогексилпропокси)-5-метилфенокси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота

ПРИКЛАД 469A

етил 7-бром-3-(3-(3-гідрокси-5-метилфенокси)пропіл)-1H-індол-2-карбоксилат

10 Суспензію етил 7-бром-3-(3-гідроксипропіл)-1H-індол-2-карбоксилату (ПРИКЛАД 1C) (0,9 г), 5-метилбензол-1,3-діолу (1,028 г), трифенілфосфіну (0,868 г), дибензилазодикарбоксилату (0,762 г) і тетрагідрофурану (40 мл) перемішували при кімнатній температурі протягом 19 годин. Після видалення розчинника неочищений продукт очищали флеш-хроматографією на силікагелі, (Analoxix, SF65-200 г), елюючи сумішшю 0-10 % етилацетату у гексані.

ПРИКЛАД 469B

15 етил 7-бром-3-(3-(3-гідрокси-5-метилфенокси)пропіл)-1H-індол-2-карбоксилат

Суспензію сполуки Прикладу 469A (0,067 г), 3-циклогексилпропан-1-олу (0,22 г), трифенілфосфіну (0,081 г), дибензилазодикарбоксилату (0,071 г) у тетрагідрофурані (3 мл) перемішували при кімнатній температурі протягом 2 годин. Зразок відразу очищали флеш-хроматографією на силікагелі (Analoxix, SF25-40 г), елюючи сумішшю 0→20 % етилацетату у гексані.

ПРИКЛАД 469C

3-(3-(3-(3-циклогексилпропокси)-5-метилфенокси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота

25 Зазначену у заголовку сполуку одержували відповідно до процедури Прикладу 164G із заміщенням сполуки Прикладу 164F сполукою Прикладу 469B. ¹H ЯМР (500 МГц, CDCl₃) δ 8,41 (с, 1H), 7,68-7,76 (м, 1H), 7,28-7,39 (м, 4H), 7,16-7,23 (м, 2H), 6,24-6,35 (м, 3H), 4,00 (т, 2H), 3,88 (т, 2H), 3,33 (т, 2H), 2,15-2,28 (м, 8H), 1,61-1,79 (м, 7H), 1,09-1,35 (м, 6H), 0,83-0,96 (м, 2H).

ПРИКЛАД 470

30 3-(3-(3-(3-(2-карбокси-1H-індол-3-іл)пропокси)-5-метилфенокси)пропіл)-7-(2-морфолін-4-ілфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (300 МГц, DMSO-d₆) 11,42 (с, 1H), 10,04 (с, 1H), 7,71 (д, 1H), 7,63 (д, 1H), 7,31-7,44 (м, 4H), 7,12-7,23 (м, 4H), 6,96-7,01 (м, 1H), 6,15-6,32 (м, 3H), 3,86-3,94 (м, 4H), 3,22-3,28 (м, 5H), 3,14-3,20 (м, 4H), 2,71-2,81 (м, 4H), 2,18 (с, 3H), 1,97-2,10 (м, 4H).

ПРИКЛАД 471

35 7-бром-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1-(піридин-4-ілметил)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (300 МГц, DMSO-d₆) 8,66-8,77 (м, 2H), 8,12 (д, 1H), 7,88 (т, 2H), 7,36-7,56 (м, 7H), 7,01 (т, 1H), 6,89 (д, 1H), 6,34 (с, 2H), 4,21 (т, 2H), 3,38 (т, 2H), 2,20-2,29 (м, 2H).

ПРИКЛАД 473

40 7-(2-морфолін-4-ілфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1-(піридин-4-ілметил)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, DMSO-d₆) 13,47 (шир.с, 1H), 8,46 (д, 2H), 8,25-8,31 (м, 1H), 7,83-7,91 (м, 2H), 7,50-7,58 (м, 2H), 7,47 (д, 1H), 7,39 (т, 1H), 7,29-7,34 (м, 1H), 7,15 (т, 1H), 7,02-7,10 (м, 2H), 6,88 (д, 1H), 6,69-6,81 (м, 4H), 6,20 (д, 1H), 5,25 (д, 1H), 4,22 (т, 2H), 3,38-3,53 (м, 2H), 3,19-3,26 (м, 2H), 2,88-3,05 (м, 2H), 2,60-2,76 (м, 4H), 2,22-2,33 (м, 2H).

ПРИКЛАД 474

45 7-(1,1'-бі(циклогексан)-2-єн-2-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

50 ¹H ЯМР (500 МГц, DMSO-d₆) 13,04 (шир.с, 1H), 10,39 (с, 1H), 8,22-8,28 (м, 1H), 7,84-7,89 (м, 1H), 7,48-7,57 (м, 3H), 7,44 (д, 1H), 7,37 (т, 1H), 6,92-7,02 (м, 2H), 6,87 (д, 1H), 5,90-5,97 (м, 1H), 4,16 (т, 2H), 2,77-2,86 (м, 1H), 2,02-2,26 (м, 4H), 1,58-1,82 (м, 4H), 1,38-1,57 (м, 4H), 1,12-1,37 (м, 3H), 0,80-1,11 (м, 5H), 0,58-0,71 (м, 1H).

ПРИКЛАД 475

3-(3-(2,3-дихлорфенокси)пропіл)-7-(1,2-диметилпроп-1-еніл)-1H-індол-2-карбонова кислота

55 ¹H ЯМР (500 МГц, DMSO-d₆) 12,88 (шир.с, 1H), 10,63 (с, 1H), 7,50 (с, 1H), 7,28 (т, 1H), 7,17-7,21 (м, 1H), 7,04-7,08 (м, 1H), 6,97 (т, 1H), 6,88-6,92 (м, 1H), 4,09 (т, 2H), 3,22 (т, 2H), 2,05-2,14 (м, 2H), 1,94 (с, 3H), 1,83 (с, 3H), 1,40 (с, 3H).

ПРИКЛАД 476

7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1-(піридин-2-ілметил)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) 13,26 (шир.с, 1H), 8,30-8,35 (м, 1H), 8,22-8,27 (м, 1H), 7,81-7,91 (м, 2H), 7,64-7,70 (м, 1H), 7,37-7,58 (м, 4H), 7,08-7,34 (м, 4H), 6,80-6,99 (м, 4H), 6,24-6,33 (м, 1H), 5,52 (д, 1H), 5,22 (д, 1H), 4,25 (т, 2H), 3,35-3,49 (м, 2H), 2,24-2,33 (м, 2H), 1,78 (с, 3H).

ПРИКЛАД 477

- 5 7-(2-метил-4-(трифторметил)феніл)-3-(3-(2,3,5-триметилфенокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) 12,74 (шир.с, 1H), 10,96 (с, 1H), 7,65-7,73 (м, 2H), 7,57-7,62 (м, 1H), 7,42 (д, 1H), 7,13 (т, 1H), 7,06 (д, 1H), 6,54 (д, 2H), 3,97 (т, 2H), 3,23-3,30 (м, 2H), 2,15-2,20 (м, 6H), 2,05-2,14 (м, 8H).

- 10 ПРИКЛАД 478

7-(4-фтор-2-метилфеніл)-3-(3-(2,3,5-триметилфенокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота
¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆) 12,89 (шир.с, 1H), 10,69 (с, 1H), 7,66 (д, 1H), 7,13 (д, 5H), 6,54 (д, 2H), 3,97 (т, 2H), 3,25 (т, 2H), 2,14-2,20 (м, 6H), 2,00-2,13 (м, 8H).

ПРИКЛАД 479

- 15 7-(4-метокси-2-метилфеніл)-3-(3-(2,3,5-триметилфенокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (400 МГц, ДМСО-d₆) 10,30 (с, 1H), 7,60-7,66 (м, 1H), 7,05-7,17 (м, 2H), 6,99-7,03 (м, 1H), 6,89-6,92 (м, 1H), 6,82-6,87 (м, 1H), 6,51-6,57 (м, 2H), 3,97 (т, 2H), 3,81 (с, 3H), 2,15-2,20 (м, 6H), 2,02-2,10 (м, 8H).

- 20 ПРИКЛАД 480

7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1-(піридин-3-ілметил)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (400 МГц, ДМСО-d₆) 8,39-8,44 (м, 1H), 8,21-8,28 (м, 1H), 7,80-7,92 (м, 2H), 7,36-7,65 (м, 5H), 7,23-7,34 (м, 2H), 7,11-7,20 (м, 2H), 7,05 (т, 1H), 6,86-6,99 (м, 4H), 5,45 (д, 1H), 5,22 (д, 1H), 4,25 (т, 2H), 2,23-2,32 (м, 2H), 1,73 (с, 3H).

- 25 ПРИКЛАД 481

6-метил-7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (400 МГц, ДМСО-d₆) 12,82 (шир.с, 1H), 9,78 (с, 1H), 8,22-8,28 (м, 1H), 7,84-7,90 (м, 1H), 7,49-7,62 (м, 3H), 7,45 (д, 1H), 7,25-7,42 (м, 4H), 7,09 (д, 1H), 6,99 (д, 1H), 6,90 (д, 1H), 4,20 (т, 2H), 2,18-2,28 (м, 2H), 2,02 (с, 3H), 1,92 (с, 3H).

- 30 ПРИКЛАД 482

3-(3-(2,3-дихлорфенокси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1-(піридин-2-ілметил)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (400 МГц, ДМСО-d₆) 12,96 (шир.с, 1H), 8,22-8,27 (м, 1H), 7,76-7,84 (м, 1H), 7,50-7,57 (м, 1H), 7,30 (т, 1H), 7,05-7,26 (м, 6H), 6,99 (т, 1H), 6,91-6,95 (м, 1H), 6,83-6,88 (м, 1H), 6,06-6,12 (м, 1H), 5,46 (д, 1H), 5,19 (д, 1H), 4,16 (т, 2H), 2,09-2,21 (м, 2H), 1,76 (с, 3H).

- 35 ПРИКЛАД 483

7-(2-метилфеніл)-1-(2-морфолін-4-іл-2-оксоетил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (400 МГц, ДМСО-d₆) 8,23-8,30 (м, 1H), 7,84-7,90 (м, 1H), 7,76 (д, 1H), 7,49-7,59 (м, 2H), 7,31-7,49 (м, 4H), 7,22-7,30 (м, 1H), 7,02-7,15 (м, 2H), 6,88-6,95 (м, 2H), 5,00-5,13 (м, 1H), 4,66-4,81 (м, 1H), 4,23 (т, 2H), 3,07-3,30 (м, 2H), 2,65-2,86 (м, 2H), 2,16-2,29 (м, 2H), 1,95 (с, 3H).

- 40 ПРИКЛАД 484

3-(3-(3,5-дихлорфенокси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (400 МГц, ДМСО-d₆) 10,33 (с, 1H), 7,64 (д, 1H), 7,17-7,33 (м, 4H), 6,99-7,13 (м, 3H), 6,93-6,96 (м, 2H), 4,02 (т, 2H), 3,20 (т, 2H), 2,00-2,10 (м, 5H).

- 45 ПРИКЛАД 485

1-метил-7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆) 8,22-8,25 (м, 1H), 7,85-7,89 (м, 1H), 7,74 (д, 1H), 7,49-7,58 (м, 2H), 7,46 (д, 1H), 7,22-7,43 (м, 5H), 7,05-7,10 (м, 1H), 6,98 (д, 1H), 6,91 (д, 1H), 4,21 (т, 2H), 3,32 (с, 3H), 2,19-2,26 (м, 2H), 1,99 (с, 3H).

- 50 ПРИКЛАД 486

1-метил-7-(2-морфолін-4-ілфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆) 8,22-8,29 (м, 1H), 7,84-7,89 (м, 1H), 7,71 (д, 1H), 7,50-7,57 (м, 2H), 7,45 (д, 1H), 7,34-7,42 (м, 3H), 7,08-7,16 (м, 2H), 7,03 (т, 2H), 6,86 (д, 1H), 4,17 (т, 2H), 3,34-3,40 (м, 5H), 3,09-3,16 (м, 2H), 2,78-2,88 (м, 2H), 2,52-2,63 (м, 4H), 2,18-2,27 (м, 2H).

- 55 ПРИКЛАД 487

1-(3-(амінометил)бензил)-7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (400 МГц, ДМСО-d₆) 13,15 (шир.с, 1H), 8,21-8,29 (м, 1H), 8,01 (с, 2H), 7,76-7,92 (м, 2H), 7,34-7,59 (м, 3H), 7,23-7,32 (м, 1H), 7,02-7,23 (м, 4H), 6,86-7,01 (м, 2H), 6,45 (с, 1H), 6,10 (д, 1H), 5,42 (д, 1H), 5,19 (д, 1H), 4,24 (т, 2H), 3,83 (дд, 2H), 3,40 (т, 2H), 2,20-2,33 (м, 2H).

ПРИКЛАД 488

5 1-(3-(амінометил)бензил)-7-(2-морфолін-4-ілфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (400 МГц, ДМСО-d₆) 8,26-8,31 (м, 1H), 7,91-8,09 (м, 2H), 7,85-7,90 (м, 1H), 7,76-7,83 (м, 1H), 7,49-7,59 (м, 2H), 7,46 (д, 1H), 7,38 (т, 2H), 6,93-7,19 (м, 7H), 6,84 (д, 1H), 6,50 (с, 1H), 6,13 (д, 1H), 5,81 (д, 1H), 4,97 (д, 1H), 4,17 (т, 2H), 3,76-3,82 (м, 2H), 3,30-3,38 (м, 2H), 3,18-3,25 (м, 2H), 2,80-2,99 (м, 2H), 2,53-2,66 (м, 4H), 2,16-2,29 (м, 2H).

ПРИКЛАД 489

7-((E)-2-(2-((E)-2-циклогексилвініл)феніл)вініл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (400 МГц, ДМСО-d₆) 11,66 (с, 1H), 8,18-8,23 (м, 1H), 7,92-8,03 (м, 2H), 7,81-7,88 (м, 1H), 7,68 (д, 1H), 7,32-7,63 (м, 7H), 7,17-7,32 (м, 2H), 7,01 (т, 1H), 6,80-6,90 (м, 2H), 6,02-6,12 (м, 1H), 4,16 (т, 2H), 2,15-2,29 (м, 2H), 1,57-1,85 (м, 5H), 1,11-1,37 (м, 6H).

ПРИКЛАД 490

7-(2-(3-карбоксифеніл)етил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (400 МГц, ДМСО-d₆) 11,42 (с, 1H), 8,20-8,25 (м, 1H), 7,95 (с, 1H), 7,82-7,88 (м, 1H), 7,77 (д, 1H), 7,58 (д, 1H), 7,47-7,55 (м, 3H), 7,32-7,46 (м, 3H), 7,06 (д, 1H), 6,84-6,92 (м, 1H), 4,16 (т, 2H), 2,93-3,01 (м, 2H), 2,14-2,25 (м, 2H).

ПРИКЛАД 491

3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-((E)-2-(2-піридин-3-ілфеніл)вініл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (400 МГц, ДМСО-d₆) 11,74 (с, 1H), 8,72-8,76 (м, 2H), 8,04-8,25 (м, 4H), 7,82-7,88 (м, 1H), 7,71-7,78 (м, 1H), 7,26-7,62 (м, 9H), 7,06 (д, 1H), 6,93 (т, 1H), 6,86 (д, 1H), 4,16 (т, 2H), 3,34 (т, 2H), 2,16-2,25 (м, 2H).

ПРИКЛАД 492

3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2-(3-(((фенілсульфоніл)аміно)карбоніл)феніл)етил)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (400 МГц, ДМСО-d₆) 12,52 (шир.с, 1H), 11,43 (с, 1H), 8,21-8,26 (м, 1H), 7,99-8,06 (м, 2H), 7,90 (с, 1H), 7,84-7,88 (м, 1H), 7,62-7,77 (м, 4H), 7,48-7,60 (м, 4H), 7,34-7,47 (м, 3H), 7,06 (д, 1H), 6,85-6,93 (м, 2H), 4,16 (т, 2H), 3,19-3,25 (м, 2H), 2,92-2,98 (м, 2H), 2,16-2,24 (м, 2H).

ПРИКЛАД 493

7-(2-(3-((4-метилпіперидин-1-іл)карбоніл)феніл)етил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (400 МГц, ДМСО-d₆) 12,95 (шир.с, 1H), 11,37 (с, 1H), 7,83-7,89 (м, 1H), 7,42-7,57 (м, 4H), 7,30-7,42 (м, 3H), 7,27 (с, 1H), 7,14 (д, 1H), 7,03 (д, 1H), 6,85-6,91 (м, 2H), 4,17 (т, 2H), 3,32 (т, 2H), 3,22-3,28 (м, 2H), 2,94-3,00 (м, 2H), 2,63-2,92 (м, 2H), 2,14-2,25 (м, 2H), 1,39-1,75 (м, 3H), 0,93-1,13 (м, 2H), 0,90 (д, 3H).

ПРИКЛАД 494

3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2-(3-(((2-піролідін-1-ілетил)аміно)карбоніл)феніл)етил)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (400 МГц, ДМСО-d₆) 12,96 (шир.с, 1H), 11,42 (с, 1H), 9,36 (с, 1H), 8,60-8,66 (м, 1H), 8,20-8,26 (м, 1H), 7,81-7,91 (м, 2H), 7,67-7,72 (м, 1H), 7,48-7,59 (м, 4H), 7,33-7,48 (м, 3H), 7,06 (д, 1H), 6,85-6,93 (м, 2H), 4,17 (т, 2H), 3,56-3,69 (м, 4H), 2,95-3,12 (м, 4H), 2,15-2,25 (м, 2H), 1,97-2,07 (м, 2H), 1,80-1,92 (м, 2H).

ПРИКЛАД 495

7-(2-(3-(((2-морфолін-4-ілетил)аміно)карбоніл)феніл)етил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (400 МГц, ДМСО-d₆) 12,98 (шир.с, 1H), 11,42 (с, 1H), 9,55 (с, 1H), 8,62-8,69 (м, 1H), 8,20-8,25 (м, 1H), 7,81-7,90 (м, 2H), 7,69 (д, 1H), 7,47-7,59 (м, 4H), 7,33-7,47 (м, 3H), 7,06 (д, 1H), 6,85-6,94 (м, 2H), 4,17 (т, 2H), 3,97-4,05 (м, 2H), 3,50-3,71 (м, 6H), 3,06-3,21 (м, 4H), 2,95-3,04 (м, 2H), 2,16-2,25 (м, 2H).

ПРИКЛАД 496

7-(2-(3-(((2-(диметиламіно)етил)аміно)карбоніл)феніл)етил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (400 МГц, ДМСО-d₆) 12,94 (шир.с, 1H), 11,41 (с, 1H), 9,26 (с, 1H), 8,58-8,64 (м, 1H), 8,19-8,27 (м, 1H), 7,81-7,88 (м, 2H), 7,68 (д, 1H), 7,47-7,58 (м, 4H), 7,33-7,47 (м, 3H), 7,06 (д, 1H), 6,84-6,94 (м, 2H), 4,17 (т, 2H), 3,33 (т, 2H), 3,21-3,30 (м, 4H), 2,95-3,04 (м, 2H), 2,85 (с, 6H), 2,16-2,26 (м, 2H).

ПРИКЛАД 497

3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-((E)-2-(3-(((фенілсульфоніл)аміно)карбоніл)феніл)вініл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (400 МГц, ДМСО-d₆) 13,10 (шир.с, 1H), 12,59 (шир.с, 1H), 11,71 (с, 1H), 8,13-8,27 (м, 3H), 7,95-8,07 (м, 3H), 7,82-7,89 (м, 1H), 7,60-7,77 (м, 6H), 7,47-7,57 (м, 3H), 7,44 (д, 1H), 7,29-7,41 (м, 2H), 7,02 (т, 1H), 6,88 (д, 1H), 4,17 (т, 2H), 3,35 (т, 2H), 2,17-2,27 (м, 2H).

ПРИКЛАД 498

3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-((E)-2-(2-піридин-4-ілфеніл)вініл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (400 МГц, ДМСО-d₆) 13,13 (шир.с, 1H), 11,75 (с, 1H), 8,81-8,88 (м, 2H), 8,15-8,27 (м, 3H), 7,83-7,89 (м, 1H), 7,76-7,80 (м, 2H), 7,56-7,64 (м, 2H), 7,42-7,55 (м, 5H), 7,32-7,40 (м, 2H), 7,10 (д, 1H), 6,94 (т, 1H), 6,86 (д, 1H), 4,16 (т, 2H), 3,34 (т, 2H), 2,16-2,26 (м, 2H).

ПРИКЛАД 499

7-((E)-2-(3-хлорфеніл)вініл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (400 МГц, ДМСО-d₄) 13,11 (шир.с, 1H), 11,68 (с, 1H), 8,12-8,27 (м, 2H), 7,83-7,89 (м, 2H), 7,60-7,72 (м, 3H), 7,48-7,57 (м, 2H), 7,26-7,47 (м, 5H), 6,99-7,08 (м, 1H), 6,88 (д, 1H), 4,18 (т, 2H), 3,35 (т, 2H), 2,17-2,28 (м, 2H).

ПРИКЛАД 500

7-((E)-2-(3-((циклогексиламіно)карбоніл)феніл)вініл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (400 МГц, ДМСО-d₆) 13,08 (шир.с, 1H), 11,73 (с, 1H), 8,13-8,26 (м, 3H), 8,05-8,09 (м, 1H), 7,92-7,97 (м, 1H), 7,83-7,89 (м, 1H), 7,69 (д, 2H), 7,62 (д, 1H), 7,48 (д, 4H), 7,36 (д, 2H), 7,03 (т, 1H), 6,88 (д, 1H), 4,18 (т, 2H), 3,73-3,85 (м, 1H), 2,16-2,28 (м, 2H), 1,81-1,91 (м, 2H), 1,71-1,79 (м, 2H), 1,26-1,38 (м, 6H).

ПРИКЛАД 501

3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-((E)-2-(3-(((2-феноксіетил)аміно)карбоніл)феніл)вініл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (400 МГц, ДМСО-d₆) 13,08 (шир.с, 1H), 8,69-8,74 (м, 1H), 8,10-8,27 (м, 3H), 7,95 (д, 1H), 7,82-7,89 (м, 1H), 7,67-7,76 (м, 2H), 7,62 (д, 1H), 7,43-7,56 (м, 4H), 7,22-7,41 (м, 4H), 6,85-7,07 (м, 5H), 4,11-4,21 (м, 4H), 3,63-3,71 (м, 2H), 2,17-2,27 (м, 2H).

ПРИКЛАД 502

7-((E)-2-(3-(((2-(2-аміноетокси)етокси)етил)аміно)карбоніл)феніл)вініл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (400 МГц, ДМСО-d₆) 13,12 (шир.с, 1H), 11,70 (с, 1H), 8,52 (т, 1H), 8,13-8,27 (м, 2H), 8,10 (с, 1H), 7,98 (д, 1H), 7,83-7,90 (м, 1H), 7,58-7,83 (м, 5H), 7,42-7,57 (м, 4H), 7,28-7,41 (м, 2H), 7,03 (т, 1H), 6,88 (д, 1H), 4,17 (т, 2H), 3,44-3,50 (м, 2H), 3,35 (т, 2H), 2,90-3,02 (м, 2H), 2,15-2,28 (м, 2H).

ПРИКЛАД 503

7-((E)-2-(3-((4-бензилпіперидин-1-іл)карбоніл)феніл)вініл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (400 МГц, ДМСО-d₆) 13,10 (шир.с, 1H), 11,70 (с, 1H), 8,12-8,28 (м, 2H), 7,82-7,90 (м, 1H), 7,59-7,81 (м, 4H), 7,41-7,57 (м, 4H), 7,13-7,40 (м, 8H), 7,03 (т, 1H), 6,88 (д, 1H), 4,41-4,59 (м, 1H), 4,18 (т, 2H), 3,51-3,69 (м, 1H), 3,35 (т, 2H), 2,92-3,10 (м, 1H), 2,67-2,82 (м, 1H), 2,55 (д, 2H), 2,17-2,28 (м, 2H), 1,63-1,90 (м, 3H), 1,08-1,29 (м, 2H).

ПРИКЛАД 504

3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-((E)-2-(3-((4-фенілпіперазин-1-іл)карбоніл)феніл)вініл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (400 МГц, ДМСО-d₆) 11,72 (с, 1H), 8,17-8,25 (м, 2H), 7,80-7,90 (м, 3H), 7,71 (д, 1H), 7,62 (д, 1H), 7,42-7,56 (м, 4H), 7,30-7,41 (м, 3H), 7,24 (т, 2H), 7,03 (т, 1H), 6,98 (с, 2H), 6,88 (д, 1H), 6,82 (т, 1H), 4,17 (т, 2H), 3,75-3,86 (м, 2H), 3,50-3,58 (м, 2H), 3,12-3,26 (м, 4H), 2,18-2,26 (м, 2H).

ПРИКЛАД 505

7-((E)-2-(3-(((3-метилпіперидин-1-іл)карбоніл)феніл)вініл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆) 11,72 (с, 1H), 8,21-8,24 (м, 1H), 8,18 (д, 1H), 7,85-7,88 (м, 1H), 7,74-7,81 (м, 2H), 7,71 (д, 1H), 7,62 (д, 1H), 7,43-7,56 (м, 4H), 7,32-7,40 (м, 2H), 7,24 (д, 1H), 7,03 (т, 1H), 6,88 (д, 1H), 4,17 (т, 2H), 2,19-2,26 (м, 2H), 1,11-1,85 (м, 5H), 0,84 (д, 3H).

ПРИКЛАД 506

7-(2-(3-(((2-(2-аміноетокси)етокси)етил)аміно)карбоніл)феніл)етил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆) 12,97 (шир.с, 1H), 11,45 (с, 1H), 8,47 (т, 1H), 8,21-8,27 (м, 1H), 7,83-7,90 (м, 2H), 7,77 (шир.с, 2H), 7,66 (д, 1H), 7,29-7,58 (м, 7H), 7,07 (д, 1H), 6,86-6,94 (м, 2H),

4,17 (т, 2H), 3,59 (т, 6H), 3,55 (т, 2H), 3,41-3,47 (м, 2H), 3,34 (т, 2H), 3,23-3,29 (м, 2H), 2,92-3,03 (м, 4H), 2,16-2,26 (м, 2H).

ПРИКЛАД 507

3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-((E)-2-(3-((E)-2-фенілвініл)феніл)вініл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆) 13,13 (шир.с, 1H), 11,69 (с, 1H), 8,21-8,25 (м, 1H), 8,18 (д, 1H), 7,85-7,92 (м, 2H), 7,69-7,75 (м, 2H), 7,61-7,66 (м, 3H), 7,49-7,56 (м, 3H), 7,35-7,47 (м, 6H), 7,27-7,34 (м, 3H), 7,04 (т, 1H), 6,89 (д, 1H), 4,18 (т, 2H), 3,36 (т, 2H), 2,18-2,27 (м, 2H).

ПРИКЛАД 508

7-((E)-2-(1,1'-біфеніл-3-іл)вініл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆) 11,68 (с, 1H), 8,18-8,27 (м, 2H), 8,04 (с, 1H), 7,85-7,91 (м, 1H), 7,71-7,82 (м, 4H), 7,65 (д, 1H), 7,49-7,61 (м, 6H), 7,34-7,49 (м, 4H), 7,06 (т, 1H), 6,90 (д, 1H), 4,20 (т, 2H), 2,20-2,30 (м, 2H).

ПРИКЛАД 509

3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-((E)-2-(3-((1E)-3-фенілпроп-1-еніл)феніл)вініл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆) 13,09 (шир.с, 1H), 11,64 (с, 1H), 8,00-8,27 (м, 2H), 7,81-7,89 (м, 1H), 7,47-7,76 (м, 6H), 7,09-7,46 (м, 10H), 7,02 (т, 1H), 6,88 (д, 1H), 6,52 (с, 1H), 4,17 (т, 2H), 2,62-2,70 (м, 2H), 2,17-2,27 (м, 2H).

ПРИКЛАД 510

3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-((E)-2-(4-((E)-2-фенілвініл)феніл)вініл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (400 МГц, ДМСО-d₆) 13,09 (с, 1H), 11,71 (с, 1H), 8,20-8,25 (м, 1H), 8,17 (д, 1H), 7,83-7,89 (м, 1H), 7,78 (д, 2H), 7,70 (д, 1H), 7,58-7,67 (м, 5H), 7,22-7,56 (м, 10H), 7,03 (т, 1H), 6,88 (д, 1H), 4,18 (т, 2H), 3,35 (т, 2H), 2,17-2,28 (м, 2H).

ПРИКЛАД 511

3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-((E)-2-(4-((1E)-3-фенілпроп-1-еніл)феніл)вініл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (400 МГц, ДМСО-d₆) 13,04 (шир.с, 1H), 11,68 (с, 1H), 8,19-8,27 (м, 1H), 8,06-8,16 (м, 1H), 7,83-7,89 (м, 1H), 7,64-7,75 (м, 3H), 7,56-7,62 (м, 1H), 7,18-7,55 (м, 12H), 7,01 (т, 1H), 6,87 (д, 1H), 6,41-6,56 (м, 2H), 4,17 (т, 2H), 3,53-3,58 (м, 2H), 2,15-2,28 (м, 2H).

ПРИКЛАД 512

7-((E)-2-(1,1'-біфеніл-4-іл)вініл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (400 МГц, ДМСО-d₆) δ 13,07 (шир.с, 1H), 11,73 (с, 1H), 8,15-8,26 (м, 2H), 7,82-7,90 (м, 3H), 7,68-7,76 (м, 5H), 7,62 (д, 1H), 7,32-7,56 (м, 8H), 7,03 (т, 1H), 6,88 (д, 1H), 4,18 (т, 2H), 3,36 (т, 2H), 2,18-2,28 (м, 2H).

ПРИКЛАД 513

7-(2-(1,1'-біфеніл-3-іл)етил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (400 МГц, ДМСО-d₆) 12,95 (шир.с, 1H), 11,36 (с, 1H), 8,21-8,26 (м, 1H), 7,83-7,89 (м, 1H), 7,56-7,66 (м, 3H), 7,30-7,56 (м, 11H), 7,10 (д, 1H), 6,84-6,95 (м, 2H), 4,17 (т, 2H), 2,97-3,05 (м, 2H), 2,15-2,26 (м, 2H).

ПРИКЛАД 514

3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2-(3-(3-фенілпропіл)феніл)етил)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (400 МГц, ДМСО-d₆) 12,91 (шир.с, 1H), 11,33 (с, 1H), 8,21-8,26 (м, 1H), 7,83-7,89 (м, 1H), 7,41-7,56 (м, 4H), 7,37 (т, 1H), 6,83-7,32 (м, 12H), 4,16 (т, 2H), 3,19-3,26 (м, 2H), 2,87-2,94 (м, 2H), 2,52-2,63 (м, 4H), 2,14-2,26 (м, 2H), 1,79-1,91 (м, 2H).

ПРИКЛАД 515

7-((E)-2-(2-хлорфеніл)вініл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (400 МГц, ДМСО-d₆) 13,07 (шир.с, 1H), 11,75 (с, 1H), 8,13-8,24 (м, 3H), 7,82-7,88 (м, 1H), 7,67 (т, 2H), 7,28-7,57 (м, 8H), 7,04 (т, 1H), 6,88 (д, 1H), 4,17 (т, 2H), 3,35 (т, 2H), 2,17-2,28 (м, 2H).

ПРИКЛАД 516

7-((E)-2-(1,1'-біфеніл-2-іл)вініл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (400 МГц, ДМСО-d₆) 13,08 (шир.с, 1H), 11,73 (с, 1H), 8,06-8,24 (м, 3H), 7,82-7,89 (м, 1H), 7,28-7,62 (м, 13H), 7,21 (д, 1H), 7,10 (д, 1H), 6,92 (т, 1H), 6,86 (д, 1H), 4,16 (т, 2H), 2,14-2,27 (м, 2H).

ПРИКЛАД 517

3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-((E)-2-(2-((E)-2-фенілвініл)феніл)вініл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (400 МГц, ДМСО-d₆) 13,08 (шир.с, 1H), 11,76 (с, 1H), 8,21-8,25 (м, 1H), 8,02-8,10 (м, 2H), 7,81-7,89 (м, 2H), 7,68-7,80 (м, 5H), 7,63 (д, 1H), 7,48-7,56 (м, 2H), 7,45 (д, 1H), 7,26-7,42 (м, 6H), 7,14 (д, 1H), 7,04 (т, 1H), 6,88 (д, 1H), 4,17 (т, 2H), 2,18-2,26 (м, 2H).

ПРИКЛАД 518

5 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2-фенілетил)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (400 МГц, ДМСО-d₆) 12,93 (шир.с, 1H), 11,37 (с, 1H), 8,21-8,26 (м, 1H), 7,83-7,89 (м, 1H), 7,48-7,56 (м, 3H), 7,44 (д, 1H), 7,24-7,41 (м, 4H), 7,14-7,21 (м, 1H), 7,06 (д, 1H), 6,85-6,93 (м, 2H), 4,17 (т, 2H), 3,34 (т, 2H), 3,21-3,27 (м, 2H), 2,89-2,97 (м, 2H), 2,16-2,26 (м, 2H).

ПРИКЛАД 519

10 7-(2-(2-хлорфеніл)етил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (400 МГц, ДМСО-d₆) 12,95 (шир.с, 1H), 11,34 (с, 1H), 8,20-8,25 (м, 1H), 7,84-7,88 (м, 1H), 7,34-7,56 (м, 7H), 7,20-7,32 (м, 2H), 7,02 (д, 1H), 6,85-6,93 (м, 2H), 4,17 (т, 2H), 3,19-3,25 (м, 2H), 2,99-3,07 (м, 2H), 2,16-2,26 (м, 2H).

ПРИКЛАД 520

15 7-(2-(1,1'-біфеніл-4-іл)етил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (400 МГц, ДМСО-d₆) 12,93 (шир.с, 1H), 11,38 (с, 1H), 8,21-8,26 (м, 1H), 7,84-7,88 (м, 1H), 7,62-7,67 (м, 2H), 7,56-7,61 (м, 2H), 7,31-7,55 (м, 10H), 7,10 (д, 1H), 6,85-6,95 (м, 2H), 4,17 (т, 2H), 2,94-3,01 (м, 2H), 2,16-2,26 (м, 2H).

ПРИКЛАД 521

20 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2-(4-(2-фенілетил)феніл)етил)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (400 МГц, ДМСО-d₆) 12,93 (шир.с, 1H), 11,33 (с, 1H), 8,20-8,26 (м, 1H), 7,84-7,88 (м, 1H), 7,42-7,57 (м, 4H), 7,37 (т, 1H), 7,09-7,30 (м, 9H), 7,04 (д, 1H), 6,85-6,93 (м, 2H), 4,17 (т, 2H), 2,82-2,93 (м, 6H), 2,15-2,25 (м, 2H).

ПРИКЛАД 522

25 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2-(4-(3-фенілпропіл)феніл)етил)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (400 МГц, ДМСО-d₆) 12,92 (шир.с, 1H), 11,33 (с, 1H), 8,20-8,25 (м, 1H), 7,84-7,88 (м, 1H), 7,47-7,56 (м, 3H), 7,44 (д, 1H), 7,37 (т, 1H), 7,08-7,31 (м, 9H), 7,05 (д, 1H), 6,84-6,93 (м, 2H), 4,16 (т, 2H), 3,16-3,25 (м, 2H), 2,85-2,93 (м, 2H), 2,53-2,63 (м, 4H), 2,15-2,25 (м, 2H), 1,81-1,92 (м, 2H).

ПРИКЛАД 523

7-(4-карбокси-2-метилфеніл)-3-(3-((2-ціанохінолін-8-іл)окси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

35 ¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) 10,85 (с, 1H), 8,51 (д, 1H), 8,18 (д, 1H), 8,04 (с, 1H), 7,89 (с, 1H), 7,80 (м, 3H), 7,58 (м, 2H), 7,32 (д, 1H), 7,24 (м, 1H), 7,04 (м, 2H), 4,26 (т, 2H), 2,26 (м, 2H), 2,10 (с, 3H).

ПРИКЛАД 524

3-(3-((2-ацетил-1-бензофуран-7-іл)окси)пропіл)-7-(4-карбокси-2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота

40 ¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) 12,87 (с, 2H), 10,87 (с, 1H), 7,89 (с, 2H), 7,82 (дд, 1H), 7,73 (дд, 1H), 7,34 (м, 2H), 7,24 (т, 1H), 7,07 (м, 3H), 4,24 (т, 2H), 2,58 (с, 2H), 2,19 (м, 2H), 2,09 (с, 3H).

ПРИКЛАД 525

7-(4-карбокси-2-метилфеніл)-3-(3-((2,2-диметил-2,3-дигідро-1-бензофуран-7-іл)окси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

45 ¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) 12,86 (с, 2H), 10,85 (с, 1H), 7,89 (м, 1H), 7,82 (м, 1H), 7,71 (м, 1H), 7,32 (д, 1H), 7,06 (м, 2H), 6,71 (м, 3H), 3,98 (т, 2H), 3,20 (т, 2H), 3,00 (с, 2H), 2,07 (м, 5H), 1,43 (с, 6H).

ПРИКЛАД 526

7-(4-карбокси-2-метилфеніл)-3-(3-(2,3-дифторфенокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

50 ¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) 12,86 (м, 2H), 10,85 (с, 1H), 7,89 (м, 1H), 7,82 (м, 1H), 7,69 (м, 1H), 7,32 (д, 1H), 7,09 (м, 3H), 6,96 (м, 2H), 4,12 (т, 2H), 3,24 (м, 5H).

ПРИКЛАД 527

7-(4-карбокси-2-метилфеніл)-3-(3-(3-метил-2-нітрофенокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

55 ¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) 12,88 (м, 2H), 10,88 (с, 1H), 7,89 (м, 1H), 7,82 (м, 1H), 7,63 (м, 1H), 7,40 (т, 1H), 7,32 (д, 1H), 7,08 (м, 3H), 6,99 (м, 1H), 4,13 (т, 2H), 3,16 (т, 2H), 2,26 (м, 3H), 2,10 (м, 3H), 2,03 (м, 2H).

ПРИКЛАД 528

7-(4-карбоксі-2-метилфеніл)-3-(3-(2-метил-3-нітрофенокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹Н ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) 12,86 (м, 2Н), 10,86 (м, 1Н), 7,89 (м, 1Н), 7,82 (м, 1Н), 7,69 (м, 1Н), 7,45 (м, 3Н), 7,31 (д, 1Н), 7,07 (м, 2Н), 4,17 (т, 2Н), 3,27 (т, 2Н), 2,15 (м, 2Н), 2,09 (с, 3Н).

5 ПРИКЛАД 529

7-(4-карбоксі-2-метилфеніл)-3-(3-(2-хлор-3-(трифторметил)фенокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹Н ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) 12,86 (м, 2Н), 10,86 (м, 1Н), 7,90 (м, 1Н), 7,82 (м, 1Н), 7,69 (м, 1Н), 7,34 (м, 4Н), 7,10 (м, 2Н), 4,12 (т, 2Н), 2,29 (м, 3Н), 2,14 (м, 2Н), 2,10 (м, 3Н).

10 ПРИКЛАД 530

7-(4-карбоксі-2-метилфеніл)-3-(3-(2-фтор-3-(трифторметил)фенокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹Н ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) 12,87 (м, 1Н), 7,89 (м, 1Н), 7,89 (м, 1Н), 7,82 (м, 1Н), 7,82 (м, 1Н), 7,68 (м, 1Н), 7,46 (м, 1Н), 7,29 (м, 3Н), 7,08 (м, 2Н), 4,15 (т, 2Н), 3,25 (т, 2Н), 2,14 (м, 2Н), 2,09 (м, 3Н).

15 ПРИКЛАД 531

7-(2-хлорфеніл)-3-(3-(етил(1-нафтил)аміно)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

ПРИКЛАД 531А

етил 7-бром-3-(3-оксопропіл)-1Н-індол-2-карбоксилат

20 До розчину етил 7-бром-3-(4-гідроксипропіл)-1Н-індол-2-карбоксилату (ПРИКЛАД 1С) (3,4 г) і триетиламіну (8,5 мл) у дихлорметані (100 мл) і диметилсульфоксиді (10 мл), охолодженого до 0 С, додавали піридин-2-сульфонат (9,54 г). Суміш перемішували протягом 3 годин, розбавляли етилацетатом (300 мл) і промивали 5 % розчином НСl, водою і насиченим сольовим розчином. Після сушіння об'єднаних органічних шарів над Na₂SO₄ фільтрат концентрували і неочищений продукт очищали флеш-хроматографією на силікагелі, елюючи сумішшю 10 % етилацетату у гексані.

ПРИКЛАД 531В

етил 7-бром-3-(3-(етил(нафталін-1-іл)аміно)пропіл)-1Н-індол-2-карбоксилат

30 До розчину сполуки Прикладу 531А (130 мг) і N-етилнафталін-1-аміну (82 мг) у дихлорметані (3 мл) додавали триацетоксиборогидрид натрію (2,35 г). Суміш перемішували при кімнатній температурі протягом ночі. Після цього суміш розбавляли етилацетатом (1500 мл) і промивали 1Н розчином NaOH, водою, насиченим сольовим розчином і сушили над Na₂SO₄. Після фільтрування і концентрування фільтрату залишок очищали флеш-хроматографією на силікагелі і елювали сумішшю 5 % етилацетату у гексані.

35 ПРИКЛАД 531С

7-(2-хлорфеніл)-3-(3-(етил(1-нафтил)аміно)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

40 До суміші сполуки Прикладу 531В (192 мг) і 2-хлорфенілборонової кислоти (76 мг) у тетрагідрофурані (6 мл) додавали трис(добензиліденацетон)дипаладій(0) (19 мг), тетрафторборат три-трет-бутил-фосфонію (12 мг) і фторид цезію (200 мг). Суміш продували аргонном і перемішували при кімнатній температурі протягом 24 годин. Суміш розбавляли етилацетатом (200 мл) і промивали водою і насиченим сольовим розчином, і сушили над Na₂SO₄. Концентрування суміші і колонкове очищення неочищеної речовини (5 % етилацетату у гексані) давали зазначену у заголовку сполуку. Частику цієї речовини (50 мг) розчиняли у суміші 1:1 тетрагідрофуран/метанол з декількома краплями води і гідролізували за допомогою LiOH. 45 Подальше очищення за допомогою 3Ф-ВЕРХ давало зазначену у заголовку сполуку. ¹Н ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 10,80 (м, 1Н), 8,27 (м, 1Н), 7,90 (м, 1Н), 7,55 (м, 1Н), 7,53 (м, 1Н), 7,42 (м, 3Н), 7,34 (м, 3Н), 7,21 (м, 2Н), 7,03 (м, 1Н), 6,98 (м, 2Н), 3,21 (м, 4Н), 3,08 (т, 2Н), 1,79 (м, 2Н), 0,96 (т, 3Н).

ПРИКЛАД 532

50 7-(4-(морфолін-4-ілкарбоніл)-2-(трифторметил)феніл)-3-(4-(5-оксо-2,3,4,5-тетрагідро-1Н-1-бензазепін-1-іл)бутил)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹Н ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 11,11 (м, 1Н), 8,29 (м, 1Н), 8,21 (м, 1Н), 7,75 (м, 1Н), 7,53 (м, 2Н), 7,27 (м, 1Н), 7,09 (м, 2Н), 6,96 (м, 1Н), 6,70 (м, 1Н), 3,74 (м, 6Н), 3,49 (т, 2Н), 3,16 (т, 4Н), 2,55 (т, 2Н), 2,07 (м, 3Н).

55 ПРИКЛАД 533

7-(4-(морфолін-4-ілкарбоніл)-2-(трифторметил)феніл)-3-(4-(2,3,4,5-тетрагідро-1Н-1-бензазепін-1-іл)бутил)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹Н ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) 11,09 (м, 1Н), 8,29 (м, 1Н), 8,20 (дд, 2Н), 7,68 (дд, 1Н), 7,52 (дд, 1Н), 7,08 (м, 4Н), 6,83 (м, 2Н), 4,36 (м, 6Н), 3,13 (м, 4Н), 2,76 (м, 3Н), 1,59 (м, 8Н).

60 ПРИКЛАД 534

3-(4-(2,3-дигідро-4Н-1,4-бензотіазин-4-іл)бутил)-7-(4-(морфолін-4-ілкарбоніл)-2-(трифторметил)феніл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹Н ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) 11,10 (м, 1Н), 8,29 (м, 1Н), 8,21 (м, 1Н), 7,74 (м, 1Н), 7,54 (м, 1Н), 7,10 (м, 2Н), 6,89 (м, 2Н), 6,64 (м, 1Н), 6,49 (м, 1Н), 3,52 (м, 2Н), 3,30 (м, 8Н), 3,14 (м, 2Н), 1,68 (м, 4Н).

ПРИКЛАД 535

3-(4-(3,4-дигідрохінолін-1(2Н)-іл)бутил)-7-(2-метилфеніл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹Н ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 10,41 (м, 1Н), 7,68 (м, 1Н), 7,28 (м, 4Н), 7,08 (м, 2Н), 6,88 (м, 2Н), 6,46 (м, 2Н), 3,18 (м, 6Н), 2,64 (м, 2Н), 2,05 (м, 3Н), 1,68 (м, 6Н).

ПРИКЛАД 536

3-(4-(2-метил-3,4-дигідрохінолін-1(2Н)-іл)бутил)-7-(2-метилфеніл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹Н ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) 10,38 (с, 1Н), 7,69 (м, 1Н), 7,29 (м, 4Н), 7,09 (м, 2Н), 6,90 (м, 2Н), 6,44 (м, 2Н), 3,38 (м, 3Н), 3,14 (м, 3Н), 2,69 (м, 2Н), 2,05 (м, 3Н), 1,65 (м, 6Н), 1,02 (д, 3Н).

ПРИКЛАД 537

3-(4-(6-метил-3,4-дигідрохінолін-1(2Н)-іл)бутил)-7-(2-метилфеніл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹Н ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) 10,38 (с, 1Н), 7,68 (м, 1Н), 7,28 (м, 5Н), 7,10 (м, 2Н), 6,72 (м, 2Н), 6,45 (м, 1Н), 3,15 (м, 7Н), 2,61 (м, 2Н), 2,11 (с, 3Н), 2,05 (с, 3Н), 1,69 (м, 5Н).

ПРИКЛАД 538

3-(4-(8-метил-3,4-дигідрохінолін-1(2Н)-іл)бутил)-7-(2-метилфеніл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹Н ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 10,41 (м, 1Н), 7,70 (м, 1Н), 7,24 (м, 8Н), 7,03 (м, 2Н), 3,13 (м, 4Н), 2,78 (м, 4Н), 2,25 (м, 4Н), 2,03 (с, 3Н), 1,75 (м, 5Н).

ПРИКЛАД 539

3-(4-(2-метил-2,3-дигідро-1Н-індол-1-іл)бутил)-7-(2-метилфеніл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹Н ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) 10,37 (м, 1Н), 7,68 (м, 1Н), 7,32 (м, 2Н), 7,24 (м, 2Н), 7,15 (м, 1Н), 7,05 (м, 1Н), 6,93 (м, 2Н), 6,49 (м, 1Н), 6,32 (м, 1Н), 3,08 (м, 6Н), 2,06 (с, 3Н), 1,63 (м, 4Н), 1,18 (д, 3Н).

ПРИКЛАД 540

7-(2-метилфеніл)-3-(4-(2,3,4,5-тетрагідро-1Н-1-бензазепін-1-іл)бутил)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹Н ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) 10,35 (м, 1Н), 7,62 (м, 1Н), 7,27 (м, 4Н), 7,07 (м, 4Н), 6,83 (м, 2Н), 3,07 (м, 5Н), 2,77 (м, 4Н), 2,08 (с, 3Н), 1,63 (м, 8Н).

ПРИКЛАД 541

3-(4-(3-метил-3,4-дигідрохінолін-1(2Н)-іл)бутил)-7-(2-метилфеніл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹Н ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 10,36 (м, 1Н), 7,67 (м, 1Н), 7,27 (м, 4Н), 7,09 (м, 2Н), 6,86 (м, 2Н), 6,47 (м, 2Н), 3,22 (м, 6Н), 2,75 (м, 1Н), 2,31 (м, 2Н), 2,06 (м, 3Н), 1,91 (м, 1Н), 1,65 (м, 4Н), 0,96 (д, 3Н).

ПРИКЛАД 542

3-(4-(3-(гідроксиметил)-3,4-дигідрохінолін-1(2Н)-іл)бутил)-7-(2-метилфеніл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹Н ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) 10,39 (м, 1Н), 7,68 (м, 1Н), 7,28 (м, 4Н), 7,09 (м, 2Н), 6,89 (м, 2Н), 6,44 (м, 2Н), 3,25 (м, 8Н), 2,93 (м, 1Н), 2,67 (м, 1Н), 2,36 (м, 1Н), 2,06 (с, 3Н), 1,92 (м, 1Н), 1,66 (м, 4Н).

ПРИКЛАД 543

3-(4-(2,3-дигідро-4Н-1,4-бензотіазин-4-іл)бутил)-7-(2-метилфеніл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹Н ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) 10,40 (м, 1Н), 7,68 (м, 1Н), 7,29 (м, 4Н), 7,09 (м, 2Н), 6,88 (м, 2Н), 6,55 (м, 2Н), 3,54 (м, 2Н), 3,29 (м, 3Н), 3,13 (м, 2Н), 2,98 (м, 2Н), 2,05 (м, 3Н), 1,67 (м, 4Н).

ПРИКЛАД 544

4-метоксі-7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹Н ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) 10,23 (м, 1Н), 8,23 (м, 1Н), 7,86 (м, 1Н), 7,47 (м, 4Н), 7,23 (м, 4Н), 6,94 (м, 2Н), 6,59 (м, 2Н), 4,23 (т, 2Н), 3,87 (с, 3Н), 3,49 (м, 2Н), 2,24 (м, 2Н), 2,06 (м, 3Н).

ПРИКЛАД 545

3-(3-((1R, 4S)-8-гідрокси-1,2,3,4-тетрагідро-1,4-метанонафталін-5-іл)окси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) 10,45 (м, 1H), 8,57 (м, 1H), 7,65 (м, 1H), 7,27 (м, 4H), 7,07 (м, 2H), 6,43 (м, 2H), 3,90 (м, 2H), 3,48 (м, 2H), 3,22 (м, 2H), 2,06 (с, 3H), 1,79 (м, 2H), 1,28 (м, 5H).

ПРИКЛАД 546

7-(2-метилфеніл)-3-(3-((1R, 4S)-1,2,3,4-тетрагідро-1,4-метанонафталін-5-ілокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

ПРИКЛАД 546A

До розчину 3',6'-дигідроксибензонорбому (3,52 г) та імідазолу (1,36 г) в N, N-диметилформаміді (150 мл) додавали по краплях розчин трет-бутилхлордиметилсилану (3,01 г) в N, N-диметилформаміді (30 мл). Після додавання суміш перемішували протягом ночі при кімнатній температурі. Після концентрування розчинника у вакуумі залишок розчиняли в етилацетаті (300 мл) і промивали 5 % розчином HCl, водою і насиченим сольовим розчином, і сушили над Na₂SO₄. Після випарювання розчинника залишок завантажували на колонку з силікагелем і елювали сумішшю 20 % етилацетату у гексані з одержанням продукту.

ПРИКЛАД 546B

До охолодженого (0°C) розчину етил 7-бром-3-(3-гідроксипропіл)-1H-індол-2-карбоксилату (326 мг) і сполуки Прикладу 546A (290 мг), і трифенілфосфіну (315 мг) у тетрагідрофурані (10 мл) додавали ди-трет-бутилазодикарбоксилат (276 мг). Суміш перемішували при 0°C протягом 1 години і потім перемішували при кімнатній температурі протягом 14 годин. Після цього суміш розбавляли етилацетатом (200 мл) і промивали водою, насиченим сольовим розчином і сушили над Na₂SO₄. Концентрування розчинника і колонкове очищення (10 % етилацетату у гексані) давали продукт.

ПРИКЛАД 546C

До суміші сполуки Прикладу 1C (310 мг) і 2-толуолборонової кислоти (84 мг) у диметоксітані (20 мл) та етанолі (10 мл) додавали тетракіс(трифенілфосфін)паладій(0) (30 мг) і фторид цезію (236 мг). Суміш перемішували в атмосфері азоту при температурі кипіння зі зворотним холодильником протягом 4 годин. Після цього розчинник концентрували у вакуумі і залишок розподіляли між етилацетатом (300 мл) і водою (100 мл). Органічну фазу промивали водою, насиченим сольовим розчином і сушили над Na₂SO₄. Випарювання розчинника і колонкове очищення (5 % етилацетату у гексані) давали продукт.

ПРИКЛАД 546D

етил 7-(2-метилфеніл)-3-(3-((8-(((трифторметил)сульфоніл)окси)-1,2,3,4-тетрагідро-1,4-метанонафталін-5-іл)окси)пропіл)-1H-індол-2-карбоксилат

До суміші сполуки Прикладу 546C (85 мг) у піридині (2 мл) при 0°C додавали трифторметансульфононий (triflic) ангідрид (120 мг). Суміш перемішували при кімнатній температурі протягом ночі. Суміш розподіляли між простим етиловим ефіром (300 мл) і 5 % водним розчином HCl (50 мл). Органічну фазу промивали водою і насиченим сольовим розчином, і сушили над Na₂SO₄. Після фільтрування і концентрування фільтрату неочищений продукт використовували на наступній стадії без додаткового очищення.

ПРИКЛАД 546E

етил 7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1,2,3,4-тетрагідро-1,4-метанонафталін-5-ілокси)пропіл)-1H-індол-2-карбоксилат

До розчину сполуки Прикладу 546D (80 мг) у тетрагідрофурані і метанолі (40 мл, 1:1) додавали 10 % гідроксид паладію (40 мг). Суміш струшували при тиску водню 30 ф/дюйм² (2,109 кг/см²) протягом 4 годин. Каталізатор відфільтровували, фільтрат концентрували і залишок гідролізували з використанням суміші LiOH/тетрагідрофуран/метанол/H₂O. Продукт очищали за допомогою зворотно-фазової ВЕРХ.

ПРИКЛАД 546F

7-(2-метилфеніл)-3-(3-((1R, 4S)-1,2,3,4-тетрагідро-1,4-метанонафталін-5-ілокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

Зазначену у заголовку сполуку одержували відповідно до процедури Прикладу 164G з використанням сполуки Прикладу 546E замість сполуки Прикладу 164F. ¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) 10,45 (м, 1H), 7,65 (м, 1H), 7,28 (м, 4H), 7,02 (м, 3H), 6,78 (м, 1H), 6,63 (м, 1H), 4,00 (м, 2H), 2,07 (м, 5H), 1,87 (м, 2H), 1,30 (м, 7H).

ПРИКЛАД 547

3-(3-((4-метокси-1-нафтил)окси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота
¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) 10,47 (м, 1H), 8,22 (м, 1H), 8,11 (м, 1H), 7,69 (м, 1H), 7,54 (м, 2H), 7,26 (м, 4H), 7,05 (м, 2H), 6,82 (м, 2H), 4,14 (м, 2H), 3,91 (с, 3H), 3,36 (м, 2H), 2,22 (м, 2H), 2,05 (с, 3H).

ПРИКЛАД 548

7-(2-метилфеніл)-3-(3-((2-нітро-1-нафтил)окси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) 12,92 (м, 1H), 10,51 (м, 1H), 8,30 (м, 1H), 8,08 (м, 1H), 7,90 (м, 2H), 7,74 (м, 3H), 7,19 (м, 4H), 4,27 (м, 2H), 2,23 (м, 2H), 2,07 (с, 3H).

ПРИКЛАД 549

5 3-(3-((3-гідрокси-1-нафтил)окси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота
¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,92 (м, 1H), 10,50 (м, 1H), 9,65 (м, 1H), 8,08 (м, 1H), 7,64 (м, 2H), 7,30 (м, 4H), 7,05 (м, 2H), 6,68 (м, 1H), 6,48 (м, 1H), 4,13 (м, 2H), 2,23 (м, 2H), 2,05 (с, 3H).

ПРИКЛАД 550

10 7-(3,5-диметилізоксазол-4-іл)-3-(3-(2,3,6,7-тетрагідро-1H, 5H-піридо(3,2,1-ij)хінолін-8-ілокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота
¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) 11,25 (м, 1H), 7,67 (м, 1H), 7,11 (м, 2H), 6,62 (д, 1H), 6,08 (д, 1H), 3,22 (м, 2H), 3,04 (м, 4H), 2,62 (м, 4H), 2,22 (с, 3H), 2,05 (с, 3H), 2,04 (м, 4H), 1,86 (м, 4H).

ПРИКЛАД 551

15 7-(2-метилфеніл)-3-(3-(2,3,6,7-тетрагідро-1H, 5H-піридо(3,2,1-ij)хінолін-8-ілокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота
¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) 10,46 (м, 1H), 7,65 (м, 1H), 7,27 (м, 4H), 7,08 (м, 2H), 6,63 (д, 1H), 6,10 (д, 1H), 3,93 (м, 2H), 3,23 (м, 2H), 3,05 (м, 4H), 2,64 (м, 4H), 2,05 (м, 5H), 1,86 (м, 4H).

ПРИКЛАД 552

20 7-(2-метилфеніл)-3-(3-((2-нітрозо-1-нафтил)окси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота
¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 10,64 (м, 1H), 8,13 (м, 2H), 7,72 (м, 5H), 7,27 (м, 4H), 7,04 (м, 2H), 3,71 (м, 2H), 2,03 (с, 3H), 1,40 (м, 2H).

ПРИКЛАД 553

25 3-(3-((5-гідрокси-1-нафтил)окси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота
¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) 12,92 (м, 1H), 10,46 (м, 1H), 9,99 (м, 1H), 7,69 (м, 3H), 7,28 (м, 6H), 7,06 (м, 2H), 6,88 (м, 2H), 4,17 (т, 2H), 3,35 (т, 2H), 2,22 (м, 2H), 2,06 (с, 3H).

ПРИКЛАД 554

30 7-(2-метилфеніл)-3-(3-(2,3,4-трифторфенокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота
¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,85 (м, 1H), 10,47 (м, 1H), 7,66 (д, 1H), 7,12 (м, 8H), 4,10 (т, 2H), 3,23 (т, 2H), 2,11 (м, 2H), 2,06 (с, 3H).

Приклад 555

30 3-(3-(3-хлор-2-метилфенокси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота
¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,87 (м, 1H), 10,45 (м, 1H), 7,65 (д, 1H), 7,27 (м, 4H), 7,07 (м, 2H), 6,88 (д, 1H), 4,04 (т, 2H), 3,27 (т, 2H), 2,24 (с, 3H), 2,12 (м, 2H), 2,06 (с, 3H).

ПРИКЛАД 556

35 3-(3-((8-гідрокси-1-нафтил)окси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота
¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) 10,53 (м, 1H), 9,56 (м, 1H), 7,68 (д, 1H), 7,44 (д, 1H), 7,34 (м, 6H), 7,24 (м, 2H), 7,07 (м, 2H), 6,93 (д, 1H), 6,81 (дд, 1H), 4,33 (т, 2H), 2,24 (м, 2H), 2,06 (с, 3H).

ПРИКЛАД 557

40 3-(3-(3-хлор-2-ціанофенокси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота
¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) 12,88 (м, 1H), 10,48 (м, 1H), 7,70 (д, 1H), 7,63 (т, 1H), 7,27 (м, 5H), 7,18 (д, 1H), 7,07 (м, 2H), 4,20 (т, 2H), 3,26 (т, 2H), 2,13 (м, 2H), 2,05 (с, 3H).

ПРИКЛАД 558

45 3-(3-(2-бром-3-метилфенокси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота
¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) 12,88 (м, 1H), 10,46 (м, 1H), 7,70 (д, 1H), 7,32 (м, 2H), 7,25 (м, 2H), 7,18 (д, 1H), 7,06 (м, 2H), 6,93 (д, 1H), 6,86 (д, 1H), 4,06 (т, 2H), 3,27 (т, 2H), 2,38 (с, 3H), 2,11 (м, 2H), 2,05 (с, 3H).

ПРИКЛАД 559

50 7-(2-метилфеніл)-3-(3-(3-метил-2-вінілфенокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота
¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) 12,88 (м, 1H), 10,47 (м, 1H), 7,65 (д, 1H), 7,32 (м, 2H), 7,24 (м, 3H), 7,08 (м, 3H), 6,80 (д, 2H), 5,81 (дд, 1H), 5,53 (дд, 1H), 4,02 (т, 2H), 3,25 (м, 2H), 2,32 (м, 3H), 2,11 (м, 2H), 2,06 (с, 3H).

ПРИКЛАД 560

55 3-(3-(3-метил-2-нітрофенокси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота
¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) 12,89 (м, 1H), 10,51 (м, 1H), 7,60 (д, 1H), 7,40 (т, 1H), 7,32 (м, 2H), 7,24 (м, 3H), 4,13 (т, 2H), 3,15 (т, 2H), 2,26 (с, 3H), 2,05 (с, 3H), 2,03 (м, 2H).

ПРИКЛАД 561

3-(3-(2-аміно-3-метилфенокси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота
¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) 10,49 (м, 1H), 7,69 (д, 1H), 7,33 (м, 2H), 7,25 (м, 3H), 7,08 (м, 3H), 6,73 (м, 3H), 4,04 (т, 2H), 3,26 (т, 2H), 2,18 (с, 3H), 2,12 (м, 2H), 2,06 (с, 3H).

ПРИКЛАД 562

7-(4-(морфолін-4-ілкарбоніл)-2-(трифторметил)феніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) 11,10 (м, 1H), 8,25 (м, 2H), 7,86 (м, 2H), 7,73 (м, 3H), 7,53 (м, 3H), 7,43 (м, 4H), 7,07 (м, 3H), 6,90 (д, 1H), 4,21 (т, 2H), 3,61 (м, 6H), 2,24 (м, 2H).

5 ПРИКЛАД 563

3-(3-((6-аміно-1-нафтил)окси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота

ПРИКЛАД 563A

етил 3-(3-(6-амінонафталін-1-ілокси)пропіл)-7-бром-1H-індол-2-карбоксилат

10 До суміші етил 7-бром-3-(3-гідроксипропіл)-1H-індол-2-карбоксилату (ПРИКЛАД 1C) (100 мг), 6-амінонафталін-1-олу (98 мг) і трифенілфосфіну на полімерній основі (204 мг 0,613 ммоль) у тетрагідрофурані (4 мл) додавали ди-трет-бутилдiazен-1,2-дикарбоксилат (141 мг). Реакційну суміш перемішували при кімнатній температурі протягом 3 годин. Нерозчинну речовину відфільтровували і фільтрат концентрували. Залишок очищали флеш-хроматографією (етилацетат у гексані) з одержанням зазначеної у заголовку сполуки.

15 ПРИКЛАД 563B

3-(3-((6-аміно-1-нафтил)окси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота

20 Суміш сполуки Прикладу 563A (45 мг), о-толілборонової кислоти (15,7 мг), K₂CO₃ (1 М, 0,17 мл) і дихлориду біс(трифенілфосфін)паладію(II) (7,2 мг, 0,01 ммоль) у суміші диметоксітану (2,2 мл), етанолу (0,6 мл) і води (0,9 мл) нагрівали при 160°C у мікрохвильовому реакторі (CEM Discover) протягом 10 хвилин. Реакційну суміш підкислювали розбавленим розчином трифтороцтової кислоти у метанолі і концентрували. Залишок суспендували у суміші DMSO і метанолу (1:1) і фільтрували. Фільтрат очищали за допомогою 3Ф-ВЕРХ з одержанням бажаного продукту. ¹H ЯМР (400 МГц, ДМСО-D₆) δ 10,43 (с, 1H), 8,08 (д, J=8,90 Гц, 1H), 7,69 (д, J=6,75 Гц, 1H), 7,31-7,34 (м, 2H), 7,18-7,29 (м, 5H), 7,02-7,11 (м, 5H), 6,64 (д, J=7,67 Гц, 1H), 4,15 (т, J=5,98 Гц, 2H), 2,49-2,53 (м, 2H), 2,17-2,25 (м, 2H), 2,06 (с, 3H).

25 ПРИКЛАД 564

7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1,2,3,4-тетрагідронафталін-1-ілокси)проп-1-ініл)-1H-індол-2-карбонова кислота

ПРИКЛАД 564A

30 етил 7-о-толіл-1H-індол-2-карбоксилат

До суміші етил 7-(4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-діоксаборолан-2-іл)-1H-індол-2-карбоксилату (Paul et al. J. Am. Chem. Soc. 2006, 128, 15552-15553) (1,6 г), тетрафторборату три-(трет-бутил)фосфонію (0,074 г), трис(дибензиліденацетон)-дипаладію(0) (0,116 г) і фториду цезію (2,313 г) додавали орто-йодтолуол (0,781 мл), потім діоксан (200 мл) і метанол (20 мл). Реакційну суміш негайно продували азотом і перемішували при кімнатній температурі протягом 2 годин. Одночасно додавали додаткові кількості (дибензиліденацетон)дипаладію(0) (0,116 г), орто-йодтолуолу (0,781 мл), CsF (2,313 г) і тетрафторборат три-(трет-бутил)фосфонію (0,074 г). Одержаний розчин перемішували при кімнатній температурі протягом ночі. Нерозчинну речовину відфільтровували, фільтрат концентрували і залишок очищали флеш-хроматографією, елюючи сумішшю 0-100 % дихлорметану у гексані, з одержанням зазначеної у заголовку сполуки.

40 ПРИКЛАД 564B

етил 3-йод-7-о-толіл-1H-індол-2-карбоксилат

45 До розчину сполуки Прикладу 564A (944 мг, 3,38 ммоль) у дихлорметані (10 мл) додавали 1-йодпіролідін-2,5-діон (798 мг, 3,55 ммоль). Реакційну суміш перемішували при кімнатній температурі протягом 3 годин і потім відразу ж завантажували на колонку для флеш-хроматографії, елюючи спочатку гексаном, потім сумішшю 0-50 % гексану у дихлорметані. Зазначену у заголовку сполуку одержували у вигляді білої твердої речовини.

ПРИКЛАД 564C

50 7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1,2,3,4-тетрагідронафталін-1-ілокси)проп-1-ініл)-1H-індол-2-карбонова кислота

До розчину сполуки Прикладу 564B (180 мг) і 1-(проп-2-інілокси)-1,2,3,4-тетрагідронафталіну (165 мг) у триетиламіні (5 мл) додавали дихлорид біс(трифенілфосфін)паладію(II) (18,71 мг) і йодид міді(I) (4,23 мг). Реакційну суміш перемішували при 70°C протягом 3 годин, охолоджували і концентрували. Залишок розчиняли у дихлорметані і очищали флеш-хроматографією, елюючи дихлорметаном, з одержанням етил 3-(3-(1,2,3,4-тетрагідронафталін-1-ілокси)проп-1-ініл)-7-о-толіл-1H-індол-2-карбоксилату. Цей складний ефір гідролізували за допомогою водного NaOH у тетрагідрофурані і метанолі з одержанням зазначеної у заголовку сполуки. ¹H ЯМР (400 МГц, метанол-d₄) 7,76 (дд, J=7,98, 1,23 Гц, 1H), 7,52 (дд, J=6,75, 2,46 Гц, 1H), 7,34-7,40 (м, 2H), 7,27-7,31 (м, 2H), 7,26 (д, J=7,98 Гц, 1H), 7,13-7,19 (м, 3H), 7,07-7,12 (м, 1H), 4,97 (т, J=3,99 Гц,

1H), 4,52-4,71 (м, 2H), 2,79-2,90 (м, 1H), 2,68-2,78 (м, 1H), 2,14-2,21 (м, 1H), 2,12 (с, 3H), 1,91-2,06 (м, 2H), 1,73-1,84 (м, 1H).

ПРИКЛАД 565

3-(3-((6-(акрилоїламіно)-1-нафтил)окси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота

ПРИКЛАД 565A

До суміші етил 7-бром-3-(3-гідроксипропіл)-1H-індол-2-карбоксилату (1 г ммоль), 6-амінонафталін-1-олу (0,732 г), трифенілфосфіну на полімерній основі (1,230 г) у тетрагідрофурані (4 мл) додавали ди-трет-бутилазодикарбоксилат (1,059 г, 4,60 ммоль). Реакційну суміш перемішували при кімнатній температурі протягом 3 годин. Нерозчинну речовину видаляли фільтруванням і ретельно промивали етилацетатом. Об'єднаний фільтрат концентрували. Залишок очищали флеш-хроматографією, елюючи сумішшю CH_2Cl_2 /етилацетат (20:1), з одержанням зазначеної у заголовку сполуки.

ПРИКЛАД 565B

Зазначену у заголовку сполуку одержували відповідно до процедури Прикладу 564A із заміщенням етил 7-(4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-діоксаборолан-2-іл)-1H-індол-2-карбоксилату орто-йодтолуолу сполукою Прикладу 565A, відповідно.

ПРИКЛАД 565C

3-(3-((6-(акрилоїламіно)-1-нафтил)окси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота

До суміші сполуки Прикладу 565B (62,8 мг), акрилової кислоти (9,91 мкл) і 2-(1H-7-азабензотриазол-1-іл)-1,1,3,3-тетраметилуронійгексафторфосфату метанамінію (HATU, 54,9 мг) у тетрагідрофурані (3 мл) додавали триетиламін (36,6 мкл). Реакційну суміш перемішували при кімнатній температурі протягом ночі, розбавляли етилацетатом і промивали водою. Органічний шар сушили над сульфатом натрію, фільтрували і концентрували. Залишок очищали флеш-хроматографією, елюючи дихлорметаном, з одержанням етил 3-(3-(6-акриламідонафталін-1-ілокси)пропіл)-7-о-толіл-1H-індол-2-карбоксилату. Цей складний ефір гідролізували за допомогою водного NaOH у тетрагідрофурані і метанолі з одержанням зазначеної у заголовку сполуки. ^1H ЯМР (500 МГц, метанол- d_4) δ 8,22-8,25 (м, 2H), 7,68 (дд, $J=5,95$, 3,20 Гц, 1H), 7,59 (дд, $J=9,15$, 2,14 Гц, 1H), 7,25-7,37 (м, 6H), 7,05-7,08 (м, 2H), 6,74 (дд, $J=6,10$, 2,44 Гц, 1H), 6,46-6,55 (м, 1H), 6,38-6,44 (м, 1H), 5,80 (дд, $J=10,07$, 1,83 Гц, 1H), 4,20 (т, $J=5,95$ Гц, 2H), 3,40-3,56 (м, 2H), 2,34 (т, $J=6,71$ Гц, 2H), 2,11 (с, 3H).

ПРИКЛАД 566

7-(2-метилфеніл)-3-(3-((6-(пропіоніламіно)-1-нафтил)окси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

^1H ЯМР (500 МГц, метанол- d_4) 8,21 (д, $J=9,15$ Гц, 1H), 8,14 (д, $J=1,83$ Гц, 1H), 7,67 (дд, $J=6,26$, 2,90 Гц, 1H), 7,53 (дд, $J=9,15$, 2,14 Гц, 1H), 7,24-7,37 (м, 6H), 7,04-7,07 (м, 2H), 6,71 (дд, $J=5,03$, 3,51 Гц, 1H), 4,19 (т, $J=5,95$ Гц, 2H), 3,42-3,49 (м, 2H), 2,45 (кв, $J=7,63$ Гц, 2H), 2,29-2,37 (м, 2H), 2,11 (с, 3H), 1,25 (т, $J=7,63$ Гц, 3H).

ПРИКЛАД 567

7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1,2,3,4-тетрагідронафталін-1-ілокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

Суміш сполуки Прикладу 564 (50 мг) і Ni Ренея (мокрий, 240 мг) у тетрагідрофурані (5 мл) і метанолі (3 мл) перемішували в атмосфері водню при 30°C протягом 1 години. Нерозчинну речовину відфільтровували. До фільтрату додавали 10 % NaOH (1 мл) і одержану суміш перемішували протягом ночі і підкислювали за допомогою HCl. Суміш концентрували і залишок очищали за допомогою зворотно-фазової ВЕРХ (рухома фаза: 10 %-100 % ацетонітрилу в 0,1 % водному розчині TFA протягом 60 хвилин) з одержанням зазначеної у заголовку сполуки. ^1H ЯМР (400 МГц, метанол- d_4) δ 7,69 (дд, $J=7,98$, 1,23 Гц, 1H), 7,31-7,38 (м, 3H), 7,27-7,30 (м, 2H), 7,13-7,17 (м, 3H), 7,07-7,12 (м, 2H), 4,43 (т, $J=4,60$ Гц, 1H), 3,71-3,76 (м, 1H), 3,59-3,65 (м, 1H), 3,23-3,27 (м, 2H), 2,79-2,86 (м, 1H), 2,67-2,75 (м, 1H), 2,12 (с, 3H), 1,94-2,06 (м, 4H), 1,85-1,93 (м, 1H), 1,69-1,77 (м, 1H).

ПРИКЛАД 568

3-(3-((6-метокси-1-нафтил)окси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота

^1H ЯМР (500 МГц, дихлорметан- d_2) 8,49 (с, 1H), 8,22 (д, $J=9,76$ Гц, 1H), 7,75 (д, $J=7,32$ Гц, 1H), 7,27-7,38 (м, 7H), 7,16-7,21 (м, 2H), 7,12 (с, 2H), 6,64 (дд, $J=5,80$, 2,75 Гц, 1H), 4,19 (т, $J=6,10$ Гц, 2H), 3,89 (с, 3H), 3,46 (т, $J=7,48$ Гц, 2H), 2,32-2,38 (м, 2H), 2,15 (с, 3H).

ПРИКЛАД 569

1-(4-метоксибензил)-7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)проп-1-ініл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (400 МГц, ДМСО-d₆) 13,50 (с, 1H), 8,21-8,24 (м, 1H), 7,89-7,92 (м, 1H), 7,63 (дд, J=7,98, 1,23 Гц, 1H), 7,49-7,57 (м, 4H), 7,28-7,33 (м, 2H), 7,24 (т, J=7,67 Гц, 2H), 7,14 (т, J=7,52 Гц, 1H), 7,01-7,04 (м, 2H), 6,61-6,65 (м, 2H), 6,18 (с, 1H), 6,16 (с, 1H), 5,39 (с, 2H), 5,29 (д, J=15,96 Гц, 1H), 5,11 (д, J=16,26 Гц, 1H), 3,62 (с, 3H), 1,72 (с, 3H).

5 ПРИКЛАД 570

3-(3-((2,3,4,5,6,7,8-гептафтор-1-нафтил)окси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆) 12,84 (с, 1H), 10,51 (с, 1H), 7,70 (д, J=7,93 Гц, 1H), 7,33 (д, J=3,97 Гц, 2H), 7,25-7,30 (м, 1H), 7,21-7,23 (м, 1H), 7,13-7,16 (м, 1H), 7,05 (д, J=6,71 Гц, 1H), 4,29 (т, J=6,41 Гц, 2H), 3,25-3,29 (м, 2H), 2,14-2,20 (м, 2H), 2,05 (с, 3H).

10 ПРИКЛАД 571

3-(3-(1-бензотієн-7-ілокси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆) 12,91 (с, 1H), 10,50 (с, 1H), 7,75 (д, J=5,49 Гц, 1H), 7,69 (д, J=7,93 Гц, 1H), 7,45-7,48 (м, 2H), 7,25-7,33 (м, 4H), 7,21-7,23 (м, 1H), 7,08 (т, J=7,48 Гц, 1H), 7,02-7,04 (м, 1H), 6,87 (д, J=7,93 Гц, 1H), 4,23 (т, J=6,10 Гц, 2H), 3,27-3,32 (м, 2H), 2,14-2,20 (м, 2H), 2,06 (с, 3H).

ПРИКЛАД 572

3-(3-((4-фтор-1-нафтил)окси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆) 12,97 (с, 1H), 10,46 (с, 1H), 8,28 (д, J=7,93 Гц, 1H), 8,00 (д, J=7,63 Гц, 1H), 7,61-7,69 (м, 3H), 7,33 (д, J=3,66 Гц, 2H), 7,24-7,29 (м, 1H), 7,19-7,23 (м, 2H), 7,02-7,08 (м, 2H), 6,84 (дд, J=8,54, 3,97 Гц, 1H), 4,19 (т, J=6,10 Гц, 2H), 3,32-3,37 (м, 2H), 2,20-2,26 (м, 2H), 2,06 (с, 3H).

ПРИКЛАД 573

3-(3-((8-фтор-1-нафтил)окси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆) 10,46 (с, 1H), 7,69-7,72 (м, 2H), 7,42-7,52 (м, 3H), 7,33 (д, J=3,66 Гц, 2H), 7,21-7,29 (м, 3H), 7,02-7,07 (м, 2H), 6,97 (д, J=7,63 Гц, 1H), 4,15 (т, J=6,10 Гц, 2H), 3,32-3,36 (м, 2H), 2,16-2,22 (м, 2H), 2,06 (с, 3H).

ПРИКЛАД 574

3-(3-((5-фтор-1-нафтил)окси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, ДМСО-d₆) 10,43 (с, 1H), 8,07 (д, J=8,54 Гц, 1H), 7,68 (д, J=7,32 Гц, 1H), 7,57-7,59 (м, 1H), 7,48-7,52 (м, 2H), 7,36 (дд, J=10,98, 7,63 Гц, 1H), 7,33 (д, J=3,66 Гц, 2H), 7,25-7,29 (м, 1H), 7,21-7,23 (м, 1H), 7,05-7,09 (м, 1H), 7,01-7,04 (м, 2H), 4,23 (т, J=6,10 Гц, 2H), 3,22-3,31 (м, 2H), 2,21-2,27 (м, 2H), 2,06 (с, 3H).

ПРИКЛАД 575

7-фтор-3-(2-ізопропілфеніл)-1-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (400 МГц, ДМСО-d₆) 12,87 (с, 1H), 8,06 (д, J=8,29 Гц, 1H), 7,84 (д, J=7,98 Гц, 1H), 7,50 (т, J=6,90 Гц, 1H), 7,32-7,47 (м, 5H), 7,12-7,20 (м, 2H), 6,99-7,05 (м, 2H), 6,88 (д, J=8,59 Гц, 2H), 5,03 (т, J=8,13 Гц, 2H), 4,18 (т, J=5,83 Гц, 2H), 2,63-2,70 (м, 1H), 2,38-2,46 (м, 2H), 1,00 (д, J=6,75 Гц, 3H), 0,93 (д, J=6,75 Гц, 3H).

ПРИКЛАД 576

7-фтор-3-(2-метилфеніл)-1-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (400 МГц, ДМСО-d₆) 8,09 (д, J=8,90 Гц, 1H), 7,85 (д, J=8,29 Гц, 1H), 7,49-7,53 (м, 1H), 7,36-7,47 (м, 3H), 7,09-7,31 (м, 5H), 6,99-7,04 (м, 1H), 6,88-6,91 (м, 2H), 5,02 (т, J=7,21 Гц, 2H), 4,20 (т, J=5,68 Гц, 2H), 2,38-2,45 (м, 2H), 1,99 (с, 3H).

ПРИКЛАД 577

3-(3-((5-фтор-1-нафтил)окси)пропіл)-7-(1,3,5-триметил-1H-піразол-4-іл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (400 МГц, ДМСО-d₆) 10,51 (с, 1H), 8,07 (д, J=8,59 Гц, 1H), 7,65 (д, J=6,75 Гц, 1H), 7,56-7,60 (м, 1H), 7,46-7,53 (м, 2H), 7,36 (дд, J=11,05, 6,75 Гц, 1H), 7,04-7,08 (м, 1H), 7,01-7,03 (м, 2H), 4,23 (т, J=6,14 Гц, 2H), 3,75 (с, 3H), 3,33-3,37 (м, 2H), 2,19-2,27 (м, 2H), 2,05 (с, 3H), 2,00 (с, 3H).

ПРИКЛАД 578

3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1-(піридин-4-ілметил)-7-(1,3,5-триметил-1H-піразол-4-іл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (400 МГц, ДМСО-d₆) 8,62 (д, J=6,44 Гц, 2H), 8,23-8,28 (м, 1H), 7,83-7,90 (м, 2H), 7,45-7,57 (м, 3H), 7,38-7,44 (м, 1H), 7,12-7,18 (м, 1H), 6,90-6,96 (м, 4H), 5,79 (д, J=18,41 Гц, 1H), 5,58 (д, J=18,10 Гц, 1H), 4,28 (т, J=5,98 Гц, 2H), 3,59 (с, 3H), 3,39-3,46 (м, 2H), 2,25-2,33 (м, 2H), 1,65 (с, 3H), 1,58 (с, 3H).

ПРИКЛАД 579

3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1-(піридин-2-ілметил)-7-(1,3,5-триметил-1Н-піразол-4-іл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹Н ЯМР (400 МГц, ДМСО-d₆) 8,43 (д, J=4,30 Гц, 1Н), 8,24-8,27 (м, 1Н), 7,86-7,89 (м, 1Н), 7,81 (д, J=7,06 Гц, 1Н), 7,74 (т, J=8,29 Гц, 1Н), 7,49-7,56 (м, 2Н), 7,44-7,48 (м, 1Н), 7,38-7,42 (м, 1Н), 7,30-7,35 (м, 1Н), 7,09-7,14 (м, 1Н), 6,92 (д, J=7,36 Гц, 1Н), 6,89 (дд, J=7,06, 0,92 Гц, 1Н), 6,31 (д, J=7,67 Гц, 1Н), 5,73 (д, J=18,10 Гц, 1Н), 5,49 (д, J=17,49 Гц, 1Н), 4,26 (т, J=6,14 Гц, 2Н), 3,59 (с, 3Н), 3,36-3,44 (м, 2Н), 2,24-2,31 (м, 2Н), 1,67 (с, 3Н), 1,56 (с, 3Н).

ПРИКЛАД 580

3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1-(піридин-3-ілметил)-7-(1,3,5-триметил-1Н-піразол-4-іл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

ПРИКЛАД 580А

етил 3-(3-(нафталін-1-ілокси)пропіл)-7-(1,3,5-триметил-1Н-піразол-4-іл)-1Н-індол-2-карбоксилат

До суміші етил 7-бром-3-(3-(нафталін-1-ілокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбоксилату (ПРИКЛАД 1С) (1,605 г) і 1,3,5-триметил-4-(4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-діоксаборолан-2-іл)-1Н-піразолу (0,838 г) у толуолі (25 мл) додавали діацетоксипаладій (0,080 г), дициклогексил(2',6'-диметоксибіфеніл-2-іл)фосфін (0,291 г) і K₃PO₄ (2,259 г). Одержану суміш перемішували при 110 °С протягом ночі. Додавали силікагель (25 г) і суміш ретельно сушили в умовах середнього вакууму протягом ночі. Одержаний з гелю порошок завантажували на колонку для очищення флеш-хроматографією і елюювали сумішшю 0-50 % етилацетату у дихлорметані з одержанням зазначеної у заголовку сполуки.

ПРИКЛАД 580В

3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1-(піридин-3-ілметил)-7-(1,3,5-триметил-1Н-піразол-4-іл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

Суміш сполуки Прикладу 580А (90 мг), гідроброміду 3-(бромметил)піридину (47,3 мг) і карбонату цезію (183 мг) в N, N-диметилформаміді (3,5 мл) перемішували при кімнатній температурі протягом ночі. Нерозчинну речовину відфільтровували і фільтрат концентрували. Залишок суспендували у тетрагідрофурані-метанолі і додавали 10 % розчин NaOH. Одержану суміш перемішували при кімнатній температурі протягом ночі і концентрували. Залишок розчиняли у суміші DMSO і метанолу. Розчин очищали за допомогою зворотно-фазової ВЕРХ (рухома фаза: 10 %-100 % ацетонітрилу в 0,1 % водному розчині TFA протягом 60 хвилин) з одержанням зазначеної у заголовку сполуки. ¹Н ЯМР (400 МГц, ДМСО-d₆) δ 8,55 (д, J=5,22 Гц, 1Н), 8,23-8,28 (м, 1Н), 7,85-7,90 (м, 1Н), 7,80-7,85 (м, 2Н), 7,49-7,57 (м, 3Н), 7,45-7,49 (м, 1Н), 7,38-7,43 (м, 1Н), 7,19 (д, J=7,67 Гц, 1Н), 7,10-7,15 (м, 1Н), 6,92 (т, J=7,67 Гц, 2Н), 5,65 (д, J=17,49 Гц, 1Н), 5,44 (д, J=17,80 Гц, 1Н), 4,26 (т, J=5,98 Гц, 2Н), 3,62 (с, 3Н), 3,35-3,49 (м, 2Н), 2,24-2,32 (м, 2Н), 1,67 (с, 3Н), 1,59 (с, 3Н).

Приклад 581

7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-2-(1Н-тетразол-5-іл)-1Н-індол

Приклад 581А

етил 7-бром-1-(4-метоксибензил)-3-(3-(нафталін-1-ілокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбоксилат

До розчину етил 7-бром-3-(3-(нафталін-1-ілокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбоксилату (2,39 г, одержаний аналогічно тому, як описано у даній заявці) в N, N-диметиламіді (20 мл) додавали 1-(хлорметил)-4-метоксибензол (1,0 г) і Cs₂CO₃ (5,16 г). Суміш перемішували протягом ночі при кімнатній температурі. Суміш розбавляли простим ефіром (300 мл) і водою (200 мл). Водний шар екстрагували простим ефіром. Об'єднані екстракти промивали водою (×3), насиченим сольовим розчином і сушили над Na₂SO₄. У результаті концентрування одержували сполуку Прикладу 581А.

Приклад 581В

7-бром-1-(4-метоксибензил)-3-(3-(нафталін-1-ілокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбоксамід

До розчину сполуки Прикладу 581А (1 г) в оксалілхлориді (10 мл) додавали декілька крапель N, N-диметиламіді. Суміш перемішували протягом 3 годин при кімнатній температурі. Суміш концентрували у вакуумі і залишок розчиняли у дихлорметані (20 мл) і додавали до охолодженого (0°C) концентрованого розчину NH₃H₂O (30 мл). Після додавання суміш перемішували протягом 2 годин, а потім екстрагували етилацетатом (200 мл). Органічний екстракт промивали водою, насиченим сольовим розчином і сушили над Na₂SO₄. Після фільтрування і випарювання розчинника одержували сполуку Прикладу 581В.

Приклад 581С

7-бром-1-(4-метоксибензил)-3-(3-(нафталін-1-ілокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонітрил

До охолодженого (0°C) розчину сполуки Прикладу 581В (545 мг) у тетрагідрофурані (5 мл) і дихлорметані (1 мл) додавали триетиламін (1 мл) з подальшим додаванням по краплях

трифтороцтової кислоти (1 мл). Після додавання суміш перемішували протягом 3 годин при 0°C. Суміш розбавляли етилацетатом (200 мл) і водою (80 мл). Водний шар екстрагували простим ефіром. Об'єднані органічні екстракти промивали водою (×3), насиченим сольовим розчином і сушили над Na₂SO₄. Після фільтрування і випарювання розчинника одержували

5 сполуку Прикладу 581C.

Приклад 581D

1-(4-метоксибензил)-3-(3-(нафталін-1-ілокси)пропіл)-7-о-толіл-1H-індол-2-карбонітрил

До суміші сполуки Прикладу 581C (300 мг) і о-толілборонової кислоти (93 мг) в 1,2-диметоксіетані (10 мл) і метанолі (5 мл) додавали тетракіс(трифенілфосфін)паладій(0) (33 мг) і CsF (260 мг). Суміш перемішували при температурі кипіння зі зворотним холодильником в атмосфері азоту протягом 4 годин. Суміш концентрували у вакуумі і залишок розподіляли між етилацетатом (300 мл) і водою (100 мл). Водний шар додатково екстрагували етилацетатом і об'єднані екстракти промивали водою, насиченим сольовим розчином і сушили над Na₂SO₄. Після фільтрування, випарювання розчинника і колонкового очищення (5→10 % етилацетату у

15 гексані) одержували сполуку Прикладу 581D.

Приклад 581E

7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-2-(1H-тетразол-5-іл)-1H-індол

До суміші сполуки Прикладу 581D (232 мг) в N, N-диметиламіді (10 мл) додавали NaN₃ (281 мг) і NH₄Cl (231 мг). Суміш перемішували при температурі кипіння зі зворотним холодильником протягом ночі. Суміш концентрували у вакуумі і залишок розподіляли між етилацетатом (200 мл) і водою (60 мл). Органічну фазу промивали насиченим сольовим розчином і сушили над Na₂SO₄. Випарювання розчинника давало неочищений продукт, який розчиняли у дихлорметані/трифтороцтовій кислоті (1:1, 4 мл) і нагрівали до 125°C у мікрохвильовому реакторі (CEM Discover) протягом 20 хвилин. Суміш концентрували і залишок розчиняли у

25 диметилсульфоксиді/метанолі (1/1, 2 мл) і завантажували у систему ВЕРХ для очищення. ¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 10,63 (м, 1H), 8,26 (м, 1H), 7,86 (м, 1H), 7,74 (д, 1H), 7,53 (м, 2H), 7,42 (м, 5H), 7,33 (м, 2H), 7,11 (м, 3H), 6,90 (д, 1H), 4,23 (т, 2H), 2,29 (м, 2H), 2,13 (с, 3H).

Приклад 582

1-(4-метоксибензил)-7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-2-(1H-тетразол-5-іл)-1H-

30 індол

¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 8,08 (д, 1H), 7,84 (м, 2H), 7,52 (м, 2H), 7,45 (д, 1H), 7,39 (д, 1H), 7,32 (м, 1H), 7,25 (д, 1H), 7,17 (м, 2H), 7,10 (д, 1H), 6,96 (д, 1H), 6,85 (д, 1H), 6,51 (д, 2H), 6,02 (д, 2H), 4,89 (дд, 2H), 4,14 (т, 2H), 3,57 (с, 3H), 3,16 (м, 2H), 2,20 (м, 2H), 1,80 (с, 3H).

Приклад 585

7-(1-метил-1H-імідазол-5-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

35 ¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 14,39 (с, 1H), 13,21 (с, 1H), 11,52 (с, 1H), 9,23 (с, 1H), 8,12-8,32 (м, 1H), 7,83-7,97 (м, 2H), 7,80 (д, J=1,7 Гц, 1H), 7,33-7,69 (м, 5H), 7,30 (д, J=6,1 Гц, 1H), 7,07-7,22 (м, 1H), 6,89 (д, J=6,4 Гц, 1H), 4,19 (т, J=6,1 Гц, 2H), 3,55 (с, 3H), 3,38 (т, J=7,3 Гц, 2H), 2,11-2,34 (м, 2H).

Приклад 586

1-(2-(диметиламіно)-2-оксоетил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(1,3,5-триметил-1H-піразол-4-іл)-1H-індол-2-карбонова кислота

45 ¹H ЯМР (400 МГц, ДМСО-d₆) 13,01 (с, 1H), 8,26-8,30 (м, 1H), 7,84-7,90 (м, 1H), 7,73 (д, J=7,06 Гц, 1H), 7,50-7,55 (м, 2H), 7,44-7,48 (м, 1H), 7,40 (т, J=7,98 Гц, 1H), 7,03-7,08 (м, 1H), 6,92 (д, J=7,36 Гц, 1H), 6,88 (д, J=6,14 Гц, 1H), 5,07-5,24 (м, 2H), 4,23 (т, J=6,14 Гц, 2H), 3,74 (с, 3H), 3,31-3,38 (м, 2H), 2,69 (с, 3H), 2,56 (с, 3H), 2,19-2,26 (м, 2H), 1,91 (с, 3H), 1,84 (с, 3H).

Приклад 587

1-(2-(4-метилпіперазин-1-іл)-2-оксоетил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(1,3,5-триметил-1H-піразол-4-іл)-1H-індол-2-карбонова кислота

50 ¹H ЯМР (500 МГц, піридин-d₅) 8,64-8,68 (м, 1H), 8,01 (д, J=7,02 Гц, 1H), 7,87-7,90 (м, 1H), 7,48-7,53 (м, 3H), 7,36-7,40 (м, 1H), 7,30-7,33 (м, 1H), 7,19-7,21 (м, 1H), 6,87 (д, J=7,32 Гц, 1H), 6,05 (с.шир, 1H), 5,79 (с.шир, 1H), 4,28 (т, J=6,26 Гц, 2H), 3,74-3,87 (м, 6H), 3,24-3,52 (м, 3H), 2,40-2,56 (м, 5H), 2,35 (с.шир, 1H), 2,31 (с, 3H), 2,22 (с, 3H), 2,02 (с, 3H).

Приклад 588

7-(4,6-диметилпіримідин-5-іл)-1-(2-морфолін-4-іл-2-оксоетил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

60 ¹H ЯМР (400 МГц, ДМСО-d₆) 9,01 (с, 1H), 8,27-8,29 (м, 1H), 7,84-7,88 (м, 2H), 7,45-7,56 (м, 3H), 7,39 (т, J=7,98 Гц, 1H), 7,16 (т, J=7,67 Гц, 1H), 7,01 (д, J=6,44 Гц, 1H), 6,92 (д, J=7,67 Гц, 1H), 4,92 (шир, 2H), 4,24 (т, J=6,14 Гц, 2H), 3,07 (шир, 2H), 3,35-3,40 (м, 4H), 3,22 (шир, 2H), 2,93 (шир, 2H), 2,15-2,28 (м, 2H), 2,09 (с, 6H).

Приклад 589

1-(2-(4-метилпіперазин-1-іл)етил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(1,3,5-триметил-1Н-піразол-4-іл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, піридин-d₅) 8,66 (д, J=7,93 Гц, 1H), 8,01 (дд, J=8,09, 1,07 Гц, 1H), 7,89-7,91 (м, 1H), 7,48-7,55 (м, 3H), 7,32-7,42 (м, 2H), 7,18-7,21 (м, 1H), 6,91 (д, J=7,63 Гц, 1H), 4,96-5,03 (м, 1H), 4,71-4,78 (м, 1H), 4,33 (т, J=6,10 Гц, 2H), 3,84 (с, 3H), 3,77 (т, J=7,48 Гц, 2H), 2,98 (с, 3H), 2,58 (с, 3H), 2,42-2,58 (м, 6H), 2,23 (с, 3H), 2,21-2,27 (м, 1H), 2,14 (с, 3H), 2,10 (д, J=7,93 Гц, 1H).

Приклад 590

1-(2-морфолін-4-ілетил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(1,3,5-триметил-1Н-піразол-4-іл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, піридин-d₅) 8,66-8,69 (м, 1H), 8,00-8,03 (м, 1H), 7,89 (д, J=7,32 Гц, 1H), 7,47-7,55 (м, 3H), 7,31-7,43 (м, 2H), 7,21 (м, 1H), 6,92 (д, J=7,63 Гц, 1H), 4,95-5,03 (м, 1H), 4,83-4,89 (м, 1H), 4,34 (т, J=6,26 Гц, 2H), 3,76-3,81 (м, 2H), 3,76 (с, 3H), 3,61 (т, J=4,73 Гц, 4H), 2,55-2,61 (м, 2H), 2,39-2,44 (м, 1H), 2,27 (с, 3H), 2,20-2,30 (м, 5H), 2,09 (с, 3H).

Приклад 591

1-(2-морфолін-4-іл-2-оксоетил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(1,3,5-триметил-1Н-піразол-4-іл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, метанол-d₄) 8,31-8,37 (м, 1H), 7,74-7,81 (м, 2H), 7,46-7,50 (м, 2H), 7,36-7,41 (м, 1H), 7,33 (т, J=7,93 Гц, 1H), 7,01-7,07 (м, 1H), 6,91-6,97 (м, 1H), 6,80-6,83 (м, 1H), 5,27 (с, 2H), 4,20-4,24 (м, 2H), 3,85-3,88 (м, 1H), 3,85-3,90 (м, 1H), 3,82-3,85 (м, 3H), 3,82-3,84 (м, 3H), 3,55-3,62 (м, 4H), 3,44-3,50 (м, 3H), 3,34-3,40 (м, 2H), 3,16-3,24 (м, 3H), 2,31-2,37 (м, 2H), 1,93-2,03 (м, 6H).

Приклад 592

1-(2-(диметиламіно)етил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(1,3,5-триметил-1Н-піразол-4-іл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (500 МГц, піридин-d₅) 8,65-8,69 (м, 1H), 8,01 (д, J=7,02 Гц, 1H), 7,89-7,91 (м, 1H), 7,49-7,55 (м, 3H), 7,40 (т, J=7,93 Гц, 1H), 7,30-7,36 (м, 1H), 7,19 (м, 1H), 6,91 (д, J=7,63 Гц, 1H), 5,01 (т, J=7,93 Гц, 2H), 4,33 (т, J=6,10 Гц, 2H), 3,81 (с, 3H), 3,75-3,79 (м, 2H), 2,86-2,99 (м, 2H), 2,50-2,58 (м, 2H), 2,47 (с, 6H), 2,21 (с, 3H), 2,12 (с, 3H).

Приклад 593

7-(2-метилімідазо(1,2-а)піридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (400 МГц, ДМСО-d₆) 13,16 (с, 1H), 11,35 (с, 1H), 8,14-8,36 (м, 1H), 7,91-8,08 (м, 4H), 7,84-7,90 (м, 1H), 7,37-7,57 (м, 5H), 7,34 (т, J=6,3 Гц, 1H), 7,22-7,29 (м, 1H), 6,92 (д, J=7,1 Гц, 1H), 4,23 (т, J=6,4 Гц, 2H), 3,37-3,46 (м, 2H), 2,37 (с, 3H), 2,21-2,31 (м, 2H).

Приклад 594

7-(2-(1Н-імідазол-1-іл)-4-метилпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1-(піридин-2-ілметил)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (400 МГц, ДМСО-d₆) 13,31 (с, 1H), 8,72 (с, 1H), 8,55 (д, J=4,7 Гц, 1H), 8,22-8,33 (м, 1H), 8,19 (д, J=4,1 Гц, 1H), 7,83-7,96 (м, 2H), 7,44-7,59 (м, 5H), 7,35-7,43 (м, 1H), 7,32 (с, 1H), 7,19 (с, 1H), 7,06-7,16 (м, 3H), 6,89 (д, J=6,8 Гц, 1H), 6,40 (д, J=7,8 Гц, 1H), 5,44 (д, J=17,3 Гц, 1H), 5,22 (д, J=17,3 Гц, 1H), 4,20 (т, J=6,1 Гц, 2H), 3,26-3,43 (м, 2H), 2,17-2,30 (м, 2H), 1,83 (с, 3H).

Приклад 595

7-(2-етил-4-метилпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1-(піридин-2-ілметил)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (400 МГц, ДМСО-d₆) 8,63-8,67 (м, 1H), 8,22-8,28 (м, 2H), 7,96 (д, 1H), 7,85-7,90 (м, 1H), 7,34-7,72 (м, 6H), 7,15-7,27 (м, 2H), 7,03 (д, 1H), 6,92 (д, 1H), 6,37 (д, 1H), 5,40 (д, 1H), 5,18 (д, 1H), 4,27 (т, 2H), 2,26-2,35 (м, 2H), 1,97-2,15 (м, 2H), 1,86 (с, 3H), 0,90 (т, 3H).

Приклад 596

7-(2-етил-4-метилпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1-((1-(піридин-4-ілметил)піридин-4-іл)метил)-1Н-індол-2-карбоксилат

¹H ЯМР (400 МГц, ДМСО-d₆) 8,88-8,92 (м, 2H), 8,69-8,72 (м, 2H), 8,39-8,43 (м, 1H), 8,23-8,28 (м, 1H), 7,95-7,99 (м, 1H), 7,85-7,90 (м, 1H), 7,37-7,58 (м, 6H), 7,22-7,35 (м, 3H), 7,10-7,21 (м, 1H), 6,91-7,06 (м, 2H), 5,85 (с, 2H), 5,24-5,61 (м, 2H), 4,30 (т, 2H), 3,45 (т, 2H), 2,26-2,38 (м, 2H), 1,87-2,13 (м, 2H), 1,70-1,82 (м, 3H), 0,82 (т, 3H).

Приклад 597

7-(2-етил-4-метилпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1-(піридин-4-ілметил)-1Н-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (400 МГц, ДМСО-d₆) 8,60 (д, 1H), 8,43 (д, 2H), 8,22-8,28 (м, 1H), 7,99 (д, 1H), 7,85-7,91 (м, 1H), 7,37-7,59 (м, 5H), 7,25 (т, 1H), 7,02-7,07 (м, 1H), 6,94 (д, 1H), 6,69 (д, 2H), 5,38-5,51 (м, 1H)

5,14-5,28 (м, 1H) 4,29 (т, 2H) 3,46 (т, 2H) 2,27-2,37 (м, 2H) 1,92-2,13 (м, 2H) 1,85 (с, 3H) 0,88 (т, 3H).

Приклад 598

7-(2-етил-4-метилпіридин-3-іл)-1-(2-морфолін-4-іл-2-оксоетил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота
¹H ЯМР (400 МГц, ДМСО-d₆) 12,96 (шир.с, 1H) 8,60-8,67 (м, 1H) 8,24-8,29 (м, 1H) 7,84-7,90 (м, 2H) 7,49-7,59 (м, 3H) 7,46 (д, 1H) 7,39 (т, 1H) 7,19 (т, 1H) 7,03 (д, 1H) 6,91 (д, 1H) 4,24 (т, 2H) 2,18-2,40 (м, 4H) 2,01 (с, 3H) 1,02 (т, 3H).

Приклад 599

1-(2-(диметиламіно)-2-оксоетил)-7-(2-етил-4-метилпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота
¹H ЯМР (400 МГц, ДМСО-d₆) 8,51-8,56 (м, 1H) 8,25-8,31 (м, 1H) 7,79-7,90 (м, 2H) 7,26-7,58 (м, 5H) 7,10-7,22 (м, 1H) 6,89-7,02 (м, 2H) 4,24 (т, 2H) 2,63 (с, 2H) 2,20-2,39 (м, 7H) 1,85-1,97 (м, 3H) 1,01 (т, 3H).

Приклад 600

7-(2-етил-4-метилпіридин-3-іл)-1-(2-(4-метилпіперазин-1-іл)-2-оксоетил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота
¹H ЯМР (400 МГц, ДМСО-d₆) 10,19 (с, 1H) 8,62-8,77 (м, 1H) 8,21-8,32 (м, 1H) 7,82-7,95 (м, 2H) 7,33-7,74 (м, 5H) 7,18 (т, 1H) 7,02 (д, 1H) 6,90 (д, 1H) 4,23 (т, 2H) 3,34-3,40 (м, 6H) 2,61-2,97 (м, 6H) 2,15-2,41 (м, 3H) 2,01 (с, 3H) 1,02 (т, 3H).

Приклад 601

7-(2-етил-4-метилпіридин-3-іл)-1-(2-морфолін-4-ілетил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота
¹H ЯМР (400 МГц, ДМСО-d₆) 8,53-8,57 (м, 1H) 8,21-8,26 (м, 1H) 7,83-7,89 (м, 2H) 7,35-7,58 (м, 5H) 7,20 (т, 1H) 7,02 (д, 1H) 6,91 (д, 1H) 4,25 (т, 2H) 2,18-2,40 (м, 8H) 2,03 (с, 3H) 1,07 (т, 3H).

Приклад 602

1-(2-(диметиламіно)етил)-7-(2-етил-4-метилпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота
¹H ЯМР (400 МГц, ДМСО-d₆) 9,78 (с, 1H) 8,63 (д, 1H) 8,17-8,25 (м, 1H) 7,81-7,91 (м, 2H) 7,31-7,60 (м, 5H) 7,20 (т, 1H) 7,04 (д, 1H) 6,89 (д, 1H) 4,22 (т, 2H) 3,36 (т, 2H) 2,74-2,89 (м, 2H) 2,49 (с, 6H) 2,30-2,43 (м, 2H) 2,16-2,27 (м, 2H) 2,06 (с, 3H) 1,05 (т, 3H).

Приклад 603

7-(2-етил-4-метилпіридин-3-іл)-1-(2-(4-метилпіперазин-1-іл)етил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота
¹H ЯМР (400 МГц, ДМСО-d₆) 8,69 (д, 1H) 8,20-8,26 (м, 1H) 7,84-7,91 (м, 2H) 7,66 (д, 1H) 7,44-7,57 (м, 3H) 7,39 (т, 1H) 7,20 (т, 1H) 7,06 (д, 1H) 6,91 (д, 1H) 4,23 (т, 2H) 3,91-3,98 (м, 2H) 3,34 (т, 2H) 3,23-3,30 (м, 2H) 2,75-2,87 (м, 2H) 2,72 (с, 3H) 2,53-2,62 (м, 2H) 2,00-2,31 (м, 10H) 1,08 (т, 3H).

Приклад 604

7-(2-((4-(4-карбоксіфеніл)піперазин-1-іл)метил)феніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота
¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 12,96 (с, 1H), 12,37 (с, 1H), 11,05 (с, 1H), 9,46 (с, 1H), 8,14-8,30 (м, 1H), 7,82-7,90 (м, 1H), 7,69-7,78 (м, 4H), 7,55-7,63 (м, 2H), 7,47-7,55 (м, 2H), 7,45 (д, J=8,1 Гц, 1H), 7,32-7,42 (м, 3H), 7,08-7,12 (м, 2H), 6,83-6,91 (м, 4H), 4,39 (д, J=16,7 Гц, 1H), 4,19 (т, J=5,9 Гц, 2H), 4,08 (д, J=16,7 Гц, 1H), 3,62-3,76 (м, 2H), 3,29-3,42 (м, 2H), 3,13-3,26 (м, 1H), 2,93-3,10 (м, 1H), 2,75-2,87 (м, 2H), 2,16-2,26 (м, 2H).

Приклад 605

3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2-піперазин-1-ілпіридин-3-іл)-1H-індол-2-карбонова кислота
¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 13,12 (с, 1H), 10,87 (с, 1H), 8,44 (с, 2H), 8,32 (дд, J=4J, 1,7 Гц, 1H), 8,22-8,29 (м, 1H), 7,84-7,90 (м, 1H), 7,70-7,80 (м, 2H), 7,48-7,58 (м, 2H), 7,46 (д, J=8,1 Гц, 1H), 7,35-7,43 (м, 1H), 7,31 (д, J=6,1 Гц, 1H), 7,07-7,16 (м, 2H), 6,89 (д, J=6,4 Гц, 1H), 4,19 (т, J=6,1 Гц, 2H), 3,12 (с, 4H), 2,59-2,71 (м, 2H), 2,16-2,31 (м, 2H).

Приклад 606

1-(2-(диметиламіно)-2-оксоетил)-7-(2-(1H-імідазол-1-іл)-4-метилпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота
¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 13,23 (с, 1H), 8,61 (д, J=4,7 Гц, 1H), 8,24-8,39 (м, 1H), 8,16-8,25 (м, 1H), 7,76-7,95 (м, 2H), 7,64 (д, J=5,1 Гц, 1H), 7,49-7,57 (м, 2H), 7,46 (д, J=8,1 Гц, 1H), 7,36-7,43 (м, 1H), 7,26 (с, 1H), 6,99-7,12 (м, 3H), 6,90 (д, J=7,5 Гц, 1H), 4,94 (с, 1H), 4,20 (т, J=6,3 Гц, 2H), 3,39-3,52 (м, 2H), 2,57 (с, 3H), 2,16-2,25 (м, 2H), 2,07 (с, 3H).

Приклад 607

7-(2-(1H-імідазол-1-іл)-4-метилпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1-(піридин-3-ілметил)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 13,44 (с, 1H), 8,55 (д, J=4,7 Гц, 1H), 8,14-8,37 (м, 3H), 7,90-7,98 (м, 1H), 7,84-7,90 (м, 1H), 7,36-7,58 (м, 6H), 7,08-7,21 (м, 4H), 6,98 (с, 1H), 6,91 (д, J=7,5 Гц, 1H), 6,69 (д, J=8,5 Гц, 1H), 5,52 (д, J=17,3 Гц, 1H), 4,97 (д, J=17,3 Гц, 1H), 4,21 (т, J=6,3 Гц, 2H), 3,38 (т, 2H), 3,11-3,21 (м, 2H), 2,16-2,30 (м, 2H), 1,68 (с, 3H).

Приклад 608

7-(2-(1H-імідазол-1-іл)-4-метилпіридин-3-іл)-1-(2-морфолін-4-іл-2-оксоетил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 13,26 (с, 1H), 8,66 (д, J=5,1 Гц, 1H), 8,41 (с, 1H), 8,23-8,31 (м, 1H), 7,80-7,91 (м, 2H), 7,71 (д, J=5,1 Гц, 1H), 7,49-7,57 (м, 2H), 7,46 (д, J=8,1 Гц, 1H), 7,36-7,43 (м, 1H), 7,31 (с, 1H), 7,15-7,23 (м, 1H), 7,00-7,10 (м, 2H), 6,90 (д, J=7,5 Гц, 1H), 4,88 (д, 2H), 4,20 (т, J=6,1 Гц, 2H), 3,34 (с, 4H), 3,17 (с, 2H), 3,04 (с, 2H), 2,14-2,25 (м, 2H), 2,09 (с, 3H).

Приклад 609

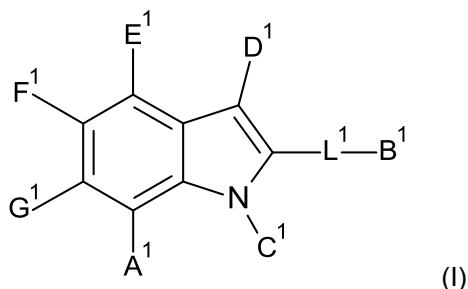
7-(2-(1H-імідазол-1-іл)-4-метилпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1-(2-оксо-2-піперазин-1-ілетил)-1H-індол-2-карбонова кислота

¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 13,22 (с, 1H), 8,69 (с, 2H), 8,57 (д, J=4,7 Гц, 1H), 8,24-8,31 (м, 1H), 7,82-7,91 (м, 2H), 7,49-7,61 (м, 3H), 7,47 (д, J=8,1 Гц, 1H), 7,35-7,44 (м, 1H), 7,10 (т, J=7,6 Гц, 3H), 6,89 (д, J=6,8 Гц, 2H), 6,47 (с, 1H), 5,01 (с, 1H), 4,21 (т, J=5,8 Гц, 2H), 3,12-3,29 (м, 4H), 2,81-3,06 (м, 4H), 2,16-2,25 (м, 2H), 2,03 (с, 3H).

Представлений вище опис призначений для ілюстрації даного винаходу, а не для його обмеження. Передбачається, що варіанти і зміни, очевидні для фахівців у даній галузі, входять в обсяг даного винаходу, як визначено у доданій формулі винаходу.

ФОРМУЛА ВИНАХОДУ

1. Сполука Формули I



або її терапевтично прийнятна сіль, де

A¹ являє собою A² або NHA²;

A² являє собою R¹, R², R³ або R⁴;

R¹ являє собою феніл, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або R^{1A}; R^{1A} являє собою циклоалкан, гетероциклоалкан або гетероциклоалкен;

R² являє собою гетероарил, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом або гетероареном;

R³ являє собою циклоалкеніл, гетероциклоалкіл або гетероциклоалкеніл, кожний з яких є неконденсованим або є конденсованим з бензолом;

R⁴ являє собою алкіл або алкеніл, кожний з яких є незаміщеним або заміщений одним, двома, трьома, чотирма або п'ятьма замісниками, незалежно вибраними з R⁵, OR⁵, SR⁵, C(O)OH, F, Cl, Br або I;

R⁵ являє собою R⁶, R⁷ або R⁸;

R⁶ являє собою феніл, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом;

R⁷ являє собою гетероарил;

R⁸ являє собою циклоалкіл;

L¹ являє собою зв'язок,

B¹ являє собою C(O)OH або C(O)OR⁴;

C¹ являє собою H, R¹² або C(O)OR¹²;

D¹ являє собою R¹²;

R¹² являє собою алкіл, алкеніл або алкініл, заміщений одним або двома замісниками, незалежно вибраними з R¹³, OR¹³, SR¹³, NHR¹³, N(R¹³)₂, C(O)R¹³ або C(O)N(R¹³)₂;

R¹³ являє собою R¹⁴, R¹⁵ або R¹⁶,

- R^{14} являє собою феніл, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом, гетероареном або R^{14A} ; R^{14A} являє собою циклоалкан або гетероциклоалкан; кожний з яких є неконденсованим або є конденсованим з R^{14B} ; R^{14B} являє собою циклоалкан;
 R^{15} являє собою гетероарил, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом або
 5 гетероареном;
 R^{16} являє собою циклоалкіл або гетероциклоалкіл, кожний з яких є неконденсованим або є конденсованим з бензолом;
 E^1 і F^1 кожний незалежно являє собою H, CF_3 , F, Cl, Br або I;
 G^1 являє собою H;
- 10 де кожна з зазначених вище циклічних груп, незалежно, є незаміщеною або заміщена одним або двома, або трьома, або чотирма, або п'ятьма замісниками, незалежно вибраними зі спірогетероалкілу, R^{30} , OR^{30} , SO_2R^{30} , $C(O)R^{30}$, NO, NO_2 , NH_2 , $N(R^{30})_2$, $C(O)NH_2$, $C(O)NHR^{30}$, $NHC(O)R^{30}$, $C(O)NH_2SO_2R^{30}$, SO_2NH_2 , $C(O)OH$, OH, (O), CN, CF_3 , OCF_3 , F, Cl, Br або I;
 R^{30} являє собою R^{31} , R^{32} , R^{33} або R^{34} ;
- 15 R^{31} являє собою феніл, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом;
 R^{32} являє собою гетероарил;
 R^{33} являє собою циклоалкіл, циклоалкеніл або гетероциклоалкіл, кожний з яких є неконденсованим або є конденсованим з бензолом;
 R^{34} являє собою алкіл, алкеніл або алкініл, кожний з яких є незаміщеним або заміщений одним,
 20 двома, трьома, чотирма або п'ятьма замісниками, незалежно вибраними з R^{35} , OR^{35} , SR^{35} , $S(O)R^{35}$, SO_2R^{35} , NH_2 , $N(R^{35})_2$, $C(O)NHR^{35}$, OH, $C(O)OH$, F, Cl, Br або I;
 R^{35} являє собою R^{36} , R^{37} , R^{38} або R^{39} ;
 R^{36} являє собою феніл, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом або R^{36A} ; R^{36A} являє собою циклоалкен;
- 25 R^{37} являє собою гетероарил, що є неконденсованим або є конденсованим з бензолом;
 R^{38} являє собою циклоалкіл або гетероциклоалкіл, кожний з яких є неконденсованим або є конденсованим з бензолом;
 R^{39} являє собою алкіл, який є незаміщеним або заміщений групою NH_2 , $N(R^{40})_2$ або OR^{40} ;
 R^{40} являє собою алкіл або феніл;
- 30 де групи, представлені як R^{31} , R^{32} , R^{33} , R^{36} , R^{37} , R^{38} і R^{40} , є, незалежно, незаміщеними або заміщені одним або двома, або трьома замісниками, незалежно вибраними з R^{50} , OR^{50} , $C(O)R^{50}$, $C(O)OR^{50}$, SO_2R^{50} , $NHC(O)R^{50}$, F, Cl, Br, I, $C(O)OH$, CN, NO_2 , NH_2 , (O) або OH;
 R^{50} являє собою R^{51} , R^{52} , R^{53} або R^{54} ;
 R^{51} являє собою феніл;
- 35 R^{52} являє собою гетероарил;
 R^{53} являє собою гетероциклоалкіл;
 R^{54} являє собою алкіл, який є незаміщеним або заміщений одним, двома, трьома, чотирма або п'ятьма замісниками, незалежно вибраними з OH, фенілу або гетероарилу;
- 40 де групи, представлені як R^{51} і R^{53} , є, незалежно, незаміщеними або заміщені одним або двома, або трьома замісниками, незалежно вибраними з $CO(O)R^{55}$, $C(O)OH$, (O), F, Cl, Br або I;
 R^{55} являє собою алкіл.
2. Сполука або її терапевтично прийнятна сіль, де сполуку вибирають з групи, яка включає:
- 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-((E)-2-фенілвініл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-феніл-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 45 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-((1E)-3-фенілпроп-1-еніл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 7-((E)-2-циклогексилвініл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(3-(бензилокси)феніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(4-фторфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(2-нафтил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 50 7-(1-нафтил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(1,1'-біфеніл-2-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(2-морфолін-4-ілфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(2-фтор-1,1'-біфеніл-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(4-(бензилокси)феніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 55 7-(3-морфолін-4-ілфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-піридин-3-іл-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-піридин-4-іл-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-((1E)-5-фенілпент-1-еніл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 60 7-(3-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;

- [illegible]

- 7-(2-метилфеніл)-1-(2-морфолін-4-ілетил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(2-метилфеніл)-3-(3-(5,6,7,8-тетрагідронафталін-1-ілокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
- 5 5-хлор-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-феніл-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 5-хлор-7-(4-хлор-2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 5-хлор-7-циклопент-1-ен-1-іл-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(3,5-дихлорпіридин-2-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(5-(амінокарбоніл)піридин-2-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
- 10 7-(3-хлор-5-(трифторметил)піридин-2-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(5-аміно-2-(трифторметокси)феніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(5-карбокси-2-метоксифеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(4-карбокси-2-нітрофеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
- 15 7-(5-карбокси-2-хлорфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(1-бензил-3-метил-1,2,3,6-тетрагідропіридин-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(4-аміно-2-(трифторметил)феніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(1,4-діокса-8-азаспіро(4,5)дец-8-ил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
- 20 7-(3-карбоксипіперидин-1-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(4-карбоксипіперидин-1-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-піролідин-1-іл-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-морфолін-4-іл-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-піперидин-1-іл-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
- 25 7-(4-(аміносульфоніл)-2-(трифторметил)феніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 4-(2-(етоксикарбоніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-7-іл)-3-метилбензойну кислоту;
 7-(2-метил-4-(морфолін-4-ілкарбоніл)феніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
- 30 7-(4-((4-карбоксипіперидин-1-іл)карбоніл)-2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(4-((3-карбоксипіперидин-1-іл)карбоніл)-2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(4-(карбоксиметилкарбамоїл)-2-метилфеніл)-3-(3-(нафталін-1-ілокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
- 35 3-(3-(3,4-дигідрохінолін-1(2Н)-іл)пропіл)-7-(2-(трифторметил)феніл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(2-метилфеніл)-3-(3-(3-феноксифенокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(3-(2,3-диметилфенокси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
- 40 7-(4-метилпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(2-метилбензил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 3,3'-біс(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н,1'Н-7,7'-бііндол-2,2'-дикарбонову кислоту;
 3-(4-(3,4-дигідрохінолін-1(2Н)-іл)бутил)-7-(2-(трифторметил)феніл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
- 45 7-(4-карбокси-2-метилфеніл)-3-(4-(3,4-дигідрохінолін-1(2Н)-іл)бутил)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(2-метилфеніл)-3-(4-(1-нафтил)бутил)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(2-метилфеніл)-3-(4-(1-нафтилокси)бутил)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(3-(2,4-диметилфенокси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
- 50 3-(3-(2,5-диметилфенокси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(1,1'-біфеніл-2-іл)-3-(4-(1-нафтилокси)бутил)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(4-((2-карбоксипіперидин-1-іл)карбоніл)-2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(4-((S)-1-карбокси-2-метилпропілкарбамоїл)-2-метилфеніл)-3-(3-(нафталін-1-ілокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
- 55 N-(4-(2-карбокси-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-7-іл)-3-метилбензоїл)-4-хлорфенілаланін;
 N-(4-(2-карбокси-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-7-іл)-3-метилбензоїл)-L-триптофан;
 (3S)-2-(4-(2-карбокси-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-7-іл)-3-метилбензоїл)-1,2,3,4-тетрагідроізохінолін-3-карбонову кислоту;
- 60 N-(4-(2-карбокси-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-7-іл)-3-метилбензоїл)-L-тирозин;

- 7-(4-((R)-2-карбоксіпіролідін-1-карбоніл)-2-метилфеніл)-3-(3-(нафталін-1-ілокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(4-((S)-1-карбоксіетилкарбамоїл)-2-метилфеніл)-3-(3-(нафталін-1-ілокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
- 5 N-(4-(2-карбоксі-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-7-іл)-3-метилбензоїл)-4-нітро-L-фенілаланін;
 N-(4-(2-карбоксі-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-7-іл)-3-метилбензоїл)-L-фенілаланін;
 7-(4-(((S)-карбоксі(феніл)метил)аміно)карбоніл)-2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
- 10 7-(4-карбоксі-2-метилфеніл)-3-(3-(2,4,5-трихлорфенокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(4-карбоксі-2-метилфеніл)-3-(3-(2,3,4-трихлорфенокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(4-карбоксі-2-метилфеніл)-3-(3-(2,3,5-триметилфенокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(3-(2-трет-бутилфенокси)пропіл)-7-(4-карбоксі-2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
- 15 7-(4-карбоксі-2-метилфеніл)-3-(3-(2-(трифторметил)фенокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(4-карбоксі-2-метилфеніл)-3-(3-(хінолін-8-ілокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(4-карбоксі-2-метилфеніл)-3-(3-((5-оксо-5,6,7,8-тетрагідронафталін-1-іл)окси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
- 20 3-(3-(3-бензоїлфенокси)пропіл)-7-(4-карбоксі-2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(2-метилфеніл)-1-(2-морфолін-4-ілетил)-3-(3-(5,6,7,8-тетрагідронафталін-1-ілокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(4-(циклогексилокси)феніл)-3-(4-(1-нафтилокси)бутил)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(1,1'-біфеніл-2-іл)-1-(2-морфолін-4-ілетил)-3-(3-(5,6,7,8-тетрагідронафталін-1-ілокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
- 25 3-(3-(3,4-диметилфенокси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(3-(3,5-диметилфенокси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(3-(2,3-диметоксифенокси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтиламіно)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
- 30 1-(карбоксіметил)-7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(3-(3-(диметиламіно)фенокси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(4-(3,4-дигідрохінолін-1(2H)-іл)бутил)-7-(4-(морфолін-4-ілкарбоніл)-2-(трифторметил)феніл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(4-(2-метил-3,4-дигідрохінолін-1(2H)-іл)бутил)-7-(4-(морфолін-4-ілкарбоніл)-2-(трифторметил)феніл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
- 35 3-(4-(6-метил-3,4-дигідрохінолін-1(2H)-іл)бутил)-7-(4-(морфолін-4-ілкарбоніл)-2-(трифторметил)феніл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(4-(6-метокси-3,4-дигідрохінолін-1(2H)-іл)бутил)-7-(4-(морфолін-4-ілкарбоніл)-2-(трифторметил)феніл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
- 40 3-(4-(2,3-дигідро-1H-індол-1-іл)бутил)-7-(4-(морфолін-4-ілкарбоніл)-2-(трифторметил)феніл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(4-(2-метил-2,3-дигідро-1H-індол-1-іл)бутил)-7-(4-(морфолін-4-ілкарбоніл)-2-(трифторметил)феніл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
- 45 7-(4-(морфолін-4-ілкарбоніл)-2-(трифторметил)феніл)-3-(4-(5-нітро-2,3-дигідро-1H-індол-1-іл)бутил)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(4-(5-бром-2,3-дигідро-1H-індол-1-іл)бутил)-7-(4-(морфолін-4-ілкарбоніл)-2-(трифторметил)феніл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(4-(2,3-дигідро-4H-1,4-бензоксазін-4-іл)бутил)-7-(4-(морфолін-4-ілкарбоніл)-2-(трифторметил)феніл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
- 50 7-(2-метилфеніл)-3-(3-(2,3,5-триметилфенокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(2-метилфеніл)-3-(3-(2,3,6-триметилфенокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(3-(2,3-дихлорфенокси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(2-метилфеніл)-3-(5-(5,6,7,8-тетрагідронафталін-1-ілокси)пентил)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
- 55 7-(2-метилфеніл)-3-(5-(1-нафтилокси)пентил)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(2,3-диметилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1-(піридин-4-ілметил)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(2-(4-фторфеніл)циклогекс-1-ен-1-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
- 60

- 7-(3,5-диметил-1-(2-(2-оксопіролідин-1-іл)етил)-1Н-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)бензил)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-тієн-3-іл-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 5 7-((3-(амінокарбоніл)феніл)аміно)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-((3-ціанофеніл)аміно)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-((2-бензилфеніл)аміно)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(1,1'-біфеніл-2-іламіно)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-((2-етилфеніл)аміно)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 10 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-((2-пропілфеніл)аміно)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(5-карбокси-3-метилтієн-2-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-((2-карбоксифеніл)аміно)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-((3-карбоксифеніл)аміно)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(2-морфолін-4-іл-5-нітропіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову
 15 кислоту;
 7-(5-аміно-2-морфолін-4-ілпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову
 кислоту;
 7-((3-хлорпіридин-4-іл)аміно)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-((2-ізопропілфеніл)аміно)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 20 7-(2-морфолін-4-ілпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(5-(амінокарбоніл)-1,2-диметил-6-оксо-1,6-дигідропіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-
 індол-2-карбонову кислоту;
 7-(5-ціано-1,2-диметил-6-оксо-1,6-дигідропіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-
 карбонову кислоту;
 25 7-(5-аміно-4-хлор-2-морфолін-4-ілпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-
 карбонову кислоту;
 2-метил-3'-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-2,3-дигідро-1'Н-1,7'-бііндол-2'-карбонову кислоту;
 7-(2-фтор-5-метилпіридин-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-((2-метоксипіридин-3-іл)аміно)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 30 7-(5-метил-2-оксо-1,2-дигідропіридин-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову
 кислоту;
 7-(5-метил-2-(2-піролідин-1-ілетокси)піридин-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-
 карбонову кислоту;
 7-(2-(диметиламіно)-5-нітропіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову
 35 кислоту;
 7-(2-(2-(диметиламіно)етокси)-5-метилпіридин-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-
 карбонову кислоту;
 7-(5-метил-2-(2-морфолін-4-ілетокси)піридин-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-
 карбонову кислоту;
 40 7-(2-(1,4-діокса-8-азаспіро(4,5)дец-8-ил)-5-нітропіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-
 індол-2-карбонову кислоту;
 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(5-нітро-2-(4-оксопіридин-1-іл)піридин-3-іл)-1Н-індол-2-
 карбонову кислоту;
 7-(5-аміно-2-(диметиламіно)піридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову
 45 кислоту;
 7-(2-(4-гідроксипіридин-1-іл)-5-нітропіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-
 карбонову кислоту;
 7-(6-метокси-4-метилпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(2-фтор-5-метилпіридин-4-іл)-1-(2-морфолін-4-ілетил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-
 50 карбонову кислоту;
 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(1,3,5-триметил-1Н-піразол-4-іл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-((2-морфолін-4-ілпіридин-3-іл)аміно)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову
 кислоту;
 7-(5-метил-2-(2-фенілетокси)піридин-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову
 55 кислоту;
 7-(5-метил-2-(2-піридин-3-ілетокси)піридин-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-
 карбонову кислоту;
 7-((2-морфолін-4-ілфеніл)аміно)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-((4-карбоксипіридин-3-іл)аміно)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;

- 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-((4-(трифторметил)піридин-3-іл)аміно)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(2-(3-амінопропокси)-5-метилпіридин-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
- 5 7-(5-метил-2-(тетрагідрофуран-3-ілметокси)піридин-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(5-метил-2-(4-фенілбутоксипіридин-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(2-(3-метоксифеніл)циклогекс-1-ен-1-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
- 10 7-(1-(карбоксиметил)-3,5-диметил-1Н-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(1-бензил-1Н-імідазол-5-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(2-(2-метилфеніл)циклогекс-1-ен-1-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
- 15 7-(3,5-диметил-1-(2-морфолін-4-ілетил)-1Н-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2-(4-нітрофеніл)циклогекс-1-ен-1-іл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
- 20 7-(4,4-диметил-2-фенілциклогекс-1-ен-1-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-аніліно-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(5-метил-2-(тетрагідро-2Н-піран-3-ілметокси)піридин-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
- 25 7-(5-метил-2-(2-(2-оксопіролідін-1-іл)етокси)піридин-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(5-метил-2-(2-(4-метилпіперазин-1-іл)етокси)піридин-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2-(2-оксоциклогексил)піридин-3-іл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
- 30 7-(2-фтор-5-метилпіридин-4-іл)-1-(2-(4-метилпіперазин-1-іл)етил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(5,5-диметил-2-фенілциклогекс-1-ен-1-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(піридин-3-іламіно)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
- 35 7-(3-циклогекс-1-ен-1-ілпіридин-2-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2-піридин-3-ілциклогекс-1-ен-1-іл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(3-((8-хлорхіназолін-4-іл)окси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(3-(7-хлор-1Н-піроло(2,3-с)піридин-1-іл)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
- 40 7-(3-циклогексилпіридин-2-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(1-(1,3-тіазол-5-ілметил)-1Н-піроло(2,3-с)піридин-3-іл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(1-(3,3-диметил-2-оксобутил)-1Н-піроло(2,3-с)піридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
- 45 7-(4-циклогекс-1-ен-1-ілпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(1-(3,5-дифторбензил)-1Н-піроло(2,3-с)піридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(1-фенілвініл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(1Н-піроло(2,3-с)піридин-7-іл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
- 50 7-(4-циклогексилпіридин-3-іл)-3-(3-феноксипропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(2,4-диметил-1,3-тіазол-5-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(1-(карбоксиметил)-1Н-піроло(2,3-с)піридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(1-фенілетил)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
- 55 7-(1-бензил-3,5-диметил-1Н-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(2-(2-хлорфеніл)циклогекс-1-ен-1-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н,1'Н-7,7'-бііндол-2-карбонову кислоту;

- 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(1-(2-(2-оксопіролідін-1-іл)етил)-1Н-піроло(2,3-с)піридин-7-іл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(5-метил-3-феніл-1Н-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(3-(1Н-індол-4-ілокси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 5 7-(2-(4-етилфеніл)циклогекс-1-ен-1-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(2-(4-ізопропілфеніл)циклогекс-1-ен-1-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 10 7-(1,3-диметил-5-феніл-1Н-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(1,5-диметил-3-феніл-1Н-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(3,5-диметил-1-((3-метилоксетан-3-іл)метил)-1Н-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 15 7-(3,5-диметил-1-тетрагідрофуран-3-іл-1Н-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(3,5-диметил-1-піридин-2-іл-1Н-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(2-хлор-4-метилпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 20 7-(4-метил-2-(2-(2-оксопіролідін-1-іл)етокси)піридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(3,5-диметил-1-(тетрагідрофуран-3-ілметил)-1Н-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(1-циклопентил-3,5-диметил-1Н-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 25 7-(1-((2,2-диметил-1,3-діоксолан-4-іл)метил)-3,5-диметил-1Н-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(4-метил-2-(2-морфолін-4-ілетокси)піридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 30 7-(4-метил-2-морфолін-4-ілпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(2-хлор-4-метилпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1-(піридин-3-ілметил)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(2-(1Н-імідазол-1-іл)-4-метилпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 35 7-(1-(2,3-дигідроксипропіл)-3,5-диметил-1Н-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(3-феніл-5-(2-фенілетил)-1Н-піразол-4-іл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 40 7-(4-метил-2-фенілпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(4-метил-2-вінілпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(4-метил-2-((1Е)-проп-1-еніл)піридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(2-етил-4-метилпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 45 7-(3,5-диметил-1-(піридин-3-ілметил)-1Н-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(2-ізопропеніл-4-метилпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(4-метил-2-пентилпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(4-метил-2-пропілпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 50 7-(2-ізопропіл-4-метилпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(3,5-діізопропіл-1-метил-1Н-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(5-карбоксі-1,3-диметил-1Н-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 55 7-(4-метил-2-(2-метилпроп-1-еніл)піридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(4-карбоксі-1-феніл-1Н-піразол-5-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(2-ізобутил-4-метилпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 60 7-(4-метил-2,3'-біпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;

- 7-(2-(4-метоксифеніл)-4-метилпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(4-метил-2-(1-метил-1H-піразол-4-іл)піридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 5 7-(3-(гідроксиметил)-1,5-диметил-1H-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(1,3-диметил-5-(феноксиметил)-1H-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 10 7-(1-метил-1H-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(3-ізопропіл-1-метил-5-(феноксиметил)-1H-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(1,5-диметил-3-(феноксиметил)-1H-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 15 7-(4-(анілінокарбоніл)-1-феніл-1H-піразол-5-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(3-((3-хлорфенокси)метил)-1,5-диметил-1H-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(1,5-диметил-3-((3-феноксифенокси)метил)-1H-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 20 7-(1,5-диметил-3-((4-морфолін-4-ілфенокси)метил)-1H-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(3-(((5-хлорпіридин-3-іл)окси)метил)-1,5-диметил-1H-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(3,5-диметил-1-(2-нітрофеніл)-1H-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 25 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-((2-(фенілтіо)етил)аміно)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(3-((2-ціанофенокси)метил)-1,5-диметил-1H-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(3-((4-(4-ацетилпіперазин-1-іл)фенокси)метил)-1,5-диметил-1H-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 30 7-(1-(2-амінофеніл)-3,5-диметил-1H-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(3-(1H-імідазол-1-ілметил)-1,5-диметил-1H-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 35 7-(4-((бензиламіно)карбоніл)-1-феніл-1H-піразол-5-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(1-феніл-4-(((3-піролідін-1-ілпропіл)аміно)карбоніл)-1H-піразол-5-іл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(4,6-диметилпіримідин-5-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 40 7-(4,6-диметилпіримідин-5-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1-(піридин-3-ілметил)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(2-етил-4-метилпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1-(піридин-3-ілметил)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(2-етил-4-метилпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1-(1,3-тіазол-4-ілметил)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 45 7-(2-хлор-4-((4-морфолін-4-ілфенокси)метил)піридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(5-ізопропіл-1-метил-3-((4-морфолін-4-ілфенокси)метил)-1H-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 50 7-(3-ізопропіл-1-метил-5-((4-морфолін-4-ілфенокси)метил)-1H-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(2-ізопропеніл-4-метилпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1-(піридин-2-ілметил)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(1,5-диметил-3-((4-морфолін-4-ілфенокси)метил)-1H-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1-(піридин-3-ілметил)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 55 7-(2-етил-4-((4-морфолін-4-ілфенокси)метил)піридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(4-метил-2-піримідин-5-ілпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;

- 7-(4-метил-6'-морфолін-4-іл-2,3'-біпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
- 7-(4,6-диметилпіримідин-5-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1-(піридин-2-ілметил)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
- 5 7-(4,6-диметилпіримідин-5-іл)-1-(2-(4-метилпіперазин-1-іл)-2-оксоетил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
- 7-(3-((4-(1,1-діоксидотіоморфолін-4-іл)фенокс)метил)-1,5-диметил-1H-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
- 10 7-(4,6-диметилпіримідин-5-іл)-1-(2-морфолін-4-ілетил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
- 7-(1,5-диметил-3-((4-піперазин-1-ілфенокс)метил)-1H-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
- 7-(3-((4-(4-ацетилпіперазин-1-іл)фенокс)метил)-1,5-диметил-1H-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1-(піридин-3-ілметил)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
- 15 7-(4,6-диметилпіримідин-5-іл)-1-(2-(4-метилпіперазин-1-іл)етил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
- 7-(3-((4-(4-(трет-бутоксикарбоніл)піперазин-1-іл)фенокс)метил)-1,5-диметил-1H-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
- 20 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(4-(1H-піразол-1-іл)феніл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
- 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2,3,4-трифторфеніл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
- 7-(4-гідрокси-3-метоксифеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
- 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(3,4,5-триметоксифеніл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
- 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(4-(трифторметокси)феніл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
- 7-(2-метокси-5-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
- 25 7-(3-фтор-4-метоксифеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
- 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(4-(5-оксо-2,5-дигідро-1H-піразол-3-іл)феніл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
- 7-(3-(морфолін-4-ілметил)феніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
- 7-(4-(морфолін-4-ілметил)феніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
- 30 7-(4-ізопропокси-2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
- 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(4-(1H-піразол-5-іл)феніл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
- 7-(2,5-диметилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
- 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2,4,5-триметилфеніл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
- 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(3-(трифторметокси)феніл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
- 35 7-(2-метил-4-пропоксифеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
- 7-(3-ціанофеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
- 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2,3,5,6-тетраметилфеніл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
- 7-(3-ціано-2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
- 7-(3-етиніл-2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
- 40 7-(5-(((3-(диметиламіно)пропіл)аміно)карбоніл)-2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
- 7-(2-ізопропілфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
- 7-(5-(((2-(диметиламіно)етил)аміно)карбоніл)-2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
- 45 7-(2-метил-5-(((2-морфолін-4-ілетил)аміно)карбоніл)феніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
- 7-(2-метил-5-(((3-морфолін-4-ілпропіл)аміно)карбоніл)феніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
- 7-(2-метил-5-(((2-фенілетил)аміно)карбоніл)феніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
- 50 7-(1H-індазол-5-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
- 7-(5-(((1S,4R)-біцикло(2,2,1)гепт-2-илметил)аміно)карбоніл)-2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
- 7-(2-метил-5-(((3-фенілпропіл)аміно)карбоніл)феніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
- 55 7-(2-((2-ізопропіл-5-метилфенокс)метил)феніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
- 7-(2-хлор-6-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
- 7-(2-бензилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
- 60 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2,4,6-триізопропілфеніл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;

- 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(1-оксо-2,3-дигідро-1H-інден-4-іл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(2-циклопентилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(2',6'-диметокси-1,1'-біфеніл-2-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(5,6,7,8-тетрагідронафталін-1-іл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 5 7-(4'-трет-бутил-1,1'-біфеніл-2-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(5-фтор-2-метил-3-((метилсульфоніл)метил)феніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(5-(((2-гідрокси-1,1-диметилетил)аміно)карбоніл)-2,3,4-триметилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 10 7-(2-(4-(етоксикарбоніл)піперазин-1-іл)феніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(2-метил-6-нітрофеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2-(4-пропіонілпіперазин-1-іл)феніл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(2-метил-6-тієн-2-ілфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 15 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2-(4-(1,3-тіазол-4-ілметил)піперазин-1-іл)феніл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(2-(4-(2-гідроксіетил)піперазин-1-іл)феніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(2-(4-(метилсульфоніл)піперазин-1-іл)феніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 20 7-(2-((4-(трет-бутоксикарбоніл)піперазин-1-іл)сульфоніл)феніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(2-((4-етилпіперазин-1-іл)сульфоніл)феніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 25 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2-((4-(2-оксопіролідін-1-іл)піперидин-1-іл)сульфоніл)феніл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(3-((1S,4R)-2-гідроксибіцикло(2,2,1)гепт-2-ил)-2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 7-((1E)-1-етилбут-1-еніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 30 7-((Z)-2-карбокси-1-пентилвініл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(5,7-диметилпіразоло(1,5-а)піримідин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(4-(4-фторфеніл)-5-(4-(метилсульфоніл)феніл)тієн-2-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 35 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1-(піридин-4-ілметил)-7-(2-(трифторметил)феніл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(5-(((2-(диметиламіно)етил)(піридин-2-іл)аміно)метил)тієн-2-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(2-морфолін-4-іл-6-(трифторметил)феніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 40 7-(4-метокси-2-феніл-1-бензофуран-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 4-(фтор-7-(2-морфолін-4-ілфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 4-фтор-7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 45 7-(2-((2-адамантиламіно)карбоніл)-6-метилімідазо(1,2-а)піридин-8-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(1-(1-адамантил)-3-карбокси-1H-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(2-(1-гідрокси-4-метоксициклогексил)-1-бензотієн-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 50 7-(5-хлор-3-метил-1-тетрагідро-2H-піран-2-іл-1H-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2,2,4-триметил-1-(фенілсульфоніл)-1,2-дигідрохінолін-3-іл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(7,8-диметил-2-(1-метил-1-фенілетил)імідазо(1,2-а)піридин-6-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(1-(4-((2-фторбензоіл)аміно)феніл)-3-(трифторметил)-1H-піразол-5-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(5-аміно-3-(піперидин-1-ілкарбоніл)-1H-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 60

- 7-(3-метил-1-(2-нітрофеніл)-5-феніл-1Н-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(5-метил-1-(2-оксо-2-((2-фенілетил)аміно)етил)-3-(трифторметил)-1Н-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 5 7-(2-(1-адамантил)імідазо(1,2-а)піридин-5-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(1,1-діоксидо-1-бензотієн-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(2-циклогексил-6-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 10 7-(4-(((2-(2-(2-аміноетоксі)етоксі)етил)аміно)карбоніл)-2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(1-метил-3,5-дифеніл-1Н-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-((Z)-2-(1Н-імідазол-1-іл)-1-фенілвініл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 15 7-(1-бензил-2-метил-4-нітро-1Н-імідазол-5-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2-проп-1-інілфеніл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2-(фенілетиніл)феніл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 3,7-біс(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 20 1-(2-метилбензил)-7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 1-(3-метилбензил)-7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 1-(4-метилбензил)-7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(2-метилфеніл)-1-(3-морфолін-4-ілпропіл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 25 7-(2-метилфеніл)-1-(2-(4-метилпіперазин-1-іл)-2-оксоетил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(2-метилфеніл)-1-(2-(4-метилпіперазин-1-іл)етил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 1-(1,1'-біфеніл-2-ілметил)-7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 30 1-(1,1'-біфеніл-3-ілметил)-7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 1-(1,1'-біфеніл-4-ілметил)-7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 35 1-(2,4-диметилбензил)-7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 1-(4-карбоксибензил)-7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 1-(1,1'-біфеніл-2-ілметил)-7-(2-морфолін-4-ілфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 40 1-(1,1'-біфеніл-3-ілметил)-7-(2-морфолін-4-ілфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 1-(1,1'-біфеніл-4-ілметил)-7-(2-морфолін-4-ілфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 45 1-(2,4-диметилбензил)-7-(2-морфолін-4-ілфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 1-(2,6-дихлорбензил)-7-(2-морфолін-4-ілфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 1-(4-карбоксибензил)-7-(2-морфолін-4-ілфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 50 7-(6,6-диметилциклогекс-1-ен-1-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(5,5-диметилциклопент-1-ен-1-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(7-фенілциклопент-1-ен-1-іл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-трицикло(4,3,1,^{3,8})ундец-4-ен-4-іл-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 55 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2-фенілциклопент-1-ен-1-іл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2,6,6-триметилциклогекс-1-ен-1-іл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-((1R,4R)-1,7,7-триметилбіцикло(2,2,1)гепт-2-ен-2-іл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-4-(трифторметил)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;

- 7-(2-морфолін-4-ілфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-4-(трифторметил)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(1,1'-біфеніл-2-ілметил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(1,1'-біфеніл-3-ілметил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 5 7-(1-(2-(1-нафтилокси)етил)вініл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2-(феноксиметил)бензил)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2-(2-феноксіетил)феніл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(3-(2-феноксіетил)феніл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2-(3-феноксипропіл)феніл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 10 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(3-(3-феноксипропіл)феніл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(3-(3-гідрокси-2-метилфенокси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(3-(3-(2-метоксіетокси)-2-метилфенокси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(1,2-диметилпроп-1-еніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 15 3-(3-(2-метил-3-(2-морфолін-4-ілетокси)фенокси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(3-(2,3-дихлорфенокси)пропіл)-7-(2-морфолін-4-ілфеніл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 1-(2-морфолін-4-ілетил)-7-(2-морфолін-4-ілфеніл)-3-(3-(5,6,7,8-тетрагідронафталін-1-ілокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 20 7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилтіо)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(3-(3-(2-метоксіетокси)-5-метилфенокси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(2-морфолін-4-ілфеніл)-3-(3-(5,6,7,8-тетрагідронафталін-1-ілокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 25 3-(3-(3-метил-5-(3-морфолін-4-ілпропокси)фенокси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(3-(3-(3-циклогексилпропокси)-5-метилфенокси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(3-(3-(3-(2-карбоксі-1Н-індол-3-іл)пропокси)-5-метилфенокси)пропіл)-7-(2-морфолін-4-ілфеніл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 30 7-(2-морфолін-4-ілфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1-(піридин-4-ілметил)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(1,1'-бі(циклогексан)-2-ен-2-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(3-(2,3-дихлорфенокси)пропіл)-7-(1,2-диметилпроп-1-еніл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 35 7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1-(піридин-2-ілметил)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(2-метил-4-(трифторметил)феніл)-3-(3-(2,3,5-триметилфенокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(4-фтор-2-метилфеніл)-3-(3-(2,3,5-триметилфенокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 40 7-(4-метокси-2-метилфеніл)-3-(3-(2,3,5-триметилфенокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1-(піридин-3-ілметил)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(3-(2,3-дихлорфенокси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1-(піридин-2-ілметил)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 45 7-(2-метилфеніл)-1-(2-морфолін-4-іл-2-оксоетил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(3-(3,5-дихлорфенокси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 1-(3-(амінометил)бензил)-7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 50 1-(3-(амінометил)бензил)-7-(2-морфолін-4-ілфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-((Е)-2-(2-((Е)-2-циклогексилвініл)феніл)вініл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(2-(3-карбоксіфеніл)етил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 55 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-((Е)-2-(2-піридин-3-ілфеніл)вініл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2-(3-((фенілсульфоніл)аміно)карбоніл)феніл)етил)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(2-(3-((4-метилпіперидин-1-іл)карбоніл)феніл)етил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;

- 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2-(3-(((2-піролідин-1-ілетил)аміно)карбоніл)феніл)етил)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(2-(3-(((2-морфолін-4-ілетил)аміно)карбоніл)феніл)етил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 5 7-(2-(3-(((2-(диметиламіно)етил)аміно)-карбоніл)феніл)етил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-((E)-2-(3-(((фенілсульфоніл)аміно)карбоніл)феніл)вініл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-((E)-2-(2-піридин-4-ілфеніл)вініл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 10 7-((E)-2-(3-хлорфеніл)вініл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 7-((E)-2-(3-((циклогексиламіно)карбоніл)феніл)вініл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-((E)-2-(3-(((2-феноксіетил)аміно)карбоніл)феніл)вініл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 15 7-((E)-2-(3-(((2-(2-аміноетоксі)етоксі)етил)аміно)карбоніл)феніл)вініл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 7-((E)-2-(3-((4-бензилпіперидин-1-іл)карбоніл)феніл)вініл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-((E)-2-(3-((4-фенілпіперазин-1-іл)карбоніл)феніл)вініл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 20 7-((E)-2-(3-((3-метилпіперидин-1-іл)карбоніл)феніл)вініл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(2-(3-(((2-(2-(2-аміноетоксі)етоксі)етил)аміно)карбоніл)феніл)етил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 25 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-((E)-2-(3-((E)-2-фенілвініл)феніл)вініл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 7-((E)-2-(1,1'-біфеніл-3-іл)вініл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-((E)-2-(3-((1E)-3-фенілпроп-1-еніл)феніл)вініл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 30 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-((E)-2-(4-((E)-2-фенілвініл)феніл)вініл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-((E)-2-(4-((1E)-3-фенілпроп-1-еніл)феніл)вініл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 7-((E)-2-(1,1'-біфеніл-4-іл)вініл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 35 7-(2-(1,1'-біфеніл-3-іл)етил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2-(3-(3-фенілпропіл)феніл)етил)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 7-((E)-2-(2-хлорфеніл)вініл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 7-((E)-2-(1,1'-біфеніл-2-іл)вініл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 40 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-((E)-2-(2-((E)-2-фенілвініл)феніл)вініл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2-фенілетил)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(2-(2-хлорфеніл)етил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(2-(1,1'-біфеніл-4-іл)етил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 45 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2-(4-(2-фенілетил)феніл)етил)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2-(4-(3-фенілпропіл)феніл)етил)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(4-карбокси-2-метилфеніл)-3-(3-((2-ціанохінолін-8-іл)окси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(3-((2-ацетил-1-бензофуран-7-іл)окси)пропіл)-7-(4-карбокси-2-метилфеніл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 50 7-(4-карбокси-2-метилфеніл)-3-(3-((2,2-диметил-2,3-дигідро-1-бензофуран-7-іл)окси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(4-карбокси-2-метилфеніл)-3-(3-(2,3-дифторфенокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(4-карбокси-2-метилфеніл)-3-(3-(3-метил-2-нітрофенокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 55 7-(4-карбокси-2-метилфеніл)-3-(3-(2-метил-3-нітрофенокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(4-карбокси-2-метилфеніл)-3-(3-(2-хлор-3-(трифторметил)фенокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(4-карбокси-2-метилфеніл)-3-(3-(2-фтор-3-(трифторметил)фенокси)пропіл)-1H-індол-2-карбонову кислоту;
 60

- 7-(4-(морфолін-4-ілкарбоніл)-2-(трифторметил)феніл)-3-(4-(5-оксо-2,3,4,5-тетрагідро-1Н-1-бензазепін-1-іл)бутил)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(4-(морфолін-4-ілкарбоніл)-2-(трифторметил)феніл)-3-(4-(2,3,4,5-тетрагідро-1Н-1-бензазепін-1-іл)бутил)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 5 3-(4-(2,3-дигідро-4Н-1,4-бензотіазин-4-іл)бутил)-7-(4-(морфолін-4-ілкарбоніл)-2-(трифторметил)феніл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(4-(3,4-дигідрохінолін-1(2Н)-іл)бутил)-7-(2-метилфеніл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(4-(2-метил-3,4-дигідрохінолін-1(2Н)-іл)бутил)-7-(2-метилфеніл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(4-(6-метил-3,4-дигідрохінолін-1(2Н)-іл)бутил)-7-(2-метилфеніл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 10 3-(4-(8-метил-3,4-дигідрохінолін-1(2Н)-іл)бутил)-7-(2-метилфеніл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(4-(2-метил-2,3-дигідро-1Н-індол-1-іл)бутил)-7-(2-метилфеніл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(2-метилфеніл)-3-(4-(2,3,4,5-тетрагідро-1Н-1-бензазепін-1-іл)бутил)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(4-(3-метил-3,4-дигідрохінолін-1(2Н)-іл)бутил)-7-(2-метилфеніл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 15 3-(4-(3-(гідроксиметил)-3,4-дигідрохінолін-1(2Н)-іл)бутил)-7-(2-метилфеніл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(4-(2,3-дигідро-4Н-1,4-бензотіазин-4-іл)бутил)-7-(2-метилфеніл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(3-(((1R,4S)-8-гідрокси-1,2,3,4-тетрагідро-1,4-метанонафталін-5-іл)окси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 20 7-(2-метилфеніл)-3-(3-(((1R,4S)-1,2,3,4-тетрагідро-1,4-метанонафталін-5-ілокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(3-((4-метокси-1-нафтил)окси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(2-метилфеніл)-3-(3-((2-нітро-1-нафтил)окси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(3-((3-гідрокси-1-нафтил)окси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 25 7-(3,5-диметилізоксазол-4-іл)-3-(3-(2,3,6,7-тетрагідро-1Н,5Н-піридо(3,2,1-іj)хінолін-8-ілокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(2-метилфеніл)-3-(3-(2,3,6,7-тетрагідро-1Н,5Н-піридо(3,2,1-іj)хінолін-8-ілокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(2-метилфеніл)-3-(3-((2-нітросо-1-нафтил)окси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 30 3-(3-((5-гідрокси-1-нафтил)окси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(2-метилфеніл)-3-(3-(2,3,4-трифторфенокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(3-(3-хлор-2-метилфенокси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(3-((8-гідрокси-1-нафтил)окси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(3-(3-хлор-2-ціанофенокси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 35 3-(3-(2-бром-3-метилфенокси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(2-метилфеніл)-3-(3-(3-метил-2-вінілфенокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(3-(3-метил-2-нітрофенокси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(3-(2-аміно-3-метилфенокси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(4-(морфолін-4-ілкарбоніл)-2-(трифторметил)феніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 40 3-(3-((6-аміно-1-нафтил)окси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1,2,3,4-тетрагідронафталін-1-ілокси)проп-1-ініл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(3-((6-(акрилоїламіно)-1-нафтил)окси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 45 7-(2-метилфеніл)-3-(3-((6-(пропіоніламіно)-1-нафтил)окси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1,2,3,4-тетрагідронафталін-1-ілокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(3-((6-метокси-1-нафтил)окси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 1-(4-метоксибензил)-7-(2-метилфеніл)-3-(3-(1-нафтилокси)проп-1-ініл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 50 3-(3-((2,3,4,5,6,7,8-гептафтор-1-нафтил)окси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(3-(1-бензотієн-7-ілокси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(3-((4-фтор-1-нафтил)окси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 55 3-(3-((8-фтор-1-нафтил)окси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(3-((5-фтор-1-нафтил)окси)пропіл)-7-(2-метилфеніл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(3-((5-фтор-1-нафтил)окси)пропіл)-7-(1,3,5-триметил-1Н-піразол-4-іл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1-(піридин-4-ілметил)-7-(1,3,5-триметил-1Н-піразол-4-іл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 60

- 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1-(піридин-2-ілметил)-7-(1,3,5-триметил-1Н-піразол-4-іл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1-(піридин-3-ілметил)-7-(1,3,5-триметил-1Н-піразол-4-іл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 5 7-(1-метил-1Н-імідазол-5-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 1-(2-(4-метилпіперазин-1-іл)-2-оксоетил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(1,3,5-триметил-1Н-піразол-4-іл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(4,6-диметилпіримідин-5-іл)-1-(2-морфолін-4-іл-2-оксоетил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 10 1-(2-(4-метилпіперазин-1-іл)етил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(1,3,5-триметил-1Н-піразол-4-іл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 1-(2-морфолін-4-ілметил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(1,3,5-триметил-1Н-піразол-4-іл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 15 1-(2-морфолін-4-іл-2-оксоетил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(1,3,5-триметил-1Н-піразол-4-іл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(2-метилімідазо(1,2-а)піридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(2-(1Н-імідазол-1-іл)-4-метилпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1-(піридин-2-ілметил)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 20 7-(2-етил-4-метилпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1-(піридин-2-ілметил)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(2-етил-4-метилпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1-((1-(піридин-4-ілметил)піридин-4-іл)метил)-1Н-індол-2-карбоксилат;
 7-(2-етил-4-метилпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1-(піридин-4-ілметил)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 25 7-(2-етил-4-метилпіридин-3-іл)-1-(2-морфолін-4-іл-2-оксоетил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(2-етил-4-метилпіридин-3-іл)-1-(2-(4-метилпіперазин-1-іл)-2-оксоетил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(2-етил-4-метилпіридин-3-іл)-1-(2-морфолін-4-ілметил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 30 7-(2-етил-4-метилпіридин-3-іл)-1-(2-(4-метилпіперазин-1-іл)етил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(2-((4-(4-карбоксифеніл)піперазин-1-іл)метил)феніл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 35 3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-7-(2-піперазин-1-ілпіридин-3-іл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(2-(1Н-імідазол-1-іл)-4-метилпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1-(піридин-3-ілметил)-1Н-індол-2-карбонову кислоту;
 7-(2-(1Н-імідазол-1-іл)-4-метилпіридин-3-іл)-1-(2-морфолін-4-іл-2-оксоетил)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1Н-індол-2-карбонову кислоту і
 40 7-(2-(1Н-імідазол-1-іл)-4-метилпіридин-3-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1-(2-оксо-2-піперазин-1-ілметил)-1Н-індол-2-карбонову кислоту.
 3. Фармацевтична композиція, яка містить ексципієнт і терапевтично ефективну кількість сполуки Формули I за п. 1 або 2 або її терапевтично прийнятну сіль.
 4. 7-(3-((4-(4-Ацетилпіперазин-1-іл)фенокси)метил)-1,5-диметил-1Н-піразол-4-іл)-3-(3-(1-нафтилокси)пропіл)-1-(піридин-3-ілметил)-1Н-індол-2-карбонова кислота або її терапевтично прийнятна сіль.
 45 5. Фармацевтична композиція, яка містить ексципієнт і терапевтично ефективну кількість сполуки або її терапевтично прийнятної солі за п. 4.

Комп'ютерна верстка М. Мацело

Державна служба інтелектуальної власності України, вул. Урицького, 45, м. Київ, МСП, 03680, Україна

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