

**УКРАЇНА****(19) UA****(11) 106971****(13) C2****(51) МПК****A01N 43/60** (2006.01)**A61K 31/495** (2006.01)

**ДЕРЖАВНА СЛУЖБА
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІ
УКРАЇНИ**

(12) ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА ВІНАХІД

(21) Номер заявки:	а 2011 07999	(72) Винахідник(и):	Мітчелл Скотт А. (US), Керрі Кевін С. (GB/US), Бломгрен Пітер А. (US), Кропф Джеффри Е. (US), Лі Сеунг Х. (US), Ксу Цзянюнь (CN/US), Стаффорд Дуглас Г. (US), Гардінг Джеймс П. (US), Барбоса Антоніо Дж. мол. (US), Жао Жонгдонг (CA), Армістід Дейвід М. (US)
(22) Дата подання заявки:	07.12.2009	(73) Власник(и):	ГІЛІАД КОННЕКТИКУТ, ІНК., 333 Lakeside Drive, Foster City, CA 94404, United States of America (US)
(24) Дата, з якої є чинними права на винахід:	10.11.2014	(74) Представник:	Дубинський Михайло Ілліч, реєстр. №70
(31) Номер попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції:	61/120,587, 61/140,514, 61/240,979	(56) Перелік документів, взятих до уваги експертизою:	WO 2005085252 A1, 15.09.2005 WO 02060492 A1, 08.08.2002 US 2006183746 A1, 17.08.2006 WO 2005047290 A1, 26.05.2005
(32) Дата подання попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції:	08.12.2008, 23.12.2008, 09.09.2009		
(33) Код держави-учасниці Паризької конвенції, до якої подано попередню заявку:	US, US, US		
(41) Публікація відомостей про заявку:	10.10.2011, Бюл.№ 19		
(46) Публікація відомостей про видачу патенту:	10.11.2014, Бюл.№ 21		
(86) Номер та дата подання міжнародної заявки, поданої відповідно до Договору РСТ	PCT/US2009/006445, 07.12.2009		

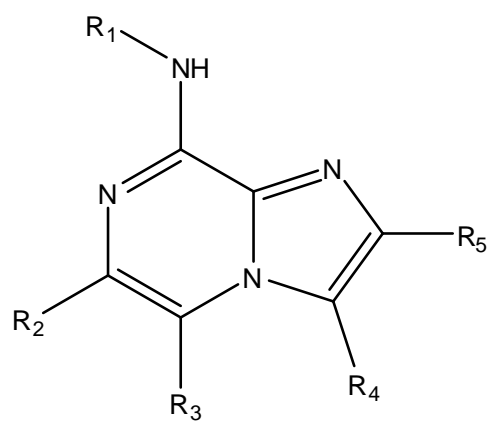
(54) ПОХІДНЕ ІМІДАЗОПІРАЗИНУ ТА ФАРМАЦЕВТИЧНА КОМПОЗИЦІЯ НА ЙОГО ОСНОВІ**(57) Реферат:**

Відповідно до винаходу запропоновані конкретні імідазопіразини та фармацевтичні композиції, що містять їх.

Запропоновані способи лікування пацієнтів, що страждають на певні захворювання та розлади, чутливі до пригнічення активності Syk-кінази, що включають введення зазначеним пацієнтам щонайменше однієї хімічної сполуки у кількості, ефективній для ослаблення ознак або симптомів захворювання або розладу.

Також запропоновані способи визначення наявності або відсутності тирозинкінази Syk у зразку.

UA 106971 C2



Дана заявка заявляє пріоритет згідно з попередньою заявкою на патент США № 61/120,587, поданою 8 грудня 2008 року, попередньою заявкою на патент США № 61/140,514, поданою 23 грудня 2008 року, та попередньою заявкою на патент США № 61/240,979, поданою 9 вересня 2009 року, кожна з яких включена в дану заявку шляхом посилання.

Згідно з даним винаходом запропоновані імідазопіразини, композиції, способи їх одержання та застосування.

Протеїнкінази - найбільше сімейство ферментів людини - включають більше 500 білків. Тирозинкіназа селезінки (Spleen Tyrosine Kinase, Syk) є представником сімейства тирозинкіназ Syk та є регулятором раннього розвитку В-клітин, а також процесів активації, передачі сигналу та виживання зрілих В-клітин.

Syk-кіназа являє собою нерецепторну тирозинкіназу, яка грає ключову роль в опосередкованій імунорецепторами та інтегрінами передачі сигналу в різних типах клітин, включаючи В-клітини, макрофаги, моноцити, тучні клітини, еозинофіли, базофіли, нейтрофіли, дендритні клітини, Т-клітини, природні клітини-кілери, тромбоцити та остеокласти. Імунорецептори, описані в даній заявці, включають класичні імунорецептори та подібні до імунорецепторів молекули. Класичні імунорецептори включають рецептори антигенів В-клітин та Т-клітин, а також різні рецептори імуноглобулінів (Fc-рецептори). Подібні імунорецепторам молекули можуть бути подібні до імунорецепторів за структурою або приймати участь в подібних шляхах передачі сигналу та головним чином залучені у вродженні імунні реакції, включаючи активацію нейтрофілів, розпізнавання природних клітин-кілерів та активність остеокластів. Інтегрини являють собою рецептори на поверхні клітини, які грають ключову роль в регуляції адгезії та активації лейкоцитів в системі як вродженого, так і набутого імунітету.

Зв'язування ліганду приводить до активації імунорецепторів та інтегринів, що викликає активацію сімейства кіназ Src та фосфорилування імунорецепторних тирозин-активуємих мотивів (ITAM), розташованих на поверхні асоційованих з рецепторами трансмембранних адапторних білків з боку цитоплазми. Тирозинкіназа Syk зв'язується з фосфорильованими мотивами ITAM адапторних білків, що приводить до активації та наступного фосфорилування Syk-кінази та активації низхідних сигнальних шляхів.

Тирозинкіназа Syk необхідна для активації В-клітин при передачі сигналу через В-клітинний рецептор (BCR). Syk-кіназа активується при зв'язуванні з фосфорильованим рецептором BCR і, таким чином, ініціює ранні події сигнального каскаду, що слідують за активацією BCR. В-клітинна передача сигналу через BCR може приводити до широкого спектру біологічних відповідей, які у свою чергу залежать від стадії розвитку В-клітин. Величина та тривалість сигналів BCR повинні точно регулюватися. Порушена BCR-опосередкована передача сигналу може викликати нерегульовану активацію В-клітин та/або формування патогенних аутоантитіл, приводячи до розвитку численних аутоімунних та/або запальних захворювань. У мишей з відсутністю Syk-кінази спостерігається порушення процесів дозрівання В-клітин, зниження продукції імуноглобулінів, порушення незалежних від Т-клітин імунних реакцій та виражене ослаблення безперервного току кальцію при стимуляції BCR.

Численні дані підтверджують роль В-клітин та гуморальної імунної системи в патогенезі аутоімунних та/або запальних захворювань. Основані на білках терапевтичні засоби (такі як ритуксан), розроблені для пригнічення В-клітин, являють собою підхід для лікування низки аутоімунних та запальних захворювань. Аутоантитіла та утворювані імунні комплекси, як відомо, грають патогенні ролі у аутоімунному захворюванні та/або запальному захворюванні. Патогенна відповідь на ці антитіла залежить від передачі сигналу через Fc-рецептори, який, у свою чергу, залежить від Syk-кінази. Завдяки участі Syk-кінази у активації В-клітин, разом з залежною від FcR передачею сигналу, інгібітори Syk-кінази можуть використовуватися як інгібітори опосередкованої В-клітинами патогенної активності, включаючи продукцію аутоантитіл. Отже, пригнічення ферментативної активності Syk-кінази в клітинах може розглядатися як підхід до лікування аутоімунного захворювання завдяки впливу Syk-кінази на продукцію аутоантитіл.

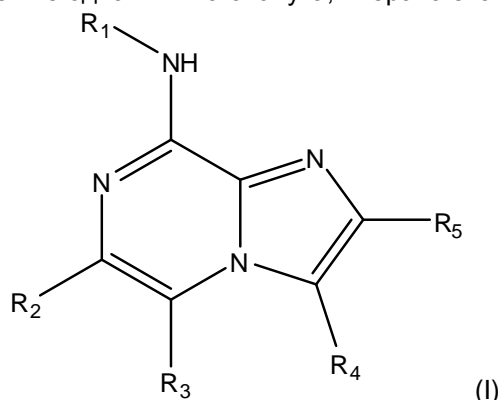
Тирозинкіназа Syk також грає ключову роль в опосередкованій FCεRI дегрануляції тучних клітин та активації еозинофілів. Таким чином, Syk-кіназа залучена в алергійні реакції, включаючи астму. Syk-кіназа зв'язується з фосфорильованим гама-ланцюгом FCεRI через SH2 домени та необхідна для подальшої передачі сигналу. В тучних клітинах з дефіцитом Syk-кінази спостерігаються порушення процесів дегрануляції, секреції арахідонової кислоти та цитокінів. Такі ж результати були отримані при використанні фармакологічних агентів, що пригнічують активність Syk-кінази в тучних клітинах. Обробка антисмисловими олігонуклеотидами до Syk приводить до пригнічення антиген-індукованої інфільтрації еозинофілів та нейтрофілів в моделях астми у тварин. У еозинофілах з дефіцитом Syk-кінази також спостерігається

порушення процесів активації у відповідь на стимуляцію FCεRI. Отже, низькомолекулярні інгібітори Syk-кінази можуть застосовуватися для лікування викликаних алергією запальних захворювань, включаючи астму.

Тирозинкіназа Syk також експресується в тучних клітинах та моноцитах та, як було показано, необхідна для функціонування зазначених клітин. Наприклад, дефіцит тирозинкінази Syk у мишей пов'язаний з порушенням активації тучних клітин, опосередкованій IgE, яке характеризується зниженням рівня ФНО-альфа та вивільненням інших запальних цитокінів. Також було показано, що інгібітори тирозинкінази Syk пригнічують дегрануляцію тучних клітин в клітинних аналізах. Крім того, було показано, що інгібітори Syk-кінази пригнічують викликану антигеном пасивну шкірну анафілаксію, бронхостеноз та набряк бронхів у щурів.

Таким чином, пригнічення активності тирозинкінази Syk може застосовуватися в лікуванні алергійних, аутоімунних та запальних захворювань, таких як: системний червоний вовчак, ревматоїдний артрит, множинний васкуліт, ідіопатична тромбоцитопенічна пурпура (ІТП), міастенія гравіс, алергічний риніт, хронічне обструктивне захворювання легенів (ХОЗЛ), респіраторний дистрес-синдром дорослих (РДСД) та астма. Крім того, було описано, що тирозинкіназа Syk грає важливу роль у процесах ліганд-незалежної тонічної передачі сигналу через В-клітинний рецептор, який, як відомо, є важливим сигналом виживаності В-клітин. Таким чином, пригнічення активності тирозинкінази Syk може застосовуватися для лікування певних типів раку, включаючи В-клітинну лімфому та лейкемію.

Запропонована щонайменше одна хімічна сполука, вибрана зі сполук формули I:



та фармацевтично прийнятних солей зазначених сполук, причому

R₁ являє собою феніл, що містить як замісник одну або дві групи, вибрані з галогену,

гідрокси групи,
карбокси групи,
ціаногрупи,

циклоалкілу, що необов'язково містить як замісник одну або дві групи, вибрані з гідрокси групи, нижчої алкокси групи та нижчого алкілу,

циклоалкілокси групи, що необов'язково містить як замісник одну або дві групи, вибрані з гідрокси групи, нижчої алкокси групи та нижчого алкілу,

гетероциклоалкілу, що необов'язково містить як замісник одну або дві групи, вибрані з ацилу, галогену, необов'язково заміщеної аміно групи, гідрокси групи, нижчої алкокси групи, нижчого алкілу, нижчого алкілу, що містить як замісник гідрокси групу, нижчого алкілу, що містить як замісник нижчу алкокси групу, нижчого алкілу, що містить як замісник одну, дві або три галогенові групи, необов'язково заміщеної аміно групи, необов'язково заміщеного гетероциклоалкілу та оксо групи,

гетероциклоалкілокси групи, що необов'язково містить як замісник одну або дві групи, вибрані з галогену, необов'язково заміщеної аміно групи, гідрокси групи, нижчої алкокси групи, нижчого алкілу, нижчого алкілу, що містить як замісник гідрокси групу, нижчого алкілу, що містить як замісник нижчу алкокси групу, нижчого алкілу, що містить як замісник одну, дві або три галогенові групи, необов'язково заміщеної аміно групи, необов'язково заміщеного гетероциклоалкілу та оксо групи,

гетероарилу,

аміно групи, що необов'язково містить як замісник одну або дві групи, вибрані з нижчого алкілу, нижчого алкілу, що містить як замісник галоген, нижчого алкілу, що містить як замісник гідрокси групу, та нижчого алкілу, що містить як замісник нижчу алкокси групу,

-C(O)NR₆R₇, де R₆ та R₇ незалежно вибрані з водню, нижчого алкілу, нижчого алкілу, що

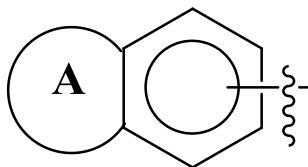
містить як замісник гідрокси групу, нижчого алкілу, що містить як замісник необов'язково заміщену аміно групу, циклоалкілу, арилу, гетероарилу та гетероциклоалкілу, або де R_6 та R_7 разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, утворюють 3 - 7-членне гетероциклоалکیلне кільце, що необов'язково містить як замісник одну або дві групи, вибрані з гідрокси групи, нижчого алкілу та нижчого алкілу, що містить як замісник гідрокси групу,

$-S(O)_2NR_6R_7$, де R_6 та R_7 незалежно вибрані з водню, нижчого алкілу, нижчого алкілу, що містить як замісник гідрокси групу, нижчого алкілу, що містить як замісник необов'язково заміщену аміно групу, циклоалкілу, арилу, гетероарилу та гетероциклоалкілу, або де R_6 та R_7 разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, утворюють 3 - 7-членне гетероциклоалکیلне кільце, що необов'язково містить як замісник одну або дві групи, вибрані з гідрокси групи, нижчого алкілу та нижчого алкілу, що містить як замісник гідрокси групу, за умови, що щонайменше один з R_6 та R_7 не є воднем,

нижчої алкокси групи, що необов'язково містить як замісник одну або дві групи, вибрані з гідрокси групи, нижчої алкокси групи, необов'язково заміщеного амінокарбонілу, необов'язково заміщеної аміно групи, карбокси групи, амінокарбонілу та гетероциклоалкілу,

гетероариллокси групи, та

нижчого алкілу, що необов'язково містить як замісник одну або дві групи, вибрані з гідрокси групи, нижчої алкокси групи, галогену, трифторметилу, необов'язково заміщеної аміно групи та гетероциклоалкілу, що необов'язково містить як замісник нижчий алкіл; або



R_1 являє собою , де A вибраний з арильних, циклоалکیلних та гетероциклоалکیلних груп, кожна з яких містить від 5 до 7 атомів в кільці, включаючи атоми, спільні з 6-членним ароматичним кільцем, та кожна з яких необов'язково містить замісники;

R_2 вибраний з необов'язково заміщеного арилу та необов'язково заміщеного гетероарилу;

R_3 вибраний з водню, нижчого алкілу та галогену;

R_4 вибраний з водню та нижчого алкілу; та

R_5 являє собою водень, за умови, що

якщо R_3 та R_4 являють собою водень, та R_1 являє собою 3-метокси-4-(морфолін-4-ілкарбоніл)феніл, 4-(морфолін-4-іл)феніл, 3,4-діетоксифеніл, 3-фтор-4-метоксифеніл, 4-(4-етилпіперазин-1-іл)феніл, 4-(3-оксопіперазин-1-іл)феніл, 4-(морфолін-4-іл)феніл, 3-метокси-4-(морфолін-4-іл)феніл, 3-метокси-4-метилфеніл, 4-метокси-3-метилфеніл, 2-(диметиламіно)етокси-3-метоксифеніл, 3-етокси-4-метоксифеніл, або 4-етокси-3-метоксифеніл, то R_2 не є фенілом, що містить як замісник $-(CO)NHR_6$, де R_6 являє собою необов'язково заміщений арил;

якщо R_3 та R_4 являють собою водень, та R_1 являє собою 3,4-диметоксифеніл, тоді R_2 не є фенілом, що містить як замісник

$-(CO)NR_8R_9$, де R_8 та R_9 разом утворюють необов'язково заміщений гетероциклоалкіл або необов'язково заміщений гетероарил, або де R_8 являє собою водень, метил або етил, та R_9 являє собою водень, необов'язково заміщений арил, необов'язково заміщений циклоалкіл, необов'язково заміщений гетероциклоалкіл, необов'язково заміщений алкіл або необов'язково заміщений гетероарил, причому зазначений феніл також необов'язково містить як замісник групу, вибрану з метилу, метокси групи та галогену, або

$-(SO_2)NHR_{10}$, де R_{10} являє собою необов'язково заміщений феніл;

якщо R_3 та R_4 являють собою водень, та R_1 являє собою 4-(морфолін-4-іл)феніл, тоді R_2 не є піридинілом, 2-фторфенілом, бензо[d][1,3]діоксолілом, 2-метоксифенілом, 2,6-диметоксифенілом, 3-ацетамідофенілом, 3-карбоксифенілом, 2-(гідроксиметил)фенілом, фуранілом або 3-(гідроксиетилкарбамоїл)фенілом;

якщо R_3 та R_4 являють собою водень, та R_1 являє собою хлорфеніл, тоді R_2 не є фенілом, що містить як замісник піперидин-1-іл-карбоніл або $NH(CO)NHR_{12}$, де R_{12} являє собою феніл, що містить як замісник трифторметил або один або більше галогенів;

якщо R_3 та R_4 являють собою водень, та R_1 являє собою феніл, що містить як замісник необов'язково заміщений піперазиніл, тоді R_2 не є 3-амінофенілом;

якщо R_3 та R_4 являють собою водень, та R_1 являє собою 4-хлорфеніл, тоді R_2 не є 4-карбоксифенілом, 3-(2-(диметиламіно)етилкарбамоїл)фенілом або 4-(2-(диметиламіно)етилкарбамоїл)фенілом; та

якщо R_3 та R_4 являють собою водень, та R_1 являє собою 4-(2-гідрокси-етил)феніл або 4-

(гідроксиетил)феніл, то R_2 не є 2-метоксифенілом або 2-фторфенілом;

якщо R_3 та R_4 являють собою водень, та R_1 являє собою 4-[(4-етилпіперазин-1-іл)метил]феніл або 4-(2-гідроксипропан-2-іл)феніл, то R_2 не є фенілом, що містить як замісник -

(CO)NR₈R₉, де R_8 являє собою водень, та R_9 являє собою водень, метил або необов'язково заміщений арил, причому зазначений феніл необов'язково додатково містить як замісник групу, що являє собою метил;

якщо R_3 та R_4 являють собою водень, та R_2 являє собою 4-карбамоїлфеніл, тоді R_1 не є 4-(гідроксиметил)фенілом, 3-(1-гідроксиетил)фенілом, 4-(1H-імідазол-2-іл)-3-метилфенілом, 3-

метокси-4-(піперидин-4-ілокси)фенілом, 3-метокси-4-(2-метоксиетокси)фенілом, 4-[2-(диметиламіно)етокси]-3-метоксифенілом, 4-(2-гідроксиетокси)-3-метоксифенілом, 3-метокси-4-(пропан-2-ілокси)фенілом, 3-метокси-4-пропоксифенілом, 4-(пропілкарбамоїл)фенілом, 4-

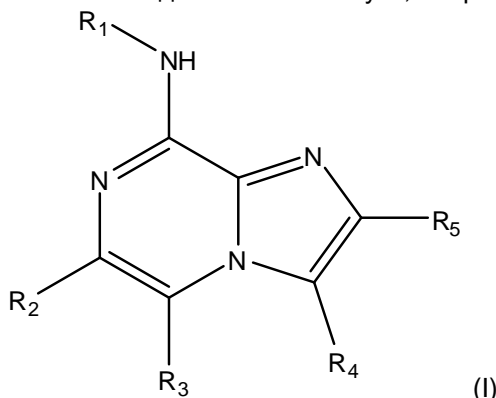
етокси-3-метоксифенілом, 4-(1H-імідазол-2-іл)фенілом, 3-метокси-4-(1H-піразол-5-іл)фенілом, якщо R_3 та R_4 являють собою водень, та R_2 являє собою піридин-3-іл, що містить як замісник карбамоїл, тоді R_1 не є 3,4-диметоксифенілом,

якщо R_3 та R_4 являють собою водень, та R_1 являє собою 4-етокси-3-метоксифеніл, тоді R_2

не є фенілом, що містить як замісник метил, та що додатково містить як замісник -(CO)NR₈R₉, де R_8 являє собою водень, та R_9 являє собою 4-(метилкарбамоїл)феніл, та

при цьому додатково R_2 не є фенілом, що містить як замісник -NHC(O)R₁₁, де R_{11} являє собою необов'язково заміщений арил.

Також запропонована щонайменше одна хімічна сполука, вибрана зі сполук Формули I:



та фармацевтично прийнятних солей зазначених сполук, причому

R_1 являє собою феніл, що містить як замісник одну або дві групи, вибрані з

галогену,

гідрокси групи,

карбокси групи,

циклоалкілу, що необов'язково містить як замісник одну або дві групи, вибрані з гідрокси групи, нижчої алкокси групи та нижчого алкілу,

гетероциклоалкілу, що необов'язково містить як замісник одну або дві групи, вибрані з гідрокси групи, нижчої алкокси групи, нижчого алкілу, нижчого алкілу, що містить як замісник гідрокси групу, необов'язково заміщеної аміно групи та оксо групи,

гетероарилу,

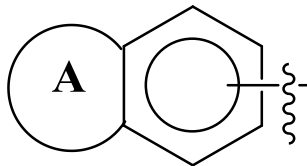
аміно групи, що необов'язково містить як замісник одну або дві групи, вибрані з нижчого алкілу, нижчого алкілу, що містить як замісник галоген, нижчого алкілу, що містить як замісник гідрокси групу, та нижчого алкілу, що містить як замісник нижчу алкокси групу,

-C(O)NR₆R₇, де R_6 та R_7 незалежно вибрані з водню, нижчого алкілу, нижчого алкілу, що містить як замісник гідрокси групу, нижчого алкілу, що містить як замісник необов'язково заміщену аміно групу, циклоалкілу, арилу, гетероарилу та гетероциклоалкілу, або де R_6 та R_7 разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, утворюють 3 - 7-членне гетероциклоалکیلне кільце, що необов'язково містить як замісник одну або дві групи, вибрані з гідрокси групи, нижчого алкілу та нижчого алкілу, що містить як замісник гідрокси групу,

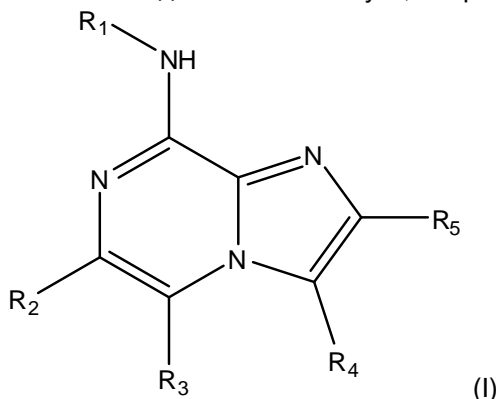
-S(O)₂NR₆R₇, де R_6 та R_7 незалежно вибрані з водню, нижчого алкілу, нижчого алкілу, що містить як замісник гідрокси групу, нижчого алкілу, що містить як замісник необов'язково заміщену аміно групу, циклоалкілу, арилу, гетероарилу та гетероциклоалкілу, або де R_6 та R_7 разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, утворюють 3 - 7-членне гетероциклоалکیلне кільце, що необов'язково містить як замісник одну або дві групи, вибрані з гідрокси групи, нижчого алкілу та нижчого алкілу, що містить як замісник гідрокси групу, за умови, що щонайменше один з R_6 та R_7 не є воднем,

нижчої алкокси групи, що необов'язково містить як замісник одну або дві групи, вибрані з гідрокси групи, нижчої алкокси групи, необов'язково заміщеної аміно групи, карбокси групи, амінокарбонілу та гетероциклоалкілу, гетероарилокси групи, та

- 5 нижчого алкілу, що необов'язково містить як замісник одну або дві групи, вибрані з гідрокси групи, нижчої алкокси групи, галогену, трифторметилу, необов'язково заміщеної аміно групи та гетероциклоалкілу, що необов'язково містить як замісник нижчий алкіл; або



- R_1 являє собою , де A вибраний з арильної, циклоалкільної та гетероциклоалкільної груп, кожна з яких містить від 5 до 7 атомів в кільці, включаючи атоми, спільні з 6-членним ароматичним кільцем та кожна з яких необов'язково містить замісники;
- R_2 вибраний з необов'язково заміщеного арилу та необов'язково заміщеного гетероарилу;
- R_3 являє собою водень;
- R_4 являє собою водень; та
- R_5 являє собою водень,
- 15 за умови, що якщо R_1 являє собою 3-метокси-4-метилфеніл, 4-метокси-3-метилфеніл, 2-(диметиламіно)етокси-3-метоксифеніл, 3-етокси-4-метоксифеніл або 4-етокси-3-метоксифеніл, тоді R_2 не є фенілом, що містить як замісник $-(CO)NHR_6$, де R_6 являє собою необов'язково заміщений арил;
- 20 якщо R_1 являє собою 3,4-диметоксифеніл, тоді R_2 не є фенілом, що містить як замісник $-(CO)NR_8R_9$, де R_8 та R_9 разом утворюють необов'язково заміщений гетероциклоалкіл або необов'язково заміщений гетероарил, або де R_8 являє собою водень, та R_9 являє собою необов'язково заміщений арил, необов'язково заміщений циклоалкіл, необов'язково заміщений гетероциклоалкіл, необов'язково заміщений алкіл або необов'язково заміщений гетероарил, або
- 25 $-(SO_2)NHR_{10}$, де R_{10} являє собою необов'язково заміщений феніл;
- якщо R_1 являє собою 4-(морфолін-4-іл)феніл, тоді R_2 не є піридинілом, 2-фторфенілом, бензо[d][1,3]діоксолілом, 2-метоксифенілом, 2,6-диметоксифенілом, 3-ацетамідофенілом, 3-карбоксифенілом, 2-(гідроксиметил)фенілом, фуранілом або 3-(гідроксиетилкарбамоїл)фенілом;
- 30 якщо R_1 являє собою хлорфеніл, тоді R_2 не є фенілом, що містить як замісник піперидин-1-іл-карбоніл або $NH(CO)NR_{12}$, де R_{12} являє собою феніл, що містить як замісник трифторметил або один або більше галогенів;
- якщо R_1 являє собою необов'язково заміщений піперазиніл, тоді R_2 не є 3-амінофенілом;
- якщо R_1 являє собою 4-хлорфеніл, тоді R_2 не є 4-карбоксифенілом, 3-(2-(диметиламіно)етилкарбамоїл)фенілом або 4-(2-(диметиламіно)-етилкарбамоїл)фенілом; та
- 35 якщо R_1 являє собою 4-(2-гідрокси-етил)феніл або 4-(гідроксиетил)феніл, тоді R_2 не є 2-метоксифенілом або 2-фторфенілом; та при цьому додатково R_2 не є фенілом, що містить як замісник $-NHC(O)R_{11}$, де R_{11} являє собою необов'язково заміщений арил.
- 40 Також запропонована щонайменше одна хімічна сполука, вибрана зі сполук Формули I:



та фармацевтично прийнятних солей зазначених сполук, причому R_1 являє собою феніл, що містить як замісник одну або дві групи, вибрані з галогену,

гідрокси групи,
циклоалкілу, що необов'язково містить як замісник одну або дві групи, вибрані з гідрокси групи, нижчої алкокси групи та нижчого алкілу,
гетероциклоалкілу, що необов'язково містить як замісник одну або дві групи, вибрані з
5 гідрокси групи, нижчої алкокси групи та нижчого алкілу,
аміно групи, що необов'язково містить як замісник одну або дві групи, вибрані з нижчого алкілу, нижчого алкілу, що містить як замісник галоген, нижчого алкілу, що містить як замісник гідрокси групу, та нижчого алкілу, що містить як замісник нижчу алкокси групу,
нижчої алкокси групи, що необов'язково містить як замісник одну або дві групи, вибрані з
10 гідрокси групи, нижчої алкокси групи та необов'язково заміщеної аміно групи, та
нижчого алкілу, що необов'язково містить як замісник одну або дві групи, вибрані з гідрокси групи, нижчої алкокси групи, галогену, трифторметилу та необов'язково заміщеної аміно групи ;
або



R_1 являє собою , де A вибраний з арильної, циклоалкільної та
15 гетероциклоалкільної груп, кожна з яких містить від 5 до 7 атомів в кільці, включаючи атоми, спільні з 6-членним ароматичним кільцем, та кожна з яких необов'язково містить замісники;

R_2 вибраний з необов'язково заміщеного арилу та необов'язково заміщеного гетероарилу;

R_3 являє собою водень;

R_4 являє собою водень; та

20 R_5 являє собою водень,

за умови, що

якщо R_1 являє собою 3-метокси-4-метилфеніл, 4-метокси-3-метилфеніл, 2-(диметиламіно)етокси-3-метоксифеніл, 3-етокси-4-метоксифеніл, або 4-етокси-3-метоксифеніл, тоді R_2 не є фенілом, що містить як замісник $-(CO)NHR_6$, де R_6 являє собою необов'язково заміщений арил;

якщо R_1 являє собою 3,4-диметоксифеніл, тоді R_2 не є фенілом, що містить як замісник $-(CO)NR_8R_9$, де R_8 та R_9 разом утворюють необов'язково заміщений гетероциклоалкіл або необов'язково заміщений гетероарил, або де R_8 являє собою водень, та R_9 являє собою необов'язково заміщений арил, необов'язково заміщений циклоалкіл, необов'язково заміщений гетероциклоалкіл, необов'язково заміщений алкіл або необов'язково заміщений гетероарил, або
30 $-(SO_2)NHR_{10}$, де R_{10} являє собою необов'язково заміщений феніл;

якщо R_1 являє собою 4-(морфолін-4-іл)феніл, тоді R_2 не є піридинілом, 2-фторфенілом, бензо[d][1,3]діоксолілом, 2-метоксифенілом, 2,6-диметоксифенілом, 3-ацетамідофенілом, 3-карбоксифенілом, 2-(гідроксиметил)фенілом, фуранілом або 3-(гідроксиетилкарбамоїл)фенілом;

якщо R_1 являє собою хлорфеніл, тоді R_2 не є фенілом, що містить як замісник піперидин-1-іл-карбоніл або $NH(CO)NR_{12}$, де R_{12} являє собою феніл, що містить як замісник трифторметил або один або більше галогенів;

якщо R_1 являє собою необов'язково заміщений піперазиніл, тоді R_2 не є 3-амінофенілом;

якщо R_1 являє собою 4-хлорфеніл, тоді R_2 не є 4-карбоксифенілом, 3-(2-(диметиламіно)-етилкарбамоїл)фенілом або 4-(2-(диметиламіно)етилкарбамоїл)фенілом; та

якщо R_1 являє собою 4-(2-гідрокси-етил)феніл або 4-(гідроксиетил)феніл, тоді R_2 не є 2-метоксифенілом або 2-фторфенілом; та

при цьому додатково R_2 не є фенілом, що містить як замісник $-NHC(O)R_{11}$, де R_{11} являє собою необов'язково заміщений арил.

Також запропонована фармацевтична композиція, що містить щонайменше одну хімічну сполуку, описану в даній заявці, разом щонайменше з одним фармацевтично прийнятним наповнювачем, вибраним з носіїв, ад'ювантів та допоміжних речовин.

Також запропонований спосіб лікування пацієнта, що страждає на захворювання, чутливе до пригнічення активності тирозинкінази Syk, що включає введення пацієнту ефективної кількості щонайменше однієї хімічної сполуки, описаної в даній заявці.

Також запропонований спосіб лікування пацієнта, що страждає на захворювання, вибране з раку, аутоімунних захворювань, запальних захворювань, гострих запальних реакцій та алергічних захворювань, що включає введення пацієнту ефективної кількості щонайменше однієї хімічної сполуки, описаної в даній заявці.

Також запропонований спосіб лікування пацієнта, що страждає на полікістозну хворобу

нирок, що включає введення пацієнту ефективної кількості щонайменше однієї хімічної сполуки, описаної в даній заявці.

Також запропонований спосіб підвищення чутливості ракових клітин до хіміотерапії, що включає введення пацієнту, якого піддають хіміотерапії за допомогою хіміотерапевтичного агента, кількості щонайменше однієї описаної в даній заявці хімічної сполуки, достатньої для підвищення чутливості ракових клітин до хіміотерапевтичного агента.

Також запропонований спосіб пригнічення гідролізу АТФ, що включає взаємодію клітин, що експресують тирозинкіназу Syk, щонайменше з однією хімічною сполукою, описаною в даній заявці, у кількості, достатній для зниження рівня гідролізу АТФ *in vitro*, що піддається визначенню.

Також запропонований спосіб визначення наявності тирозинкінази Syk у зразку, що включає взаємодію зразку щонайменше з однією хімічною сполукою, описаною в даній заявці, в умовах, що дозволяють визначення активності Syk-кінази та визначення рівня активності Syk-кінази у зразку, та визначення на основі отриманих даних наявності або відсутності тирозинкінази Syk у зразку.

Також запропонований спосіб пригнічення активності В-клітин, що включає взаємодію клітин, які експресують тирозинкіназу Syk, щонайменше з однією з описаних в даній заявці хімічною сполукою у кількості, достатній для зниження активності В-клітин *in vitro*, що піддається визначенню.

В даній заявці в тих випадках, коли яка-небудь змінна зустрічається більше одного разу в хімічній формулі, визначення зазначеної змінної в кожному конкретному випадку не залежить від її визначення у будь-якому іншому випадку. У відповідності зі звичайним застосуванням однини та множини в патентній літературі, іменник, наприклад, «кіназа», що використовується у однині, може означати одну кіназу або більше.

Використовувані в даній заявці наступні слова, фрази та символи в цілому мають зазначені нижче значення, якщо інше не слідує з контексту, у якому вони використовуються. Наступні аббревіатури та терміни приймають зазначені значення по всій заявці:

Дефіс («-»), розташований не між двома літерами або символами, використовується для позначення точки приєднання замісника. Наприклад, $-\text{CONH}_2$ приєднується через атом вуглецю.

Під терміном «необов'язково» або «необов'язковий» мають на увазі, що наступна описана подія або умова може реалізовуватися або не реалізовуватися, та що опис включає приклади, згідно з якими подія або умова реалізується, та приклади, згідно з якими подія або умова не реалізується. Наприклад, термін «необов'язково заміщений алкіл» включає терміни «алкіл» та «заміщений алкіл» згідно з наведеним нижче визначенням. Спеціалістам в даній галузі зрозуміло, що для будь-якої групи, що містить один або більше замісників, не розглядаються варіанти заміни або схеми заміщення, які є стерично неможливими, синтетично нездійсненними та/або по суті нестабільними.

Термін «алкіл» включає лінійний та розгалужений вуглеводневий ланцюг, що містить зазначену кількість атомів вуглецю, звичайно від 1 до 20 атомів вуглецю, наприклад, від 1 до 8 атомів вуглецю, наприклад, від 1 до 6 атомів вуглецю. Наприклад, C_1 - C_6 -алкіл включає алкіл як з лінійним, так і з розгалуженим ланцюгом, що містить від 1 до 6 атомів вуглецю. Приклади алкільних груп включають метил, етил, пропіл, ізопропіл, н-бутил, втор-бутил, трет-бутил, пентил, 2-пентил, ізопентил, неопентил, гексил, 2-гексил, 3-гексил, 3-метилпентил тощо. Алкілен відноситься до іншого підкласу алкілу та включає ті ж залишки, що і алкіл, але з двома точками приєднання. Алкіленові групи звичайно містять від 2 до 20 атомів вуглецю, наприклад, від 2 до 8 атомів вуглецю, наприклад, від 2 до 6 атомів вуглецю. Наприклад, C_0 -алкілен позначає ковалентний зв'язок, та C_1 -алкілен позначає метиленову групу. При позначенні алкільного залишку, що містить конкретну кількість атомів вуглецю, передбачається, що він включає всі геометричні ізомери, що мають зазначену кількість атомів вуглецю, таким чином, наприклад, термін «бутил» включає н-бутил, втор-бутил, ізобутил та трет-бутил; термін «пропіл» включає н-пропіл та ізопропіл. Термін «нижчий алкіл» відноситься до алкільних груп, що містять від 1 до 4 атомів вуглецю.

Термін «алкеніл» відноситься до ненасиченої розгалуженої або лінійної алкільної групи, що містить щонайменше один подвійний вуглець-вуглецевий зв'язок, що утворився у результаті видалення одного атому водню від кожного із сусідніх атомів вуглецю вихідного алкілу. Група може мати цис- або транс- конфігурацію подвійного зв'язку (зв'язків). Типові алкенільні групи включають (але не обмежуються зазначеними) етеніл; пропеніли, такі як проп-1-ен-1-іл, проп-1-ен-2-іл, проп-2-ен-1-іл (аліл), проп-2-ен-2-іл; бутеніли, такі як бут-1-ен-1-іл, бут-1-ен-2-іл, 2-метил-проп-1-ен-1-іл, бут-2-ен-1-іл, бут-2-ен-1-іл, бут-2-ен-2-іл, бута-1,3-діен-1-іл, бута-1,3-діен-2-іл; та т.п. Відповідно до деяких варіантів реалізації винаходу алкенільна група містить від 2 до

20 атомів вуглецю, згідно з іншими варіантами реалізації винаходу алкенільна група містить від 2 до 6 атомів вуглецю.

Термін «циклоалкіл» відноситься до групи, що являє собою насичене вуглеводневе кільце, що містить певну кількість атомів вуглецю, звичайно від 3 до 7 атомів вуглецю. Приклади циклоалкільних груп включають циклопропіл, циклобутил, цикlopентил, та циклогексил, а також місткові та внутрішні насичені кільцеві групи, такі як норборнан.

Термін «алкокси» відноситься до алкільної групи, що містить зазначену кількість атомів вуглецю та приєднана через кисневий місток, такий як, наприклад, метокси, етокси, пропокси, ізопропокси, н-бутокси, втор-бутокси, трет-бутокси, пентокси, 2-пентилокси групи, ізопентокси, неопентокси, гексокси, 2-гексокси, 3-гексокси, 3-метилпентокси, тощо. Алкоксигрупи звичайно містять від 1 до 6 атомів вуглецю та приєднуються через кисневий місток. Термін «нижча алкокси група» відноситься до алкоксигрупи, що містить від 1 до 4 атомів вуглецю.

Термін «амінокарбоніл» відноситься до групи формули $-(C=O)NR_aR_b$, де R_a та R_b незалежно вибрані з водню та описаних нижче можливих замісників для «заміщеної аміно групи».

Термін «ацил» відноситься до наступних груп: (алкіл)-C(O)-; (циклоалкіл)-C(O)-; (арил)-C(O)-; (гетероарил)-C(O)- та (гетероциклоалкіл)-C(O)-, причому зазначені групи приєднуються до вихідної структури через карбонільну функціональну групу, та причому алкіл, циклоалкіл, арил, гетероарил та гетероциклоалкіл відповідають наведеному в даній заявці визначенню. Ацильні групи містять зазначену кількість атомів вуглецю, причому вуглець кетогрупи включений в пронумеровані атоми вуглецю. Наприклад, C₂-ацильна група являє собою ацетильну групу формули $CH_3(C=O)-$.

Термін «алкоксикарбоніл» відноситься до групи складного ефіру формули (алкокси)C(O)-, яка приєднується через вуглець карбонілу, причому алкоксигрупа містить зазначену кількість атомів вуглецю. Таким чином, C₁-C₆-алкоксикарбонільна група являє собою алкоксигрупу, що містить від 1 до 6 атомів вуглецю та приєднану через свій атом кисню до карбонільного мостика.

Термін «аміно» відноситься до групи -NH₂.

Термін «арил» включає:

5- та 6-членні карбоциклічні ароматичні кільця, наприклад, бензол;
біциклічні системи кілець, у яких щонайменше одне кільце є карбоциклічним та ароматичним, наприклад, нафталін, індан та тетралін; та
трициклічні системи кілець, у яких щонайменше одне кільце є карбоциклічним та ароматичним, наприклад, флуорен.

Наприклад, арил включає 5- та 6-членні карбоциклічні ароматичні кільця, конденсовані з 5 - 7-членним гетероциклоалкільним кільцем, що містить один або більше гетероатомів, вибраних з N, O та S. Для таких конденсованих, біциклічних кільцевих систем, де тільки одне з кілець являє собою карбоциклічне ароматичне кільце, точка приєднання може знаходитися на карбоциклічному ароматичному кільці або гетероциклоалкільному кільці. Бівалентні радикали, що утворені з похідних заміщеного бензолу та мають вільні валентності на атомах кілець, називаються заміщеними радикалами фенілену. Назви бівалентних радикалів, утворених з одновалентних поліциклічних вуглеводневих радикалів, назви яких закінчуються на «-іл», в результаті видалення одного атому водню від атому вуглецю з вільною валентністю, утворюються шляхом додавання суфіксу «-іден» до назви відповідного одновалентного радикалу, наприклад, нафтильна група з двома точками приєднання називається «нафтиліденом». Однак термін «арил» не включає або не перекривається яким-небудь чином з терміном «гетероарил» згідно з наведеним нижче визначенням. Отже, якщо одне або більше карбоциклічних ароматичних кілець сконденсовані з гетероциклоалкільним ароматичним кільцем, утворена в результаті система кілець являє собою гетероарил, а не арил, згідно з наведеним в даній заявці визначенням.

Термін «арилокси» відноситься до групи -O-арил.

Термін «галоген» включає фтор, хлор, бром та йод, та термін «галогенований» означає фтористий, хлористий, бромистий та йодистий.

Термін «гетероарил» включає:

5 - 7-членні ароматичні моноциклічні кільця, що містять один або більше, наприклад, від 1 до 4, або Відповідно до деяких варіантів реалізації винаходу від 1 до 3, гетероатомів, вибраних з N, O та S, причому решта атомів кільця являють собою атоми вуглецю; та

біциклічні гетероциклоалкільні кільця, що містять один або більше, наприклад, від 1 до 4, або Відповідно до деяких варіантів реалізації винаходу від 1 до 3, гетероатомів, вибраних з N, O та S, причому решта атомів кільця являють собою атоми вуглецю, та причому щонайменше один гетероатом присутній в ароматичному кільці.

Наприклад, гетероарил включає 5 - 7-членне гетероциклоалкільне ароматичне кільце, конденсоване з 5 - 7-членним циклоалкілним кільцем. Для такої конденсованої біциклічної гетероарильної кільцевої системи, де тільки одне з кілець містить один або більше гетероатомів, точка приєднання може бути на гетероароматичному кільці або циклоалкільному кільці. Коли загальне число атомів S та O в гетероарильній групі перевищує 1, ці гетероатоми не є сусідніми атомами. Відповідно до деяких варіантів реалізації винаходу загальне число атомів S та O в гетероарильній групі становить не більше, ніж 2. Відповідно до деяких варіантів реалізації винаходу загальне число атомів S та O в ароматичному гетероциклі становить не більше, ніж 1. Приклади гетероарильних груп включають (але не обмежуються зазначеними) (при нумерації атомів від точки приєднання, що відповідає пріоритетному положенню 1) 2-піридил, 3-піридил, 4-піридил, 2,3-піразиніл, 3,4-піразиніл, 2,4-піримідиніл, 3,5-піримідиніл, 2,3-піразолініл, 2,4-імідазолініл, ізоксазолініл, оксазолініл, тiazолініл, тиадіазолініл, тетразоліл, тісніл, бензотіофеніл, фураніл, бензофураніл, бензоімідазолініл, індолініл, піридинініл, триазоліл, хінолініл, піразоліл та 5,6,7,8-тетрагідроізохінолін. Назви бівалентних радикалів, що утворюються з одновалентних гетероарильних радикалів, назви яких закінчуються на «-іл», в результаті видалення одного атому водню від атому з вільним валентним зв'язком, утворюються шляхом додавання суфіксу «-іден» до назви відповідного одновалентного радикалу, наприклад, піридинільна група з двома точками приєднання називається піридиліден. Термін «гетероарил» не включає або не перекривається з терміном «арил» згідно з наведеним вище визначенням.

Заміщений гетероарил також включає кільцеві системи, що містять як замісник один або більше оксидних ($-O^-$) замісників, таких як піридиніл-N-оксиди.

Термін «гетероарилокси» відноситься до групи -O-гетероарил.

Термін «гетероциклоалкіл» відноситься до єдиного аліфатичного кільця, що звичайно містить від 3 до 7 атомів, що включає щонайменше 2 атоми вуглецю на додаток до 1-3 гетероатомів, незалежно вибраних з кисню, сірки та азоту, а також до комбінацій, що містять щонайменше один з вищезазначених гетероатомів. Підходящі гетероциклоалкільні групи включають, наприклад, (при нумерації атомів від точки приєднання, що відповідає пріоритетному положенню 1) 2-піролініл, 2,4-імідазолідиніл, 2,3-піразолідиніл, 2-піперидил, 3-піперидил, 4-піперидил та 2,5-піперзиніл. Термін також включає морфолінільні групи, такі як 2-морфолініл та 3-морфолініл (при нумерації атомів від атому кисню, що відповідає пріоритетному положенню 1). Термін «заміщений гетероциклоалкіл» також включає системи кілець, що містять як замісник одну або більше оксогруп, такі як піперидиніл-N-оксид, морфолініл-N-оксид, 1-оксо-1-тіоморфолініл та 1,1-діоксо-1-тіоморфолініл.

Термін «гетероциклоалкіл» також включає біциклічні кільцеві системи, причому жодне з кілець не є ароматичним, та причому щонайменше одне з кілець у біциклічній системі містить щонайменше 2 атоми вуглецю на додаток до 1-3 гетероатомів, незалежно вибраних з кисню, сірки та азоту.

Термін «гетероциклоалкілокси» відноситься до групи -O-гетероциклоалкіл.

Термін «нітро» відноситься до групи $-NO_2$.

Термін «фосфоно» відноситься до групи $-PO_3H_2$.

Термін «тіокарбоніл» відноситься до групи $-C(=O)SH$.

Термін «необов'язково заміщений тіокарбоніл» включає наступні групи: - $C(=O)S$ -(необов'язково заміщений (C_1-C_6)алкіл), $-C(=O)S$ -(необов'язково заміщений арил), $-C(=O)S$ -(необов'язково заміщений гетероарил) та $C(=O)S$ -(необов'язково заміщений гетероциклоалкіл).

Термін «сульфаніл» включає наступні групи: $-S$ -(необов'язково заміщений (C_1-C_6)алкіл), $-S$ -(необов'язково заміщений арил), $-S$ -(необов'язково заміщений гетероарил) та $-S$ -(необов'язково заміщений гетероциклоалкіл). Отже, термін «сульфаніл» відноситься до C_1-C_6 -алкілсульфанілу.

Термін «сульфініл» включає наступні групи: $-S(O)-H$, $-S(O)$ -(необов'язково заміщений (C_1-C_6)алкіл), $-S(O)$ -(необов'язково заміщений арил), $-S(O)$ -(необов'язково заміщений гетероарил), $-S(O)$ -(необов'язково заміщений гетероциклоалкіл) та $-S(O)$ -(необов'язково заміщена аміно група).

Термін «сульфоніл» включає наступні групи: $-S(O_2)-H$, $-S(O_2)$ -(необов'язково заміщений (C_1-C_6)алкіл), $-S(O_2)$ -(необов'язково заміщений арил), $-S(O_2)$ -(необов'язково заміщений гетероарил), $-S(O_2)$ -(необов'язково заміщений гетероциклоалкіл), $-S(O_2)$ -(необов'язково заміщений алкокси), $-S(O_2)$ -(необов'язково заміщений арилокси), $-S(O_2)$ -(необов'язково заміщений гетероарилокси), $-S(O_2)$ -(необов'язково заміщений гетероциклокси) та $-S(O_2)$ -(необов'язково заміщена аміно група).

Термін «заміщений» при використанні в даній заявці означає, що будь-який один або більше атомів водню при позначеному атомі або групі заміщений замісником, вибраним з зазначеної групи, за умови, що нормальна валентність позначеного атому не перевищується. Якщо замісник являє собою оксогрупу (тобто $=O$), тоді заміщуються 2 водні при позначеному атомі.

Комбінації замісників та/або перемінних допустимі тільки в тому випадку, якщо такі комбінації приводять до утворення стабільних сполук або проміжних сполук, використовуваних в процесах синтезу. Стабільна сполука або стабільна структура являє собою сполуку, яка є достатньо стійкою для того, щоб перенести процес ізоляції з реакційної суміші та наступний процес її одержання у вигляді агента, що має щонайменше практичне застосування. Якщо інше не оговорено, замісники вказуються в основній структурі. Наприклад, необхідно розуміти, що коли (циклоалкіл)алкіл згадується як можливий замісник, місце приєднання зазначеного замісника до основної структури знаходиться в алкільній частині.

Термін «заміщений» при використанні по відношенню до алкілу, циклоалкілу, арилу, гетероциклоалкілу та гетероарилу (включаючи дигідробензоксазиніл, дигідрохіноксалініл, дигідробензодіазоліл, дигідроіндоліл, піримідиніл, хінолініл, індазоліл, індоліл, бензоімідазоліл, бензотіозоліл, бензотриазоліл, хіноксалініл, хіназолініл, морфолініл, азетидиніл, піролідиніл, оксаніл, піридиніл, оксазоліл, піперазиніл та пірадазиніл, але не обмежуючись зазначеними), якщо інше спеціально не зазначено, відноситься відповідно до алкілу, циклоалкілу, арилу, гетероциклоалкілу та гетероарилу (включаючи дигідробензоксазиніл, дигідрохіноксалініл, дигідробензодіазоліл, дигідроіндоліл, піримідиніл, хінолініл, індазоліл, індоліл, бензоімідазоліл, бензотіозоліл, бензотриазоліл, хіноксалініл, хіназолініл, морфолініл, азетидиніл, піролідиніл, оксаніл, піридиніл, оксазоліл, піперазиніл та пірадазиніл, але не обмежуючись зазначеними), де один або більше (наприклад, до 5, наприклад, до 3) атомів водню заміщені групою, незалежно вибраною з:

R^a , OR^b , $O(C_1C_2 \text{ алкіл})O$ (наприклад, метилендіокси-), SR^b , гуанідину, гуанідину, у якому один або більше атомів водню заміщені групою нижчого алкілу, NR^bR^c , галогену, ціано, оксо (як замісник для гетероциклоалкілу), нітро, COR^b , CO_2R^b , $CONR^bR^c$, $OCOR^b$, OCO_2R^a , $CONR^bR^c$, NR^cCOR^b , $NR^cCO_2R^a$, $NR^cCONR^bR^c$, SOR^a , SO_2R^a , $SO_2NR^bR^c$ та $NR^cSO_2R^a$,

де R^a вибраний з необов'язково заміщеного C_1C_6 -алкілу, необов'язково заміщеного циклоалкілу, необов'язково заміщеного арилу, необов'язково заміщеного гетероциклоалкілу та необов'язково заміщеного гетероарилу;

R^b вибраний з H, необов'язково заміщеного C_1C_6 -алкілу, необов'язково заміщеного арилу та необов'язково заміщеного гетероарилу; та

R^c вибраний з водню та необов'язково заміщеного C_1C_4 -алкілу; або

R^b та R^c разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, утворюють необов'язково заміщену гетероциклоалкільну групу; та

при цьому кожна необов'язково заміщена група є незаміщеною або незалежно містить один або більше, наприклад, один, два або три, замісники, незалежно вибрані з наступних: C_1C_4 -алкіл, C_3C_6 -циклоалкіл, арил, гетероарил, арил C_1C_4 -алкіл, гетероарил C_1C_4 -алкіл, C_1C_4 -галогеналкіл-, OC_1C_4 -алкіл, OC_1C_4 -алкілфеніл, $-C_1C_4$ -алкілОН, $-C_1C_4$ -алкілО- C_1C_4 -алкіл, OC_1C_4 -галогеналкіл, галоген, ОН, NH_2 , C_1C_4 -алкіл NH_2 , $N(C_1C_4$ -алкіл)(C_1C_4 -алкіл), $NH(C_1C_4$ -алкіл), $N(C_1C_4$ -алкіл)(C_1C_4 -алкілфеніл), $NH(C_1C_4$ -алкілфеніл), ціано, нітро, оксо (як замісник для гетероарилу), CO_2H , $C(O)OC_1C_4$ -алкіл, $CON(C_1C_4$ -алкіл)(C_1C_4 -алкіл), $CONH(C_1C_4$ -алкіл), $CONH_2$, $NHC(O)(C_1C_4$ -алкіл), $NHC(O)(\text{феніл})$, $N(C_1C_4$ -алкіл) $C(O)(C_1C_4$ -алкіл), $N(C_1C_4$ -алкіл) $C(O)(\text{феніл})$, $-C(O)C_1C_4$ -алкіл, $C(O)C_1C_4$ -феніл, $C(O)C_1C_4$ -галогеналкіл, $OC(O)C_1C_4$ -алкіл, $-SO_2(C_1C_4$ -алкіл), $-SO_2(\text{феніл})$, $-SO_2(C_1C_4$ -галогеналкіл), $-SO_2NH_2$, $SO_2NH(C_1C_4$ -алкіл), $SO_2NH(\text{феніл})$, $-NHSO_2(C_1C_4$ -алкіл), $-NHSO_2(\text{феніл})$ та $NHSO_2(C_1C_4$ -галогеналкіл).

Термін «заміщений ацил» відноситься до наступних груп: (заміщений алкіл)- $C(O)$ -; (заміщений циклоалкіл)- $C(O)$ -; (заміщений арил)- $C(O)$ -; (заміщений гетероарил)- $C(O)$ - та (заміщений гетероциклоалкіл)- $C(O)$ -, причому зазначені групи приєднані до вихідної структури через карбонільну функціональну групу, та причому заміщений алкіл, циклоалкіл, арил, гетероарил та гетероциклоалкіл відповідає наведеному в даній заявці визначенню.

Термін «заміщений алкокси» відноситься до алкоксигрупи, у якій алкільна частина є заміщеною (тобто $-O$ -(заміщеного алкілу)), де «заміщений алкіл» відповідає наведеному в даній заявці визначенню.

Термін «заміщений алкоксикарбоніл» відноситься до групи (заміщений алкіл)- $O-C(O)$ -, причому зазначені групи приєднані до вихідної структури через карбонільну функціональну групу, та причому «заміщений алкіл» відповідає наведеному в даній заявці визначенню.

Термін «заміщена арилокси група» відноситься до арилокси групи, причому арильна складова являє собою заміщений (тобто $-O$ -(заміщений арил)), причому «заміщений арил»

відповідає опису, наведеному в даній заявці.

Термін «заміщена гетероарилокси група» відноситься до гетероарилокси групи, гетероарильна частина якої є заміщеною (тобто -O-(заміщеного гетероарилу)), причому «заміщений гетероарил» відповідає наведеному в даній заявці визначенню.

5 Термін «заміщена циклоалкілокси група» відноситься до циклоалкілокси групи, циклоалкільна частина якої є заміщеною (тобто -O-(заміщеного циклоалкілу)), причому «заміщений циклоалкіл» відповідає наведеному в даній заявці визначенню.

Термін «заміщена гетероциклоалкілокси група» відноситься до гетероциклоалкілокси групи, алкільна частина якої є заміщеною (тобто -O-(заміщеного гетероциклоалкілу)), причому «заміщений гетероциклоалкіл» відповідає наведеному в даній заявці визначенню.

10 Термін «заміщена аміно група» відноситься до групи -NHR^d або $\text{-NR}^d\text{R}^d$, де кожен R^d незалежно вибраний з гідрокси групи, необов'язково заміщеного алкілу, необов'язково заміщеного циклоалкілу, необов'язково заміщеного ацилу, амінокарбонілу, необов'язково заміщеного арилу, необов'язково заміщеного гетероарилу, необов'язково заміщеного гетероциклоалкілу, алкоксикарбонілу, сульфінілу та сульфонілу, за умови, що тільки один з R^d являє собою гідроксил, та де заміщений алкіл, циклоалкіл, арил, гетероциклоалкіл та гетероарил відносяться відповідно до алкілу, циклоалкілу, арилу, гетероциклоалкілу, та гетероарилу, один або більше (наприклад, до 5, наприклад, до 3) атомів водню яких заміщені замісником, незалежно вибраним з наступних:

20 R^a , OR^b , $\text{O}(\text{C}_1\text{C}_2 \text{ алкіл})\text{O}$ (наприклад, метилендіокси-), SR^b , гуанідин, гуанідин, один або більше атомів водню якого заміщені групою нижчого алкілу, NR^bR^c , галоген, ціано групою, нітро групою, COR^b , CO_2R^b , CONR^bR^c , OCOR^b , OCO_2R^a , CONR^bR^c , NR^cCOR^b , $\text{NR}^c\text{CO}_2\text{R}^a$, - $\text{NR}^c\text{CONR}^b\text{R}^c$, SOR^a , SO_2R^a , $\text{SO}_2\text{NR}^b\text{R}^c$ та $\text{NR}^c\text{SO}_2\text{R}^a$,

де R^a вибраний з необов'язково заміщеного C_1C_6 -алкілу, необов'язково заміщеного арилу та необов'язково заміщеного гетероарилу;

25 R^b вибраний з H, необов'язково заміщеного C_1C_6 -алкілу, необов'язково заміщеного арилу та необов'язково заміщеного гетероарилу; та

R^c вибраний з водню та необов'язково заміщеного C_1C_4 -алкілу; та

30 R^b та R^c разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, утворюють необов'язково заміщену гетероциклоалкільну групу; та

де кожна необов'язково заміщена група є незаміщеною або незалежно містить один або більше, наприклад, один, два або три, замісники, незалежно вибрані з наступних: C_1C_4 -алкіл, арил, гетероарил, арил C_1C_4 -алкіл, гетероарил C_1C_4 -алкіл, C_1C_4 -галогеналкіл-, OC_1C_4 -алкіл, OC_1C_4 -алкілфеніл, $\text{-C}_1\text{C}_4$ -алкілОН, OC_1C_4 -галогеналкіл, галоген, ОН, NH_2 , C_1C_4 -алкіл NH_2 , $\text{N}(\text{C}_1\text{C}_4$ -алкіл)(C_1C_4 -алкіл), $\text{NH}(\text{C}_1\text{C}_4$ -алкіл), $\text{N}(\text{C}_1\text{C}_4$ -алкіл)(C_1C_4 -алкілфеніл), $\text{NH}(\text{C}_1\text{C}_4$ -алкілфеніл), ціано групи, нітро групи, оксо групи (як замісник для гетероарилу), CO_2H , $\text{C}(\text{O})\text{OC}_1\text{C}_4$ -алкіл, $\text{CON}(\text{C}_1\text{C}_4$ -алкіл)(C_1C_4 -алкіл), $\text{CONH}(\text{C}_1\text{C}_4$ -алкіл), CONH_2 , $\text{NHC}(\text{O})(\text{C}_1\text{C}_4$ -алкіл), $\text{NHC}(\text{O})(\text{феніл})$, $\text{N}(\text{C}_1\text{C}_4$ -алкіл) $\text{C}(\text{O})(\text{C}_1\text{C}_4$ -алкіл), $\text{N}(\text{C}_1\text{C}_4$ -алкіл) $\text{C}(\text{O})(\text{феніл})$, $\text{C}(\text{O})\text{C}_1\text{C}_4$ -алкіл, $\text{C}(\text{O})\text{C}_1\text{C}_4$ -феніл, $\text{C}(\text{O})\text{C}_1\text{C}_4$ -галогеналкіл, $\text{OC}(\text{O})\text{C}_1\text{C}_4$ -алкіл, $\text{-SO}_2(\text{C}_1\text{C}_4$ -алкіл), $\text{-SO}_2(\text{феніл})$, $\text{-SO}_2(\text{C}_1\text{C}_4$ -галогеналкіл), $\text{-SO}_2\text{NH}_2$, $\text{SO}_2\text{NH}(\text{C}_1\text{C}_4$ -алкіл), $\text{SO}_2\text{NH}(\text{феніл})$, $\text{-NHSO}_2(\text{C}_1\text{C}_4$ -алкіл), $\text{-NHSO}_2(\text{феніл})$ та $\text{NHSO}_2(\text{C}_1\text{C}_4$ -галогеналкіл); та

де необов'язково заміщений ацил, амінокарбоніл, алкоксикарбоніл, сульфініл та сульфоніл відповідає наведеним в даній заявці визначенням.

45 Термін «заміщена аміно група» також відноситься до N-оксидних груп -NHR^d та NR^dR^d згідно з наведеними вище визначеннями. N-оксиди можуть бути отримані шляхом обробки відповідної аміногрупи, наприклад, пероксидом водню або м-хлорпероксибензойною кислотою. Спеціалістам в даній галузі техніки відомі умови реакції для проведення N-окислення.

Описані в даній заявці сполуки можуть включати оптичні ізомери, рацемати та інші суміші зазначених сполук, але не обмежуються ними. У зазначених випадках окремі енантіомери або діастереомери, тобто оптично активні форми, можуть бути отримані шляхом асиметричного синтезу або шляхом розщеплення рацематів. Розщеплення рацематів може здійснюватися, наприклад, за допомогою стандартних способів, таких як кристалізація в присутності розщеплюючого агента або хроматографії з використанням, наприклад, колонки для хіральної високоефективної рідинної хроматографії (ВЕРХ). Крім того, зазначені сполуки включають Z- та E- форми (або цис- та транс- форми) сполук з вуглець-вуглецевими подвійними зв'язками. У випадках, коли описані в даній заявці сполуки можуть існувати в різних таутомерних формах, зазначені хімічні сполуки включають всі таутомерні форми. Такі сполуки також включають кристалічні форми, включаючи поліморфи та клатрати.

60 Сполуки Формули I також включають кристалічні та аморфні форми зазначених сполук, включаючи, наприклад, поліморфи, псевдополіморфи, сольвати, гідрати, несольватовані

поліморфи (включаючи ангідрати), конформаційні поліморфи та аморфні форми зазначених сполук, а також суміші зазначених форм. Терміни «кристалічна форма», «поліморф» та «нова форма» при використанні в даній заявці можуть бути взаємозамінними та включають всі кристалічні та аморфні форми сполуки, включаючи, наприклад, поліморфи, псевдополіморфи, сольвати, гідрати, несольватовані поліморфи (включаючи ангідрати), конформаційні поліморфи та аморфні форми, а також суміші зазначених сполук, за виключенням посилань на конкретну кристалічну або аморфну форму. Сполуки Формули I також включають фармацевтично прийнятні форми перерахованих сполук, включаючи хелати, нековалентні комплекси, пролікарські форми та їх суміші.

Хімічні сполуки включають (але не обмежуються зазначеними) сполуки, описані в даній заявці та всі фармацевтично прийнятні форми зазначених сполук. Отже, терміни «хімічна сполука» та «хімічні сполуки» також включають фармацевтично прийнятні солі.

«Фармацевтично прийнятні солі» включають (але не обмежуються зазначеними) солі, утворені з неорганічними кислотами, такі як гідрохлорат, фосфат, дифосфат, гідробромат, сульфат, сульфінат, нітрат та подібні солі; а також солі, утворені з органічною кислотою, такі як малат, малеат, фумарат, тарtrat, сукцинат, цитрат, ацетат, лактат, метансульфонат, п-толуолсульфонат, 2-гідроксиетилсульфонат, бензоат, саліцилат, стеарат та алканоат, такий як ацетат, $\text{HOOC}-(\text{CH}_2)_n-\text{COOH}$, де n дорівнює 0-4, та подібні солі. Аналогічно, фармацевтично прийнятні катіони включають (але не обмежуються зазначеними) натрій, калій, кальцій, алюміній, літій та амоній.

Крім того, у тих випадках, коли сполуки, описані в даній заявці, являють собою сіль приєднання кислоти, вільна основа може бути отримана шляхом олужнення розчину кислоти солі. Навпаки, якщо продукт являє собою вільну основу, сіль приєднання, зокрема, фармацевтично прийнятна сіль приєднання, може бути отримана шляхом розчинення вільної основи в підходящому органічному розчиннику та обробки розчину кислотою у відповідності зі стандартними способами одержання солей приєднання кислоти з основних сполук. Фахівцям у даній галузі відомі різні синтетичні методи, які можуть використовуватися для одержання нетоксичних фармацевтично прийнятних солей приєднання.

Як відзначено вище, сполуки Формули I також включають пролікарські форми. Відповідно до деяких варіантів реалізації винаходу «пролікарські форми», описані в даній заявці, включають будь-яку сполуку, яка перетворюється в сполуку Формули I при введенні пацієнту, наприклад, у результаті метаболічних процесів. Приклади пролікарських форм включають похідні функціональних груп, наприклад, груп карбонової кислоти, у сполуках формули I. Типові пролікарські форми, що є похідними групи карбонової кислоти, включають (але не обмежуються зазначеними) складні ефіри карбонових кислот, такі як алкілові ефіри, гідроксialкілові ефіри, арилалкілові ефіри та арилоксиалкілові ефіри.

«Сольват» утворюється в результаті взаємодії розчинника та сполуки. Термін «сполука» включає сольвати сполук. Подібним чином, термін «солі» включає сольвати солей. Підходящі сольвати являють собою фармацевтично прийнятні сольвати, такі як гідрати, включаючи моногідрати та напівгідрати.

«Хелат» утворюється в результаті взаємодії сполуки з іонами металу за двома (або більше) точками. Термін «сполука» включає хелати сполук. Подібним чином, термін «солі» включає хелати солей.

«Нековалентний комплекс» утворюється в результаті взаємодії сполуки і іншої молекули, причому ковалентний зв'язок не формується між сполукою та зазначеною молекулою. Наприклад, комплексоутворення може бути опосередковане ван-дер-ваальсовою взаємодією, водневими зв'язками та електростатичними взаємодіями (які також називають іонним зв'язком). Термін «сполука» включає зазначені нековалентні комплекси.

Термін «водневий зв'язок» відноситься до форми зв'язку між електронегативним атомом (також відомим як акцептор водневого зв'язку) та атомом водню, пов'язаним з іншим, відносно електронегативним атомом (також відомим як донор водневого зв'язку). Підходящі донори та акцептори водневого зв'язку добре відомі в області медичної хімії (G. C. Pimentel and A. L. McClellan, *The Hydrogen Bond*, Freeman, San Francisco, 1960; R. Taylor and O. Kennard, "Hydrogen Bond Geometry in Organic Crystals", *Accounts of Chemical Research*, 17, pp. 320-326 (1984)).

«Акцептор водневого зв'язку» відноситься до групи, що включає кисень або азот, зокрема кисень або азот, який є sp^2 -гібридизованим, кисень ефіру або кисень сульфоксиду або N-оксиду.

Термін «донор водневого зв'язку» відноситься до кисню, азоту або вуглецю в гетероароматичному кільці, яке пов'язане з групою, що містить водень, що включає атом азоту в кільці, або гетероарильною групою, яка містить атом азоту в кільці.

Використовувані в даній заявці терміни «група», «радикал» або «фрагмент» є синонімами та спрямовані на зазначення функціональних груп або фрагментів молекул, здатних приєднуватися до зв'язку або інших фрагментів молекул.

Термін «активний агент» використовується для позначення хімічної сполуки, яка проявляє біологічну активність. Відповідно до деяких варіантів реалізації винаходу «активний агент» являє собою сполуку, що має фармацевтичну корисність. Наприклад, активний агент може являти собою протираковий терапевтичний засіб.

Термін «терапевтично ефективна кількість» описаної в даній заявці хімічної сполуки означає кількість, достатню для забезпечення терапевтичного сприятливого ефекту, такого як послаблення симптомів, уповільнення прогресування захворювання або попередження розвитку захворювання при введенні пацієнту, що являє собою людину або, що являє собою не людину, наприклад, терапевтично ефективна кількість може являти собою кількість, достатню для послаблення симптомів захворювання, чутливого до пригнічення активності Syk-кінази. Відповідно до деяких варіантів реалізації винаходу терапевтично ефективна кількість являє собою кількість, достатню для ослаблення симптомів раку, симптомів алергійного захворювання, симптомів аутоімунного та/або запального захворювання або симптомів гострої запальної реакції. Відповідно до деяких варіантів реалізації винаходу терапевтично ефективна кількість, являє собою кількість, достатню для зниження кількості, що піддається визначенню, ракових клітин в організмі, зниження, що піддається визначенню або зупинки росту ракової пухлини. Відповідно до деяких варіантів реалізації винаходу терапевтично ефективна кількість, являє собою кількість, достатню для зменшення ракової пухлини. У деяких випадках у пацієнта, що страждає від раку, можуть не виявлятися симптоми захворювання. Відповідно до деяких варіантів реалізації винаходу терапевтично ефективна кількість хімічної сполуки, являє собою кількість, достатню для попередження значного підвищення або для значного зниження кількості, що піддаються визначенню ракових клітин або маркерів раку в крові, сироватці або тканинах пацієнта. Відповідно до описаних у даній заявці способів лікування алергічних захворювань та/або аутоімунних та/або запальних захворювань та/або гострих запальних реакцій терапевтично ефективна кількість може також являти собою кількість, достатню при введенні пацієнту для уповільнення, що піддається визначенню, прогресування захворювання або попередження прояву симптомів алергійного захворювання та/або аутоімунного та/або запального захворювання та/або гострої запальної реакції у пацієнта, що одержує лікування зазначеною хімічною сполукою. Відповідно до деяких описаних у даній заявці способів лікування алергічних захворювань та/або аутоімунних та/або запальних захворювань та/або гострих запальних реакцій терапевтично ефективна кількість може також являти собою кількість, достатню для зниження, що піддається визначенню, кількості маркерного білку або типу клітин у крові або сироватці пацієнта. Наприклад, відповідно до деяких варіантів реалізації винаходу терапевтично ефективна кількість являє собою кількість хімічної сполуки, описаної в даній заявці, достатню для значного зниження активності В-клітин. Відповідно до іншого прикладу, відповідно до деяких варіантів реалізації винаходу терапевтично ефективна кількість являє собою кількість хімічної сполуки, описаної в даній заявці, достатню для значного зниження кількості В-клітин. Відповідно до іншого прикладу, відповідно до деяких варіантів реалізації винаходу терапевтично ефективна кількість являє собою кількість хімічної сполуки, описаної в даній заявці, достатню для зниження рівня антитіл проти ацетилхолінових рецепторів у крові пацієнта, що страждає від міастенії гравіс.

Термін «пригнічення» відноситься до значного зниження початкового рівня біологічної активності або процесу. «Пригнічення активності тирозинкінази Syk» відноситься до безпосереднього або опосередкованого зниження активності Syk-кінази у відповідь на присутність щонайменше однієї описаної в даній заявці хімічної сполуки в порівнянні з активністю Syk-кінази за відсутності зазначеної щонайменше однієї хімічної сполуки. Зниження активності може відбуватися в результаті безпосередньої взаємодії сполуки з тирозинкіназою Syk або в результаті взаємодії, описаної в даній заявці хімічної сполуки (сполук) з одним або більше іншими факторами, які у свою чергу впливають на активність тирозинкінази Syk. Наприклад, наявність зазначеної хімічної сполуки (сполук) може знижувати активність тирозинкінази Syk шляхом безпосереднього зв'язування з Syk-кіназою, шляхом стимуляції (безпосередньої або опосередкованої) іншого фактора для зниження активності тирозинкінази Syk або шляхом зниження (безпосереднього або опосередковано) кількості тирозинкінази Syk, присутньої в клітині або організмі.

Пригнічення активності тирозинкінази Syk також відноситься до пригнічення, яке піддається визначенню, активності Syk-кінази в стандартному біохімічному аналізі активності Syk, такому як аналіз гідролізу АТФ, описаний нижче. Відповідно до деяких варіантів реалізації винаходу

хімічна сполука, описана в даній заявці, має значення IC_{50} , менше або рівне 1 мікромолю. Відповідно до деяких варіантів реалізації винаходу хімічна сполука має значення IC_{50} , менше або рівне менше ніж 100 наномолям. Відповідно до деяких варіантів реалізації винаходу хімічна сполука характеризується значенням IC_{50} , меншим або рівним 10 наномолям.

5 Термін «пригнічення активності В-клітин» відноситься до безпосереднього або опосередкованого зниженню активності В-клітин у відповідь на присутність щонайменше однієї хімічної сполуки, описаної в даній заявці, у порівнянні з активністю В-клітин за відсутності зазначеної щонайменше однієї хімічної сполуки. Зниження активності може відбуватися в результаті безпосередньої взаємодії сполуки з Сук-кіназою або з одним або більше іншими факторами, які у свою чергу впливають на активність В-клітин.

10 Пригнічення активності В-клітин також відноситься до пригнічення, що піддається визначенню, експресії CD86 у стандартному аналізі, такому як аналіз, описаний нижче. Відповідно до деяких варіантів реалізації винаходу хімічна сполука, описана в даній заявці, характеризується значенням IC_{50} , меншим або рівним 10 мікромолям. Відповідно до деяких варіантів реалізації винаходу хімічна сполука характеризується значенням IC_{50} , меншим або рівним менше ніж 1 мікромолю. Відповідно до деяких варіантів реалізації винаходу хімічна сполука характеризується значенням IC_{50} , меншим або рівним 500 наномолям.

15 Термін «активність В-клітин» також включає активацію, перерозподіл, реорганізацію або кеппінг одного або більше з різних В-клітинних мембранних рецепторів або мембран-зв'язаних імунoglobulinів, наприклад, імунoglobulinів IgM, IgG та IgD. Більшість В-клітин також містить мембранний рецептор для Fc-фрагменту IgG у вигляді комплексів антиген-антитіло або агрегованого IgG. В-клітини також містять мембранні рецептори для активованих компонентів комплементу, наприклад, C3b, C3d, C4 та C1q. Ці різні мембранні рецептори та мембранно-зв'язані імунoglobulini мають мембранну рухливість, та можливо їх перерозподіл та кеппінг, який може ініціювати передачу сигналу.

20 Активність В-клітин також стосується синтезу або одержання антитіл, або імунoglobulinів. Імунoglobulini синтезуються групами В-клітин та мають спільні структурні особливості та однакові структурні одиниці. П'ять класів імунoglobulinів, тобто IgG, IgA, IgM, IgD, та IgE, розпізнаються на основі структурних відмінностей їх важких ланцюгів, включаючи амінокислотну послідовність та довжину поліпептидного ланцюга. Антитіла до конкретного антигену можуть відноситися до всіх або деяких класів імунoglobulinів, або ж можуть обмежуватися єдиним класом або підкласом імунoglobulinів. Аутоантитіла, або аутоімунні антитіла, також можуть належати до одного або декількох класів імунoglobulinів. Наприклад, ревматоїдні фактори (антитіла до IgG) найбільш часто визначаються як імунoglobulini IgM, але можуть також являти собою IgG або IgA.

30 Крім того, активність В-клітин також відноситься до ряду подій, що приводять до клональної експансії В-клітин (проліферації) з В-лімфоцитів-попередників та диференціювання в синтезуючі антитіла плазматичні клітини, яка відбувається при зв'язуванні антигену та надходженні цитокінових сигналів від інших клітин.

40 «Пригнічення проліферації В-клітин» відноситься до пригнічення проліферації аномальних В-клітин, таких як ракові В-клітини, наприклад, В-клітинної лімфоми, та/або пригнічення нормальних здоровіших В-клітин. Термін «пригнічення проліферації В-клітин» відноситься до будь-якого значного зниженню кількості В-клітин, або *in vitro*, або *in vivo*. Таким чином, пригнічення проліферації В-клітин *in vitro* являє собою будь-яке значне зниження кількості В-клітин *in vitro* у зразку, що зазнав взаємодії щонайменше з однією хімічною сполукою, описаною в даній заявці, у порівнянні з еквівалентним зразком, що не зазнав взаємодії з зазначеною хімічною сполукою (сполуками).

45 Пригнічення проліферації В-клітин також відноситься до пригнічення, що піддається визначенню, проліферації В-клітин у стандартному аналізі проліферації В-клітин, заснованому на включенні тимідину, такому як аналіз, описаний у даній заявці. Відповідно до деяких варіантів реалізації винаходу хімічна сполука характеризується значенням IC_{50} , меншим або рівним 10 мікромолям. Відповідно до деяких варіантів реалізації винаходу хімічна сполука характеризується значенням IC_{50} , меншим або рівним менше ніж 1 мікромолю. Відповідно до деяких варіантів реалізації винаходу хімічна сполука характеризується значенням IC_{50} , меншим або рівним 500 наномолям.

50 Термін «алергія» або «алергічне захворювання» відноситься до надбаної гіперчутливості до речовини (алергену). Алергічні захворювання включають екзему, алергічний риніт або нежить, сінну лихоманку, бронхіальну астму, алергічний висип (кропивницю) та харчові алергії та інші atopічні стани.

60 Термін «астма» стосується розладу дихальної системи, що характеризується запаленням,

звуженням повітряних шляхів та підвищенням реактивності повітряних шляхів при взаємодії з вдихуваними агентами. Астма часто, хоча і не обов'язково, пов'язана з atopічними або алергійними симптомами.

Термін «значний» відноситься до будь-якої зміни, що піддається визначенню, яка є статистично достовірною у стандартному параметричному тесті статистичної вірогідності, такому як критерій Ст'юдента, де $p < 0,05$.

«Захворювання, чутливе до пригнічення активності Syk-кінази» являє собою захворювання, за якого пригнічення активності тирозинкінази Syk забезпечує сприятливий терапевтичний ефект, такий як полегшення симптомів, зниження прогресування захворювання, попередження або затримка розвитку захворювання або пригнічення аберантної активності певних клітинних типів (моноцитів, В-клітин та гладких клітин).

Термін «проведення лікування або лікування» відноситься до будь-якого лікування захворювання у пацієнта, спрямованого на:

а) попередження захворювання, тобто, перешкоджання розвитку клінічних симптомів захворювання;

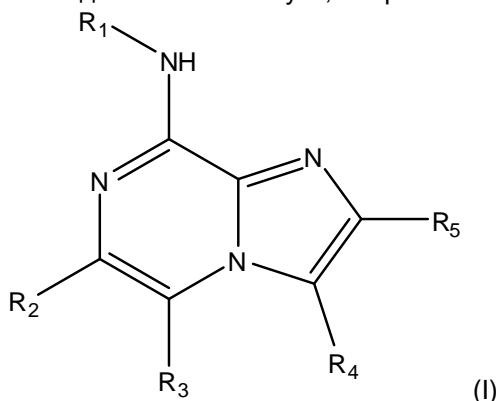
b) пригнічення захворювання;

c) уповільнення або стримування розвитку клінічних симптомів; та/або

d) полегшення захворювання, тобто забезпечення регресії клінічних симптомів.

Термін «пацієнт» відноситься до тварини, наприклад, ссавця, який є або може бути об'єктом лікування, спостереження або дослідження. Способи, описані в даній заявці, терапевтично застосовні до людей, і також можуть застосовуватися у ветеринарії. Відповідно до деяких варіантів реалізації винаходу пацієнт являє собою ссавця; Відповідно до деяких варіантів реалізації винаходу пацієнт являє собою людину; Відповідно до деяких варіантів реалізації винаходу пацієнт являє собою кішку або собаку.

Запропонована щонайменше одна хімічна сполука, вибрана зі сполук Формули I:



та фармацевтично прийнятних солей зазначених сполук, причому R_1 являє собою феніл, що містить як замісник одну або дві групи, вибрані з галогену,

гідрокси групи,

карбокси групи,

ціано групи,

циклоалкілу, що необов'язково містить як замісник одну або дві групи, вибрані з гідрокси групи, нижчої алкокси групи та нижчого алкілу,

циклоалкілокси групи, що необов'язково містить як замісник одну або дві групи, вибрані з гідрокси групи, нижчої алкокси групи та нижчого алкілу,

гетероциклоалкілу, що необов'язково містить як замісник одну або дві групи, вибрані з ацилу, галогену, необов'язково заміщеної аміно групи, гідрокси групи, нижчої алкокси групи, нижчого алкілу, нижчого алкілу, що містить як замісник гідрокси групу, нижчого алкілу, що містить як замісник нижчу алкокси групу, нижчого алкілу, що містить як замісник одну, дві або три галогенові групи, необов'язково заміщеної аміно групи, необов'язково заміщеного гетероциклоалкілу та оксо групи,

гетероциклоалкілокси групи, що необов'язково містить як замісник одну або дві групи, вибрані з галогену, необов'язково заміщеної аміно групи, гідрокси групи, нижчої алкокси групи, нижчого алкілу, нижчого алкілу, що містить як замісник гідрокси групу, нижчого алкілу, що містить як замісник нижчу алкокси групу, нижчого алкілу, що містить як замісник одну, дві або три галогенові групи, необов'язково заміщеної аміно групи, необов'язково заміщеного гетероциклоалкілу та оксо групи,

гетероарилу,

аміно групи, що необов'язково містить як замісник одну або дві групи, вибрані з нижчого алкілу, нижчого алкілу, що містить як замісник галоген, нижчого алкілу, що містить як замісник гідрокси групу, та нижчого алкілу, що містить як замісник нижчу алкокси групу,

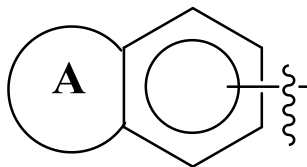
5 -C(O)NR₆R₇, де R₆ та R₇ незалежно вибрані з водню, нижчого алкілу, нижчого алкілу, що містить як замісник гідрокси групу, нижчого алкілу, що містить як замісник необов'язково заміщену аміно групу, циклоалкілу, арилу, гетероарилу та гетероциклоалкілу, або де R₆ та R₇ разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, утворюють 3 - 7-членне гетероциклоалکیلне кільце, що необов'язково містить як замісник одну або дві групи, вибрані з гідрокси групи, 10 нижчого алкілу та нижчого алкілу, що містить як замісник гідрокси групу,

-S(O)₂NR₆R₇, де R₆ та R₇ незалежно вибрані з водню, нижчого алкілу, нижчого алкілу, що містить як замісник гідрокси групу, нижчого алкілу, що містить як замісник необов'язково заміщену аміно групу, циклоалкілу, арилу, гетероарилу та гетероциклоалкілу, або де R₆ та R₇ разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, утворюють 3 - 7-членне гетероциклоалکیلне кільце, що необов'язково містить як замісник одну або дві групи, вибрані з гідрокси групи, 15 нижчого алкілу та нижчого алкілу, що містить як замісник гідрокси групу, за умови, що щонайменше один з R₆ та R₇ не є воднем,

нижчої алкокси групи, що необов'язково містить як замісник одну або дві групи, вибрані з гідрокси групи, нижчої алкокси групи, необов'язково заміщеного амінокарбонілу, необов'язково заміщеної аміно групи, карбокси групи, амінокарбонілу та гетероциклоалкілу,

гетероарилокси групи, та

нижчого алкілу, що необов'язково містить як замісник одну або дві групи, вибрані з гідрокси групи, нижчої алкокси групи, галогену, трифторметилу, необов'язково заміщеної аміно групи та гетероциклоалкілу, що необов'язково містить як замісник нижчий алкіл; або



25 R₁ являє собою , де A вибраний з арильної, циклоалкільної та гетероциклоалкільної груп, кожна з яких містить від 5 до 7 атомів в кільці, включаючи атоми, спільні з 6-членним ароматичним кільцем, та кожна з яких необов'язково містить замісники;

R₂ вибраний з необов'язково заміщеного арилу та необов'язково заміщеного гетероарилу;

R₃ вибраний з водню, нижчого алкілу та галогену;

30 R₄ вибраний з водню та нижчого алкілу; та

R₅ являє собою водень,

за умови, що

якщо R₃ та R₄ являють собою водень, та R₁ являє собою 3-метокси-4-(морфолін-4-ілкарбоніл)феніл, 4-(морфолін-4-іл)феніл, 3,4-діетоксифеніл, 3-фтор-4-метоксифеніл, 4-(4-етилпіперазин-1-іл)феніл, 4-(3-оксопіперазин-1-іл)феніл, 4-(морфолін-4-іл)феніл, 3-метокси-4-(морфолін-4-іл)феніл, 3-метокси-4-метилфеніл, 4-метокси-3-метилфеніл, 2-(диметиламіно)етокси-3-метоксифеніл, 3-етокси-4-метоксифеніл або 4-етокси-3-метоксифеніл, тоді R₂ не є фенілом, що містить як замісник -(CO)NHR₆, де R₆ являє собою необов'язково заміщений арил;

40 якщо R₃ та R₄ являють собою водень, та R₁ являє собою 3,4-диметоксифеніл, тоді R₂ не є фенілом, що містить як замісник

-(CO)NR₈R₉, де R₈ та R₉ разом утворюють необов'язково заміщений гетероциклоалкіл або необов'язково заміщений гетероарил, або де R₈ являє собою водень, метил або етил, та R₉ являє собою водень, необов'язково заміщений арил, необов'язково заміщений циклоалкіл, 45 необов'язково заміщений гетероциклоалкіл, необов'язково заміщений алкіл або необов'язково заміщений гетероарил, причому зазначений феніл також необов'язково містить як замісник групу, вибрану з метилу, метокси групи та галогену, або

-(SO₂)NHR₁₀, де R₁₀ являє собою необов'язково заміщений феніл;

якщо R₃ та R₄ являють собою водень, та R₁ являє собою 4-(морфолін-4-іл)феніл, тоді R₂ не є піридинілом, 2-фторфенілом, бензо[d][1,3]діоксолілом, 2-метоксифенілом, 2,6-діметоксифенілом, 3-ацетамідофенілом, 3-карбоксифенілом, 2-(гідроксиметил)фенілом, фуранілом або 3-(гідроксиетилкарбамоїл)фенілом;

якщо R₃ та R₄ являють собою водень, та R₁ являє собою хлорфеніл, тоді R₂ не є фенілом, що містить як замісник піперидин-1-іл-карбоніл або NH(CO)NHR₁₂, де R₁₂ являє собою феніл, 55 що містить як замісник трифторметил або один або більше галогенів;

якщо R₃ та R₄ являють собою водень, та R₁ являє собою феніл, що містить як замісник

необов'язково заміщений піперазиніл, тоді R_2 не є 3-амінофенілом;

якщо R_3 та R_4 являють собою водень, та R_1 являє собою 4-хлорфеніл, тоді R_2 не є 4-карбоксифенілом, 3-(2-(диметиламіно)етилкарбамоїл)фенілом або 4-(2-(диметиламіно)етилкарбамоїл)фенілом; та

якщо R_3 та R_4 являють собою водень, та R_1 являє собою 4-(2-гідрокси-етил)феніл або 4-(гідроксиетил)феніл, то R_2 не є 2-метоксифенілом або 2-фторфенілом;

якщо R_3 та R_4 являють собою водень, та R_1 являє собою 4-[(4-етилпіперазин-1-іл)метил]феніл або 4-(2-гідроксипропан-2-іл)феніл, тоді R_2 не є фенілом, що містить як замісник $-(CO)NR_8R_9$, де R_8 являє собою водень, та R_9 являє собою водень, метил або необов'язково заміщений арил, причому зазначений феніл необов'язково також містить як замісник групу, що являє собою метил;

якщо R_3 та R_4 являють собою водень, та R_2 являє собою 4-карбамоїлфеніл, тоді R_1 не є 4-(гідроксиметил)фенілом, 3-(1-гідроксиетил)фенілом, 4-(1H-імідазол-2-іл)-3-метилфенілом, 3-метокси-4-(піперидин-4-ілокси)фенілом, 3-метокси-4-(2-метоксиетокси)фенілом, 4-[2-(диметиламіно)етокси]-3-метоксифенілом, 4-(2-гідроксиетокси)-3-метоксифенілом, 3-метокси-4-(пропан-2-ілокси)фенілом, 3-метокси-4-пропоксифенілом, 4-(пропілкарбамоїл)фенілом, 4-етокси-3-метоксифенілом, 4-(1H-імідазол-2-іл)фенілом, 3-метокси-4-(1H-піразол-5-іл)фенілом,

якщо R_3 та R_4 являють собою водень, та R_2 являє собою піридин-3-іл, що містить як замісник карбамоїл, тоді R_1 не є 3,4-диметоксифенілом,

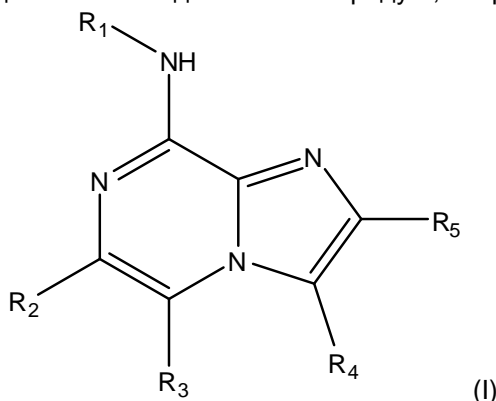
якщо R_3 та R_4 являють собою водень, та R_1 являє собою 4-етокси-3-метоксифеніл, тоді R_2 не є фенілом, що містить як замісник метил, та що додатково містить як замісник $-(CO)NR_8R_9$, де R_8 являє собою водень, та R_9 являє собою 4-(метилкарбамоїл)феніл, та

при цьому додатково R_2 не є фенілом, що містить як замісник $-NHC(O)R_{11}$, де R_{11} являє собою необов'язково заміщений арил.

Відповідно до деяких варіантів реалізації винаходу R_3 вибраний з водню, метилу, етилу та хлору. Відповідно до деяких варіантів реалізації винаходу R_3 являє собою водень.

Відповідно до деяких варіантів реалізації винаходу R_4 вибраний з водню та метилу. Відповідно до деяких варіантів реалізації винаходу R_4 являє собою водень.

Також запропонований щонайменше один хімічний продукт, вибраний зі сполук Формули I:



та фармацевтично прийнятних солей зазначених сполук, причому R_1 являє собою феніл, що містить як замісник одну або дві групи, вибрані з галогену,

гідрокси групи,

карбокси групи,

циклоалкілу, що необов'язково містить як замісник одну або дві групи, вибрані з гідрокси групи, нижчої алкокси групи та нижчого алкілу,

гетероциклоалкілу, що необов'язково містить як замісник одну або дві групи, вибрані з гідрокси групи, нижчої алкокси групи, нижчого алкілу, нижчого алкілу, що містить як замісник

гідрокси групу, необов'язково заміщеної аміно групи та оксо групи,

гетероарилу,

аміно групи, що необов'язково містить як замісник одну або дві групи, вибрані з нижчого алкілу, нижчого алкілу, що містить як замісник галоген, нижчого алкілу, що містить як замісник гідрокси групу, та нижчого алкілу, що містить як замісник нижчу алкокси групу,

$-C(O)NR_6R_7$, де R_6 та R_7 незалежно вибрані з водню, нижчого алкілу, нижчого алкілу, що містить як замісник гідрокси групу, нижчого алкілу, що містить як замісник необов'язково заміщену аміно групу, циклоалкілу, арилу, гетероарилу та гетероциклоалкілу, або де R_6 та R_7 разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, утворюють 3 - 7-членне гетероциклоалکیلне

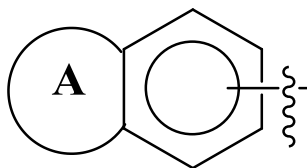
кільце, що необов'язково містить як замісник одну або дві групи, вибрані з гідрокси групи, нижчого алкілу та нижчого алкілу, що містить як замісник гідрокси групу,

-S(O)₂NR₆R₇, де R₆ та R₇ незалежно вибрані з водню, нижчого алкілу, нижчого алкілу, що містить як замісник гідрокси групу, нижчого алкілу, що містить як замісник необов'язково заміщену аміно групу, циклоалкілу, арилу, гетероарилу та гетероциклоалкілу, або де R₆ та R₇ разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, утворюють 3 - 7-членне гетероциклоалکیلне кільце, що необов'язково містить як замісник одну або дві групи, вибрані з гідрокси групи, нижчого алкілу та нижчого алкілу, що містить як замісник гідрокси групу, за умови, що щонайменше один з R₆ та R₇ не є воднем,

нижчої алкокси групи, що необов'язково містить як замісник одну або дві групи, вибрані з гідрокси групи, нижчої алкокси групи, необов'язково заміщеної аміно групи, карбокси групи, амінокарбонілу та гетероциклоалкілу,

гетероариллокси групи, та

нижчого алкілу, що необов'язково містить як замісник одну або дві групи, вибрані з гідрокси групи, нижчої алкокси групи, галогену, трифторметилу, необов'язково заміщеної аміно групи та гетероциклоалкілу, що необов'язково містить як замісник нижчий алкіл; або



R₁ являє собою , де A вибраний з арильної, циклоалکیلної та гетероциклоалکیلної груп, кожна з яких містить від 5 до 7 атомів в кільці, включаючи атоми, спільні з 6-членним ароматичним кільцем, та кожна з яких необов'язково змістить замісники;

R₂ вибраний з необов'язково заміщеного арилу та необов'язково заміщеного гетероарилу;

R₃ являє собою водень;

R₄ являє собою водень; та

R₅ являє собою водень,

за умови, що

якщо R₁ являє собою 3-метокси-4-метилфеніл, 4-метокси-3-метилфеніл, 2-(диметиламіно)етокси-3-метоксифеніл, 3-етокси-4-метоксифеніл або 4-етокси-3-метоксифеніл, тоді R₂ не є фенілом, що містить як замісник -(CO)NHR₆, де R₆ являє собою необов'язково заміщений арил;

якщо R₁ являє собою 3,4-диметоксифеніл, тоді R₂ не є фенілом, що містить як замісник

-(CO)NR₈R₉, де R₈ та R₉ разом утворюють необов'язково заміщений гетероциклоалкіл або необов'язково заміщений гетероарил, або де R₈ являє собою водень, та R₉ являє собою необов'язково заміщений арил, необов'язково заміщений циклоалкіл, необов'язково заміщений гетероциклоалкіл, необов'язково заміщений алкіл або необов'язково заміщений гетероарил, або -(SO₂)NHR₁₀, де R₁₀ являє собою необов'язково заміщений феніл;

якщо R₁ являє собою 4-(морфолін-4-іл)феніл, тоді R₂ не є піридинілом, 2-фторфенілом, бензо[d][1,3]діоксолілом, 2-метоксифенілом, 2,6-диметоксифенілом, 3-ацетамідофенілом, 3-карбоксифенілом, 2-(гідроксиметил)фенілом, фуранілом або 3-(гідроксиетилкарбамоїл)фенілом;

якщо R₁ являє собою хлорфеніл, тоді R₂ не є фенілом, що містить як замісник піперидин-1-іл-карбоніл або NH(CO)NR₁₂, де R₁₂ являє собою феніл, що містить як замісник трифторметил або один або більше галогенів;

якщо R₁ являє собою необов'язково заміщений піперазиніл, тоді R₂ не є 3-амінофенілом;

якщо R₁ являє собою 4-хлорфеніл, тоді R₂ не є 4-карбоксифенілом, 3-(2-(диметиламіно)-етилкарбамоїл)фенілом або 4-(2-(диметиламіно)етилкарбамоїл)фенілом; та

якщо R₁ являє собою 4-(2-гідрокси-етил)феніл або 4-(гідроксиетил)феніл, тоді R₂ не є 2-метоксифенілом або 2-фторфенілом; та

при цьому додатково R₂ не є фенілом, що містить як замісник -NHC(O)R₁₁, де R₁₁ являє собою необов'язково заміщений арил.

Відповідно до деяких варіантів реалізації винаходу R₁ являє собою феніл, що містить як замісник одну або дві групи, вибрані з

галогену,

гідрокси групи,

карбокси групи,

циклоалкілу, що необов'язково містить як замісник одну або дві групи, вибрані з гідрокси групи, нижчої алкокси групи та нижчого алкілу,

гетероциклоалкілу, що необов'язково містить як замісник одну або дві групи, вибрані з

гідрокси групи, нижчої алкокси групи, нижчого алкілу, нижчого алкілу, що містить як замісник гідрокси групи, необов'язково заміщеної аміно групи та оксо групи, гетероарилу,

аміно групи, що необов'язково містить як замісник одну або дві групи, вибрані з нижчого алкілу, нижчого алкілу, що містить як замісник галоген, нижчого алкілу, що містить як замісник гідрокси групи, та нижчого алкілу, що містить як замісник нижчу алкокси групи,

-C(O)NR₆R₇, де R₆ та R₇ незалежно вибрані з водню, нижчого алкілу, нижчого алкілу, що містить як замісник гідрокси групи, нижчого алкілу, що містить як замісник необов'язково заміщену аміно групи, циклоалкілу, арилу, гетероарилу та гетероциклоалкілу, або де R₆ та R₇ разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, утворюють 3 - 7-членне гетероциклоалکیلне кільце, що необов'язково містить як замісник одну або дві групи, вибрані з гідрокси групи, нижчого алкілу та нижчого алкілу, що містить як замісник гідрокси групи,

-S(O)₂NR₆R₇, де R₆ та R₇ незалежно вибрані з водню, нижчого алкілу, нижчого алкілу, що містить як замісник гідрокси групи, нижчого алкілу, що містить як замісник необов'язково заміщену аміно групи, циклоалкілу, арилу, гетероарилу та гетероциклоалкілу, або де R₆ та R₇ разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, утворюють 3 - 7-членне гетероциклоалکیلне кільце, що необов'язково містить як замісник одну або дві групи, вибрані з гідрокси групи, нижчого алкілу та нижчого алкілу, що містить як замісник гідрокси групи, за умови, що щонайменше один з R₆ та R₇ не є воднем,

нижчої алкокси групи, що необов'язково містить як замісник одну або дві групи, вибрані з гідрокси групи, нижчої алкокси групи, необов'язково заміщеної аміно групи, карбокси групи, амінокарбонілу та гетероциклоалкілу,

гетероарилокси групи, та

нижчого алкілу, що необов'язково містить як замісник одну або дві групи, вибрані з гідрокси групи, нижчої алкокси групи, галогену, трифторметилу, необов'язково заміщеної аміно групи та гетероциклоалкілу, що необов'язково містить як замісник нижчий алкіл.

Відповідно до деяких варіантів реалізації винаходу R₁ являє собою феніл, що містить як замісник одну або дві групи, вибрані з

галогену,

гідрокси групи,

гетероциклоалкілу, що необов'язково містить як замісник одну або дві групи, вибрані з гідрокси групи, нижчої алкокси групи, нижчого алкілу та нижчого алкілу, що містить як замісник гідрокси групи,

аміно групи, що необов'язково містить як замісник одну або дві групи, вибрані з нижчого алкілу, нижчого алкілу, що містить як замісник гідрокси групи, та нижчого алкілу, що містить як замісник нижчу алкокси групи,

нижчої алкокси групи, що необов'язково містить як замісник одну або дві групи, вибрані з гідрокси групи, нижчої алкокси групи, та необов'язково заміщеної аміно групи,

нижчого алкілу, що необов'язково містить як замісник одну або дві групи, вибрані з гідрокси групи, нижчої алкокси групи, трифторметилу, необов'язково заміщеної аміно групи та гетероциклоалкілу та

-C(O)NR₆R₇, де R₆ та R₇ незалежно вибрані з водню, нижчого алкілу, нижчого алкілу, що містить як замісник гідрокси групи, нижчого алкілу, що містить як замісник необов'язково заміщену аміно групи, циклоалкілу, арилу, гетероарилу та гетероциклоалкілу, або де R₆ та R₇ разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, утворюють 3 -7-членне гетероциклоалکیلне кільце, що необов'язково містить як замісник одну або дві групи, вибрані з гідрокси групи, нижчого алкілу та нижчого алкілу, що містить як замісник гідрокси.

Відповідно до деяких варіантів реалізації винаходу R₁ являє собою феніл, що містить як замісник одну або дві групи, вибрані з

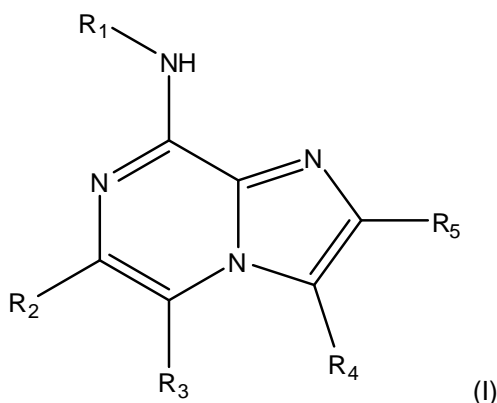
гідрокси групи,

гетероциклоалкілу, що необов'язково містить як замісник одну або дві групи, вибрані з гідрокси групи, нижчої алкокси групи, нижчого алкілу та нижчого алкілу, що містить як замісник гідрокси групи,

нижчої алкокси групи, що необов'язково містить як замісник одну або дві групи, вибрані з гідрокси та нижчої алкокси групи, та

нижчого алкілу, що містить як замісник одну або дві групи, вибрані з гідрокси групи, нижчої алкокси групи, трифторметилу, необов'язково заміщеної аміно групи та гетероциклоалкілу.

Також запропонована щонайменше одна хімічна сполука, вибрана зі сполук Формули I:



та фармацевтично прийнятних солей зазначених сполук, причому

R_1 являє собою феніл, що містить як замісник одну або дві групи, вибрані з галогену,

5 гідрокси групи,

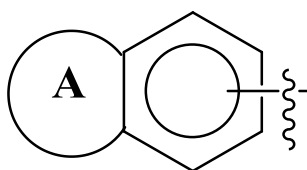
циклоалкілу, що необов'язково містить як замісник одну або дві групи, вибрані з гідрокси групи, нижчої алкокси групи та нижчого алкілу,

гетероциклоалкілу, що необов'язково містить як замісник одну або дві групи, вибрані з гідрокси групи, нижчої алкокси групи та нижчого алкілу,

10 аміно групи, що необов'язково містить як замісник одну або дві групи, вибрані з нижчого алкілу, нижчого алкілу, що містить як замісник галоген, нижчого алкілу, що містить як замісник гідрокси групу, та нижчого алкілу, що містить як замісник нижчу алкокси групу,

нижчої алкокси групи, що необов'язково містить як замісник одну або дві групи, вибрані з гідрокси групи, нижчої алкокси групи та необов'язково заміщеної аміно групи, та

15 нижчого алкілу, що необов'язково містить як замісник одну або дві групи, вибрані з гідрокси групи, нижчої алкокси групи, галогену, трифторметилу та необов'язково заміщеної аміно групи ; або



R_1 являє собою , де A вибраний з арильної, циклоалкільної та гетероциклоалкільної груп, кожна з яких містить від 5 до 7 атомів в кільці, включаючи атоми, спільні з 6-членним ароматичним кільцем, та кожна з яких необов'язково містить замісники;

R_2 вибраний з необов'язково заміщеного арилу та необов'язково заміщеного гетероарилу;

R_3 являє собою водень;

R_4 являє собою водень; та

R_5 являє собою водень,

25 за умови, що

якщо R_1 являє собою 3-метокси-4-метилфеніл, 4-метокси-3-метилфеніл, 2-(диметиламіно)етокси-3-метоксифеніл, 3-етокси-4-метоксифеніл або 4-етокси-3-метоксифеніл, тоді R_2 не є фенілом, що містить як замісник $-(CO)NHR_6$, де R_6 являє собою необов'язково заміщений арил;

30 якщо R_1 являє собою 3,4-диметоксифеніл, тоді R_2 не є фенілом, що містить як замісник $-(CO)NR_8R_9$, де R_8 та R_9 разом утворюють необов'язково заміщений гетероциклоалкіл або необов'язково заміщений гетероарил, або де R_8 являє собою водень, та R_9 являє собою необов'язково заміщений арил, необов'язково заміщений циклоалкіл, необов'язково заміщений гетероциклоалкіл, необов'язково заміщений алкіл або необов'язково заміщений гетероарил, або

35 $-(SO_2)NHR_{10}$, де R_{10} являє собою необов'язково заміщений феніл;

якщо R_1 являє собою 4-(морфолін-4-іл)феніл, тоді R_2 не є піридинілом, 2-фторфенілом, бензо[d][1,3]діоксолілом, 2-метоксифенілом, 2,6-диметоксифенілом, 3-ацетамідофенілом, 3-карбоксифенілом, 2-(гідроксиметил)фенілом, фуранілом або 3-(гідроксиетилкарбамоїл)фенілом;

40 якщо R_1 являє собою хлорфеніл, тоді R_2 не є фенілом, що містить як замісник піперидин-1-іл-карбоніл або $NH(CO)NR_{12}$, де R_{12} являє собою феніл, що містить як замісник трифторметил або один або більше галогенів;

якщо R_1 являє собою необов'язково заміщений піперазиніл, тоді R_2 не є 3-амінофенілом;

якщо R_1 являє собою 4-хлорфеніл, тоді R_2 не є 4-карбоксифенілом, 3-(2-(диметиламіно)-

етилкарбамоїл)фенілом або 4-(2-(диметиламіно)етилкарбамоїл)фенілом; та якщо R_1 являє собою 4-(2-гідрокси-етил)феніл або 4-(гідроксиетил)феніл, тоді R_2 не є 2-метоксифенілом або 2-фторфенілом; та

при цьому додатково R_2 не є фенілом, що містить як замісник $-NHC(O)R_{11}$, де R_{11} являє собою необов'язково заміщений арил.

Відповідно до деяких варіантів реалізації винаходу R_1 являє собою феніл, що містить як замісник одну або дві групи, вибрані з

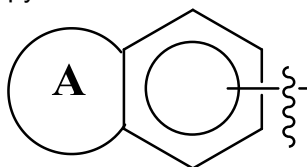
галогену,

гідрокси групи,

гетероциклоалкілу, що необов'язково містить як замісник одну або дві групи, вибрані з гідрокси групи, нижчої алкокси групи та нижчого алкілу,

нижчої алкокси групи, що необов'язково містить як замісник необов'язково заміщену аміно групу, та

нижчого алкілу, що необов'язково містить як замісник одну або дві групи, вибрані з гідрокси групи, нижчої алкокси групи та необов'язково заміщеної аміно групи; або



R_1 являє собою , де A вибраний з арильної, циклоалкільної та гетероциклоалкільної груп, кожна з яких містить від 5 до 7 атомів в кільці, включаючи атоми, спільні з 6-членним ароматичним кільцем, та кожна з яких необов'язково містить замісники.

Відповідно до деяких варіантів реалізації винаходу R_1 являє собою феніл, що містить як замісник одну або дві групи, вибрані з

гідрокси групи,

гетероциклоалкілу, що необов'язково містить як замісник одну або дві групи, вибрані з гідрокси групи, нижчої алкокси групи та нижчого алкілу,

аміно групи, що необов'язково містить як замісник одну або дві групи, вибрані з нижчого алкілу, нижчого алкілу, що містить як замісник гідрокси групу, та нижчого алкілу, що містить як замісник нижчу алкокси групу,

нижчої алкокси групи, що необов'язково містить як замісник одну або дві групи, вибрані з гідрокси та необов'язково заміщеної аміно групи, та

нижчого алкілу, що необов'язково містить як замісник одну або дві групи, вибрані з гідрокси групи, нижчої алкокси групи, трифторметилу та необов'язково заміщеної аміно групи.

Відповідно до деяких варіантів реалізації винаходу R_1 являє собою феніл, що містить як замісник одну або дві групи, вибрані з

гідрокси групи,

гетероциклоалкілу, що необов'язково містить як замісник одну або дві групи, вибрані з гідрокси групи, нижчої алкокси групи та нижчого алкілу,

нижчої алкокси групи, та

нижчого алкілу, що містить як замісник одну або дві групи, вибрані з гідрокси групи, нижчої алкокси групи, трифторметилу та необов'язково заміщеної аміно групи.

Відповідно до деяких варіантів реалізації винаходу R_1 вибраний з (1-гідроксициклобутил)фенілу, (1,1,1-трифтор-2-гідроксипропан-2-іл)фенілу, (2,2,2-трифтор-1-гідроксиетил)фенілу, (1,1,1,3,3,3-гексафтор-2-гідроксипропан-2-іл)фенілу, (2-гідрокси-2-метилпропокси)-3-метоксифенілу, (2-гідроксиетил)(метил)аміно-3-метоксифенілу, (2-метоксиетил)(метил)аміно-3-метоксифенілу, (1-гідроксиетил)фенілу, 3,4-диметоксифенілу, 3-метоксифенілу, 4-етокси-3-метоксифенілу, 4-гідроксиметил-3-метоксифенілу, 3-гідроксиметил-4-метоксифенілу, 2-фтор-4-метоксифенілу, 4-(диметиламіно)пропокси-3-метоксифенілу, 4-гідроксипропокси-3-метоксифенілу, 4-(2-гідрокси-1,1-диметилетил)фенілу, 4-(1-гідрокси-1-метилетил)фенілу, 4-метокси-3-(піролідін-1-іл)фенілу, 3-метокси-4-(піролідін-1-іл)фенілу, 3-метокси-4-(пропан-2-ілокси)фенілу, 3-метокси-4-(морфолін-4-іл)фенілу, 4-(піролідін-1-іл)фенілу, 4-(3-гідроксипіролідініл)фенілу, 4-(4-гідроксипіперидиніл)-3-метоксифенілу, 4-(3-гідроксизетидиніл)-3-метоксифенілу, 4-(3-гідроксипіролідініл)-3-метоксифенілу, 4-(2-метоксипропан-2-іл)фенілу, 4-(4-етилпіперазин-1-іл)-3-метоксифенілу, 4-(4-етилпіперазин-1-іл)фенілу, 4-(3-гідрокси-3-метилпіперидиніл)фенілу та 3-гідроксиметилфенілу.

Відповідно до деяких варіантів реалізації винаходу R_1 являє собою феніл, що містить як замісник одну або дві групи, вибрані з

гідрокси групи,

гетероциклоалкілу, що необов'язково містить як замісник одну або дві групи, вибрані з

гідрокси групи, нижчої алкокси групи та нижчого алкілу,

нижчої алкокси групи, що необов'язково містить як замісник необов'язково заміщену аміно групу, та

нижчого алкілу, що необов'язково містить як замісник одну або дві групи, вибрані з гідрокси групи, нижчої алкокси групи та необов'язково заміщеної аміно групи.

Відповідно до деяких варіантів реалізації винаходу R_1 являє собою феніл, що містить як замісник одну або дві групи, вибрані з

гідрокси групи,

гетероциклоалкілу, що необов'язково містить як замісник одну або дві групи, вибрані з гідрокси групи, нижчої алкокси групи та нижчого алкілу,

нижчої алкокси групи, та

нижчого алкілу, що містить як замісник одну або дві групи, вибрані з гідрокси групи, нижчої алкокси групи та необов'язково заміщеної аміно групи.

Відповідно до деяких варіантів реалізації винаходу R_1 являє собою феніл, що містить як замісник одну або дві групи, вибрані з

гідрокси групи,

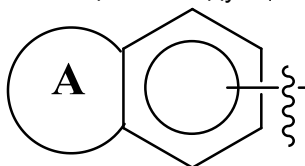
гетероциклоалкілу, що необов'язково містить як замісник одну або дві групи, вибрані з гідрокси та нижчого алкілу,

нижчої алкокси групи, та

нижчого алкілу, що містить як замісник одну або дві групи, вибрані з гідрокси та нижчої алкокси групи.

Відповідно до деяких варіантів реалізації винаходу R_1 вибраний з (1-гідроксиетил)фенілу, 3,4-диметоксифенілу, 3-метоксифенілу, 4-етокси-3-метоксифенілу, 4-гідроксиметил-3-метоксифенілу, 3-гідроксиметил-4-метоксифенілу, 2-фтор-4-метоксифенілу, 4-(диметиламіно)пропокси-3-метоксифенілу, 4-гідроксипропокси-3-метоксифенілу, 4-(2-гідрокси-1,1-диметилетил)фенілу, 4-(1-гідрокси-1-метилетил)фенілу, 4-метокси-3-(піролідин-1-іл)фенілу, 3-метокси-4-(піролідин-1-іл)фенілу, 3-метокси-4-(пропан-2-ілокси)фенілу, 3-метокси-4-(морфолін-4-іл)фенілу, 4-(піролідин-1-іл)фенілу, 4-(3-гідроксипіролідиніл)фенілу, 4-(4-гідроксипіперидиніл)-3-метоксифенілу, 4-(3-гідроксизетидиніл)-3-метоксифенілу, 4-(3-гідроксипіролідиніл)-3-метоксифенілу, 4-(2-метоксипропан-2-іл)фенілу, 4-(4-етилпіперазин-1-іл)-3-метоксифенілу, 4-(4-етилпіперазин-1-іл)фенілу, 4-(3-гідрокси-3-метилпіперидиніл)фенілу та 3-гідроксиметилфенілу.

Відповідно до деяких варіантів реалізації винаходу R_1 являє собою



35

Відповідно до деяких варіантів реалізації винаходу A являє собою необов'язково заміщену гетероциклоалкілну групу, що містить один або більше гетероатомів, вибраних з O та N. Відповідно до деяких варіантів реалізації винаходу гетероциклоалкільна група містить як замісник одну або більше груп, вибраних з нижчого алкілу та оксо. Відповідно до деяких варіантів реалізації винаходу гетероатом N містить як замісник нижчий алкіл.

40

Відповідно до деяких варіантів реалізації винаходу R_1 вибраний з 3,4-дигідро-2H-бензо[b][1,4]оксазин-6-ілу, 4-метил-3,4-дигідро-2H-бензо[b][1,4]оксазин-6-ілу, 2,3,4,5-тетрагідробензо[b][1,4]оксазепін-7-ілу, 5-метил-2,3,4,5-тетрагідробензо[b][1,4]оксазепін-7-ілу, 2,3-дигідро-1H-індол-2-он-6-ілу та 2,3-дигідро-1H-індол-2-он-5-ілу.

45

Відповідно до деяких варіантів реалізації винаходу R_2 вибраний з необов'язково заміщеного гетероарилу;

дигідробензоксазинілу, що необов'язково містить як замісник одну або більше груп, вибраних з нижчого алкілу, галогену та оксо групи,

50

дигідрохіноксалінілу, що необов'язково містить як замісник одну або більше груп, вибраних з нижчого алкілу та оксо;

дигідробензодіазолілу, що необов'язково містить як замісник оксо;

дигідроіндолілу, що необов'язково містить як замісник одну або більше груп, вибраних з нижчого алкілу та оксо групи, та

55

фенілу, що містить як замісник одну або більше груп, вибраних з необов'язково заміщеного алкілу, ціано, нітро, нижчої алкокси групи, галогену, сульфонілу, необов'язково заміщеної аміно групи та необов'язково заміщеного гетероарилу.

Відповідно до деяких варіантів реалізації винаходу R_2 вибраний з необов'язково заміщеного піридинілу, піримідинілу, тіофенілу, хінолінілу, що необов'язково містить як замісник аміно групи, індазолілу, що необов'язково містить як замісник одну або дві групи, вибрані з карбамоїлу, галогену, нижчого алкілу та аміно групи, індолілу, що необов'язково містить як замісник одну або дві групи, вибрані з нижчого алкілу, карбамоїлу, бензоімідазолілу, що необов'язково містить як замісник метил або аміно групи, бензотіозолілу, що необов'язково містить як замісник нижчий алкіл, бензоксазолілу, бензотриазолілу, хіноксалінілу, що необов'язково містить як замісник аміно групи, хіназолінілу, що необов'язково містить як замісник аміно групи, дигідробензоксазинілу, що необов'язково містить як замісник одну або більше груп, вибраних з метилу, галогену та оксо групи, 1Н-піроло[3,2-*b*]піридинілу, дигідробензоксазинілу, що необов'язково містить як замісник одну або більше груп, вибраних з нижчого алкілу, галогену та оксо групи, дигідроіндолілу, що необов'язково містить як замісник одну або більше груп, вибраних з нижчого алкілу та оксо групи, та фенілу, що містить як замісник одну або більше груп, вибраних з необов'язково заміщеного алкілу, ціано, хлору, фтору, нітро, метокси, сульфонілу, гетероарилу, аміно та $NHC(O)R_{12}$, де R_{12} являє собою нижчий алкіл.

Відповідно до деяких варіантів реалізації винаходу R_2 вибраний з 2,3-дигідро-1,4-бензодіоксин-6-ілу, 4-метил-3,4-дигідро-2Н-1,4-бензоксазин-6-ілу, 1,3-бензоксазол-5-ілу, 2Н-1,3-бензодіоксол-5-ілу, 2,3-дигідро-1Н-індол-6-ілу, 2-метил-1,2,3,4-тетрагідроізохінолін-6-ілу, 1-метил-2,3-дигідро-1Н-індол-2-он-6-ілу, 1,2,3,4-тетрагідроізохінолін-2-іла-етан-1-он-6-ілу, 2-етил-1,2,3,4-тетрагідроізохінолін-7-ілу, 2-амінохіназолін-6-ілу, 2-гідроксиетил-2Н-індазол-6-ілу, 1-гідроксиетил-2Н-індазол-6-ілу, 1Н-індазол-7-ілу, 1,2,3,4-тетрагідроізохінолін-6-ілу, 3-(діетиламіно)метил-1Н-індазол-6-ілу, 1,2-дигідрохіноксалін-2-он-6-ілу, 1,2-дигідрохінолін-2-он-6-ілу, 1Н-піразол-4-ілу, 1,3-тіазол-5-ілу, 2-метил-1,3-бензотіазол-5-ілу, 1'2'-дигідроспіро[циклопропан-1,3'-індол]-2'-он-6-ілу, 3,3-диметил-2-оксо-2,3-дигідро-1Н-індол-6-ілу, 3-(1,3-тіазол-4-іламетиліден)-2,3-дигідро-1Н-індол-2-он-6-ілу, 1-метил-1Н-індазол-6-ілу, (N,N-диметиламінокарбоніл)індол-6-ілу, 1,3-бензотіазол-5-ілу, 1,3-бензотіазол-6-ілу, 1Н,2Н,3Н-піридо[2,3-*b*][1,4]оксазин-2-он-6-ілу, 2,2-дифтор-3,4-дигідро-2Н-1,4-бензоксазин-3-он-6-ілу, 3-етил-1Н-індазол-6-ілу, 1Н-індол-2-ілу, 1Н-індол-3-ілу, 4-фтор-1Н-індазол-6-ілу, 1Н-1,2,3-бензотриазол-6-ілу, 2,3-дигідро-1Н-1,3-бензодіазол-2-он-6-ілу, 1Н-1,3-бензодіазол-6-ілу, 1Н-індол-6-ілу, 1Н-піроло[3,2-*b*]піридин-6-ілу, 1-метил-1Н-1,3-бензодіазол-5-ілу, 1-метил-1Н-1,3-бензодіазол-6-ілу, 1-метил-1Н-бензо[*d*]імідазол-5-ілу, 2-метил-1Н-бензо[*d*]імідазол-5-ілу, 2-оксоіндолін-6-ілу, 3,3-диметил-2-оксоіндолін-6-ілу, 3,4-дигідро-2Н-1,4-бензоксазин-6-ілу, 3,4-дигідро-2Н-1,4-бензоксазин-7-ілу, 3-аміно-1Н-індазол-5-ілу, 3-аміно-1Н-індазол-6-ілу, 3-карбамоїл-1Н-індазол-6-ілу, 3-метил-1Н-індазол-6-ілу, 3-оксо-3,4-дигідро-2Н-бензо[*b*][1,4]оксазин-6-ілу, 4-(1-гідрокси-2-метилпропан-2-іл)фенілу, 5-фтор-1Н-індазол-6-ілу та індолін-6-ілу.

Відповідно до деяких варіантів реалізації винаходу R_2 вибраний з необов'язково заміщеного гетероарилу, дигідробензоксазинілу, що необов'язково містить як замісник нижчий алкіл та оксо групи, та фенілу, що містить як замісник одну або більше груп, вибраних з необов'язково заміщеного алкілу, ціано, нітро, нижчої алкокси групи, галогену, сульфонілу, необов'язково заміщеної аміно групи та необов'язково заміщеного гетероарилу.

Відповідно до деяких варіантів реалізації винаходу R_2 вибраний з необов'язково заміщеного піридинілу, піримідинілу, тіофенілу, хінолінілу, що необов'язково містить як замісник аміно групи, індазолілу, що необов'язково містить як замісник галоген, карбамоїл, метил або аміно групи, індолілу, індолінілу, що необов'язково містить як замісник одну або дві групи, вибрані з нижчого алкілу та оксо групи, бензоімідазолілу, що необов'язково містить як замісник метил або аміно групи, бензотіозолілу, бензоксазолілу, бензотриазолілу, хіноксалінілу, що необов'язково містить як замісник аміно групи, хіназолінілу, що необов'язково містить як замісник аміно групи, дигідробензоксазинілу, що необов'язково містить як замісник метил та оксо групи, 1Н-піроло[3,2-*b*]піридинілу та фенілу, що містить як замісник одну або більше груп, вибраних з

необов'язково заміщеного алкілу, ціано, хлору, фтору, нітро, метокси, сульфонілу, гетероарилу, аміно та $\text{NHC}(\text{O})\text{R}_{12}$, де R_{12} являє собою нижчий алкіл.

Відповідно до деяких варіантів реалізації винаходу R_2 вибраний з 1Н-1,3-бензодіазол-6-ілу, 1Н-індол-6-ілу, 1Н-піроло[3,2-б]піридин-6-ілу, 1-метил-1Н-1,3-бензодіазол-5-ілу, 1-метил-1Н-1,3-бензодіазол-6-ілу, 1-метил-1Н-бензо[д]імідазол-5-ілу, 2-метил-1Н-бензо[д]імідазол-5-ілу, 2-оксоіндолін-6-ілу, 3,3-диметил-2-оксоіндолін-6-ілу, 3,4-дигідро-2Н-1,4-бензоксазин-6-ілу, 3,4-дигідро-2Н-1,4-бензоксазин-7-ілу, 3-аміно-1Н-індазол-5-ілу, 3-аміно-1Н-індазол-6-ілу, 3-карбамоїл-1Н-індазол-6-ілу, 3-метил-1Н-індазол-6-ілу, 3-оксо-3,4-дигідро-2Н-бензо[б][1,4]оксазин-6-ілу, 4-(1-гідрокси-2-метилпропан-2-іл)фенілу, 5-фтор-1Н-індазол-6-ілу та індолін-6-ілу.

Відповідно до деяких варіантів реалізації винаходу R_2 вибраний з необов'язково заміщеного піридинілу, піримідинілу, тіофенілу, хінолінілу, що необов'язково містить як замісник аміно групи, індазолілу, що необов'язково містить як замісник метил або аміно групи, індолілу, бензоімідазолілу, що необов'язково містить як замісник метил або аміно групи, бензотіазолілу, бензоксазолілу, бензотріазолілу, хіноксалінілу, що необов'язково містить як замісник аміно групи, хіназолінілу, що необов'язково містить як замісник аміно групи, дигідробензоксазинілу, що необов'язково містить як замісник метил та оксо групи, та фенілу, що містить як замісник одну або більше груп, вибраних з необов'язково заміщеного алкілу, ціано, хлор, фтору, нітро, метокси, сульфонілу, гетероарилу, аміно та $\text{NHC}(\text{O})\text{R}_{12}$, де R_{12} являє собою нижчий алкіл.

Відповідно до деяких варіантів реалізації винаходу R_2 вибраний з 3-метилфенілу, 4-метилфенілу, 3-нітрофенілу, 3-[(етиламіно)метил]фенілу, 4-[(етиламіно)метил]фенілу, 3-(трифторметил)фенілу, 3-метоксифенілу, 4-піридиніл, 3-піридиніл, 4-ціанофенілу, 3-ціанофенілу, 4-хлорфенілу, 3-хлорфенілу, 4-хлор-3-метилфенілу, 3-хлор-4-метилфенілу, 4-фторфенілу, 3-фторфенілу, 4-фтор-3-метилфенілу, 3-фтор-4-метилфенілу, 3,4-дифторфенілу, 4-сульфонамідофенілу, 3-сульфонамідофенілу, 4-метансульфонілфенілу, 3-метансульфонілфенілу, 2-фторпіридин-4-ілу, 5-метилпіридин-3-ілу, 5-хлорпіридин-3-ілу, піримідин-5-ілу, (4-ацетилпіперазин-1-іл)метилфенілу, (3-ацетилпіперазин-1-іл)метилфенілу, (3-піперазин-1-іламетил)фенілу, (4-піперазин-1-іламетил)фенілу, 3-ацетамідофенілу, 4-ацетамідофенілу, 4-амінофенілу, 3-амінофенілу, тіофен-3-ілу, тіофен-2-ілу, 1Н-індазол-5-ілу, 1Н-індазол-6-ілу, 3-аміно-1Н-індазол-5-ілу, 1-метил-1Н-індазол-5-ілу, 1-метил-1Н-індазол-6-ілу, 3-метил-1Н-індазол-5-ілу, 2,3-диметил-2Н-індазол-5-ілу, 3-аміно-1Н-індазол-6-ілу, 3-аміно-1Н-індазол-5-ілу, 4-(1Н-імідазол-2-іл)фенілу, 4-(1Н-імідазол-5-іл)фенілу, 3-(1Н-імідазол-5-іл)фенілу, хінолін-6-ілу, 2-амінохінолін-6-ілу, 3-амінохінолін-6-ілу, 1,3-бензотіазол-5-ілу, 1,3-бензотіазол-6-ілу, 2-амінохіназолін-6-ілу, 3-(1,3-тіазол-2-іл)фенілу, 4-(1,3-тіазол-2-іл)фенілу, 3-(1,3-тіазол-2-іл)фенілу, 1,2-дигідропіридин-2-он-5-ілу, 4-(1,3-оксазол-2-іл)фенілу, 3-(1,3-оксазол-2-іл)фенілу, 2-амінопіридин-5-ілу, 1Н-1,2,3-бензотріазол-6-ілу, 1Н-імідазо[4,5-б]піридин-6-ілу, 1,3-бензоксазол-5-ілу, 1,3-бензоксазол-6-ілу, 1Н-індол-6-ілу, 1Н-індол-5-ілу, 1-метил-1Н-1,3-бензодіазол-5-ілу, 2-аміно-1Н-1,3-бензодіазол-6-ілу, 1-метил-1Н-1,3-бензодіазол-6-ілу, 2Н,3Н,4Н-піридо[3,2-б][1,4]оксазин-3-он-6-ілу, 1Н,2Н,3Н-піридо[3,2-б][1,4]оксазин-3-он-6-ілу, 3,4-дигідро-2Н-1,4-бензоксазин-3-он-6-ілу, 3,4-дигідро-2Н-1,4-бензоксазин-3-он-7-ілу, 4-метил-3,4-дигідро-2Н-1,4-бензоксазин-3-он-6-ілу, 2-метил-3,4-дигідро-2Н-1,4-бензоксазин-3-он-6-ілу, 2,2-диметил-3,4-дигідро-2Н-1,4-бензоксазин-3-он-6-ілу, 2-гідроксихінолін-6-ілу, 1-метил-1,2-дигідропіридин-2-он-5-ілу та хіноксалін-2-ол-7-ілу.

Також запропонована щонайменше одна хімічна сполука, вибрана з:

- N-(3,4-диметоксифеніл)-6-(3-метилфеніл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
- N-(3,4-диметоксифеніл)-6-(3-нітрофеніл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
- N-(3,4-диметоксифеніл)-6-{3-[(етиламіно)метил]феніл}імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
- N-(3,4-диметоксифеніл)-6-{3-(трифторметил)феніл}імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
- N-(3,4-диметоксифеніл)-6-(3-метоксифеніл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
- N-(3,4-диметоксифеніл)-6-(піридин-4-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
- N-(3,4-диметоксифеніл)-6-(піридин-3-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
- N-(3,4-диметоксифеніл)-6-фенілімідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
- 3-{8-[(3,4-диметоксифеніл)аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл}бензонітрилу;
- N-(3,4-диметоксифеніл)-6-(4-фторфеніл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
- 4-{8-[(3,4-диметоксифеніл)аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл}бензол-1-сульфонаміду;
- N-(3,4-диметоксифеніл)-6-{4-[(етиламіно)метил]феніл}імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
- 6-(4-хлорфеніл)-N-(3,4-диметоксифеніл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
- 6-(3-хлорфеніл)-N-(4-етокси-3-метоксифеніл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
- N-(3,4-диметоксифеніл)-6-(4-метансульфонілфеніл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
- 4-{8-[(3,4-диметоксифеніл)аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл}бензонітрилу;

- N-(3,4-диметоксифеніл)-6-(4-метилфеніл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 N-(4-етокси-3-метоксифеніл)-6-(3-метилфеніл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 N-(4-етокси-3-метоксифеніл)-6-(3-фторфеніл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 6-(3,4-дифторфеніл)-N-(4-етокси-3-метоксифеніл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 5 6-(4-хлор-3-метилфеніл)-N-(4-етокси-3-метоксифеніл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 3-{8-[(4-етокси-3-метоксифеніл)аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл}бензол-1-сульфонамід;
 N-(4-етокси-3-метоксифеніл)-6-(3-метансульфонілфеніл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 N-(4-етокси-3-метоксифеніл)-6-(4-фтор-3-метилфеніл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 N-(4-етокси-3-метоксифеніл)-6-(3-фтор-4-метилфеніл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 10 6-(3-хлор-4-метилфеніл)-N-(4-етокси-3-метоксифеніл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 N-(4-етокси-3-метоксифеніл)-6-(2-фторпіридин-4-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 N-(4-етокси-3-метоксифеніл)-6-(5-метилпіридин-3-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 6-(5-хлорпіридин-3-іл)-N-(4-етокси-3-метоксифеніл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 N-(4-етокси-3-метоксифеніл)-6-(піримідин-5-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 15 1-{4-[(4-{8-[(4-етокси-3-метоксифеніл)аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл}феніл)-
 метил]піперазин-1-іл}етан-1-ону;
 1-{4-[(3-{8-[(3,4-диметоксифеніл)аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл}феніл)-метил]піперазин-1-
 іл}етан-1-ону;
 N-(3,4-диметоксифеніл)-6-[3-(піперазин-1-ілметил)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 20 N-(3,4-диметоксифеніл)-6-[4-(піперазин-1-ілметил)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 6-(2,3-дигідро-1,4-бензодіоксин-6-іл)-N-(3,4-диметоксифеніл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 N-(3-{8-[(3,4-диметоксифеніл)аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл}феніл)ацетамід;
 6-(3-амінофеніл)-N-(3,4-диметоксифеніл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 N-(4-{8-[(3,4-диметоксифеніл)аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл}феніл)ацетамід;
 25 N-(3,4-диметоксифеніл)-6-(тіофен-3-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 N-(3,4-диметоксифеніл)-6-(1H-індазол-5-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 N-(3,4-диметоксифеніл)-6-[4-(1H-індазол-2-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 N-(3,4-диметоксифеніл)-6-(хінолін-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 N-(3,4-диметоксифеніл)-6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 30 6-{8-[(3,4-диметоксифеніл)аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл}-3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-3-
 ону;
 6-(1,3-бензотіазол-5-іл)-N-(3,4-диметоксифеніл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 6-(1,3-бензотіазол-6-іл)-N-(3,4-диметоксифеніл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 6-{8-[(3,4-диметоксифеніл)аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл}хіназолін-2-аміну;
 35 N-(3,4-диметоксифеніл)-6-(тіофен-2-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 3-аміно-5-{8-[(3,4-диметоксифеніл)аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл}-1-метил-1,2-
 дигідропіридин-2-ону;
 6-{8-[(3,4-диметоксифеніл)аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл}хінолін-2-аміну;
 6-(4-амінофеніл)-N-(3,4-диметоксифеніл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 40 6-(1H-1,3-бензодіазол-5-іл)-N-(3,4-диметоксифеніл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 N-(3,4-диметоксифеніл)-6-[3-(1H-індазол-5-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 7-{8-[(3,4-диметоксифеніл)аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл}-3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-3-
 ону;
 N-(4-етокси-3-метоксифеніл)-6-(1H-індазол-5-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 45 N-(3,4-диметоксифеніл)-6-[4-(1H-індазол-5-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 N-(4-етокси-3-метоксифеніл)-6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 6-(1,3-бензотіазол-6-іл)-N-(4-етокси-3-метоксифеніл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 N-(3,4-диметоксифеніл)-6-[3-(1,3-тіазол-2-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 N-(3,4-диметоксифеніл)-6-(1-метил-1H-1,3-бензодіазол-5-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 50 5-{8-[(3,4-диметоксифеніл)аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл}-1,2-дигідропіридин-2-ону;
 6-(1,3-бензотіазол-5-іл)-N-(4-етокси-3-метоксифеніл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 N-(3,4-диметоксифеніл)-6-[4-(1,3-оксазол-2-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 (3-{[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)метанолу;
 5-{8-[(3,4-диметоксифеніл)аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл}піридин-2-аміну;
 55 N-(3,4-диметоксифеніл)-6-[3-(1,3-оксазол-2-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 N-[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]-3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-6-аміну;
 1-(4-{[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)етан-1-олу;
 N-(3,4-диметоксифеніл)-6-[4-(1,3-тіазол-2-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 (5-{[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}-2-метоксифеніл)метанолу;
 60 N-(3,4-диметоксифеніл)-6-(1H-індол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;

- N-(3,4-диметоксифеніл)-6-(1-метил-1H-1,3-бензодіазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 N-(4-етокси-3-метоксифеніл)-6-(1-метил-1H-індазол-5-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 N-(4-етокси-3-метоксифеніл)-6-(1-метил-1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 N-(3,4-диметоксифеніл)-6-(1-метил-1H-індазол-5-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 5 6-(1H-1,2,3-бензотриазол-6-іл)-N-(3,4-диметоксифеніл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 N-(3,4-диметоксифеніл)-6-{1H-імідазо[4,5-b]піридин-6-іл}імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 6-(1,3-бензоксазол-5-іл)-N-(3,4-диметоксифеніл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 6-(1,3-бензоксазол-6-іл)-N-(3,4-диметоксифеніл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 6-{8-[(3,4-диметоксифеніл)аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл}-4-метил-3,4-дигідро-2H-1,4-
 10 бензоксазин-3-ону;
 N-(3,4-диметоксифеніл)-6-(1-метил-1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 N-(3,4-диметоксифеніл)-6-(1H-індол-5-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 6-{8-[(3,4-диметоксифеніл)аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл}хінолін-3-аміну;
 2-(4-{[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)пропан-2-олу;
 15 5-{8-[(3,4-диметоксифеніл)аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл}-1H-індазол-3-аміну;
 6-{8-[(3,4-диметоксифеніл)аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл}-1H-1,3-бензодіазол-2-аміну;
 6-{8-[(3,4-диметоксифеніл)аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл}-2H,3H,4H-піридо[3,2-
 b][1,4]оксазин-3-ону;
 6-{8-[(3,4-диметоксифеніл)аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл}-2-метил-3,4-дигідро-2H-1,4-
 20 бензоксазин-3-ону;
 6-{8-[(3,4-диметоксифеніл)аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл}-2,2-диметил-3,4-дигідро-2H-1,4-
 бензоксазин-3-ону;
 7-{8-[(3,4-диметоксифеніл)аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл}хінолін-2-олу;
 2-(4-{[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)-2-метилпропан-1-олу;
 25 6-{8-[(3,4-диметоксифеніл)аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл}-1H-індазол-3-аміну;
 (4-{[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}-2-метоксифеніл)метанолу;
 6-(2,3-дигідро-1H-індол-6-іл)-N-(3,4-диметоксифеніл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 N-[6-(3-аміно-1H-індазол-5-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]-3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-6-
 аміну;
 30 N-{4-[3-(диметиламіно)пропокси]-3-метоксифеніл}-6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-
 аміну;
 3-(4-{[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}-2-метоксифенокси)пропан-1-олу;
 6-(1H-індазол-6-іл)-N-[4-метокси-3-(піролідин-1-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 5-{[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}-2,3-дигідро-1H-індол-2-ону;
 35 7-{8-[(3,4-диметоксифеніл)аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл}хіноксалін-2-олу;
 7-{8-[(3,4-диметоксифеніл)аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл}-1H,2H,3H-піридо[2,3-
 b][1,4]оксазин-2-ону;
 N-[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]-4-метил-3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-7-
 аміну;
 40 N-(2-фтор-4-метоксифеніл)-6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 6-(1H-індазол-6-іл)-N-[3-метокси-4-(піролідин-1-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 N-[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]-2,3,4,5-тетрагідро-1,5-бензоксазепін-7-аміну;
 1-(4-{[6-(3-аміно-1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)етан-1-олу;
 6-(3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-6-іл)-N-(3,4-диметоксифеніл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 45 N-[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]-4-метил-3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-6-
 аміну;
 6-{[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}-2,3-дигідро-1H-індол-2-ону;
 N-(3,4-диметоксифеніл)-6-{1H-піроло[3,2-b]піридин-6-іл}імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 N-[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]-3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-7-аміну;
 50 6-{8-[(4-етокси-3-метоксифеніл)аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл}-1H-індазол-3-аміну;
 N-[6-(2-амінохіназолін-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]-4-метил-3,4-дигідро-2H-1,4-
 бензоксазин-6-аміну;
 2-метил-2-(4-{[6-(1-метил-1H-1,3-бензодіазол-5-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-
 іл]аміно}феніл)пропан-1-олу;
 55 6-(3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-6-іл)-N-(4-етокси-3-метоксифеніл)імідазо[1,2-а]піразин-8-
 аміну;
 N-[6-(2,3-дигідро-1H-індол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]-3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-6-
 аміну;
 (2-метокси-5-{[6-(1-метил-1H-1,3-бензодіазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-
 60 іл]аміно}феніл)метанолу;

- 6-(1H-індазол-6-іл)-N-{4-[2-метил-1-(морфолін-4-іл)пропан-2-іл]феніл}імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 N-[6-(1H-індол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]-3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-6-аміну;
 7-{8-[(4-метил-3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-7-іл)аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл}хіноксалін-2-олу;
 1-(4-{[6-(1,3-бензотіазол-5-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)етан-1-олу;
 6-(1H-1,2,3-бензотриазол-6-іл)-N-[3-метокси-4-(пропан-2-ілокси)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 5 5-(8-{[3-метокси-4-(піролідін-1-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-1H-індазол-3-аміну;
 10 2-(4-{[6-(2-амінохіназолін-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)пропан-2-олу;
 6-(1H-індазол-6-іл)-N-[3-метокси-4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 2-(4-{[6-(1,3-бензотіазол-5-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)пропан-2-олу;
 6-(8-{[4-(2-гідроксипропан-2-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-3-олу;
 15 6-(1H-індазол-6-іл)-N-(3-метоксифеніл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 6-(1H-індазол-6-іл)-N-(4-метоксифеніл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 2-(4-{[6-(1-метил-1H-1,3-бензодіазол-5-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)-пропан-2-олу;
 2-(4-{[6-(1-метил-1H-1,3-бензодіазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)-пропан-2-олу;
 20 1-(4-{[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}-2-метоксифеніл)піперидин-4-олу;
 6-(1H-індазол-6-іл)-N-[4-(піролідін-1-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 1-(4-{[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)піролідін-3-олу;
 2-(4-{[6-(4-метил-3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-7-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)пропан-2-олу;
 25 2-(4-{[6-(3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)пропан-2-олу;
 2-(4-{[6-(1,4-диметил-1,2,3,4-тетрагідрохіноксалін-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)пропан-2-олу;
 1-(4-{[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}-2-метоксифеніл)азетидин-3-олу;
 2-(4-{[6-(1H-індол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)пропан-2-олу;
 2-(4-{[6-(3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-7-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)пропан-2-олу;
 2-(4-{[6-(4-метил-3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)пропан-2-олу;
 35 2-(4-{[6-(2,3-диметил-2H-індазол-5-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)пропан-2-олу;
 2-(4-{[6-(3-метил-1H-індазол-5-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)пропан-2-олу;
 N-[3-метокси-4-(морфолін-4-іл)феніл]-6-(1-метил-1H-1,3-бензодіазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 40 6-(8-{[3-метокси-4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)хіназолін-2-аміну;
 1-(4-{[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)азетидин-3-олу;
 1-(4-{[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}-2-метоксифеніл)піролідін-3-олу;
 6-(3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-6-іл)-N-[3-метокси-4-(морфолін-4-іл)-феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 45 6-(1H-індазол-6-іл)-N-[4-(2-метоксипропан-2-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 N-(4-етокси-3-метоксифеніл)-6-(1H-індол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 N-[3-метокси-4-(морфолін-4-іл)феніл]-6-(1-метил-1H-1,3-бензодіазол-5-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 N-[4-(4-етилпіперазин-1-іл)-3-метоксифеніл]-6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 50 1-(4-{[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)-3-метилпіперидин-3-олу; та
 N-[4-(4-етилпіперазин-1-іл)феніл]-6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну,
 та фармацевтично прийнятних солей зазначених сполук.
 Також запропонована щонайменше одна хімічна сполука, вибрана з:
 6-(8-{[3-метокси-4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-1H-індазол-3-аміну;
 55 5-(8-{[3-метокси-4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-1H-індазол-3-аміну;
 6-(8-{[4-(2-гідроксипропан-2-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-2,3-дигідро-1H-індол-2-олу;
 1-(4-{[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)піперидин-4-олу;
 1-(4-{[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}-2-метоксифеноксид)-2-метилпропан-60 2-олу;

- 1-(4-{[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}-2-метоксифеніл)-4-метилпіперидин-4-олу;
 2-[(4-{[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}-2-метоксифеніл)-(метил)аміно]етан-1-олу;
 5 1-(4-{[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)-4-метилпіперидин-4-олу;
 4-{[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}фенолу;
 2-(4-{[6-(2,3-дигідро-1H-індол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)пропан-2-олу;
 1-(4-{[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)-3-метилпіролідін-3-олу;
 N-[3-метокси-4-(морфолін-4-іл)феніл]-6-(2-метил-1H-1,3-бензодіазол-5-іл)імідазо[1,2-
 10 а]піразин-8-аміну;
 N-(4-етокси-3-метоксифеніл)-6-(1-метил-1H-1,3-бензодіазол-5-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 (3R)-1-(4-{[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)піролідін-3-олу;
 (3R)-1-(4-{[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}-2-метоксифеніл)-піролідін-3-
 15 олу;
 (3S)-1-(4-{[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}-2-метоксифеніл)-піролідін-3-олу;
 [4-(4-{[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)морфолін-2-іл]метанолу;
 N-(4-етокси-3-метоксифеніл)-6-(1-метил-1H-1,3-бензодіазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-
 20 аміну;
 6-(5-фтор-1H-індазол-6-іл)-N-[3-метокси-4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 2-[1-(4-{[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)піперидин-4-іл]пропан-2-олу;
 25 (3S)-1-(4-{[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)піролідін-3-олу;
 N-[3-метокси-4-(морфолін-4-іл)феніл]-6-(3-метил-1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 1-(4-{[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}-2-метоксифеніл)-3-метилпіролідін-3-олу;
 30 6-(1H-1,3-бензодіазол-6-іл)-N-(4-етокси-3-метоксифеніл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 6-(8-{[3-метокси-4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-2,3-дигідро-1H-індол-2-ону;
 6-(8-{[3-метокси-4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-3,3-диметил-2,3-дигідро-1H-індол-2-ону;
 35 N-(4-етокси-3-метоксифеніл)-6-{1H-піроло[3,2-b]піридин-6-іл}імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 4-N-[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]-2-метокси-1-N-(2-метоксиетил)-1-N-метилбензол-1,4-діаміну;
 4-метил-1-(4-{[6-(1-метил-1H-1,3-бензодіазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}-феніл)піперидин-4-олу;
 40 6-(3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-7-іл)-N-[3-метокси-4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 6-(8-{[4-(1-гідрокси-2-метилпропан-2-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-3-ону;
 1-(4-{[6-(1H-1,3-бензодіазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)-2-метилпропан-2-
 45 олу;
 N-[3-метокси-4-(морфолін-4-іл)феніл]-6-{1H-піроло[3,2-b]піридин-6-іл}імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 2-(4-{[6-(1H-1,3-бензодіазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)-1,1,1,3,3,3-гексафторпропан-2-олу;
 50 2-метил-2-(4-{[6-(1-метил-1H-1,3-бензодіазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)пропан-1-олу;
 2-метил-2-[4-{[6-(1H-піроло[3,2-b]піридин-6-іл]імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл]пропан-1-олу;
 2,2,2-трифтор-1-(4-{[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)етан-1-олу;
 55 2-(4-{[6-(3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)-2-метилпропан-1-олу;
 6-(8-{[4-(4-гідрокси-4-метилпіперидин-1-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-3-ону;
 4-метил-1-[4-{[6-(1H-піроло[3,2-b]піридин-6-іл]імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]-аміно}феніл]піперидин-4-олу;
 60

- 1-(4-{[6-(1H-1,3-бензодіазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)-4-метилпіперидин-4-олу;
 6-(1H-індазол-6-іл)-N-[4-(1-метокси-2-метилпропан-2-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 4-метил-1-(4-{[6-(1-метил-1H-1,3-бензодіазол-5-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)піперидин-4-олу;
 6-(1H-1,3-бензодіазол-6-іл)-N-[3-метокси-4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 1,1,1-трифтор-2-(4-{[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)-пропан-2-олу;
 1-(4-{[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)-2-метилпропан-2-олу;
 1-(4-{[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)циклобутан-1-олу;
 1-(4-{[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}-2-метоксифеніл)-3-метилпіперидин-3-олу;
 4-N-[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]-1-N-(2-метоксиетил)-1-N-метилбензол-1,4-діаміну;
 6-{8-[(4-етокси-3-метоксифеніл)аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл}-1H-індазол-3-карбоксаміду;
 2-{[4-{[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл](метил)аміно}етан-1-олу;
 1-(4-{[6-(3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)-4-метилпіперидин-4-олу;
 6-(1H-індазол-6-іл)-N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]-6-{1H-піроло[3,2-b]піридин-6-іл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 1-(4-{[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)піперидин-3-олу;
 6-(1H-індол-6-іл)-N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 2-(4-{[6-(1H-1,3-бензодіазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)-2-метилпропан-1-олу;
 6-(8-{[4-(1-гідрокси-2-метилпропан-2-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-2,3-дигідро-1H-індол-2-олу;
 2-(4-{[6-(1H-індол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)-2-метилпропан-1-олу;
 6-{8-[(4-етокси-3-метоксифеніл)аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл}-2,3-дигідро-1H-індол-2-олу;
 2-(4-{[6-(3-аміно-1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)-2-метилпропан-1-олу;
 5-{8-[(4-етокси-3-метоксифеніл)аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл}-1H-індазол-3-аміну; та
 2-(4-{[6-(3-аміно-1H-індазол-5-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)-2-метилпропан-1-олу;
 та фармацевтично прийнятних солей зазначених сполук.
 Також запропонована щонайменше одна хімічна сполука, вибрана з:
 (3S)-1-(4-{[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}-2-метоксифеніл)-3-метилпіролідін-3-олу;
 (3R)-1-(4-{[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}-2-метоксифеніл)-3-метилпіролідін-3-олу;
 7-(8-{[4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-1,2-дигідрохіноксалін-2-олу;
 N,N-диметил-6-(8-{[4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-1H-індазол-3-карбоксаміду;
 5-(8-{[4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-2,3-дигідро-1H-1,3-бензодіазол-2-олу;
 1-(4-{[6-(3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)-2-метилпропан-2-олу;
 N-метил-2-(4-{[6-(2-оксо-2,3-дигідро-1H-індол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}фенокси)ацетаміду;
 N-[3-(8-{[4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)феніл]метансульфонаміду;
 N-[4-(8-{[4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)феніл]метансульфонаміду;
 [(2S)-4-(4-{[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)морфолін-2-іл]метанолу;
 [(2R)-4-(4-{[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)морфолін-2-іл]метанолу;
 6-(8-{[4-(2-гідрокси-2-метилпропіл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-3-олу;
 1-(4-{[6-(3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-7-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}-2-метоксифеніл)-4-метилпіперидин-4-олу;
 N-(2-гідроксиетил)-N-метил-6-(8-{[4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-1H-індол-3-карбоксаміду;
 6'-(8-{[4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-1',2'-дигідро-спіро[циклопропан-1,3'-індол]-2'-олу;

- 3-метил-1-(4-[[6-(1-метил-1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно]феніл)азетидин-3-олу;
- 4-[[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно]-2-метоксифенолу;
- N-[3-метокси-4-(морфолін-4-іл)феніл]-6-(6-метоксипіридин-3-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
- 6-(1H-1,2,3-бензотриазол-6-іл)-N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
- N,N-диметил-6-(8-[[4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-1H-індол-3-карбоксаміду;
- N-[3-метокси-4-(морфолін-4-іл)феніл]-6-(5-метоксипіридин-3-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
- 6-(8-[[4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-1H-індазол-3-аміну;
- 7-[8-{{4-[(3S)-3-гідроксипіролідін-1-іл]феніл}аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл]-1H,2H,3H-піридо[2,3-b][1,4]оксазин-2-ону;
- 4-[[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно]-N-метил-N-(оксан-4-іл)бензаміду;
- 6-(3-етил-1H-індазол-6-іл)-N-{4-[2-метил-1-(морфолін-4-іл)пропан-2-іл]феніл}імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
- 2,2-дифтор-6-(8-[[4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-3-ону;
- 1-(4-[[6-(3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-7-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно]-2-метоксифеніл)-3-метилазетидин-3-олу;
- 6-(1H-індол-2-іл)-N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
- (3S)-1-(4-[[6-(3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-7-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно]-2-метоксифеніл)піролідін-3-олу;
- 1-(4-[[6-(4-фтор-1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно]феніл)-3-метилазетидин-3-олу;
- 6-(1H-індазол-6-іл)-N-[4-(2H-1,2,3,4-тетразол-5-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
- 7-(8-[[4-(3-гідрокси-3-метилазетидин-1-іл)феніл]аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-1H,2H,3H-піридо[2,3-b][1,4]оксазин-2-ону;
- 6-(1H-індазол-6-іл)-N-[3-метокси-4-(2-метоксиетокси)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
- 6-(2-етил-1,2,3,4-тетрагідроізохінолін-6-іл)-N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
- 4-[[6-(3,3-диметил-2-оксо-2,3-дигідро-1H-індол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно]-N-пропілбензаміду;
- 6-(8-[[3-етокси-4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-3,3-диметил-2,3-дигідро-1H-індол-2-ону;
- 6-(1H-індол-3-іл)-N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
- 6-(1,3-бензотіазол-5-іл)-N-{4-[2-метил-1-(морфолін-4-іл)пропан-2-іл]феніл}імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
- (3E)-6-(8-[[4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-3-(1,3-тіазол-4-ілметиліден)-2,3-дигідро-1H-індол-2-ону;
- 4-[[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно]-N-(оксан-4-іл)бензаміду;
- 6-(2-метил-1,3-бензотіазол-5-іл)-N-{4-[2-метил-1-(морфолін-4-іл)пропан-2-іл]феніл}імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
- 6-(2,3-дигідро-1,4-бензодіоксин-6-іл)-N-[3-метокси-4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
- 6-(1H-індазол-6-іл)-N-[4-(2-метоксиетокси)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
- 6-(8-[[4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)хіназолін-2-аміну;
- 6-(8-[[4-(4-гідрокси-4-метилпіперидин-1-іл)феніл]аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-3,3-диметил-2,3-дигідро-1H-індол-2-ону;
- 6-(1H-індазол-6-іл)-N-{4-[(2S)-оксолан-2-ілметокси]феніл}імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
- 6-(3-етил-1H-індазол-6-іл)-N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
- N-(2,3-дигідро-1,4-бензодіоксин-6-іл)-6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
- N-(2H-1,3-бензодіоксол-5-іл)-6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
- 1-(2-етокси-4-[[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно]феніл)-4-метилпіперидин-4-олу;
- 6-[8-{{4-[(3S)-3-гідроксипіролідін-1-іл]феніл}аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл]-3,3-диметил-2,3-дигідро-1H-індол-2-ону;
- 6-(8-[[4-(3-гідрокси-3-метилазетидин-1-іл)феніл]аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-3,3-диметил-2,3-дигідро-1H-індол-2-ону;
- 6-(2H-1,3-бензодіоксол-5-іл)-N-[3-метокси-4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
- 6-(1H-індол-6-іл)-N-{4-[2-метил-1-(морфолін-4-іл)пропан-2-іл]феніл}імідазо[1,2-а]піразин-8-

- аміну;
 6-(1H-індазол-6-іл)-N-[4-(піридин-4-ілокси)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 (3E)-6-(8-([4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно)імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-3-(піридин-4-ілметиліден)-
 2,3-дигідро-1H-індол-2-ону;
 5 4-([6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно)-N-(оксетан-3-іл)бензаміду;
 6-{3-([діетиламіно)метил]-1H-індазол-6-іл)-N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 1-([4-([6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно)феніл]карбоніл)-3-метилазетидин-3-олу;
 10 [6-(8-([4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно)імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-1H-індазол-3-іл]метанолу;
 N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]-6-(1H-піразол-4-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 6-(4-фтор-1H-індазол-6-іл)-N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]-6-{1H,2H,3H-піридо[2,3-b][1,4]оксазин-6-іл}імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 15 N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]-6-(1,3-тіазол-5-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 {4-([4-([6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно)феніл]карбоніл]морфолін-2-іл]метанолу;
 1-([4-([6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно)феніл]карбоніл]піперидин-4-олу;
 N-етил-N-(2-гідроксиетил)-4-([6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно)бензаміду;
 20 2-(4-([6-(3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно)-2-метоксифенокси)-N-метилацетаміду;
 7-(8-([4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно)імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-1,2-дигідрохінолін-2-ону;
 6-(2-етил-1,2,3,4-тетрагідроізохінолін-7-іл)-N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 25 1-([4-([6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно)феніл]карбоніл)-4-метилпіперидин-4-олу;
 4-([6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно)-2-метоксибензойної кислоти;
 6-(1H-індазол-6-іл)-N-{4-([4-метилпіперазин-1-іл]карбоніл]феніл}імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 30 1-([4-([6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно)феніл]карбоніл]азетидин-3-олу;
 3,3-диметил-6-(8-([4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно)імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-2,3-дигідро-1H-індол-2-ону;
 6-(1H-індазол-6-іл)-N-[4-(1-метилпіперидин-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 2-(4-([6-(4-фтор-1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно)феніл)-2-метилпропан-1-олу;
 35 2-[етил(4-([6-(4-фтор-1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно)феніл)-аміно]етан-1-олу;
 6-(1H-індазол-7-іл)-N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 6-[8-([4-([етил(2-гідроксиетил)аміно)феніл]аміно)імідазо[1,2-а]піразин-6-іл]-3,3-диметил-2,3-дигідро-1H-індол-2-ону;
 40 N-{4-[2-(диметиламіно)етокси]феніл}-6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 6-(3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-6-іл)-N-{4-[2-(диметиламіно)-етокси]феніл}імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 1-(4-([6-(3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно)феніл)-3-метилазетидин-3-олу;
 45 2-[6-(8-([4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно)імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-2H-індазол-2-іл]етан-1-олу;
 3-(2-етокси-4-([6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно)фенокси)-2,2-диметилпропан-1-олу;
 3-(4-([6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно)фенокси)-2,2-диметилпропан-1-олу;
 2-(4-([6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно)-2-метоксифенокси)-N-метилацетаміду;
 50 2-(4-([6-(3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно)фенокси)-N-метилацетаміду;
 2-(4-([6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно)фенокси)-N-метилацетаміду;
 2-(4-([6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно)фенокси)оцтової кислоти;
 55 N-(2-гідроксиетил)-4-([6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно)-2-метоксибензаміду;
 6-(1,3-бензотіазол-5-іл)-N-[3-етокси-4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 6-(1H-індазол-6-іл)-N-{3-метокси-4-[(2R)-оксолан-2-ілметокси]феніл}імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 60 6-(1H-індазол-6-іл)-N-{4-[(2R)-оксолан-2-ілметокси]феніл}імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;

- 6-(8-{[4-(3-гідрокси-3-метилазетидин-1-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-3,4-дигідро-2Н-1,4-бензоксазин-3-ону;
- 6-(1Н-індазол-6-іл)-N-[4-(морфолін-4-ілкарбоніл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
- N-(2-гідроксиетил)-4-{[6-(1Н-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}-N-метилбензаміду;
- 2-{[2-етокси-4-{[6-(1Н-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл](метил)-аміно}етан-1-олу;
- N-[2-(диметиламіно)етил]-4-{[6-(1Н-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}-N-метилбензаміду;
- 1-(2-фтор-4-{[6-(1Н-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)-3-метилазетидин-3-олу;
- (3S)-1-(4-{[6-(4-фтор-1Н-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)-піролідін-3-олу;
- 2-[6-(8-{[4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-1Н-індазол-1-іл]етан-1-олу;
- 6-(8-{[4-(3-гідрокси-3-метилазетидин-1-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-2,3-дигідро-1Н-індол-2-ону;
- N-[6-(1Н-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]-2-метил-1,2,3,4-тетрагідроізохінолін-6-аміну;
- N-[3-етокси-4-(морфолін-4-іл)феніл]-6-(4-фтор-1Н-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
- 1-(2-етокси-4-{[6-(1Н-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}фенокси)-2-метилпропан-2-олу;
- (3R)-3-(4-{[6-(1Н-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)-1,4-диметилпіперазин-2-олу;
- N-(2-гідроксиетил)-4-{[6-(1Н-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}бензаміду;
- 6-(8-{[3-етокси-4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-2,3-дигідро-1Н-індол-2-ону;
- 6-(3,4-дигідро-2Н-1,4-бензоксазин-6-іл)-N-[3-етокси-4-(морфолін-4-іл)-феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
- 1-(4-{[6-(1Н-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)-N,N-диметилпіперидин-4-аміну;
- 1-(4-{[6-(1,3-бензотіазол-5-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}фенокси)-2-метилпропан-2-олу;
- (3R)-1-(2-етокси-4-{[6-(1Н-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)піролідін-3-олу;
- 2-(4-{[6-(1Н-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}фенокси)етан-1-олу;
- 1-(2-етокси-4-{[6-(1Н-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)-3-метилазетидин-3-олу;
- 1-(4-{[6-(1Н-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}-2-метоксифеніл)-3-метилазетидин-3-олу;
- 4-{[6-(1Н-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}бензойної кислоти;
- N-[3-етокси-4-(4-етилпіперазин-1-іл)феніл]-6-(1Н-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
- 4-{[6-(1Н-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}-N-пропілбензаміду;
- 1-(4-{[6-(4-фтор-1Н-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)-4-метилпіперидин-4-олу;
- 3-(4-{[6-(1Н-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}-2-метоксифенокси)-2,2-диметилпропан-1-олу;
- 6-(4-фтор-1Н-індазол-6-іл)-N-[4-(1,4-оксазепан-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
- 6-(8-{[3-етокси-4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-3,4-дигідро-2Н-1,4-бензоксазин-3-ону;
- 1-(4-{[6-(3,4-дигідро-2Н-1,4-бензоксазин-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}фенокси)-2-метилпропан-2-олу;
- 2-метил-1-(4-{[6-(1-метил-1Н-1,3-бензодіазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}фенокси)пропан-2-олу;
- 6-(8-{[4-(2-гідрокси-2-метилпропокси)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-2,3-дигідро-1Н-індол-2-ону;
- N-[3-фтор-4-(морфолін-4-іл)феніл]-6-(1Н-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
- 1-(4-{[6-(1,3-бензотіазол-5-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)-3-метил-азетидин-3-олу;
- N-[6-(1Н-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]-1,2,3,4-тетрагідроізохінолін-6-аміну;
- N-[6-(1Н-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]-2,3-дигідро-1Н-індол-6-аміну;
- 1-[6-(8-{[4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-1,2,3,4-тетрагідроізохінолін-2-іл]етан-1-олу;
- 1-[7-(8-{[4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-1,2,3,4-тетрагідроізохінолін-2-іл]етан-1-олу;
- N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]-6-{1Н,2Н,3Н-піридо[2,3-б][1,4]оксазин-7-іл}імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;

- 6-(1-метил-1Н-індазол-6-іл)-N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]-6-{2Н,3Н,4Н-піридо[3,2-б][1,4]оксазин-7-іл}імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
- 5 6-(8-{[4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-1Н,2Н,3Н-піридо[2,3-
b][1,4]оксазин-2-ону;
(3S)-1-(4-{[6-(3,4-дигідро-2Н-1,4-бензоксазин-7-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)-3-метилпіперидин-3-олу;
- 10 5-(8-{[4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-2,3-дигідро-1Н-індол-2-ону;
1-метил-6-(8-{[4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-2,3-дигідро-1Н-індол-2-ону;
- 15 6-(8-{[4-(2-гідрокси-2-метилпропокси)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-3,4-дигідро-2Н-1,4-бензоксазин-3-ону;
2-[4-(4-{[6-(1Н-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)піперазин-1-іл]етан-1-олу;
6-(1Н-індазол-4-іл)-N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
- 20 N-[3-етокси-4-(морфолін-4-іл)феніл]-6-(1-метил-1Н-1,3-бензодіазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
6-(1Н-індазол-6-іл)-N-[4-(піперазин-1-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]-6-(1,2,3,4-тетрагідроізохінолін-7-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]-6-(1,2,3,4-тетрагідроізохінолін-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
- 25 7-(8-{[4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-1Н,2Н,3Н-піридо[2,3-
b][1,4]оксазин-2-ону;
6-{1-метил-1Н-піроло[3,2-б]пиридин-6-іл}-N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
- 30 6-(1-метил-1Н-індол-6-іл)-N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
6-(1,3-бензоксазол-5-іл)-N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
6-(4-метил-3,4-дигідро-2Н-1,4-бензоксазин-7-іл)-N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
- 35 6-(4-метил-3,4-дигідро-2Н-1,4-бензоксазин-6-іл)-N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
6-[8-({4-[(3S)-3-гідроксипіролідин-1-іл]феніл}аміно)імідазо[1,2-а]піразин-6-іл]-3,4-дигідро-2Н-1,4-бензоксазин-3-ону;
- 40 (3R)-1-(4-{[6-(3,4-дигідро-2Н-1,4-бензоксазин-7-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)-3-метилпіперидин-3-олу;
6-[8-({4-[(3S)-3-гідрокси-3-метилпіперидин-1-іл]феніл}аміно)імідазо[1,2-а]піразин-6-іл]-3,4-дигідро-2Н-1,4-бензоксазин-3-ону;
- 45 6-[8-({4-[(3R)-3-гідрокси-3-метилпіперидин-1-іл]феніл}аміно)імідазо[1,2-а]піразин-6-іл]-2,3-дигідро-1Н-індол-2-ону;
6-[8-({4-[(3R)-3-гідрокси-3-метилпіперидин-1-іл]феніл}аміно)імідазо[1,2-а]піразин-6-іл]-2,3-дигідро-1Н-індол-2-ону;
- 50 (3R)-1-(4-{[6-(3,4-дигідро-2Н-1,4-бензоксазин-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)-3-метилпіперидин-3-олу;
(3S)-3-метил-1-(4-{[6-(1-метил-1Н-1,3-бензодіазол-5-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)піперидин-3-олу;
- 55 (3R)-3-метил-1-(4-{[6-(1-метил-1Н-1,3-бензодіазол-5-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)піперидин-3-олу;
(3R)-3-метил-1-(4-{[6-(1-метил-1Н-1,3-бензодіазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)піперидин-3-олу;
- 60 6-(8-{[4-(4-етилпіперазин-1-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-3,4-дигідро-2Н-1,4-бензоксазин-3-ону;
6-(1,3-бензотіазол-6-іл)-N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
6-(1,3-бензотіазол-5-іл)-N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
6-(1,3-бензоксазол-6-іл)-N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
- (3S)-1-(4-{[6-(3,4-дигідро-2Н-1,4-бензоксазин-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)-3-метилпіперидин-3-олу;
(3S)-3-метил-1-(4-{[6-(1-метил-1Н-1,3-бензодіазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)піперидин-3-олу;
- 1-(4-{[6-(1Н-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)-3-метилазетидин-3-олу;

- N-{4-[(4-етилпіперазин-1-іл)метил]феніл}-6-(1-метил-1Н-1,3-бензодіазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 2-[етил(4-{[6-(1Н-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)аміно]етан-1-олу;
 1-(4-{[6-(3,4-дигідро-2Н-1,4-бензоксазин-7-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)азетидин-3-олу;
 7-(8-{[4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-2Н,3Н,4Н-піридо[3,2-
 б][1,4]оксазин-3-олу;
 6-(1-метил-1Н-індазол-5-іл)-N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 1-(4-{[6-(1Н-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}фенокси)-2-метилпропан-2-олу;
 6-(3,4-дигідро-2Н-1,4-бензоксазин-6-іл)-N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 4-(4-{[6-(1Н-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)піперазин-2-олу;
 6-(1-метил-1Н-1,3-бензодіазол-6-іл)-N-[4-(морфолін-4-іл)метил]феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 6-(1Н-1,3-бензодіазол-6-іл)-N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 1-(4-{[6-(3,4-дигідро-2Н-1,4-бензоксазин-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)азетидин-3-олу;
 6-(1Н-індазол-6-іл)-N-[4-(1,4-оксазепан-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 (3S)-1-(4-{[6-(1Н-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)-3-метилпіперидин-3-олу;
 (3R)-1-(4-{[6-(1Н-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)-3-метилпіперидин-3-олу;
 (3S)-1-(4-{[6-(1Н-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)-3-метилпіролідин-3-олу;
 (3R)-1-(4-{[6-(1Н-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)-3-метилпіролідин-3-олу;
 6-(8-{[4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-3,4-дигідро-2Н-1,4-бензоксазин-3-олу;
 6-(8-{[4-(3-гідроксиазетидин-1-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-2,3-дигідро-1Н-індол-2-олу;
 6-(8-{[4-(3-гідрокси-3-метилпіролідин-1-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-3,4-дигідро-2Н-1,4-бензоксазин-3-олу;
 6-(1-метил-1Н-1,3-бензодіазол-6-іл)-N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 6-(3,4-дигідро-2Н-1,4-бензоксазин-7-іл)-N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 1-(4-{[6-(3,4-дигідро-2Н-1,4-бензоксазин-7-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)-4-метилпіперидин-4-олу;
 1-(4-{[6-(1Н-індол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)-4-метилпіперидин-4-олу;
 1-(4-{[6-(1Н-індол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)азетидин-3-олу;
 1-(4-{[6-(1-метил-1Н-1,3-бензодіазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)азетидин-3-олу;
 1-(4-{[6-(1-метил-1Н-1,3-бензодіазол-5-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)азетидин-3-олу;
 6-(1-метил-1Н-1,3-бензодіазол-5-іл)-N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 6-(8-{[4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-2,3-дигідро-1Н-індол-2-олу;
 6-(8-{[4-(3-гідроксиазетидин-1-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-3,4-дигідро-2Н-1,4-бензоксазин-3-олу;
 5-(8-{[4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-2,3-дигідро-1,3-бензоксазол-2-олу;
 4-{[6-(1Н-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}-N,N-диметилбензол-1-сульфонамід;
 6-(1Н-індазол-6-іл)-N-{4-[4-(пропан-2-іл)піперазин-1-іл]феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 2-(4-{[6-(3,4-дигідро-2Н-1,4-бензоксазин-7-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)-2-метилпропан-1-олу;
 4-(4-{[6-(1Н-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)тіоморфолін-1,1-діону;
 6-(1Н-індазол-6-іл)-N-[4-(2-метилморфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 та фармацевтично прийнятних солей зазначених сполук.
 Також запропонована щонайменше одна хімічна сполука, вибрана з:
 N-(4-етокси-3-метоксифеніл)-6-(1Н-індазол-6-іл)-5-метилімідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 1-(4-{[6-(1Н-індазол-6-іл)-5-метилімідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)-4-метилпіперидин-4-олу;
 N,6-біс[4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 2-[1-(4-{[6-(1Н-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)піперидин-4-іл]етан-1-олу;
 6-[3-(морфолін-4-іл)феніл]-N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну;
 2-[6-(8-{[4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-1Н-індол-3-іл]етан-1-олу;

- 1-[4-([6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл)аміно]феніл)піперидин-4-іл]метанолу,
 1-[4-(4-([6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл)аміно]феніл)піперазин-1-іл]етан-1-ону,
 6-(5-хлор-8-([3-метокси-4-(морфолін-4-іл)феніл)аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-2,3-дигідро-
 1H-індол-2-ону,
 5-хлор-N-[3-метокси-4-(морфолін-4-іл)феніл]-6-(1H-піроло[3,2-b]піридин-6-іл)імідазо[1,2-
 а]піразин-8-аміну,
 N-метил-5-(8-([4-(морфолін-4-іл)феніл)аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)піридин-3-аміну,
 6-(1H-індазол-6-іл)-N-(4-{7-окса-2-азаспіро[3,5]нонан-2-іл}феніл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну,
 6-(2-метил-1H-1,3-бензодіазол-6-іл)-N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну,
 5-(8-([4-(3-гідрокси-3-метилазетидин-1-іл)феніл)аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-1-метил-2,3-
 дигідро-1H-1,3-бензодіазол-2-ону,
 N-{4-[(2R,6S)-2,6-диметилморфолін-4-іл]феніл}-6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-
 аміну,
 N-[6-(1H-індазол-6-іл)-5-метилімідазо[1,2-а]піридин-8-іл]-5-(морфолін-4-іл)піридин-2-аміну,
 [(2R)-6-(8-([4-(морфолін-4-іл)феніл)аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-3,4-дигідро-2H-1,4-
 бензоксазин-2-іл]метанолу,
 6-(1H-індазол-6-іл)-N-[3-(метоксиметил)-4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-
 аміну,
 7-(8-([4-(морфолін-4-іл)феніл)аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-1,2,3,4-тетрагідрокіноксалін-2-
 ону,
 5-хлор-6-(1H-індазол-6-іл)-N-[3-метокси-4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну,
 1-(4-([6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл)аміно]феніл)-3-метилазетидин-3-аміну,
 [(2S)-6-(8-([4-(морфолін-4-іл)феніл)аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-3,4-дигідро-2H-1,4-
 бензоксазин-2-іл]метанолу,
 7-(8-([4-(морфолін-4-іл)феніл)аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-1,2,3,4-тетрагідрокінолін-2-
 ону,
 5-([6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл)аміно]-2-(морфолін-4-іл)бензонітрилу,
 6-(3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-6-іл)-3-метил-N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-
 а]піразин-8-аміну,
 N-[3-метокси-4-(морфолін-4-іл)феніл]-3-метил-6-(1H-піроло[3,2-b]піридин-6-іл)імідазо[1,2-
 а]піразин-8-аміну,
 5-метил-6-(2-метил-1H-1,3-бензодіазол-6-іл)-N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-
 8-аміну,
 5-етил-6-(1H-індазол-6-іл)-N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну,
 1-метил-6-(8-([4-(морфолін-4-іл)феніл)аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-2,3-дигідро-1H-1,3-
 бензодіазол-2-ону,
 6-(3-метил-8-([4-(морфолін-4-іл)феніл)аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-2,3-дигідро-1H-індол-
 2-ону,
 1,3-диметил-5-(8-([4-(морфолін-4-іл)феніл)аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-2,3-дигідро-1H-
 1,3-бензодіазол-2-ону,
 2-[6-(8-([4-(морфолін-4-іл)феніл)аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-1H-індазол-3-іл]пропан-2-
 олу,
 6-(4-фтор-1H-індол-6-іл)-N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну,
 5-([6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл)аміно]-2-(морфолін-4-іл)бензаміду,
 5-(8-([3-метокси-4-(морфолін-4-іл)феніл)аміно]-5-метилімідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-2,3-
 дигідро-1H-1,3-бензодіазол-2-ону,
 5-(5-метил-8-([4-(морфолін-4-іл)феніл)аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-2,3-дигідро-1H-1,3-
 бензодіазол-2-ону,
 [2-(8-([4-(морфолін-4-іл)феніл)аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)феніл]метанолу,
 1-метил-5-(8-([4-(морфолін-4-іл)феніл)аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-2,3-дигідро-1H-1,3-
 бензодіазол-2-ону,
 2-[6-(8-([4-(морфолін-4-іл)феніл)аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-3,4-дигідро-2H-1,4-
 бензоксазин-4-іл]етан-1-олу,
 (3R)-2,2-диметил-6-(8-([4-(морфолін-4-іл)феніл)аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-2,3-дигідро-
 1H-індол-3-олу,
 6-(1H-індазол-6-іл)-N-{3-метокси-4-[4-(2-метоксиетил)піперазин-1-іл]феніл}-імідазо[1,2-
 а]піразин-8-аміну,
 2-(4-{2-метокси-4-[(6-(1H-піроло[3,2-b]піридин-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-
 іл)аміно]феніл}піперазин-1-іл)етан-1-олу,
 1-[6-(8-([4-(морфолін-4-іл)феніл)аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-1H-індазол-3-іл]етан-1-олу,

- 2-[6-(8-{[4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-1Н-індазол-3-іл]етан-1-олу,
2-{[5-(8-{[4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)піридин-3-іл]аміно}етан-1-олу,
N-[3-метокси-4-(морфолін-4-іл)феніл]-5-метил-6-{1Н-піроло[3,2-б]піридин-6-іл}імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну,
5 (3S)-2,2-диметил-6-(8-{[4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-2,3-дигідро-1Н-індол-3-олу,
N-{4-[4-(3-фторпропіл)піперазин-1-іл]феніл}-6-(1Н-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну,
6-(1Н-індазол-6-іл)-N-[4-(оксан-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну,
10 N-[4-(4-фторпіперидин-1-іл)феніл]-6-(1Н-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну,
6-(1Н-індазол-6-іл)-N-[3-(2-метоксиетокси)-4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну,
6-(1Н-індазол-6-іл)-N-[4-(4Н-1,2,4-триазол-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну,
N-[4-(3,3-дифторпіролідін-1-іл)феніл]-6-(1Н-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну,
15 6-(1Н-індазол-6-іл)-N-[3-метокси-4-(морфолін-4-іл)феніл]-5-метилімідазо[1,2-а]піразин-8-аміну,
2,2-диметил-6-(8-{[4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-2,3-дигідро-1Н-індол-3-олу,
6-(1Н-індазол-6-іл)-N-[3-метокси-4-(метоксиметил)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну,
20 1-(4-{[6-(1Н-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}-2-метоксифеніл)-2-метилпропан-2-олу,
[(2S)-4-(4-{[6-(3,4-дигідро-2Н-1,4-бензоксазин-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)морфолін-2-іл]метанолу,
N-[4-(4,4-дифторпіперидин-1-іл)феніл]-6-(1Н-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну,
25 6-(1Н-індазол-6-іл)-N-{3-метокси-4-[(2-метоксиетокси)метил]феніл}імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну,
2-[2-(морфолін-4-іл)-5-[(6-{1Н-піроло[3,2-б]піридин-6-іл}імідазо[1,2-а]піразин-8-іл)аміно]феноксид]етан-1-олу,
6-(1Н-індазол-6-іл)-N-[4-(3-метокси-3-метилазетидин-1-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну,
30 5-(8-{[4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)піридин-3-аміну,
N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]-6-(1,5-нафтиридин-3-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну,
3-етил-1-(4-{[6-(1Н-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)азетидин-3-олу,
N-[4-(3-фтор-3-метилазетидин-1-іл)феніл]-6-(1Н-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну,
35 N-[4-(3,3-дифторпіперидин-1-іл)феніл]-6-(1Н-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну,
[(2R)-4-(4-{[6-(3,4-дигідро-2Н-1,4-бензоксазин-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)морфолін-2-іл]метанолу,
N-[4-(3,3-дифторазетидин-1-іл)феніл]-6-(1Н-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну,
(3S)-1-(4-{[6-(3,4-дигідро-2Н-1,4-бензоксазин-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}-2-метоксифеніл)піролідін-3-олу,
40 (3R)-1-(4-{[6-(3,4-дигідро-2Н-1,4-бензоксазин-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}-2-метоксифеніл)піролідін-3-олу,
N-[4-(3-фторазетидин-1-іл)феніл]-6-(1Н-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну,
6-(3,4-дигідро-2Н-1,4-бензоксазин-6-іл)-N-[3-метокси-4-(морфолін-4-іл)феніл]-5-метилімідазо[1,2-а]піразин-8-аміну,
45 N,N-діетил-6-(8-{[4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-1Н-індазол-3-аміну,
(3S)-3-гідрокси-3-метил-6-(8-{[4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-2,3-дигідро-1Н-індол-2-олу,
50 N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]-6-(хіноксалін-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну,
(3R)-3-гідрокси-3-метил-6-(8-{[4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-2,3-дигідро-1Н-індол-2-олу,
6-(1Н-індазол-6-іл)-N-{3-метокси-4-[(2S)-оксолан-2-ілметокси]феніл}імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну,
55 6-(8-{[3-метокси-4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}-5-метилімідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-2,3-дигідро-1Н-індол-2-олу,
6-(8-{[3-метокси-4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}-5-метилімідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-3,4-дигідро-2Н-1,4-бензоксазин-3-олу,
(3S)-1-(4-{[6-(1Н,2Н,3Н-піридо[2,3-б][1,4]оксазин-7-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)піролідін-3-олу,
60

- (3R)-1-(4-([6-(3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл)аміно)феніл)піролідин-3-олу,
6-[8-([4-((3R)-3-гідроксипіролідин-1-іл)-3-метоксифеніл)аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл]-2,3-дигідро-1H-індол-2-олу,
- 5 N-[4-(1H-індазол-1-іл)феніл]-6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну,
6-(1H-індазол-6-іл)-N-[4-(1H-піразол-1-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну,
6-[8-([4-((3R)-3-гідроксипіролідин-1-іл)феніл)аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл]-2,3-дигідро-1H-індол-2-олу,
- 10 6-[8-([4-((3S)-3-гідроксипіролідин-1-іл)феніл)аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл]-2,3-дигідро-1H-індол-2-олу,
1-(4-([6-(1H-індазол-6-іл)-5-метилімідазо[1,2-а]піразин-8-іл)аміно)феніл)-3-метилазетидин-3-олу,
(3S)-1-(4-([6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл)аміно)феніл)піперидин-3-олу,
(3R)-1-(4-([6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл)аміно)феніл)піперидин-3-олу,
- 15 2-[3-(8-([4-(морфолін-4-іл)феніл)аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)феніл]пропан-2-олу,
6-(5-метил-8-([4-(морфолін-4-іл)феніл)аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-3-олу,
N-етил-6-(8-([4-(морфолін-4-іл)феніл)аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-1H-індазол-3-аміну,
2-[4-(4-([6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл)аміно]-2-метоксифеніл)-піперазин-1-іл]етан-1-олу,
- 20 6-[8-([4-((3S)-3-гідроксипіролідин-1-іл)-3-метоксифеніл)аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл]-2,3-дигідро-1H-індол-2-олу,
2-(5-([6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл)аміно]-2-(морфолін-4-іл)фенокси)етан-1-олу,
- 25 (3S)-1-(4-([6-(1-метил-1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл)аміно)феніл)-піролідин-3-олу,
6-(5-метил-8-([4-(морфолін-4-іл)феніл)аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-2,3-дигідро-1H-індол-2-олу,
2-метил-1-[6-(8-([4-(морфолін-4-іл)феніл)аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-2H-індазол-2-іл]пропан-2-олу,
- 30 2-метил-1-[4-([6-(1H-піроло[3,2-b]піридин-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл)аміно]феніл]пропан-2-олу,
(3S)-1-(4-([6-(3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл)аміно)феніл)піролідин-3-олу,
2-[4-(8-([4-(морфолін-4-іл)феніл)аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)феніл]пропан-2-олу,
- 35 6-(1H-індазол-6-іл)-3-метил-N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну,
N-(2-гідроксиетил)-N-метил-6-(8-([4-(морфолін-4-іл)феніл)аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-1H-індазол-3-карбоксаміду,
5-хлор-6-(1H-індазол-6-іл)-N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну,
N-(2-гідроксиетил)-2-(4-([6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл)аміно)фенокси)ацетаміду,
- 40 1-(4-([6-(1H-індол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл)аміно]-2-метоксифеніл)-3-метилазетидин-3-олу,
1-(4-([6-(1H-індол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл)аміно)феніл)-3-метилазетидин-3-олу,
2-метил-1-[6-(8-([4-(морфолін-4-іл)феніл)аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-1H-індазол-1-іл]пропан-2-олу,
- 45 6-(1H-індазол-6-іл)-N-[3-метокси-4-(оксан-4-ілокси)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну,
N-[3-метокси-4-(морфолін-4-іл)феніл]-6-(1-метил-1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну,
6-(3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-6-іл)-5-метил-N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну,
- 50 2-метил-2-(4-([6-(1-метил-1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл)аміно)феніл)-пропан-1-олу,
1-(3-гідрокси-3-метилазетидин-1-іл)-2-(4-([6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл)аміно)фенокси)етан-1-олу,
- 55 1-[6-(1,3-бензотіазол-5-іл)імідазо[1,2-а]піридин-8-іл]-3-метилсечовини,
1-[6-(1,3-бензотіазол-5-іл)імідазо[1,2-а]піридин-8-іл]-3-етилсечовини,
1-[2-етокси-4-([6-(1H-піроло[3,2-b]піридин-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл)аміно]феніл]-3-метилазетидин-3-олу,
1-[2-метокси-4-([6-(1H-піроло[3,2-b]піридин-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл)аміно]феніл]-3-метилазетидин-3-олу,
- 60

- 6-(1H-індол-6-іл)-N-[3-метокси-4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну,
 6-(1H-індазол-6-іл)-N-[4-(оксан-4-ілокси)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну,
 6-(8-{[3-метокси-4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-3-ону,
- 5 6-(1H-індазол-6-іл)-N-[3-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну,
 2-(4-{[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}фенокси)-N,N-диметилацетаміду,
 3-метил-1-{4-[(6-{1H-піроло[3,2-b]піридин-6-іл]імідазо[1,2-а]піразин-8-іл)аміно]феніл}азетидин-3-олу,
 1-метил-5-(5-метил-8-{[4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-2,3-дигідро-
- 10 1H-1,3-бензодіазол-2-ону,
 1-етил-5-(8-{[4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-2,3-дигідро-1H-1,3-бензодіазол-2-ону,
 6-(3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-6-іл)-5-етил-N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну,
- 15 6-(5-етил-8-{[4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-2,3-дигідро-1H-індол-2-ону,
 (3S)-1-{4-[(6-{1H-піроло[3,2-b]піридин-6-іл]імідазо[1,2-а]піразин-8-іл)аміно]феніл}піперидин-3-олу,
 (3S)-1-{2-метокси-4-[(6-{1H-піроло[3,2-b]піридин-6-іл]імідазо[1,2-а]піразин-8-іл)аміно]феніл}піперидин-3-олу,
- 20 2-(1-{4-[(6-{1H-піроло[3,2-b]піридин-6-іл]імідазо[1,2-а]піразин-8-іл)аміно]феніл}піперидин-4-іл)етан-1-олу,
 2-[6-(5-метил-8-{[4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-1H-індазол-3-іл]етан-1-олу,
- 25 1-[4-{[3-(2-гідроксиетил)-1H-індазол-6-іл]імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл]-3-метилазетидин-3-олу,
 6-[8-{[4-[(2R)-2-(гідроксиметил)морфолін-4-іл]феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл]-2,3-дигідро-1H-індол-2-ону,
 6-[8-{[4-[(2S)-2-(гідроксиметил)морфолін-4-іл]феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл]-2,3-дигідро-1H-індол-2-ону,
- 30 5-(5-етил-8-{[4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-1-метил-2,3-дигідро-1H-1,3-бензодіазол-2-ону,
 5-етил-N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]-6-{1H-піроло[3,2-b]піридин-6-іл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну,
- 35 (3R)-1-(4-{[6-(3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}-2-метоксифеніл)піперидин-3-олу,
 N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]-6-(1,2,3,5-тетрагідро-4,1-бензоксазепін-8-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну,
 [(3R)-4-(4-{[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)морфолін-3-іл]метанолу,
- 40 [(3S)-4-(4-{[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)морфолін-3-іл]метанолу,
 (3S)-1-(4-{[6-(3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}-2-метоксифеніл)піперидин-3-олу,
 (1-{4-[(6-{1H-піроло[3,2-b]піридин-6-іл]імідазо[1,2-а]піразин-8-іл)аміно]феніл}-піперидин-4-іл)метанолу,
- 45 [(2R)-4-(4-{[6-(3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}-2-метоксифеніл)морфолін-2-іл]метанолу,
 [(2S)-4-(4-{[6-(3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}-2-метоксифеніл)морфолін-2-іл]метанолу,
 4-(4-{[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}фенокси)циклогексан-1-олу,
- 50 6-(1H-індазол-6-іл)-N-(4-{2-окса-6-азаспіро[3,3]гептан-6-іл}феніл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну,
 2-[6-(8-{[3-метокси-4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-1H-індазол-3-іл]етан-1-олу,
 [(2S)-4-(4-{[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}-2-метоксифеніл)морфолін-2-іл]метанолу,
- 55 [(2R)-4-(4-{[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}-2-метоксифеніл)морфолін-2-іл]метанолу,
 2-[1-(4-{[6-(3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)піперидин-4-іл]етан-1-олу,
- 60 6-(1H-індазол-6-іл)-N-(4-{8-окса-3-азабіцикло[3,2,1]октан-3-іл}феніл)імідазо[1,2-а]піразин-8-

аміну,

[(3R)-1-(4-{{6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл}аміно}феніл)піролідин-3-іл]метанолу,
[(3S)-1-(4-{{6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл}аміно}феніл)піролідин-3-іл]метанолу,
5-хлор-6-(3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-6-іл)-N-[3-метокси-4-(морфолін-4-

5 іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну,

2-[6-(8-{{3-метокси-4-(морфолін-4-іл)феніл}аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-1H-індол-3-іл]етан-1-олу,

(3R)-1-(4-{{6-(3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл}аміно}феніл)піперидин-3-олу,

10 [1-(4-{{6-(3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл}аміно}феніл)піперидин-4-іл]метанолу,

(3S)-1-(4-{{6-(3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл}аміно}феніл)піперидин-3-олу,

15 [(2S)-4-{{4-{{6-(1H-піроло[3,2-b]піридин-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл}аміно}феніл}морфолін-2-іл]метанолу,

[(2R)-4-{{4-{{6-(1H-піроло[3,2-b]піридин-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл}аміно}феніл}морфолін-2-іл]метанолу,

2-[1-(4-{{6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл}аміно}феніл)піролідин-3-іл]етан-1-олу,
6-(1H-індазол-6-іл)-N-[4-(оксан-4-ілметокси)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну,

20 N-[5-(8-{{4-(морфолін-4-іл)феніл}аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)піридин-3-іл]ацетаміду,
6-(8-{{3-метокси-4-(оксан-4-ілокси)феніл}аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-2,3-дигідро-1H-індол-2-ону,

6-(1H-індол-6-іл)-N-[3-метокси-4-(морфолін-4-іл)феніл]-5-метилімідазо[1,2-а]піразин-8-аміну,

25 6-(1H-індол-6-іл)-5-метил-N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну,

1-(4-{{6-(3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-6-іл)-5-метилімідазо[1,2-а]піразин-8-іл}аміно}феніл)-4-метилпіперидин-4-олу,

N-[3-метокси-4-(оксан-4-ілокси)феніл]-6-(1H-піроло[3,2-b]піридин-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну,

6-(1H-індазол-6-іл)-N-(4-{{2-окса-7-азаспіро[3,5]нонан-7-іл}феніл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну,
30 та 6-(1H-індазол-6-іл)-N-[3-метокси-4-(оксан-4-ілметокси)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну,

1-(4-{{4-{{6-(1H-піроло[3,2-b]піридин-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл}аміно}феніл}піперазин-1-іл)етан-1-ону,

5-(8-{{3-(2-гідроксиетокси)-4-(морфолін-4-іл)феніл}аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-1-метил-2,3-дигідро-1H-1,3-бензодіазол-2-ону,

35 [(3S)-1-{{2-метокси-4-{{6-(1H-піроло[3,2-b]піридин-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл}аміно}феніл}піролідин-3-іл]метанолу,

5-(8-{{3-метокси-4-(морфолін-4-іл)феніл}аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-N-метилпіридин-3-аміну,

5-(8-{{3-метокси-4-(морфолін-4-іл)феніл}аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-1-метил-2,3-дигідро-1H-1,3-бензодіазол-2-ону,

40 5-[8-{{4-{{(3R)-3-гідроксипіперидин-1-іл}феніл}аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл]-1-метил-2,3-дигідро-1H-1,3-бензодіазол-2-ону,

(3R)-1-{{2-метокси-4-{{6-(1H-піроло[3,2-b]піридин-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл}аміно}феніл}піперидин-3-олу,

45 4-метил-7-(8-{{4-(морфолін-4-іл)феніл}аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-1,2,3,4-тетрагідрохіноксалін-2-ону,

[(2R)-4-{{2-метокси-4-{{6-(1H-піроло[3,2-b]піридин-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл}аміно}феніл}морфолін-2-іл]метанолу, та

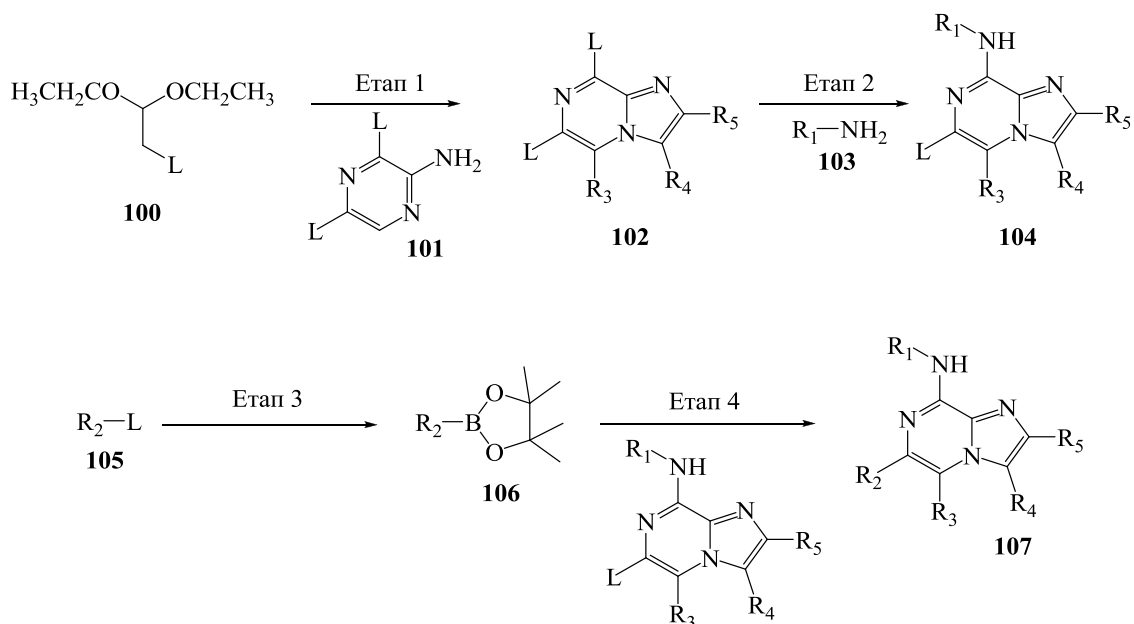
50 (3R)-1-{{4-{{6-(1H-піроло[3,2-b]піридин-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл}аміно}феніл}піперидин-3-олу,

та фармацевтично прийнятних солей зазначених сполук.

Хімічні сполуки, представлені у вищевикладених прикладах, можуть бути введені окремо, у вигляді суміші або в комбінації з іншими активними агентами.

55 Способи одержання нових сполук, описаних у даній заявці, будуть очевидні для фахівців у даній галузі техніки, придатні способи описані, наприклад, у наведених нижче схемах реакцій та прикладах, а також у посиланнях, цитованих у даній заявці.

Схема реакції 1



Відповідно до етапу 1 схеми реакції 1 надлишок сполуки Формули 100 (наприклад, приблизно 3,5 еквіваленти), де L являє собою відхідну групу, таку як бромід, змішували з водним розчином кислоти (наприклад, 48% водним бромоводнем) та суміш перемішували зі зворотним холодильником впродовж приблизно 2 годин. Суміш охолоджували до приблизно 40 °C та додавали основу (таку як твердий бікарбонат натрію). Реакційну суміш фільтрували та додавали сполуку Формули 101, де L являє собою відхідну групу, таку як бромід, і реакційну суміш перемішували зі зворотним холодильником впродовж приблизно 16 годин. Отриманий продукт - сполуку Формули 102 - виділяли та необов'язково очищали.

Відповідно до етапу 2 схеми реакції 1 розчин сполуки Формули 103 у полярному розчиннику, такому як N,N-Диметилформамід, додавали в надлишку (наприклад, приблизно 1,3 еквівалента) до сполуки формули 102, де L являє собою відхідну групу, таку як бромід. Додавали органічну основу, таку як N, N-Диізопропілетиламін, та суміш перемішували при температурі приблизно 120 °C впродовж приблизно 13 годин. Отриманий продукт - сполуку Формули 104 - виділяли та необов'язково очищали.

Відповідно до етапу 3 схеми реакції 1 суміш сполуки Формули 105, де L являє собою відхідну групу, таку як бромід, змішували з надлишком біс(пінаcolato)дибору (наприклад, приблизно 1,1 еквіваленти) та надлишком неорганічної основи (наприклад, приблизно 3,0 еквівалентами), такої як ацетат калію в полярному розчиннику, наприклад, диметилсульфоксиді. Через реакційну суміш барботували азот та перемішували впродовж приблизно 5 хв. Реакційну суміш обробляли приблизно 0,2 еквівалентами дихлорметану дихлор-1,1-біс(дифенілфосфіно)фероценпалладію(II) та перемішували при температурі приблизно 80 °C впродовж приблизно 3 годин. Отриманий продукт - сполуку Формули 106 - виділяли та необов'язково очищали.

Відповідно до етапу 4 схеми реакції 1 надлишок сполуки Формули 106 (наприклад, приблизно 1,1 еквівалент) та сполуку Формули 104, де L являє собою відхідну групу, таку як бромід, поміщали у водний розчин основи (такої як 1M карбонат натрію) та інертного розчинника, такого як 1,4-диоксан. Через реакційну суміш барботували азот та перемішували впродовж приблизно 5 хв. Отриману в результаті суміш обробляли приблизно 0,1 еквівалентом тетракіс(трифенілфосфін)палладію(0) та піддавали впливу мікрохвильового опромінювання при температурі приблизно 135 °C впродовж приблизно 30 хв. Отриманий у результаті продукт - сполуку Формули 107 - виділяли та необов'язково очищали.

Таким чином, запропонований спосіб лікування пацієнта, наприклад, ссавця, такого як людини, що страждає від захворювання, чутливого до пригнічення активності Syk-кінази, який включає введення пацієнту, що страждає зазначеним захворюванням, ефективною кількості щонайменше однієї хімічної сполуки, описаної в даній заявці.

Відповідно до деяких варіантів реалізації винаходу хімічні сполуки, описані в даній заявці, здатні також пригнічувати інші кінази, здійснюючи лікування захворювання, симптомів захворювання та патологічних станів, пов'язаних із зазначеними кіназами.

Способи лікування також включають пригнічення активності Syk-кінази та/або пригнічення

активності В-клітин шляхом інгібування зв'язування або гідролізу АТФ Сук-кіназою або за допомогою деякого іншого механізму *in vivo* у пацієнта, що страждає на захворювання, чутливе до пригнічення активності Сук-кінази, шляхом введення ефективної концентрації щонайменше однієї хімічної сполуки, вибраної з описаних у даній заявці. Прикладом ефективної концентрації є концентрація, достатня для пригнічення активності Сук-кінази *in vitro*. Ефективна концентрація може бути встановлена експериментально, наприклад шляхом визначення концентрації в крові хімічної сполуки, або теоретично, за допомогою визначення біодоступності.

Відповідно до деяких варіантів реалізації винаходу розлад, чутливий до пригнічення активності Сук-кінази та/або активності В-клітин, являє собою рак, алергійне захворювання та/або аутоімунне та/або запальне захворювання та/або гостру запальну реакцію.

Також запропонований спосіб лікування пацієнта, що страждає від раку, алергійного захворювання та/або аутоімунного та/або запального захворювання та/або гострої запальної реакції, шляхом введення ефективної кількості щонайменше однієї хімічної сполуки, описаної в даній заявці.

Відповідно до деяких варіантів реалізації винаходу розлади та захворювання, чутливі до дії описаних у даній заявці хімічних сполук при їх застосуванні, включають (не обмежуються зазначеними): алергійні захворювання, включаючи екзему, алергічний риніт або нежить, сінну лихоманку, бронхіальну астму, алергійний висип (кропивницю) та харчові алергії та інші atopічні захворювання (не обмежуючись зазначеними); аутоімунні та/або запальні захворювання, включаючи псоріаз, хворобу Крона, синдром подразненого кишечника, хворобу Шегрена, відторгнення тканинного трансплантату та надгостре відторгнення трансплантованих органів, астму, системний червоний вовчак (і пов'язаний з нею гломерулонефрит), дерматоміозит, множинний склероз, склеродермію, васкуліт (Анца-асоційований та інші васкуліти), аутоімунні гемолітичні та тромбоцитопенічні стадії, синдром Гудпасчера (і пов'язаний з ним гломерулонефрит та легенеvu кровотечу), атеросклероз, ревматоїдний артрит, хронічну ідіопатичну тромбоцитопенічну пурпуру (ІТП), хворобу Адісона, хворобу Паркінсона, хворобу Альцгеймера, діабет, септичний шок, міастенію гравіс та т.п. (не обмежуючись зазначеними); гострі запальні реакції, включаючи (але не обмежуючись зазначеними) сонячний опік шкіри, запальне захворювання органів таза, запальне захворювання кишечника, уретрит, увеїт, синусит, пневмонію, енцефаліт, менінгіт, міокардит, нефрит, остеомієліт, міозит, гепатит, гастрит, ентерит, дерматит, гінгівіт, апендицит, панкреатит та холецистит; полікістозну хворобу нирок та рак, включаючи (але не обмежуючись зазначеними) В-клітинну лімфому, лімфому (включаючи лімфому Ходжкіна та неходжкінську лімфому), лейкоз ворсистих клітин, множинну мієлому, хронічну та гостру мієлогенну лейкемію та хронічний та гострий лімфоцитарний лейкоз.

Сук-кіназа є відомим інгібітором апоптозу клітин В-клітинної лімфоми. Порушення апоптозу залучені у патогенезі та прояві лікарської стійкості лейкемій та лімфом людини. Таким чином, також запропонований спосіб стимуляції або індукції апоптозу в клітках, що експресують Сук-кіназу, що включає взаємодію клітини щонайменше з однією хімічною сполукою, описаною в даній заявці.

Також запропоновані способи лікування, відповідно до яких щонайменше одна хімічна сполука, описана в даній заявці, є єдиним активним агентом, що вводиться пацієнту, та також включає способи лікування, у яких щонайменше одна хімічна сполука, описана в даній заявці, вводиться пацієнту в комбінації з одним або більше додатковими активними агентами.

Таким чином, відповідно до деяких варіантів реалізації винаходу спосіб лікування раку, алергійного захворювання та/або аутоімунного та/або запального захворювання та/або гострої запальної реакції включає введення пацієнту, який потребує такого лікування ефективної кількості щонайменше однієї хімічної сполуки, описаної в даній заявці, разом із іншим активним агентом, який може застосовуватися для лікування раку, алергійного захворювання та/або аутоімунного та/або запального захворювання та/або гострої запальної реакції. Наприклад, другий агент може являти собою протизапальний агент. Лікування іншим активним агентом може проводитися до, під час або після проведення лікування щонайменше однією хімічною сполукою, описаною у даній заявці. Відповідно до деяких варіантів реалізації винаходу щонайменше одна хімічна сполука, описана в даній заявці, комбінується з іншим активним агентом у дозованій формі для однократного введення. Підходящі протипухлинні терапевтичні засоби, які можуть використовуватися в комбінації щонайменше з однією хімічною сполукою, описаною в даній заявці, включають (але не обмежуються зазначеними) хіміотерапевтичні агенти, наприклад, мітоміцин С, карбоплатин, таксол, цисплатин, паклітаксел, етопозид, доксорубіцин або комбінації, що включають щонайменше один з зазначених вище хіміотерапевтичних агентів. Радіотерапевтичні протипухлинні агенти також можуть

застосовуватися, окремо або в комбінації з хіміотерапевтичними агентами.

Хімічні сполуки, описані в даній заявці, можуть застосовуватися як агенти, що підвищують чутливість до хіміотерапевтичних агентів і, таким чином, можуть застосовуватися в комбінації з іншими хіміотерапевтичними лікарськими засобами, зокрема, лікарськими засобами, що викликають апоптоз.

Також згідно з даним винаходом запропонований спосіб підвищення чутливості ракових клітин до хіміотерапії, що включає введення пацієнту, що зазнає хіміотерапії за допомогою хіміотерапевтичного агента, також щонайменше однієї хімічної сполуки, описаної в даній заявці, у кількості, достатній для підвищення чутливості ракових клітин до хіміотерапевтичного агенту.

Приклади інших хіміотерапевтичних лікарських засобів, які можуть застосовуватися в комбінації з хімічними сполуками, описаними в даній заявці, включають інгібітори топоізомерази I (камптотecin або топотекан), інгібітори топоізомерази II (наприклад, дауноміцин та етопозид), алкілюючі агенти (наприклад, циклофосфамід, мелфалан та 1,3-біс(2-хлоретил)-1-нітрозосечовина, БХНМ), агенти зі спрямованою дією на тубулін (наприклад, таксол та вінбластин) та біологічні агенти (наприклад, антитіла, такі як антитіла проти CD20, IDEC 8, імунотоксини та цитокіни).

Відповідно до деяких варіантів реалізації винаходу хімічні сполуки, описані в даній заявці, застосовуються в комбінації з Rituxan® (ритуксимабом) або іншими агентами, які діють за принципом селективного пригнічення CD20+ В-клітин.

Даний винахід включає способи лікування, відповідно до яких щонайменше одну хімічну сполуку, описану в даній заявці, вводять в комбінації з протизапальним агентом. Протизапальні агенти включають (але не обмежуються зазначеними) НПВС, інгібітори ферменту циклооксигенази, неспецифічні та специфічні до COX-2, сполуки золота, кортикостероїди, метотрексат, антагоністи рецепторів фактору некрозу пухлини (ФНП), імуносупресори та метотрексат.

Приклади НПВС включають (але не обмежуються зазначеними) ібупрофен, флурбіпрофен, напроксен та напроксен натрію, диклофенак, комбінації диклофенаку натрію та мізопростолу, суліндак, оксaproзин, дифлунізал, піроксикам, індометацин, етодолак, фенпрофен кальцію, кетопрофен, набуметон натрію, сульфасалазин, толметин натрію та гідроксихлорохін. Приклади НПВС також включають специфічні інгібітори циклооксигенази COX-2 (тобто сполуки, які пригнічують циклооксигеназу COX-2 зі значенням IC₅₀ для COX-2 щонайменше в 50 раз меншим, ніж значення IC₅₀ для COX-1), такі як целекоксиб, валдекоксиб, люміракоксиб, еторикоксиб та/або рофекококсиб.

Відповідно до іншого варіанту реалізації винаходу протизапальний агент являє собою саліцилат. Саліцилати включають (але не обмежуються зазначеними) ацетилсаліцилову кислоту або аспірин, саліцилат натрію та саліцилати холіну та магнію.

Протизапальний агент може також являти собою кортикостероїд. Наприклад, кортикостероїд може бути вибраний з кортизону, дексаметазону, метилпреднізолону, преднізолону, преднізолонфосфат натрію та преднізону.

Відповідно до деяких варіантів реалізації винаходу протизапальний терапевтичний агент являє собою сполуку золота, таку як ауротіомалат натрію або ауранофін.

Відповідно до деяких варіантів реалізації винаходу протизапальний агент являє собою метаболічний інгібітор, такий як інгібітор дигідрофолатредуктази, такий як інгібітор метотрексату або дегідрогенази, наприклад, лефлуномід.

Відповідно до деяких варіантів реалізації винаходу застосовуються комбінації, у яких щонайменше одна протизапальна сполука являє собою моноклональне антитіло до C5 (таке як екулізумаб або пекселізумаб), антагоніст ФНО, такий як ентанерцепт, або інфліксимаб, який являє собою моноклональне антитіло до ФНО-альфа.

Відповідно до деяких варіантів реалізації винаходу застосовуються комбінації, у яких щонайменше один активний агент являє собою імуносупресорну сполуку, таку як метотрексат, лефлуномід, циклоспорин, такролімус, азатіоприн, або мікофенолат мофетил.

Для лікування зазначених вище патологічних станів можуть застосовуватися дозування, наприклад, від 0,1 мг до 140 мг на кілограм маси тіла на добу (від 0,5 мг до 7 г на пацієнта на добу). Кількість активного інгредієнта, який може змішуватися з наповнювачем для одержання дозованої форми для однократного введення, буде різнитися залежно від пацієнта, якому проводять лікування, та конкретного способу введення. Дозовані лікарські форми, як правило, містять від 1 мг до 500 мг активного інгредієнта.

Частота введення дози може також змінюватися в залежності застосовуваної сполуки та конкретного захворювання, на яке спрямовано лікування. Відповідно до деяких варіантів реалізації винаходу для лікування, наприклад, алергійного захворювання та/або аутоімунного

та/або запального захворювання, застосовується режим дозування 4 рази на добу, або менше. Відповідно до деяких варіантів реалізації винаходу застосовується режим дозування 1 або 2 рази на добу. Необхідно розуміти однак, що специфічний рівень дози для будь-якого конкретного пацієнта буде залежати від множини факторів, включаючи активність визначеної

5 сполуки, яка застосовується, віку пацієнта, маси тіла, загального стану здоров'я, статі, харчування, часу введення сполуки, шляху введення та швидкості виведення, комбінації лікарських засобів та тяжкості конкретного захворювання пацієнта, що зазнає терапії.

Мічена форма хімічної сполуки, описаної в даній заявці, може застосовуватися як діагностичний маркер для ідентифікації та/або одержання сполук, дію яких спрямовано на

10 модулювання активності кінази, як описано в даній заявці. Хімічні сполуки, описані в даній заявці, можуть додатково використовуватися для підтвердження, оптимізації та стандартизації біоаналізів.

Термін «мічений» означає, що сполука безпосередньо або опосередковано зв'язана з міткою, яка забезпечує обумовлений сигнал, наприклад, з радіоізотопом, флуоресцентною

15 міткою, ферментом, антитілами, частками, такими як магнітні частки, хемілюмінесцентною міткою або молекулами специфічного зв'язування та т.д. Молекули специфічного зв'язування включають пари, такі як біотин та стрептавідин, дигоксин та антидигоксин та т.д. У випадку молекул специфічного зв'язування, комплементарний елемент, як правило, мітється молекулою, яка забезпечує можливість визначення відповідно до вищезазначених відомих

20 способів. Мітка може забезпечувати обумовлений сигнал безпосереднім або опосередкованим способом.

ПРИКЛАДИ

Винахід далі проілюстровано за допомогою наступних необмежуючих прикладів.

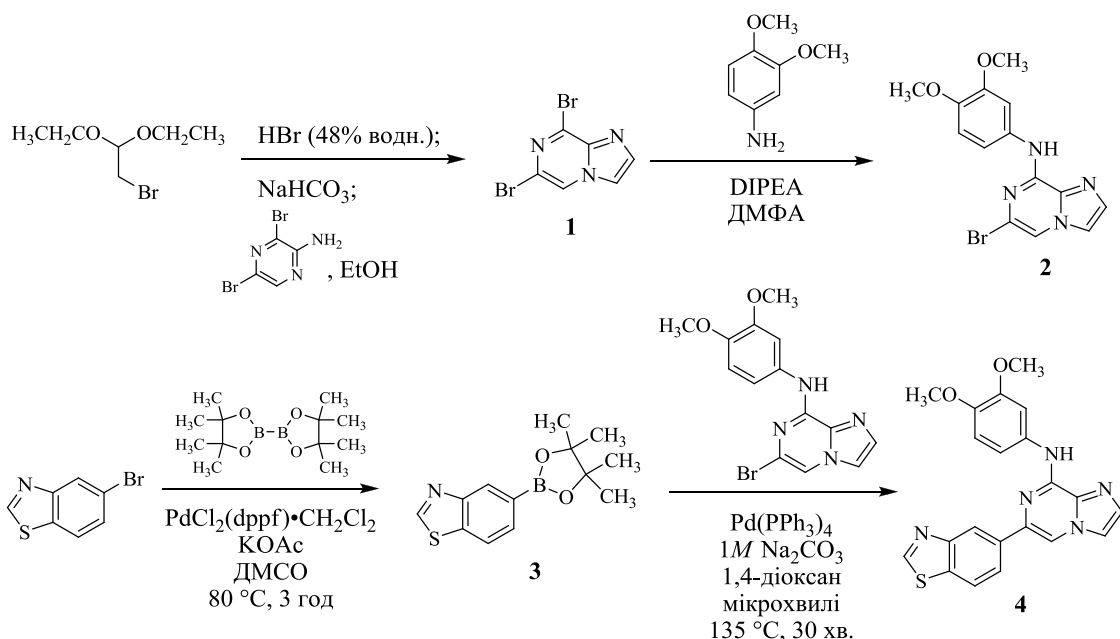
У наведених нижче прикладах наступні аббревіатури мають зазначені значення. Якщо

25 аббревіатура не визначена, вона має загальноприйняте значення.

DME	=	диметиловий ефір
DMEM	=	модифіковане Дульбекко середовище Ігла
ДМФА	=	N,N-Диметилформамід
ДМСО	=	диметилсульфоксид
Et ₂ O	=	діетиловий ефір
г	=	грам
год.	=	година
мг	=	міліграм
хв.	=	хвилини
мл	=	мілілітри
ммоль	=	мілімоль
мМ	=	мілімолярний
нг	=	нанограми
нм	=	нанометри
нМ	=	наномолярний
ФСБ	=	фосфатний сольовий буфер
мкл	=	мікролітр
мкМ	=	мікромолярний

Приклад 1

Одержання 6-(бензо[d]тіазол-5-іл)-N-(3,4-диметокси-феніл)імідазо[1,2-a]піразин-8-аміну (4)



DIPEA – N,N-Дізопропілетиламін

Одержання 6,8-дібромімідазо[1,2-а]піразину (1) Чотиригорлу круглодонну колбу на 1 л, оснащену температурним датчиком, механічною мішалкою та зворотним холодильником, наповнювали бром-1,1-діетоксиетаном (68,1 г, 346 ммоль) та 48% водним бромоводнем (11,3 мл, 99,2 ммоль) та реакційну суміш перемішували зі зворотним холодильником впродовж 2 годин. Отриману в результаті суміш залишали для охолодження до температури 40 °C та додавали твердий бікарбонат натрію (8,50 г, 101 ммоль) невеликими порціями доти, поки не спостерігалось припинення газоутворення. Запобіжні заходи: початкове додавання бікарбонату натрію до теплого розчину приводило до інтенсивного газоутворення (піноутворення). Отриману в результаті суспензію фільтрували в чотиригорлу круглодонну колбу на 1 літр, оснащену температурним датчиком, механічною мішалкою та зворотним холодильником, та відфільтрований осад промивали етанолом (200 мл). Додавали 3,5-дібромпіразин-2-амін (50,0 г, 198 ммоль) та реакційну суміш нагрівали зі зворотним холодильником при інтенсивному перемішуванні впродовж 16 год. Після цього суспензію охолоджували до 0 °C та фільтрували. Відфільтрований осад промивали холодним етанолом (50 мл), сушили у вакуумі та додавали в тригорлу круглодонну колбу на 1 л, оснащену механічною мішалкою. Додавали воду (200 мл) та після інтенсивного перемішування суспензію обробляли порціями твердого карбонату калію (27,4 г, 198 ммоль). Запобіжні заходи: при додаванні карбонату калію спостерігалось газоутворення. Після перемішування впродовж 30 хв. отриманий у результаті преципітат ізолювали за допомогою фільтрування та відфільтрований осад промивали водою (100 мл) з наступним промиванням етанолом (50 мл). Відфільтрований осад сушили при температурі 50 °C до одержання постійної маси у вакуумі з одержанням 6,8-дібромімідазо[1,2-а]піразину (1) (52,0 г, 94%) у вигляді твердої речовини світло-жовтого кольору: ¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 9,02 (s, 1H), 8,23 (s, 1H), 7,90 (s, 1H).

Одержання 6-бром-N-(3,4-диметоксифеніл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну (2) Суміш 3,4-диметоксиаланіну (18,0 г, 118 ммоль), 6,8-дібромімідазо[1,2-а]піразину (25,0 г, 90,4 ммоль) та N,N-дізопропілетиламіні (11,7 г, 90,4 ммоль) у ДМФА (500 мл) перемішували при температурі 120 °C впродовж ночі. Після цього реакційну суміш охолоджували до кімнатної температури та концентрували до одержання приблизно 100 мл при зниженому тиску. Реакційну суміш темно-коричневого кольору виливали в крижану воду (300 мл) та перемішували впродовж 10 хв. Отриманий у результаті преципітат коричневого кольору фільтрували та відфільтрований осад промивали водою (100 мл). Відфільтрований осад сушили у вакуумі та перекристалізовували з метанолу (~800 мл) з одержанням 6-бром-N-(3,4,5-триметоксифеніл)імідазо[1,2-а]піразин-8-аміну (2) (23,3 г, 74%) у вигляді голкоподібної твердої речовини світло-коричневого кольору: ¹H ЯМР (300 МГц, ДМСО-d₆) δ 9,81 (s, 1H), 8,22 (s, 1H), 7,93 (s, 1H), 7,75 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 7,62 (s, 1H), 7,53 (dd, J = 8,7, 2,4, 1H), 6,94 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 3,77 (s, 3H), 3,75 (s, 3H); ІЕР МС m/z 349,2 [M + H]⁺; ВЕРХ, 6,92 хв, >99% (ППК).

Одержання 5-(4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолан-2-іл)бензо[d]тіазолу (3) Через суміш

5-бромбензо[d]тіазолу (428 мг, 2,00 ммоль), біс(пінаcolato)дибору (558 мг, 2,20 ммоль) та ацетату калію (588 мг, 6,00 ммоль) у диметилсульфоксиді (7 мл) барботували азот при перемішуванні впродовж 5 хв. Потім додавали дихлорметан дихлор-1,1-біс(дифенілфосфіно)фероценпаладію (II) (293 мг, 0,40 ммоль) та реакційну суміш перемішували при температурі 85 °C впродовж 3 годин. Після цього суміш фільтрували через фільтрувальну подушку Celite та відфільтрований осад промивали етилацетатом (75 мл) з наступним промиванням водою (20 мл). Фільтрат розбавляли етилацетатом (100 мл) та промивали водою (2 x 75 мл) з наступним промиванням сольовим розчином (75 мл). Органічну фазу сушили над безводним сульфатом натрію, фільтрували та концентрували при зниженому тиску. Отриманий осад очищали за допомогою хроматографії (силікагель, градієнт: від 0% до 50% етилацетату в хлориді метану) з одержанням 5-(4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-діоксаборолан-2-іл)бензо[d]тіазолу (3) (200 мг, 38%) у вигляді твердої речовини світло-коричневого кольору: ¹H ЯМР (300 МГц, DMSO-d₆) δ 9,41 (s, 1H), 8,32 (s, 1H), 8,18 (d, 1H, J = 8,0 Hz), 7,72 (d, 1H, J = 8,0 Hz), 1,33 (s, 12H); IER MS m/z 262,1 [M + H]⁺.

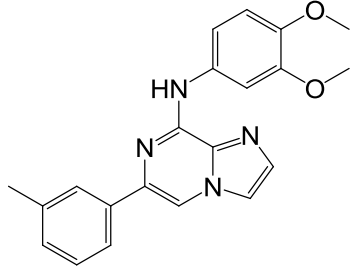
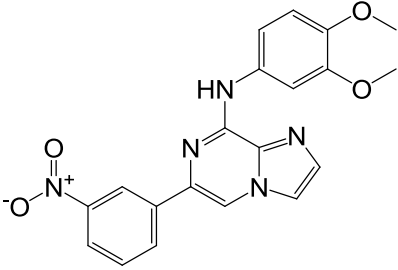
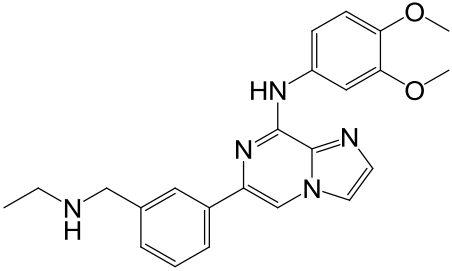
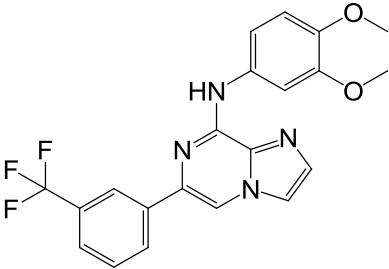
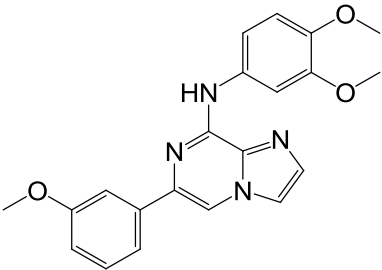
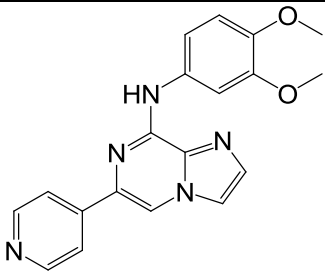
Одержання 6-(бензо[d]тіазол-5-іл)-N-(3,4-диметоксифеніл)імідазо[1,2-a]піразин-8-аміну (4) Через суміш 6-бром-N-(3,4-диметоксифеніл)імідазо[1,2-a]піразин-8-аміну (2) (209 мг, 0,601 ммоль) та 5-(4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-діоксаборолан-2-іл)бензо[d]тіазолу (3) (180 мг, 0,689 ммоль) в 1М водяному розчині карбонату натрію (0,76 мл) та 1,4-диоксану (2,4 мл) барботували азот при перемішуванні впродовж 5 хв. Потім додавали тетракіс(трифенілфосфін)паладій (0) (69 мг, 0,06 ммоль) та отриману в результаті суміш піддавали впливу мікрохвильового опромінювання при температурі 135 °C впродовж 30 хв. Після цього реакційну суміш охолоджували до температури навколишнього середовища, розбавляли сумішшю метанол/етилацетат у співвідношенні 1:9 (75 мл) та промивали водою (50 мл) з наступним промиванням сольовим розчином (50 мл). Органічну фазу сушили над безводним сульфатом натрію, фільтрували та концентрували при зниженому тиску. Отриманий у результаті осад очищали за допомогою хроматографії (силікагель, градієнт: від 0% до 10% метанолу в метиленхлориді) з одержанням 6-(бензо[d]тіазол-5-іл)-N-(3,4-диметоксифеніл)імідазо[1,2-a]піразин-8-аміну (4) (169 мг, 70%) у вигляді твердої речовини брудно-білого кольору: Т.пл. 179-181 °C; ¹H ЯМР (300 МГц, DMSO-d₆) δ 9,56 (s, 1H), 9,45 (s, 1H), 8,78 (s, 1H), 8,76 (d, 1H, J = 1,2 Hz), 8,26 (d, 1H, J = 8,7 Hz), 8,14 (m, 2H), 8,00 (s, 1H), 7,66 (s, 1H), 7,58 (dd, 1H, J = 8,7, 2,4 Hz), 6,99 (d, 1H, J = 8,7 Hz), 3,87 (s, 3H), 3,76 (s, 3H); MS m/z 404,6 [M + H]⁺; ВЕРХ, 6,475 хв, 98,6% (ППК).

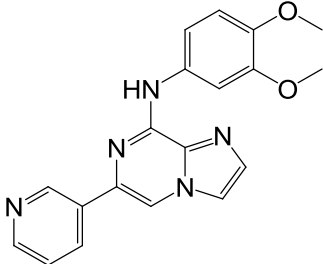
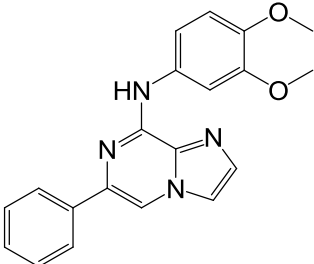
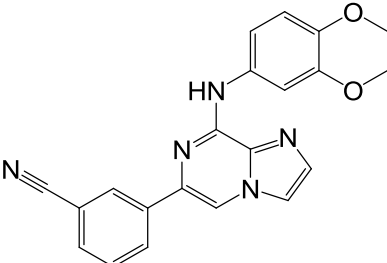
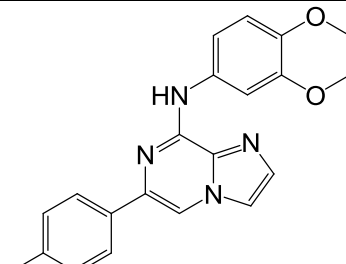
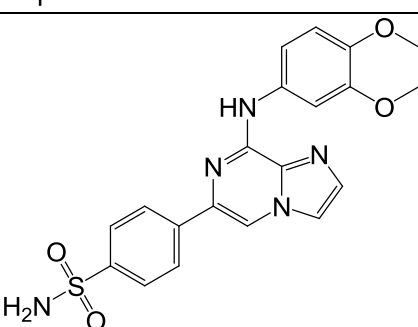
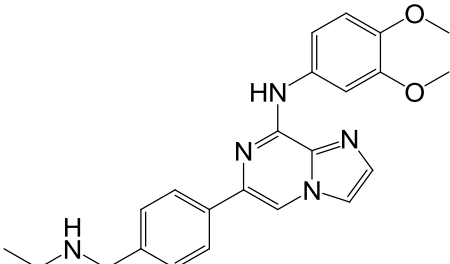
Приклад 2

Наступні сполуки очищали у відповідності зі способами, описаними вище. Фахівцям в галузі органічного синтезу будуть очевидні необхідні модифікації умов реакцій або матеріалів для одержання бажаної сполуки.

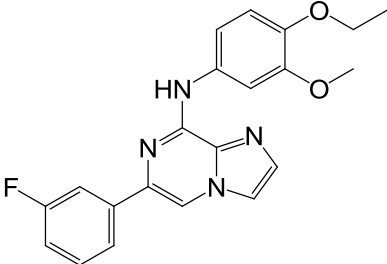
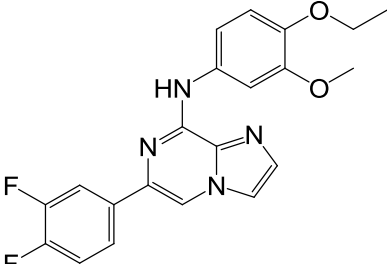
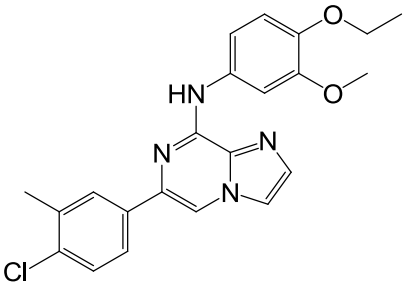
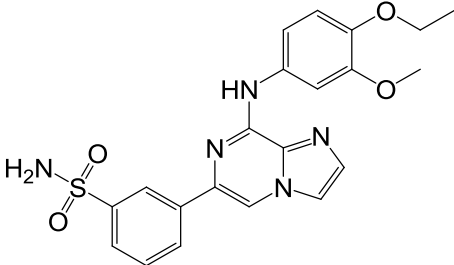
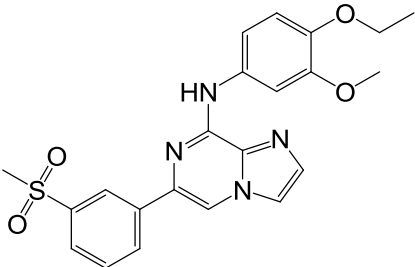
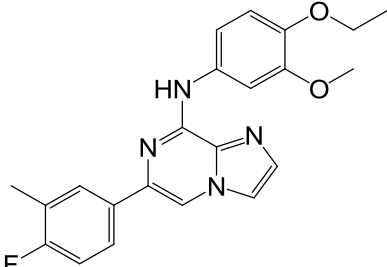
Дані МС відповідно до даного прикладу були отримані в такий спосіб:

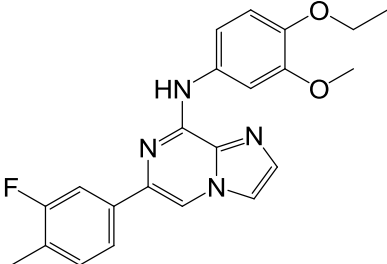
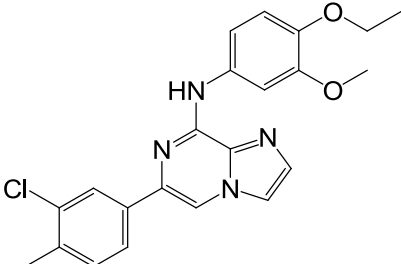
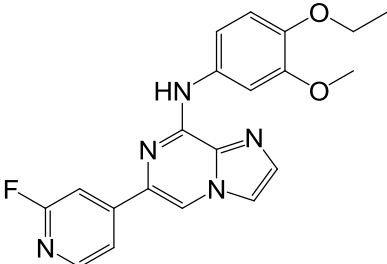
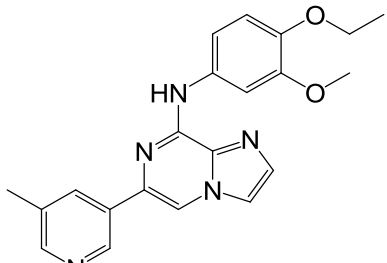
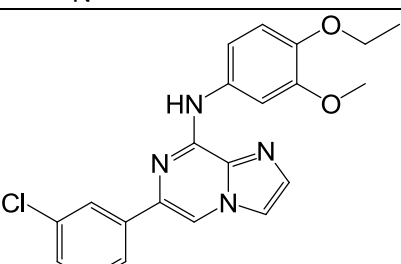
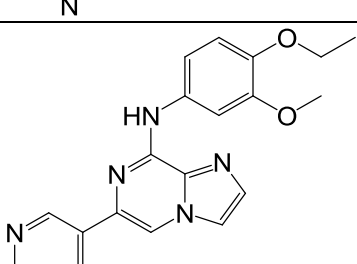
Умови проведення МС: МС з іонізацією електророзпиленням проводили на мас-спектрометрі MICROMASS LCT, оснащеному джерелом LockSpray для точних вимірів маси. Спектри одержували в режимі визначення позитивних іонів з діапазоном мас 100-1000 Да при частоті збору даних 1 спектр/0,9 сек. з інтервалом між сканами, рівним 0,1 сек. Прилад налаштовували на роздільну здатність 5000 (спектральна ширина, FWHM). Кожний 5-й скан відповідав стандарту джерела Lockspray. Лейциненкефалін (556,2771 [M+H]⁺) використовували як стандарт, або масу захоплення.

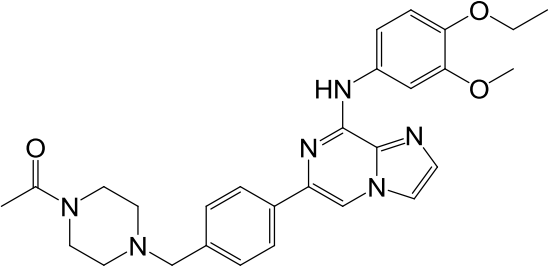
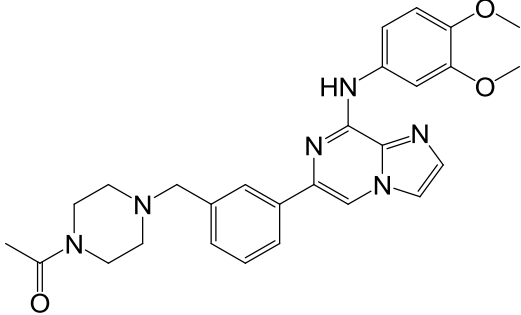
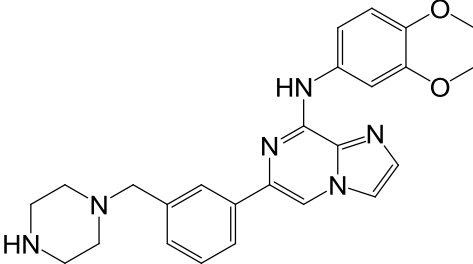
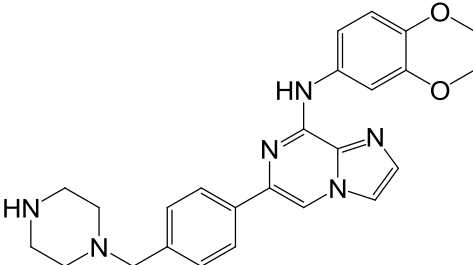
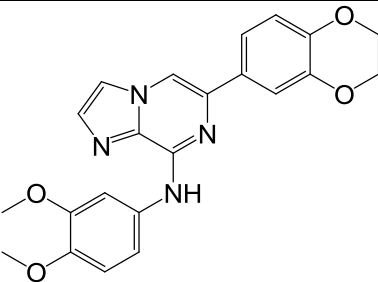
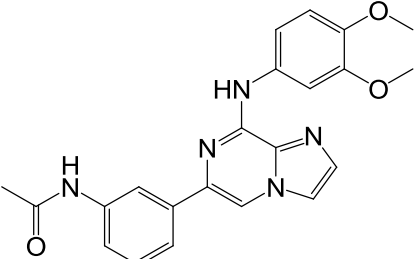
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	N-(3,4-диметоксифеніл)-6-(3-метилфеніл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	361,2
	N-(3,4-диметоксифеніл)-6-(3-нітрофеніл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	392,1
	N-(3,4-диметоксифеніл)-6-{3-[(етиламіно)метил]феніл}імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	404,7
	N-(3,4-диметоксифеніл)-6-[3-(трифторметил)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	415,5
	N-(3,4-диметоксифеніл)-6-(3-метоксифеніл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	377,5
	N-(3,4-диметоксифеніл)-6-(піридин-4-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	348,3

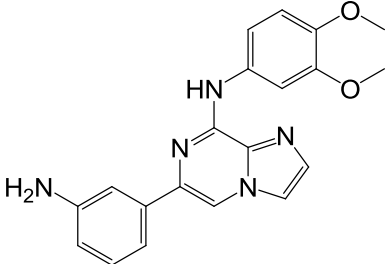
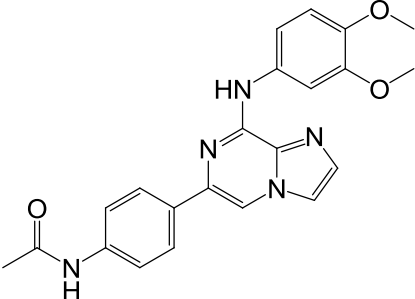
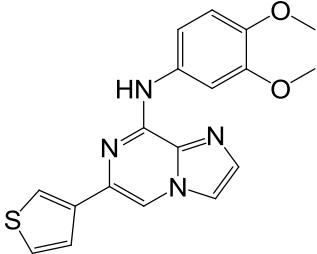
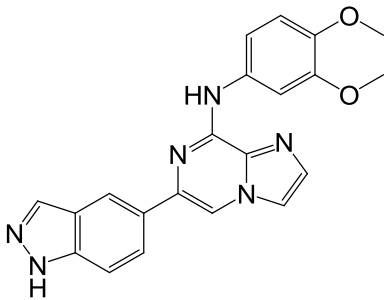
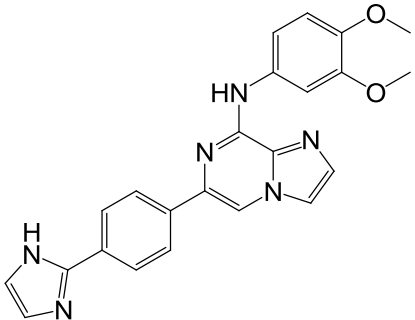
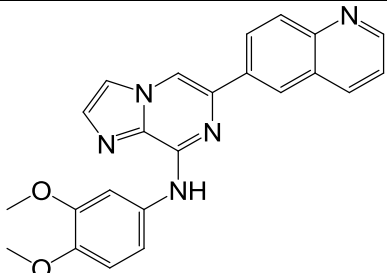
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	N-(3,4-диметоксифеніл)-6-(піридин-3-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	348,2
	N-(3,4-диметоксифеніл)-6-фенілімідазо[1,2-а]піразин-8-амін	347
	3-{8-[(3,4-диметоксифеніл)-аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл}бензонітрил	372
	N-(3,4-диметоксифеніл)-6-(4-фторфеніл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	365,2
	4-{8-[(3,4-диметоксифеніл)-аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл}бензол-1-сульфонамід	426,2
	N-(3,4-диметоксифеніл)-6-{4-[(етиламіно)метил]феніл}імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	404,7

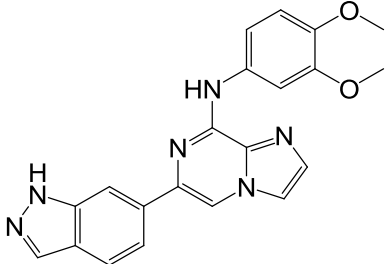
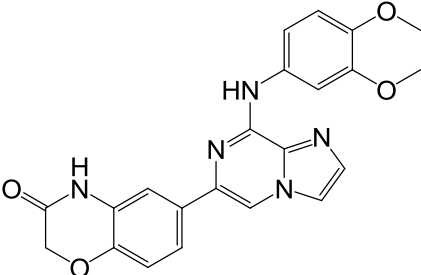
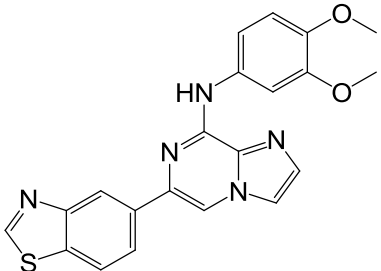
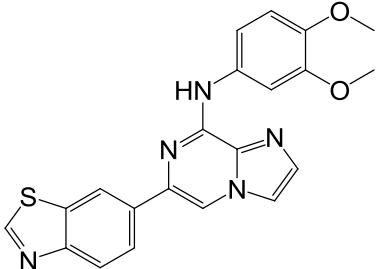
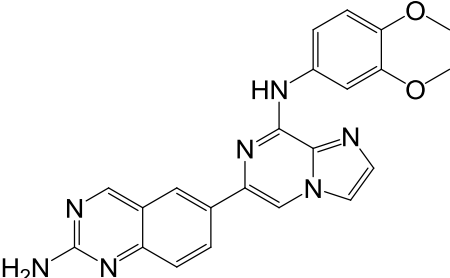
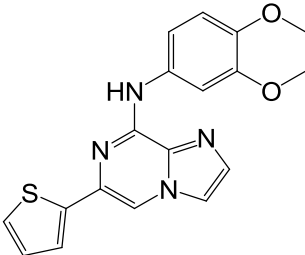
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	6-(4-хлорфеніл)-N-(3,4-диметоксифеніл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	381,2
	6-(3-хлорфеніл)-N-(4-етокси-3-метоксифеніл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	395,2
	N-(3,4-диметоксифеніл)-6-(4-метансульфонілфеніл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	425,2
	4-{8-[(3,4-диметоксифеніл)-аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл}бензонітрил	372,1
	N-(3,4-диметоксифеніл)-6-(4-метилфеніл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	361,2
	N-(4-етокси-3-метоксифеніл)-6-(3-метилфеніл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	375,2

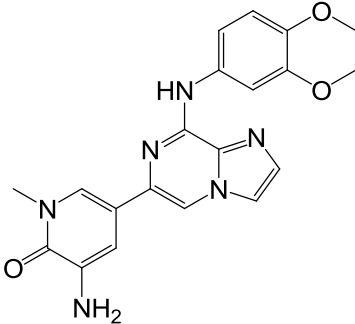
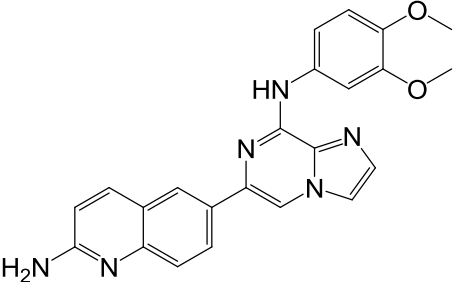
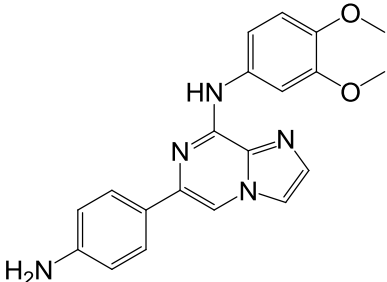
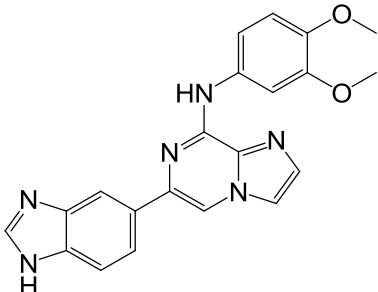
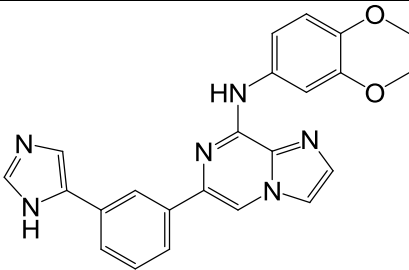
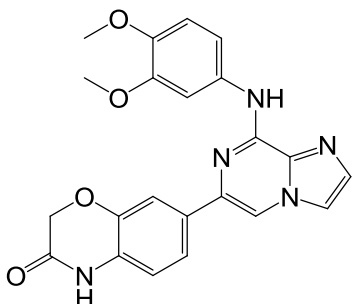
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	N-(4-етокси-3-метоксифеніл)-6-(3-фторфеніл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	379,1
	6-(3,4-дифторфеніл)-N-(4-етокси-3-метоксифеніл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	397,1
	6-(4-хлор-3-метилфеніл)-N-(4-етокси-3-метоксифеніл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	409
	3-{8-[(4-етокси-3-метоксифеніл)-аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл}бензол-1-сульфонамід	440,1
	N-(4-етокси-3-метоксифеніл)-6-(3-метансульфонілфеніл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	439,3
	N-(4-етокси-3-метоксифеніл)-6-(4-фтор-3-метилфеніл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	393,2

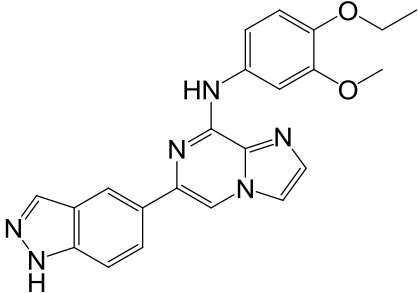
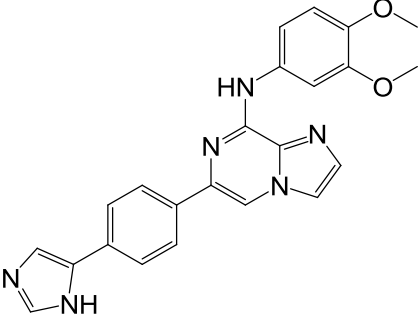
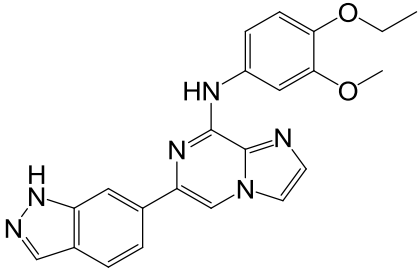
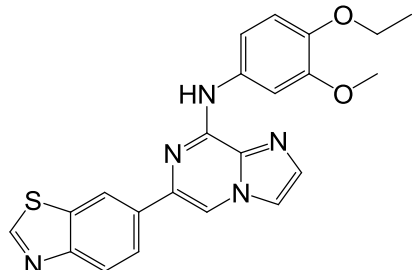
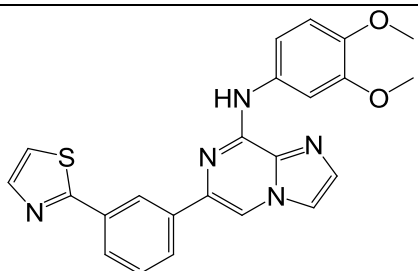
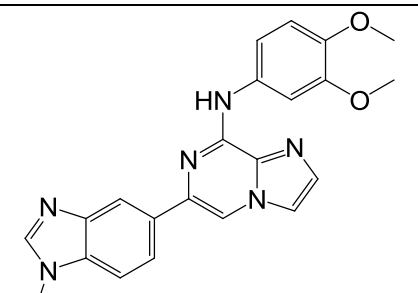
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	N-(4-етокси-3-метоксифеніл)-6-(3-фтор-4-метилфеніл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	393,2
	6-(3-хлор-4-метилфеніл)-N-(4-етокси-3-метоксифеніл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	409,2
	N-(4-етокси-3-метоксифеніл)-6-(2-фторпіридин-4-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	380,3
	N-(4-етокси-3-метоксифеніл)-6-(5-метилпіридин-3-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	376,5
	6-(5-хлорпіридин-3-іл)-N-(4-етокси-3-метоксифеніл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	396,2
	N-(4-етокси-3-метоксифеніл)-6-(піримідин-5-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	363,5

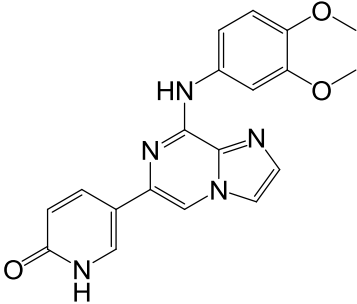
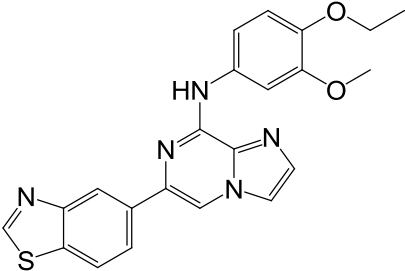
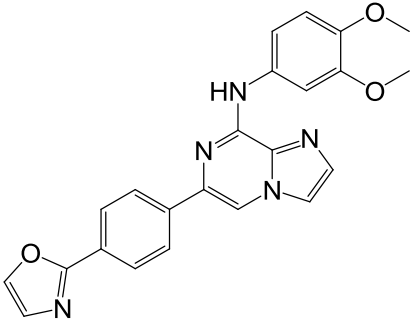
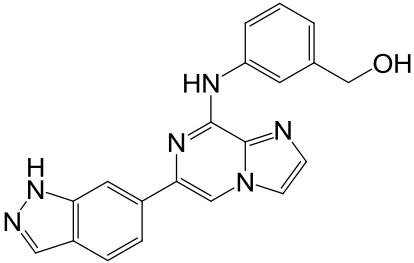
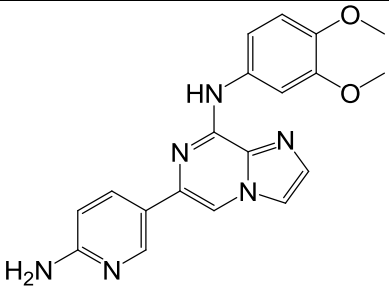
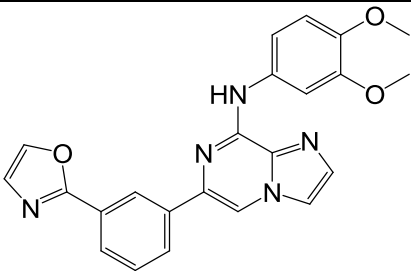
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	1-{4-[(4-{8-[(4-етокси-3-метоксифеніл)аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл}феніл)-метил]піперазин-1-іл}етан-1-ол	487,5
	1-{4-[(3-{8-[(3,4-диметоксифеніл)аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл}феніл)-метил]піперазин-1-іл}етан-1-ол	487,1
	N-(3,4-диметоксифеніл)-6-[3-(піперазин-1-ілметил)-феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	445,3
	N-(3,4-диметоксифеніл)-6-[4-(піперазин-1-ілметил)-феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	445,3
	6-(2,3-дигідро-1,4-бензодіоксин-6-іл)-N-(3,4-диметоксифеніл)-імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	404,42
	N-(3-{8-[(3,4-диметоксифеніл)-аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл}феніл)ацетамід	404,9

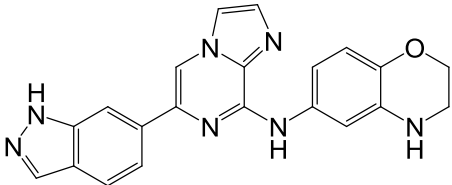
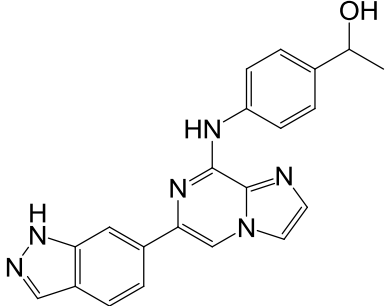
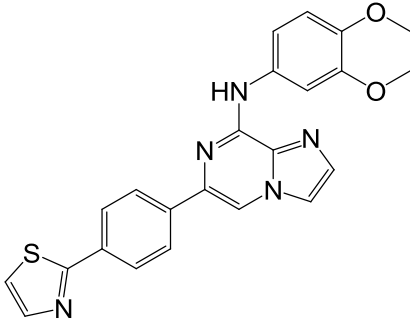
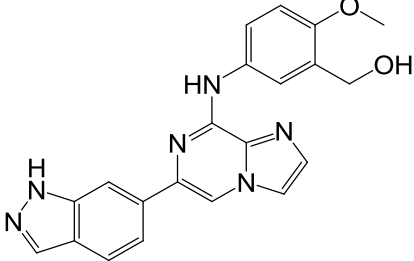
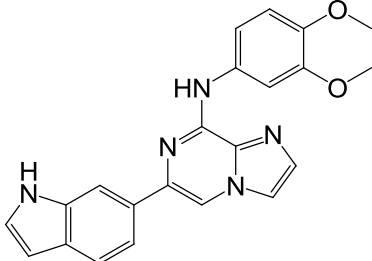
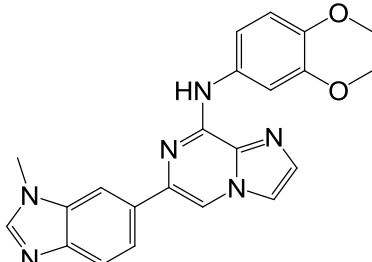
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	6-(3-амінофеніл)-N-(3,4-диметоксифеніл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	362,8
	N-(4-{8-[(3,4-диметоксифеніл)-аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл}феніл)ацетамід	404,6
	N-(3,4-диметоксифеніл)-6-(тіофен-3-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	353,5
	N-(3,4-диметоксифеніл)-6-(1H-індазол-5-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	387,2
	N-(3,4-диметоксифеніл)-6-[4-(1H-імідазол-2-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	413,3
	N-(3,4-диметоксифеніл)-6-(хінолін-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	398

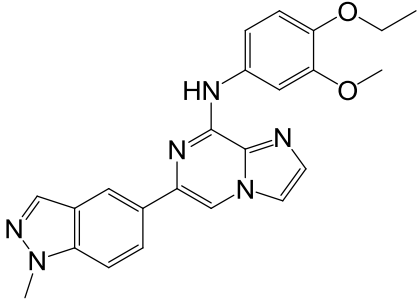
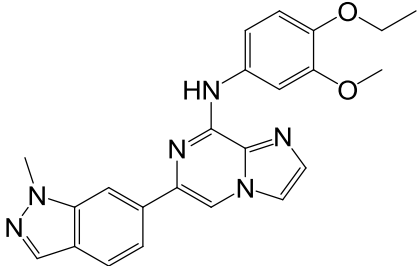
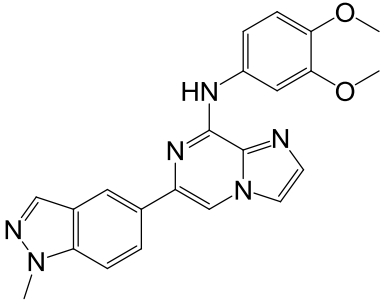
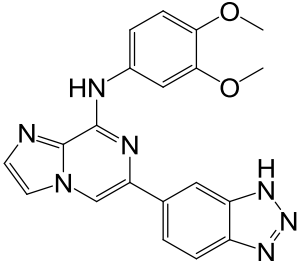
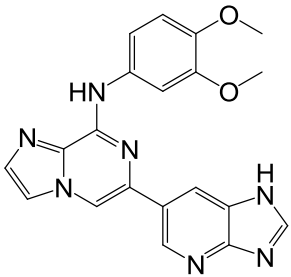
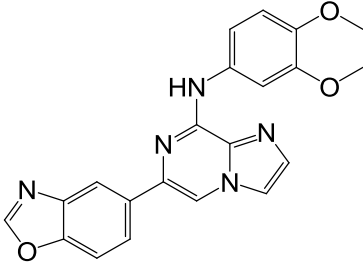
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	N-(3,4-диметоксифеніл)-6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	387,4
	6-{8-[(3,4-диметоксифеніл)-аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл}-3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-3-он	418,6
	6-(1,3-бензотіазол-5-іл)-N-(3,4-диметоксифеніл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	404,6
	6-(1,3-бензотіазол-6-іл)-N-(3,4-диметоксифеніл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	404,9
	6-{8-[(3,4-диметоксифеніл)-аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл}хіназолін-2-амін	414,4
	N-(3,4-диметоксифеніл)-6-(тіофен-2-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	353,4

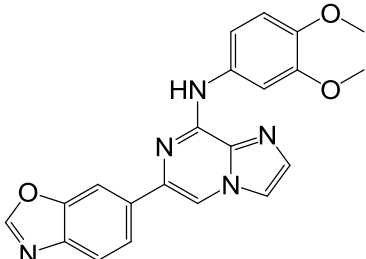
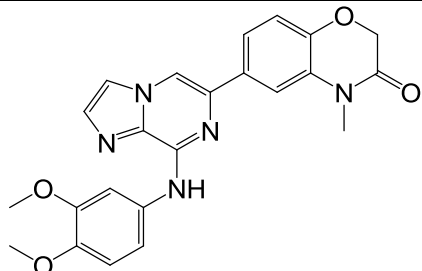
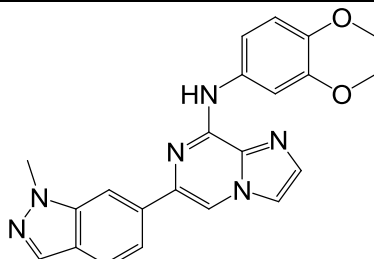
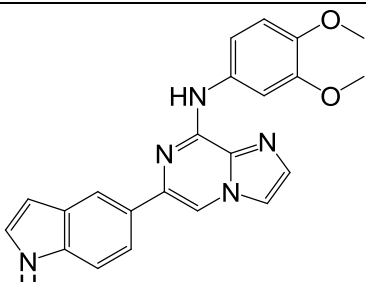
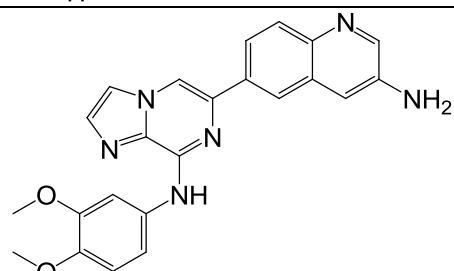
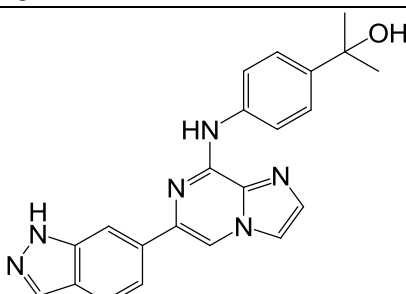
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	3-аміно-5-{8-[(3,4-диметоксифеніл)аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл}-1-метил-1,2-дигідропіридин-2-он	393,3
	6-{8-[(3,4-диметоксифеніл)аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл}хінолін-2-амін	413,3
	6-(4-амінофеніл)-N-(3,4-диметоксифеніл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	362,6
	6-(1H-1,3-бензодіазол-5-іл)-N-(3,4-диметоксифеніл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	387,1
	N-(3,4-диметоксифеніл)-6-[3-(1H-імідазол-5-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	413,3
	7-{8-[(3,4-диметоксифеніл)аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл}-3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-3-он	418,7

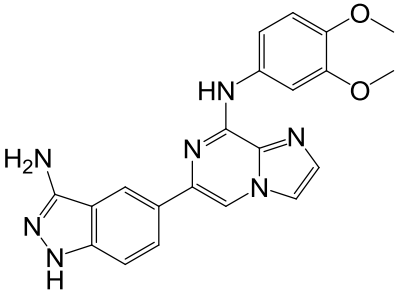
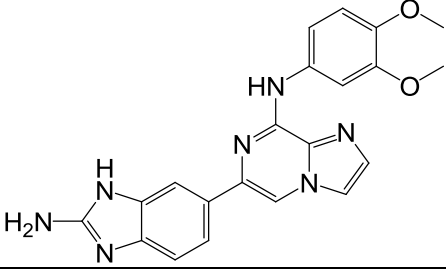
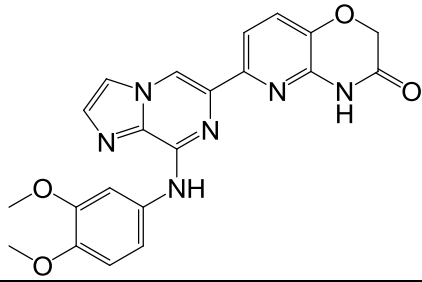
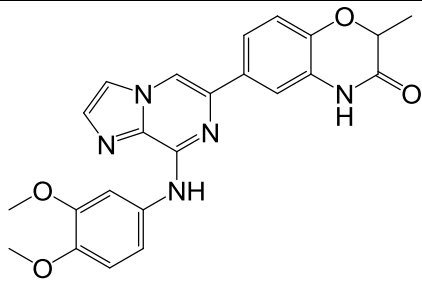
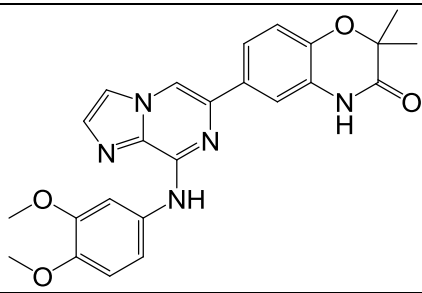
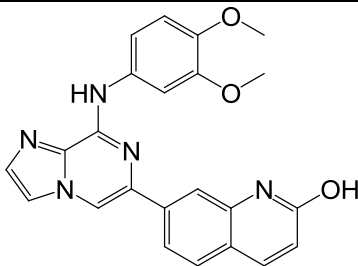
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	N-(4-етокси-3-метоксифеніл)-6-(1H-імдазол-5-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	401,2
	N-(3,4-диметоксифеніл)-6-[4-(1H-імідазол-5-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	413,4
	N-(4-етокси-3-метоксифеніл)-6-(1H-імдазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	401,1
	6-(1,3-бензотіазол-6-іл)-N-(4-етокси-3-метоксифеніл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	418,7
	N-(3,4-диметоксифеніл)-6-[3-(1,3-тіазол-2-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	430,5
	N-(3,4-диметоксифеніл)-6-(1-метил-1H-1,3-бензодіазол-5-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	401,3

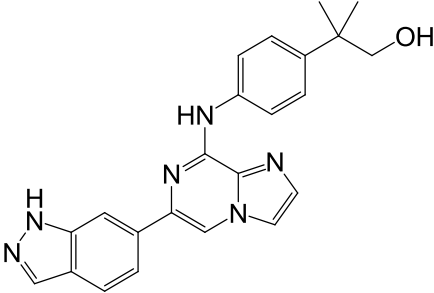
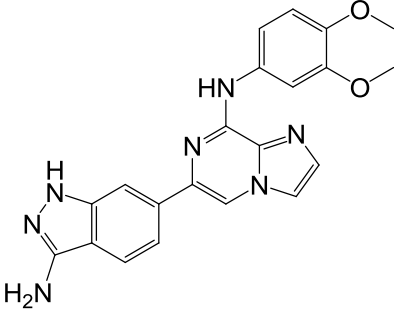
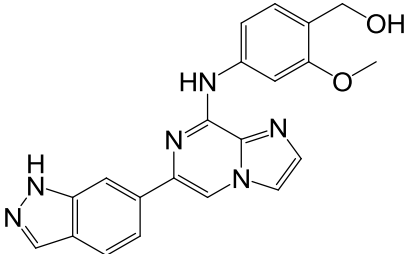
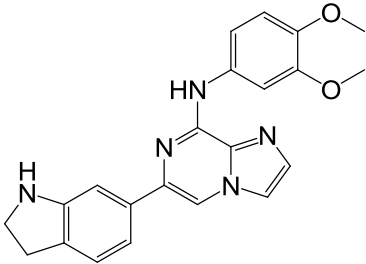
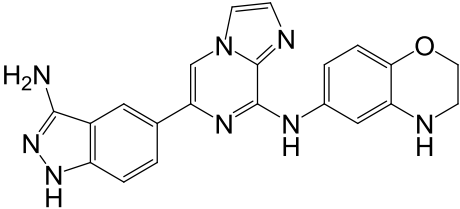
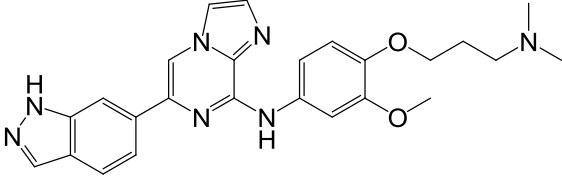
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	5-{8-[(3,4-диметоксифеніл)-аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл}-1,2-дигідропіридин-2-он	364,5
	6-(1,3-бензотіазол-5-іл)-N-(4-етокси-3-метоксифеніл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	418,7
	N-(3,4-диметоксифеніл)-6-[4-(1,3-оксазол-2-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	414,1
	(3-{[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)метанол	357
	5-{8-[(3,4-диметоксифеніл)-аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл}піридин-2-амін	363,2
	N-(3,4-диметоксифеніл)-6-[3-(1,3-оксазол-2-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	414,3

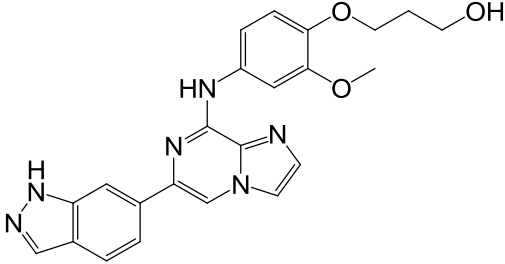
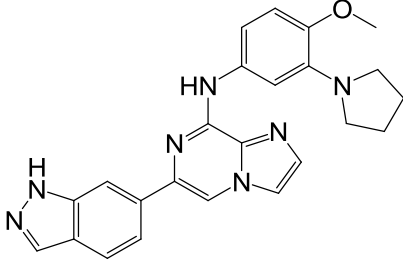
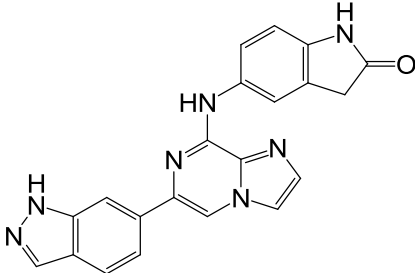
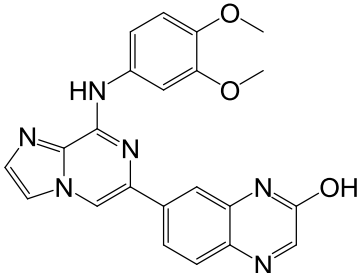
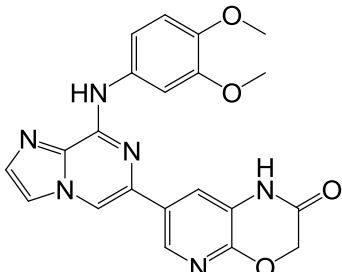
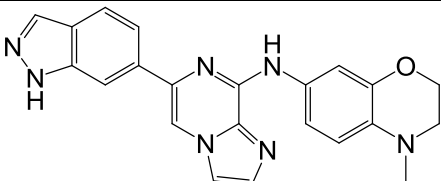
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	N-[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]-3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-6-амін	384
	1-(4-{[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)етан-1-ол	371,1
	N-(3,4-диметоксифеніл)-6-[4-(1,3-тіазол-2-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	430,5
	(5-{[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}-2-метоксифеніл)метанол	387,2
	N-(3,4-диметоксифеніл)-6-(1H-індол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	386,3
	N-(3,4-диметоксифеніл)-6-(1-метил-1H-1,3-бензодіазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	401,2

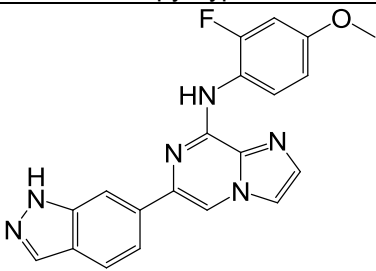
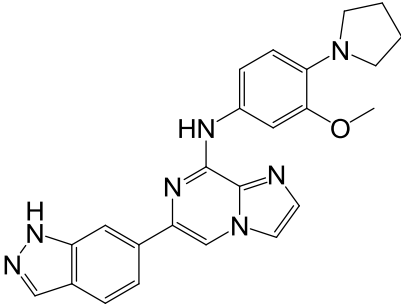
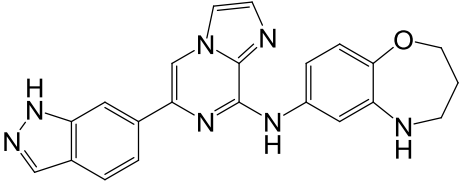
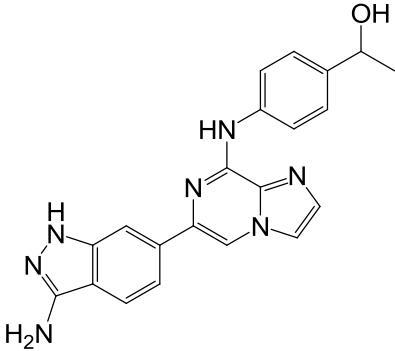
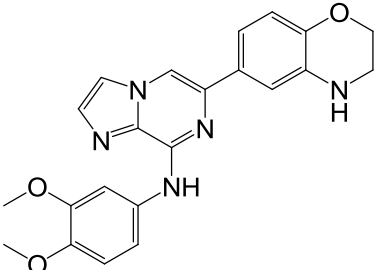
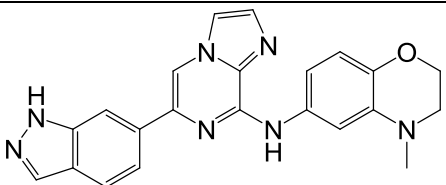
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	N-(4-етокси-3-метоксифеніл)-6-(1-метил-1H-індазол-5-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	415,6
	N-(4-етокси-3-метоксифеніл)-6-(1-метил-1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	415,5
	N-(3,4-диметоксифеніл)-6-(1-метил-1H-індазол-5-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	401,3
	6-(1H-1,2,3-бензотриазол-6-іл)-N-(3,4-диметоксифеніл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	388,2
	N-(3,4-диметоксифеніл)-6-{1H-імідазо[4,5-b]піридин-6-іл}імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	388,3
	6-(1,3-бензоксазол-5-іл)-N-(3,4-диметоксифеніл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	388,7

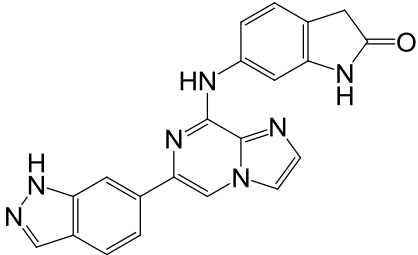
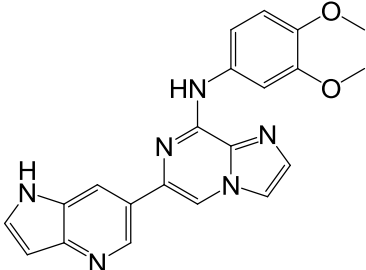
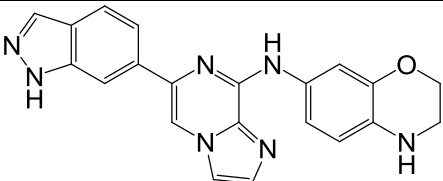
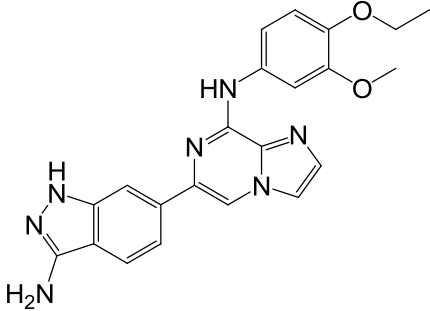
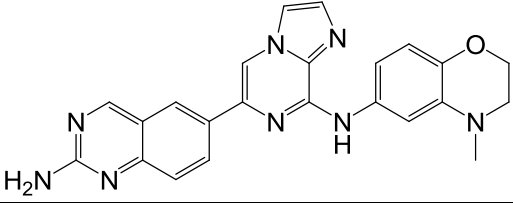
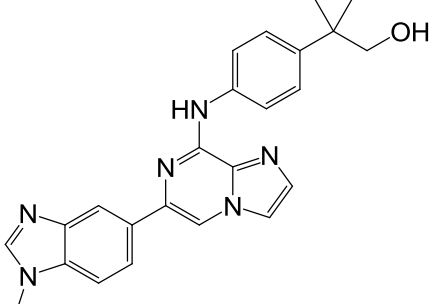
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	6-(1,3-бензоксазол-6-іл)-N-(3,4-диметоксифеніл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	388,3
	6-{8-[(3,4-диметоксифеніл)-аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл}-4-метил-3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-3-он	432,4
	N-(3,4-диметоксифеніл)-6-(1-метил-1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	400,3
	N-(3,4-диметоксифеніл)-6-(1H-індол-5-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	386,4
	6-{8-[(3,4-диметоксифеніл)-аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл}хінолін-3-амін	413,7
	2-(4-{[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)пропан-2-ол	385,1

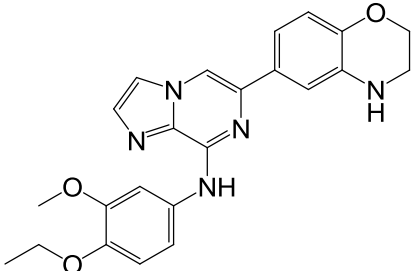
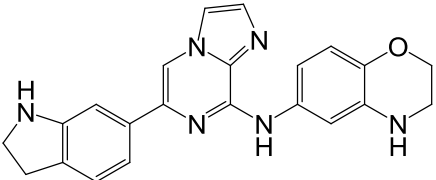
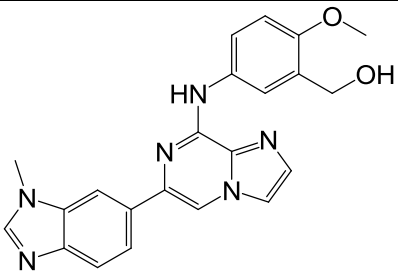
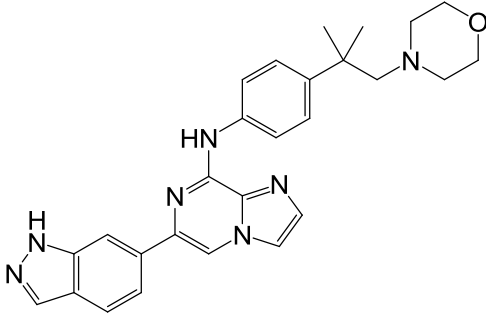
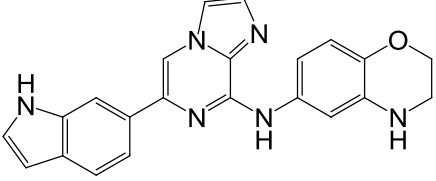
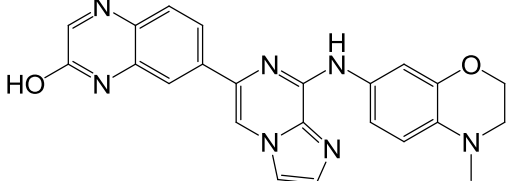
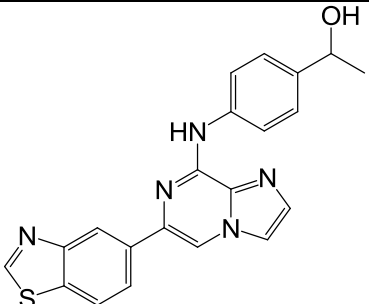
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	5-{8-[(3,4-диметоксифеніл)-аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл}-1H-індазол-3-амін	402,1
	6-{8-[(3,4-диметоксифеніл)-аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл}-1H-1,3-бензодіазол-2-амін	402,3
	6-{8-[(3,4-диметоксифеніл)-аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл}-2H,4H-піридо[3,2-б][1,4]оксазин-3-он	3H, 419,5
	6-{8-[(3,4-диметоксифеніл)-аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл}-2-метил-3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-3-он	432,5
	6-{8-[(3,4-диметоксифеніл)-аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл}-2,2-диметил-3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-3-он	446,4
	7-{8-[(3,4-диметоксифеніл)-аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл}хінолін-2-ол	414,3

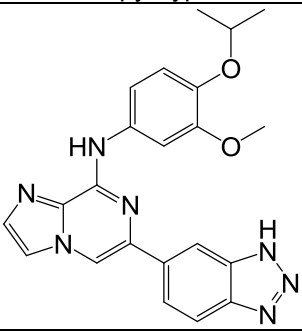
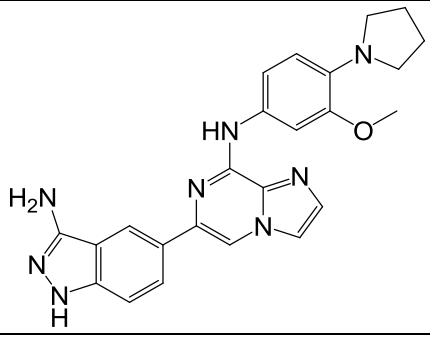
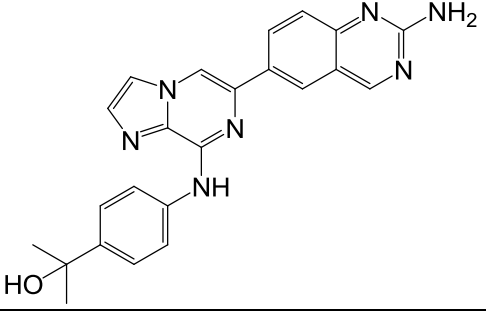
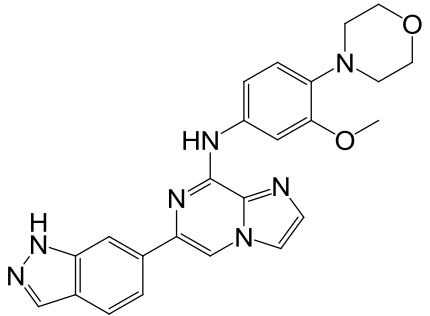
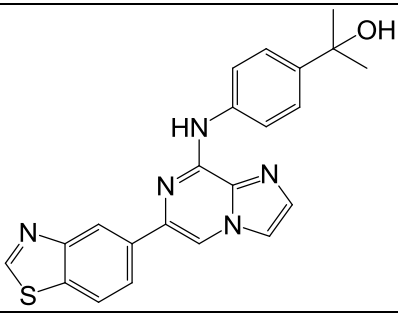
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	2-(4-[[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)-2-метилпропан-1-ол	399,3
	6-{8-[(3,4-диметоксифеніл)-аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл}-1H-індазол-3-амін	400,2
	(4-[[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}-2-метоксифеніл)метанол	385,3
	6-(2,3-дигідро-1H-індол-6-іл)-N-(3,4-диметоксифеніл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	388,8
	N-[6-(3-аміно-1H-індазол-5-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]-3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-6-амін	399,2
	N-[4-[3-(диметиламіно)пропокси]-3-метоксифеніл]-6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	458,7

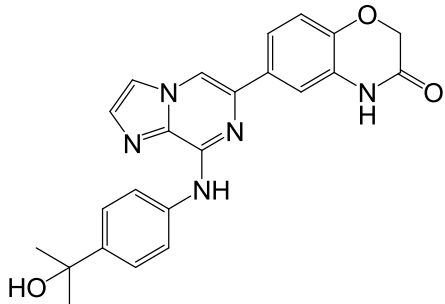
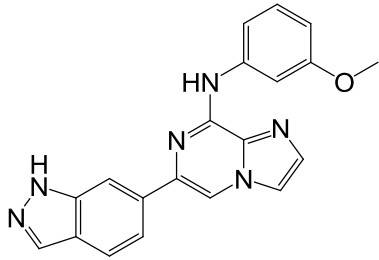
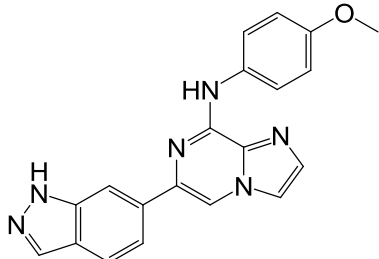
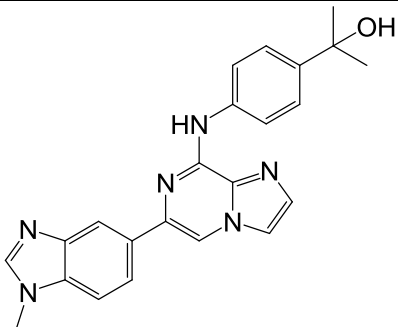
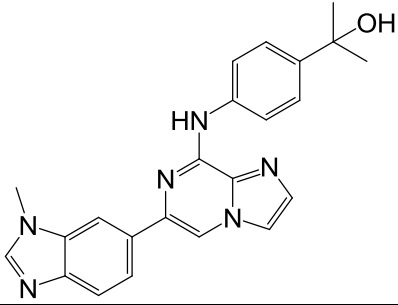
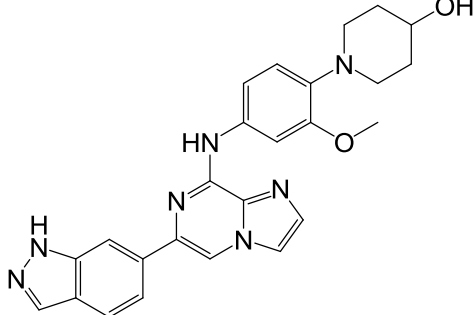
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	3-(4-({6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}-2-метоксифенокси)пропан-1-ол	431,6
	6-(1H-індазол-6-іл)-N-[4-метокси-3-(піролідин-1-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	426,3
	5-({6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}-2,3-дигідро-1H-індол-2-он	382,3
	7-{8-[(3,4-диметоксифеніл)-аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл}хіноксалін-2-ол	413,5
	7-{8-[(3,4-диметоксифеніл)-аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл}-1H, 3H-піридо[2,3-б][1,4]оксазин-2-он	2H, 419,5
	N-[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]-4-метил-3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-7-амін	398,3

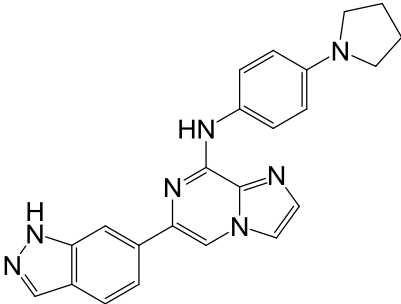
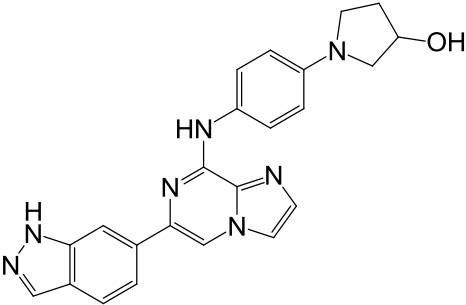
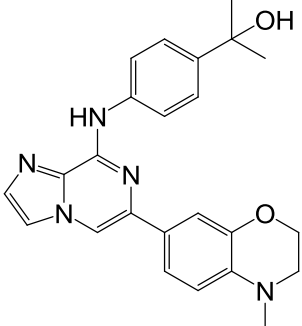
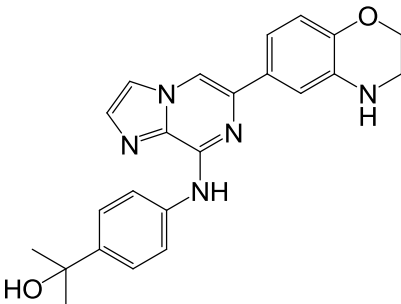
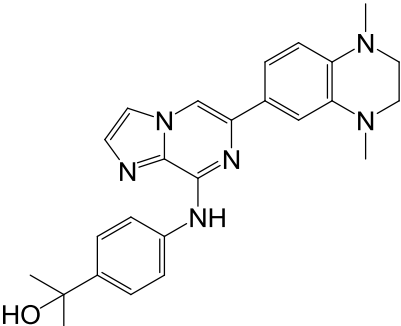
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	N-(2-фтор-4-метоксифеніл)-6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	375,3
	6-(1H-індазол-6-іл)-N-[3-метокси-4-(піролідин-1-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	425,5
	N-[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]-2,3,4,5-тетрагідро-1,5-бензоксазепін-7-амін	398,5
	1-(4-([6-(3-аміно-1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно)феніл)етан-1-ол	386,4
	6-(3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-6-іл)-N-(3,4-диметоксифеніл)-імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	404,5
	N-[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]-4-метил-3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-6-амін	396,3

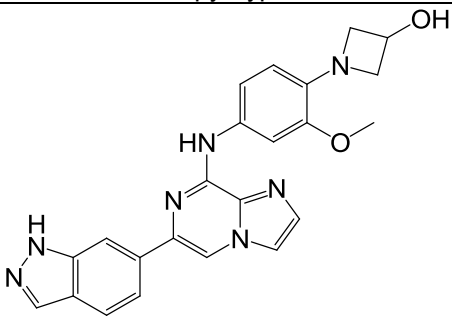
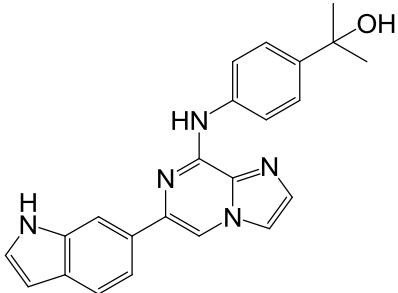
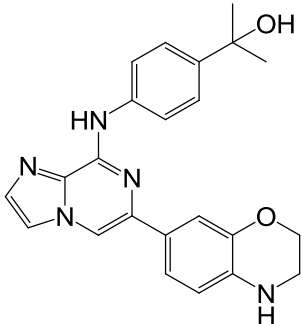
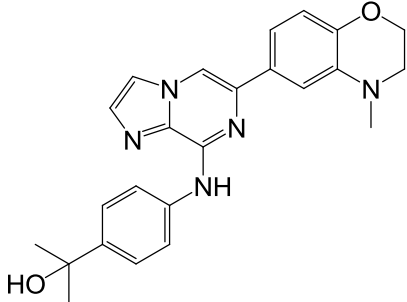
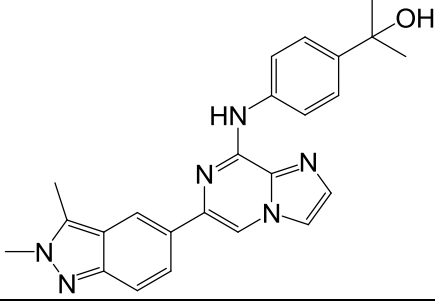
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	6-([6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно)-2,3-дигідро-1H-індол-2-он	382,3
	N-(3,4-диметоксифеніл)-6-{1H-піроло[3,2-б]піридин-6-іл}імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	387,6
	N-[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]-3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-7-амін	384,3
	6-{8-[(4-етокси-3-метоксифеніл)-аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл}-1H-індазол-3-амін	416,8
	N-[6-(2-амінохіназолін-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]-4-метил-3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-6-амін	425,2
	2-метил-2-(4-{[6-(1-метил-1H-1,3-бензодіазол-5-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)пропан-1-ол	413,7

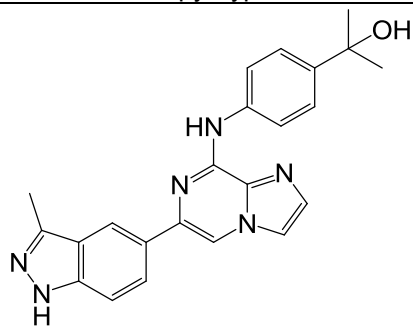
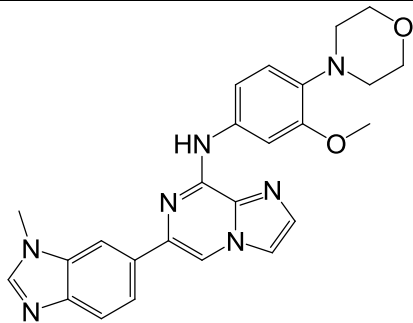
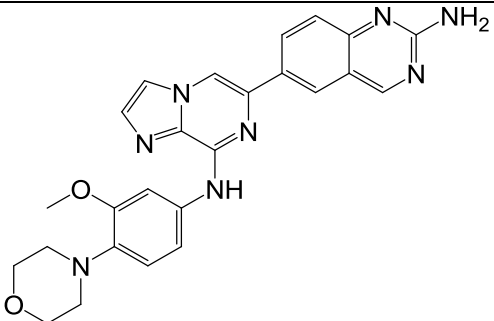
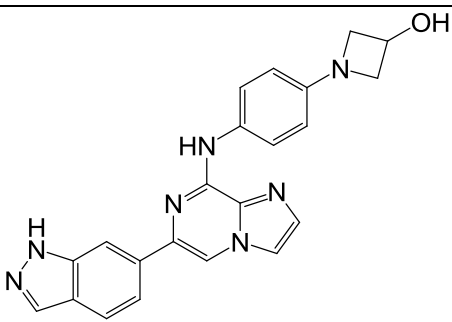
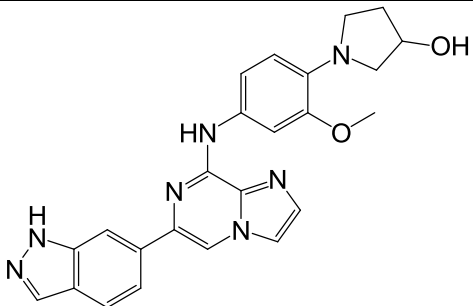
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	6-(3,4-дигідро-2Н-1,4-бензоксазин-6-іл)-N-(4-етокси-3-метоксифеніл)-імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	418,4
	N-[6-(2,3-дигідро-1Н-індол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]-3,4-дигідро-2Н-1,4-бензоксазин-6-амін	385,3
	(2-метокси-5-{[6-(1-метил-1Н-1,3-бензодіазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)метанол	401,2
	6-(1Н-індазол-6-іл)-N-{4-[2-метил-1-(морфолін-4-іл)пропан-2-іл]феніл}імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	468,6
	N-[6-(1Н-індол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]-3,4-дигідро-2Н-1,4-бензоксазин-6-амін	383,4
	7-{8-[(4-метил-3,4-дигідро-2Н-1,4-бензоксазин-7-іл)аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл}хіноксалін-2-ол	426,2
	1-(4-{[6-(1,3-бензотіазол-5-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)етан-1-ол	388,7

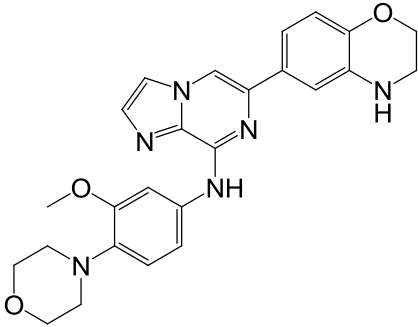
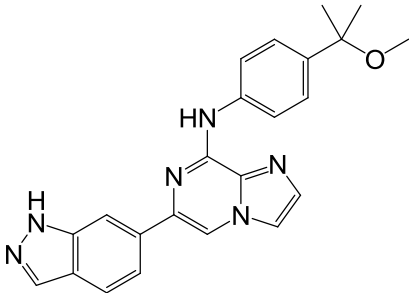
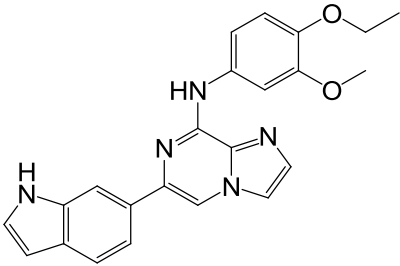
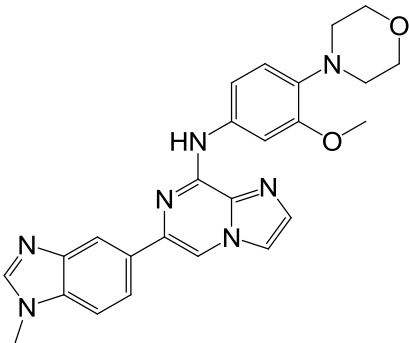
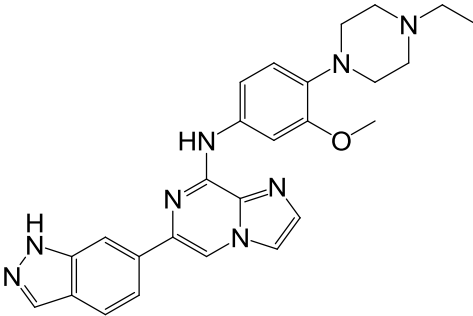
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	6-(1H-1,2,3-бензотриазол-6-іл)-N-[3-метокси-4-(пропан-2-ілокси)-феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	416,6
	5-(8-([3-метокси-4-(піролідин-1-іл)феніл]аміно)імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-1H-індазол-3-амін	441,4
	2-(4-([6-(2-амінохіназолін-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно)феніл)пропан-2-ол	412,4
	6-(1H-індазол-6-іл)-N-[3-метокси-4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	442,5
	2-(4-([6-(1,3-бензотіазол-5-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно)феніл)пропан-2-ол	402,3

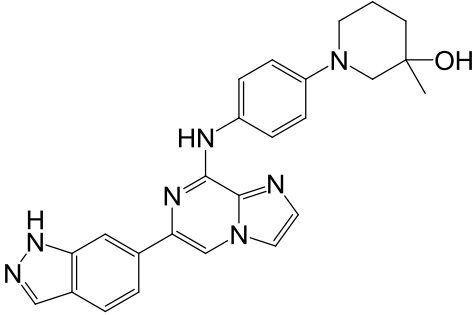
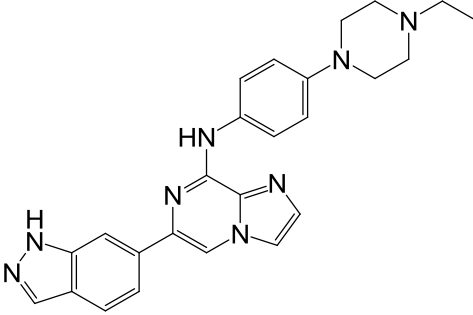
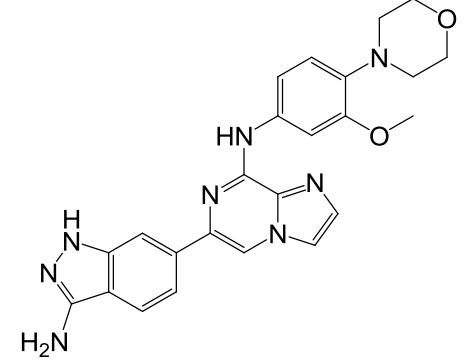
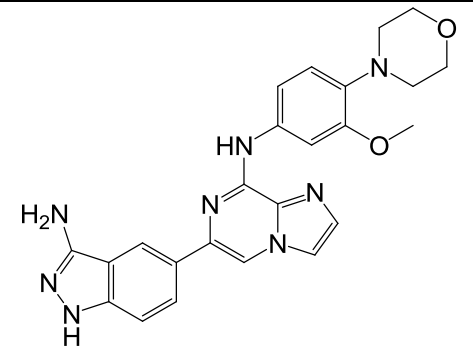
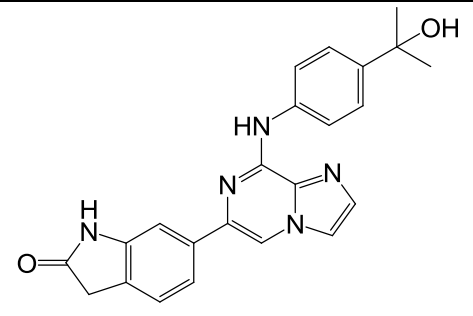
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	6-(8-({4-(2-гідроксипропан-2-іл)феніл}аміно)імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-3-он	416,7
	6-(1H-індазол-6-іл)-N-(3-метоксифеніл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	357,3
	6-(1H-індазол-6-іл)-N-(4-метоксифеніл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	357,3
	2-(4-({6-(1-метил-1H-1,3-бензодіазол-5-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл}аміно)феніл)пропан-2-ол	399,1
	2-(4-({6-(1-метил-1H-1,3-бензодіазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл}аміно)феніл)пропан-2-ол	399,2
	1-(4-({6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл}аміно)-2-метоксифеніл)піперидин-4-ол	456,5

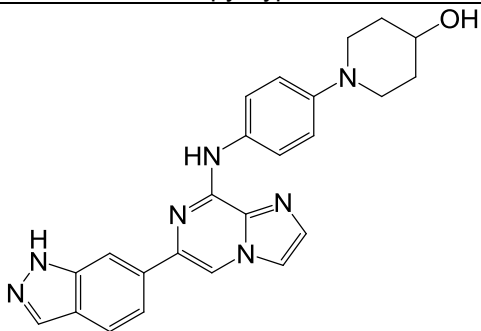
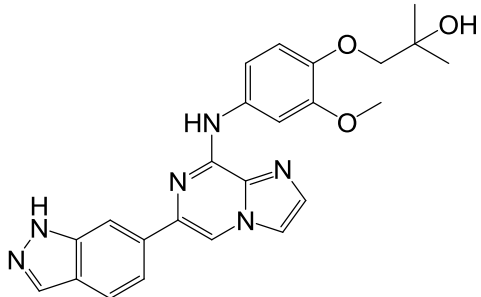
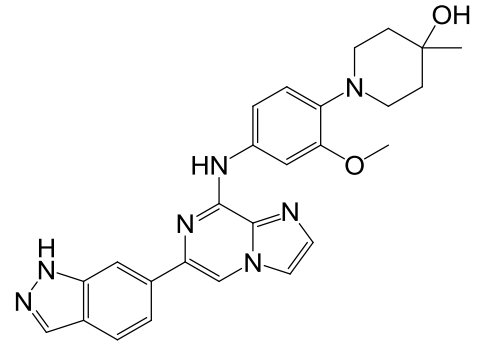
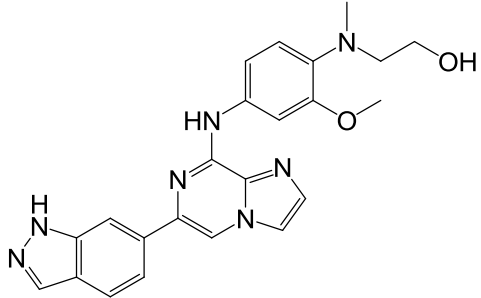
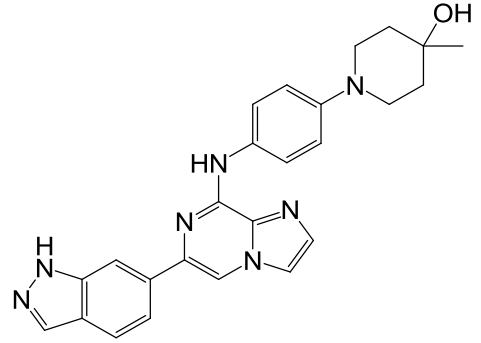
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	6-(1H-індазол-6-іл)-N-[4-(піролідин-1-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	396,1
	1-(4-([6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно)феніл)-піролідин-3-ол	412,3
	2-(4-([6-(4-метил-3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-7-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно)феніл)пропан-2-ол	416,5
	2-(4-([6-(3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно)феніл)пропан-2-ол	402,5
	2-(4-([6-(1,4-диметил-1,2,3,4-тетрагідрокіноксалін-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно)феніл)пропан-2-ол	429,4

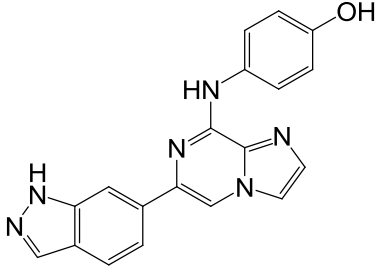
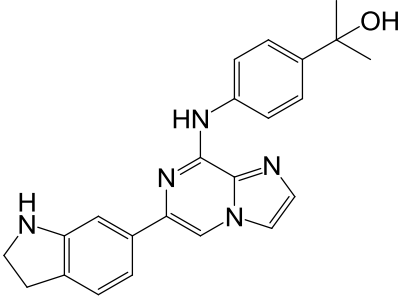
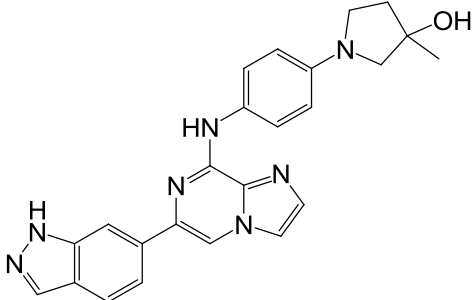
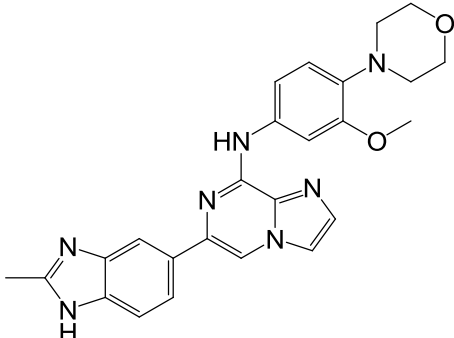
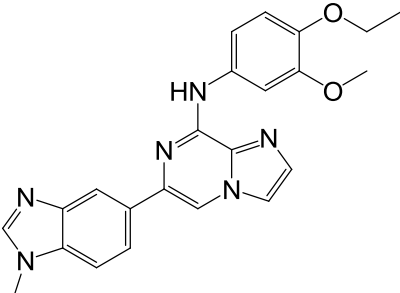
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	1-(4-({[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}-2-метоксифеніл)азетидин-3-ол	428,3
	2-(4-({[6-(1H-індол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)пропан-2-ол	384,2
	2-(4-({[6-(3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-7-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)пропан-2-ол	402,5
	2-(4-({[6-(4-метил-3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)пропан-2-ол	416,7
	2-(4-({[6-(2,3-диметил-2H-індазол-5-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)пропан-2-ол	413,4

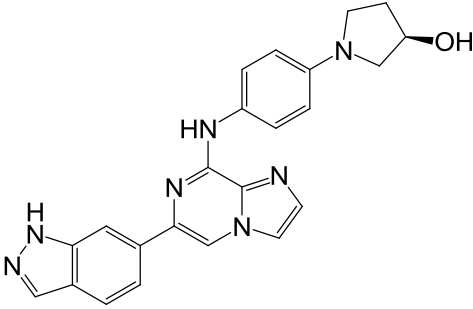
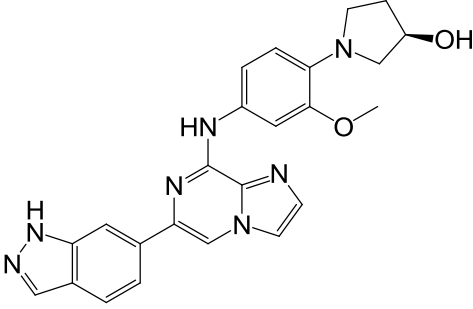
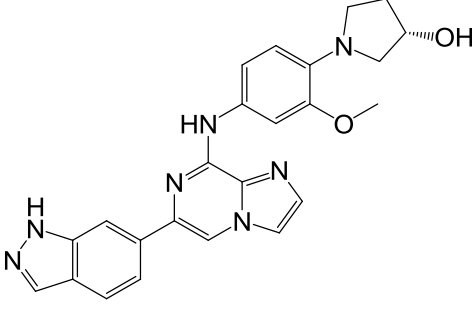
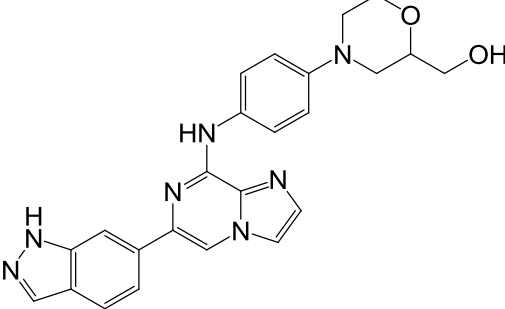
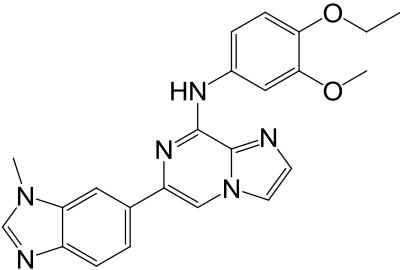
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	2-(4-{{[6-(3-метил-1H-індазол-5-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл}пропан-2-ол	399,2
	N-[3-метокси-4-(морфолін-4-іл)феніл]-6-(1-метил-1H-1,3-бензодіазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	456,3
	6-(8-{{[3-метокси-4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл}хіназолін-2-амін	469,4
	1-(4-{{[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл}азетидин-3-ол	398,3
	1-(4-{{[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}-2-метоксифеніл}піролідін-3-ол	442,5

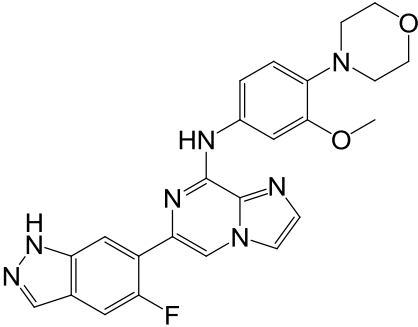
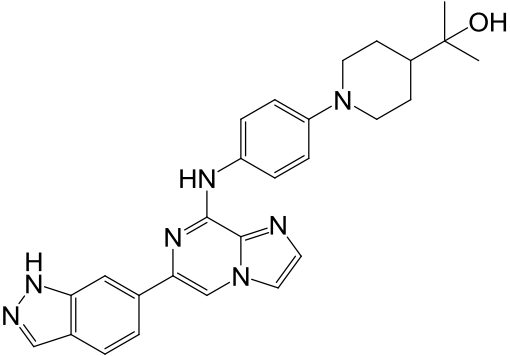
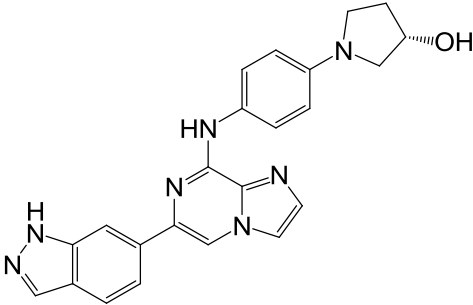
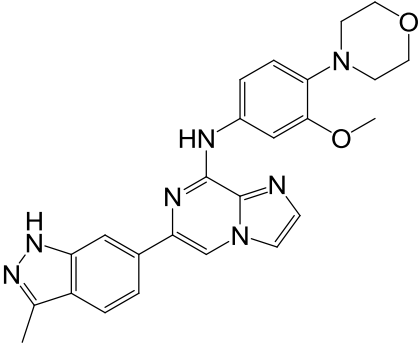
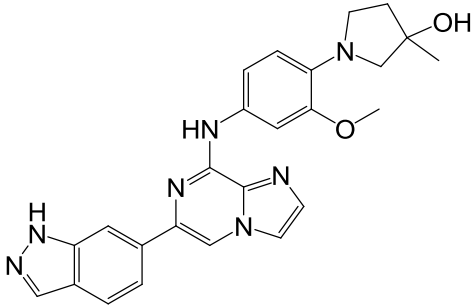
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	6-(3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-6-іл)-N-[3-метокси-4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	459,7
	6-(1H-індазол-6-іл)-N-[4-(2-метоксипропан-2-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	399,4
	N-(4-етокси-3-метоксифеніл)-6-(1H-індол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	400,1
	N-[3-метокси-4-(морфолін-4-іл)феніл]-6-(1-метил-1H-1,3-бензодіазол-5-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	456,4
	N-[4-(4-етилпіперазин-1-іл)-3-метоксифеніл]-6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	469,7

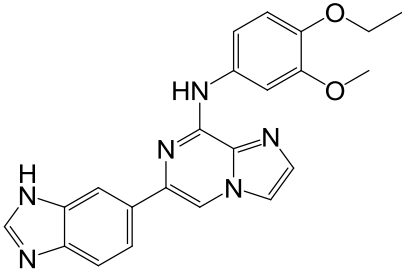
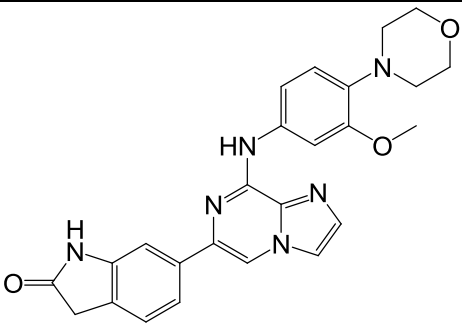
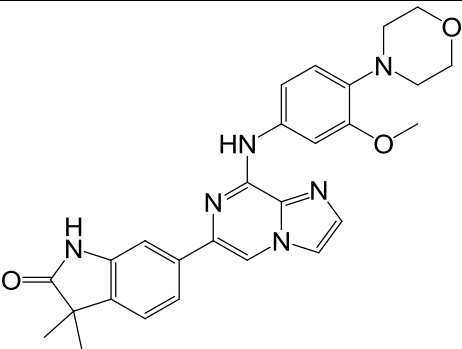
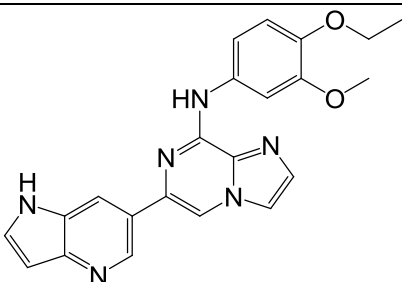
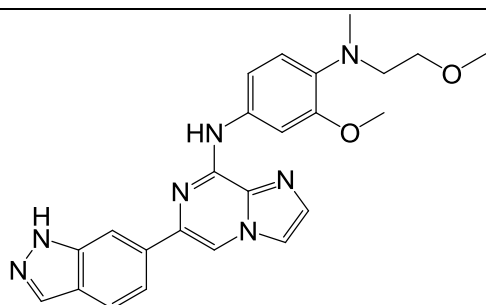
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	1-(4-([6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно)феніл)-3-метилпіперидин-3-ол	440,5
	N-[4-(4-етилпіперазин-1-іл)феніл]-6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	439,4
	6-(8-([3-метокси-4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно)імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-1H-індазол-3-амін	457,6
	5-(8-([3-метокси-4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно)імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-1H-індазол-3-амін	457,5
	6-(8-([4-(2-гідроксипропан-2-іл)феніл]аміно)імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-2,3-дигідро-1H-індол-2-он	399,45

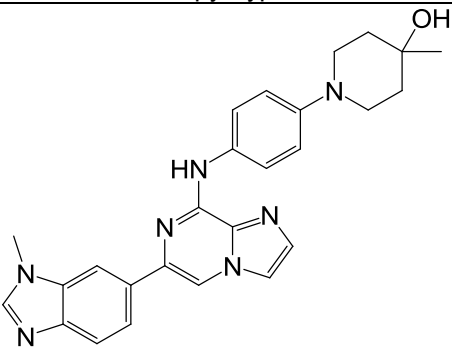
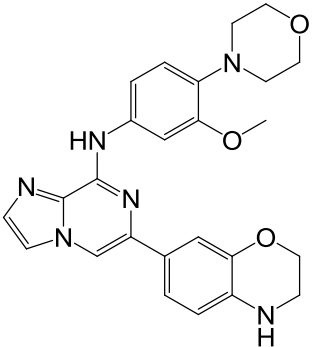
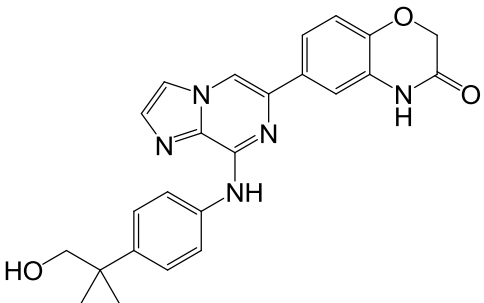
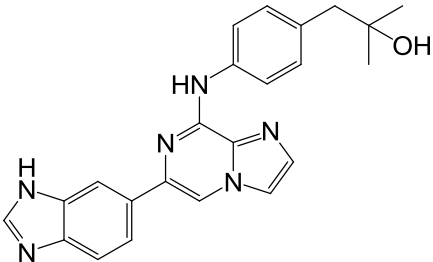
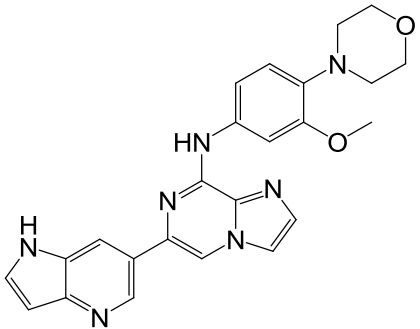
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	1-(4-([6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно)феніл)-піперидин-4-ол	426,2
	1-(4-([6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно)-2-метокси-фенокси)-2-метилпропан-2-ол	443,6
	1-(4-([6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно)-2-метокси-феніл)-4-метилпіперидин-4-ол	470,9
	2-[(4-([6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно)-2-метоксифеніл)(метил)аміно]етан-1-ол	430,5
	1-(4-([6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно)феніл)-4-метилпіперидин-4-ол	440,4

Структура	Назва	[M+H] ⁺
	4-([6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно)фенол	343,2
	2-(4-([6-(2,3-дигідро-1H-індол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно)феніл)пропан-2-ол	386,2
	1-(4-([6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно)феніл)-3-метилпіролідін-3-ол	426,2
	N-[3-метокси-4-(морфолін-4-іл)феніл]-6-(2-метил-1H-1,3-бензодіазол-5-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	456,3
	N-(4-етокси-3-метоксифеніл)-6-(1-метил-1H-1,3-бензодіазол-5-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	415,6

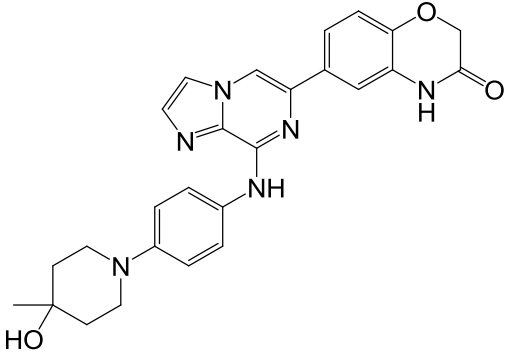
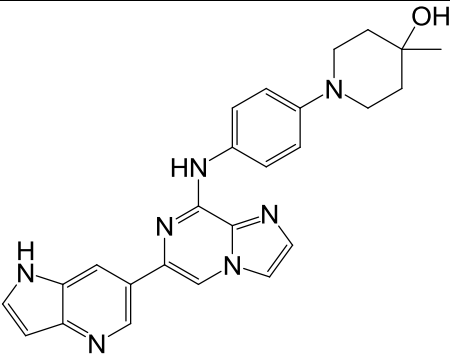
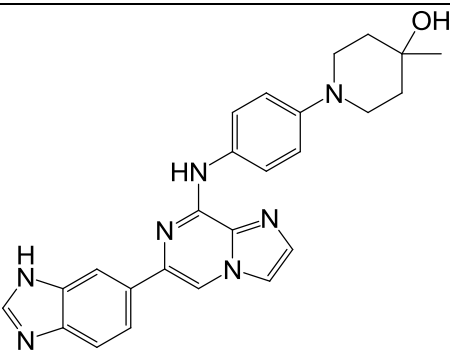
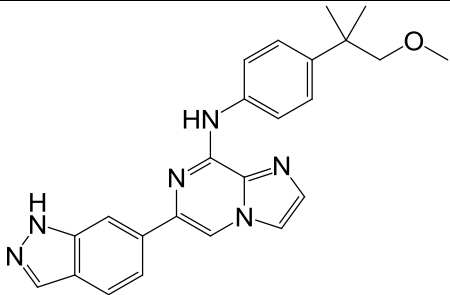
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	(3R)-1-(4-([6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно)феніл)піролідин-3-ол	412,2
	(3R)-1-(4-([6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно)-2-метоксифеніл)піролідин-3-ол	442,7
	(3S)-1-(4-([6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно)-2-метоксифеніл)піролідин-3-ол	442,7
	[4-(4-([6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно)феніл)морфолін-2-іл]метанол	442,7
	N-(4-етокси-3-метоксифеніл)-6-(1-метил-1H-1,3-бензодіазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	415,4

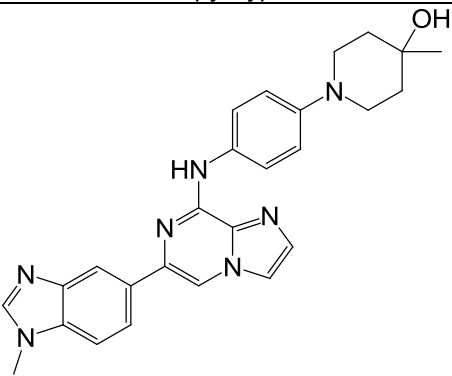
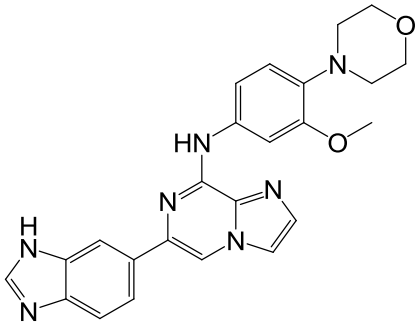
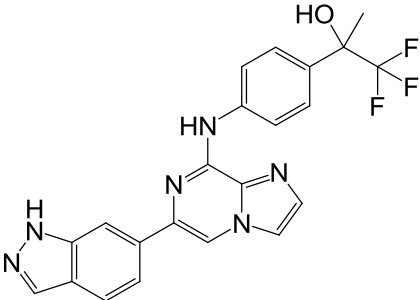
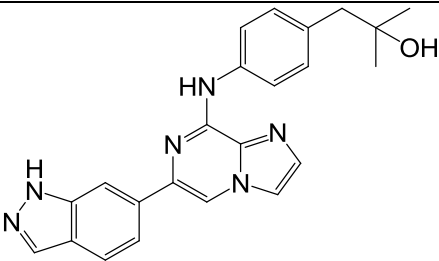
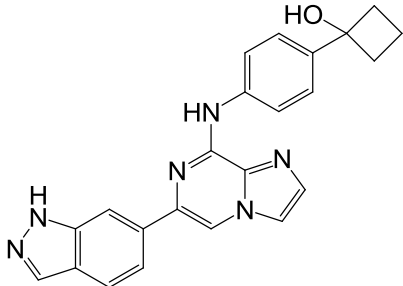
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	6-(5-фтор-1H-індазол-6-іл)-N-[3-метокси-4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	460,6
	2-[1-(4-[[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)піперидин-4-іл]пропан-2-ол	468,5
	(3S)-1-(4-[[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)піролідин-3-ол	412,1
	N-[3-метокси-4-(морфолін-4-іл)феніл]-6-(3-метил-1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	456,2
	1-(4-[[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}-2-метоксифеніл)-3-метилпіролідин-3-ол	456,2

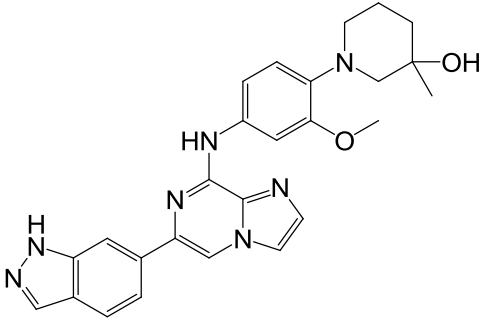
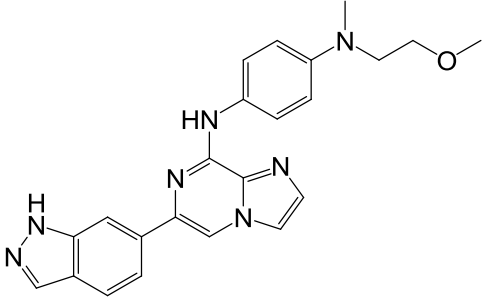
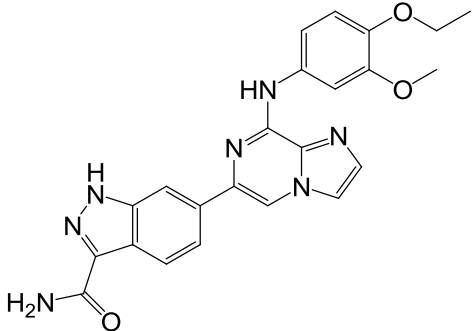
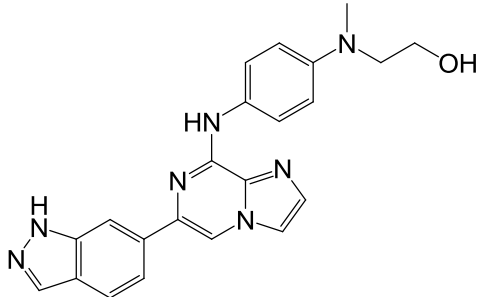
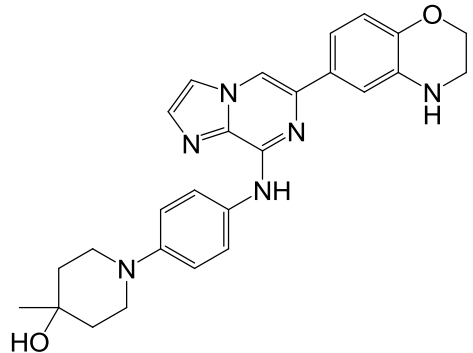
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	6-(1H-1,3-бензодіазол-6-іл)-N-(4-етокси-3-метоксифеніл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	401,2
	6-(8-{{3-метокси-4-(морфолін-4-іл)феніл}аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-2,3-дигідро-1H-індол-2-он	457,7
	6-(8-{{3-метокси-4-(морфолін-4-іл)феніл}аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-3,3-диметил-2,3-дигідро-1H-індол-2-он	485,7
	N-(4-етокси-3-метоксифеніл)-6-{1H-піроло[3,2-b]піридин-6-іл}імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	401,2
	4-N-[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]-2-метокси-1-N-(2-метоксиетил)-1-N-метилбензол-1,4-діамін	444,3

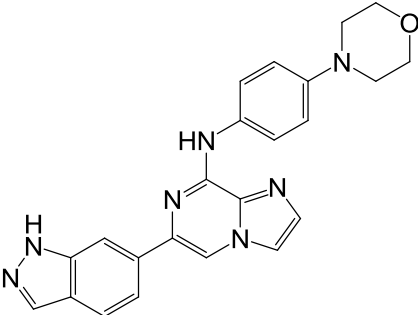
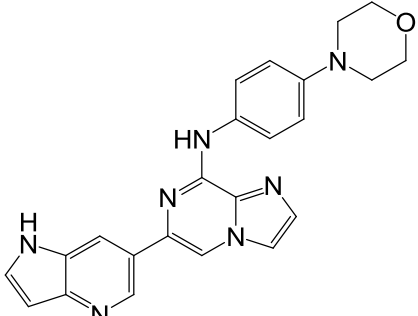
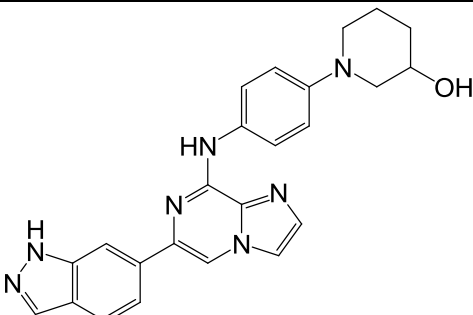
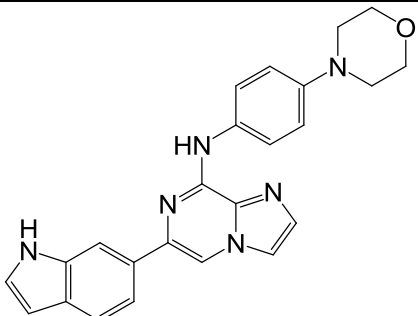
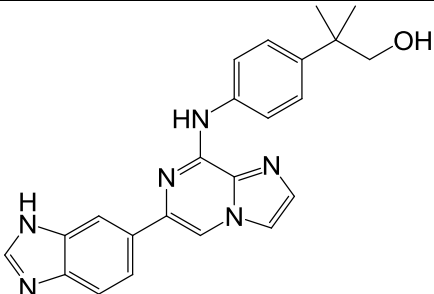
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	4-метил-1-(4-({6-(1-метил-1H-1,3-бензодіазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл}аміно)феніл)-піперидин-4-ол	454,1
	6-(3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-7-іл)-N-[3-метокси-4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	459,4
	6-(8-({4-(1-гідрокси-2-метилпропан-2-іл)феніл}аміно)імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-3-он	430,2
	1-(4-({6-(1H-1,3-бензодіазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл}аміно)феніл)-2-метилпропан-2-ол	397,2
	N-[3-метокси-4-(морфолін-4-іл)феніл]-6-{1H-піроло[3,2-b]піридин-6-іл}імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	442,7

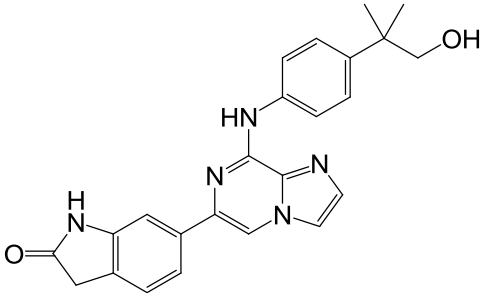
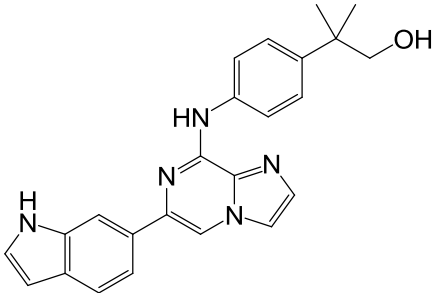
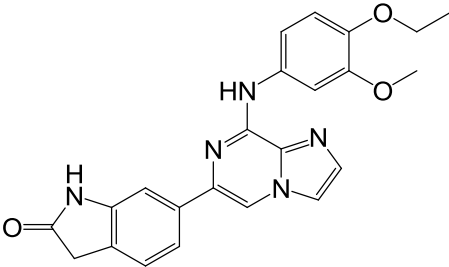
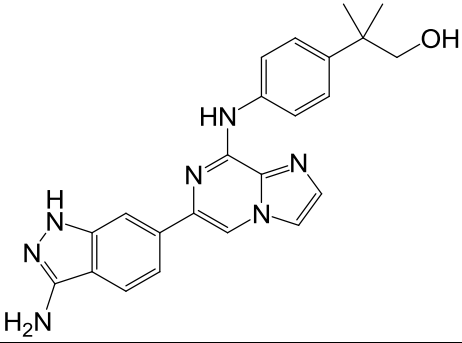
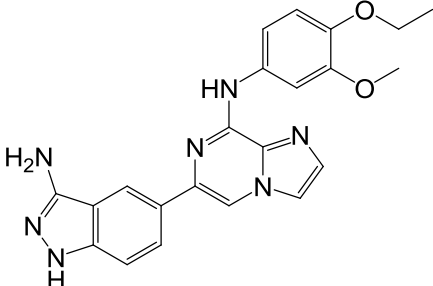
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	2-(4-({[6-(1H-1,3-бензодіазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)-1,1,1,3,3,3-гексафторпропан-2-ол	493,5
	2-метил-2-(4-({[6-(1-метил-1H-1,3-бензодіазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)пропан-1-ол	413,4
	2-метил-2-{4-[(6-{1H-піроло[3,2-b]піридин-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл}пропан-1-ол	399,2
	2,2,2-трифтор-1-(4-({[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)етан-1-ол	425,3
	2-(4-({[6-(3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)-2-метилпропан-1-ол	416,8

Структура	Назва	[M+H] ⁺
	6-(8-([4-(4-гідрокси-4-метилпіперидин-1-іл)-феніл]аміно)імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-3,4-дигідро-2Н-1,4-бензоксазин-3-он	471,7
	4-метил-1-{4-[(6-{1Н-піроло[3,2-в]піридин-6-іл]імідазо[1,2-а]піразин-8-іл)аміно]феніл}піперидин-4-ол	440,5
	1-(4-[[6-(1Н-1,3-бензодіазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно]феніл)-4-метилпіперидин-4-ол	438,2
	6-(1Н-індазол-6-іл)-N-[4-(1-метокси-2-метилпропан-2-іл)феніл]-імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	413,3

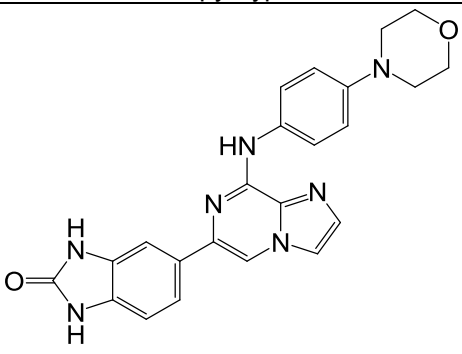
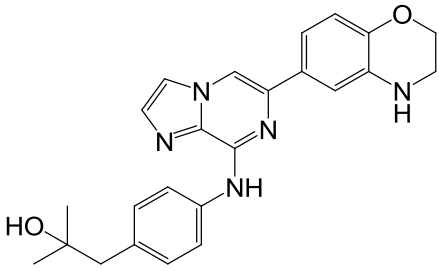
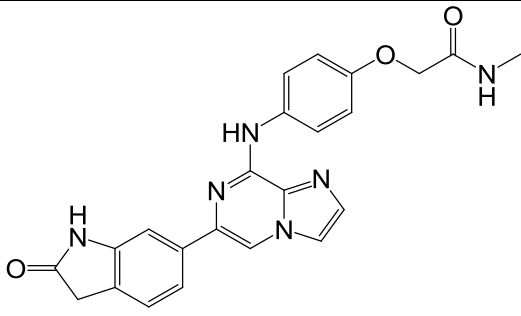
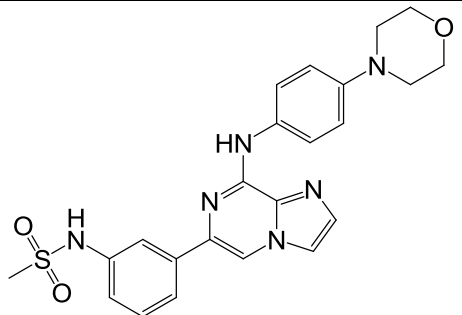
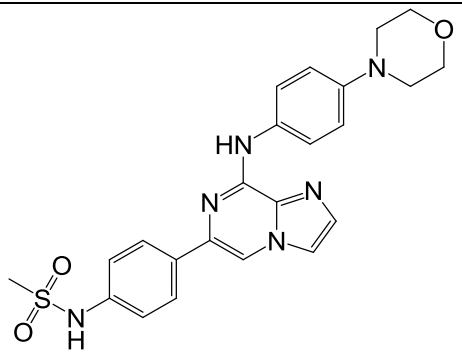
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	4-метил-1-(4-{{6-(1-метил-1H-1,3-бензодіазол-5-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл}аміно}-феніл)піперидин-4-ол	454,1
	6-(1H-1,3-бензодіазол-6-іл)-N-[3-метокси-4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	442,8
	1,1,1-трифтор-2-(4-{{6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл}аміно}феніл)пропан-2-ол	437,4
	1-(4-{{6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл}аміно}феніл)-2-метилпропан-2-ол	399,3
	1-(4-{{6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл}аміно}феніл)-циклобутан-1-ол	397,2

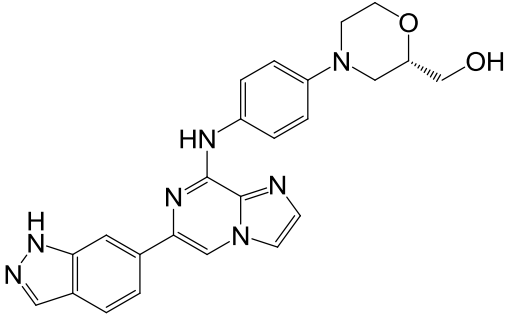
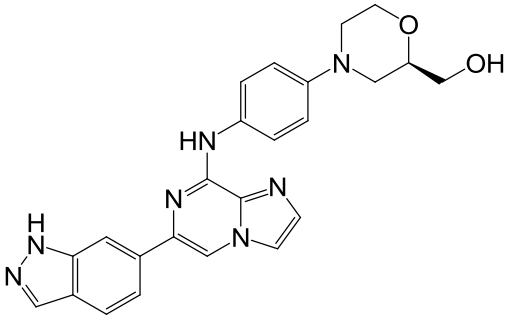
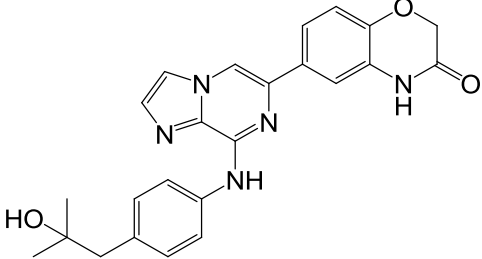
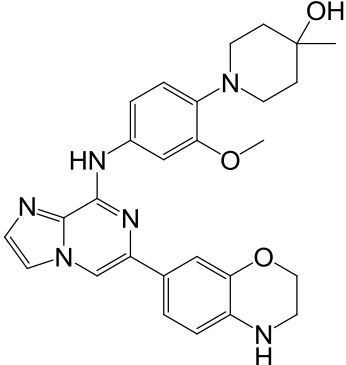
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	1-(4-{{[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}-2-метоксифеніл)-3-метилпіперидин-3-ол	470,9
	4-N-[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]-1-N-(2-метоксиетил)-1-N-метилбензол-1,4-діамін	414,5
	6-{8-[(4-етокси-3-метоксифеніл)аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл}-1H-індазол-3-карбоксамід	444,8
	2-[(4-{{[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)(метил)аміно]етан-1-ол	400,2
	1-(4-{{[6-(3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)-4-метилпіперидин-4-ол	457,6

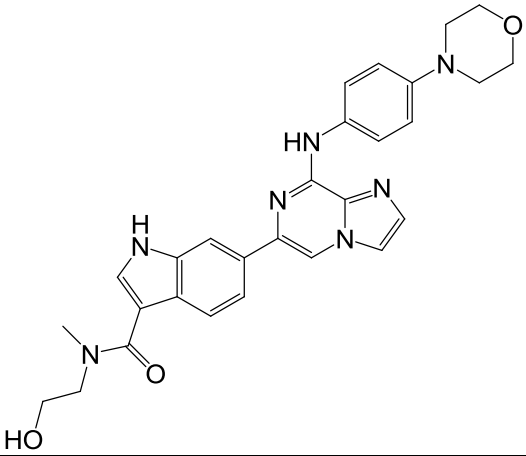
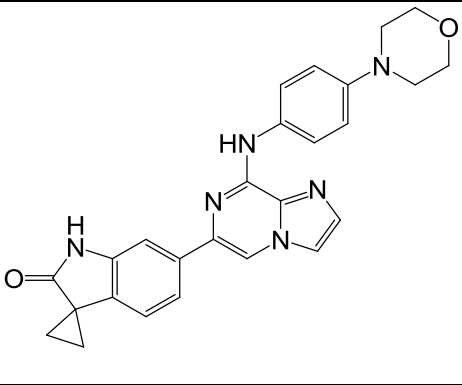
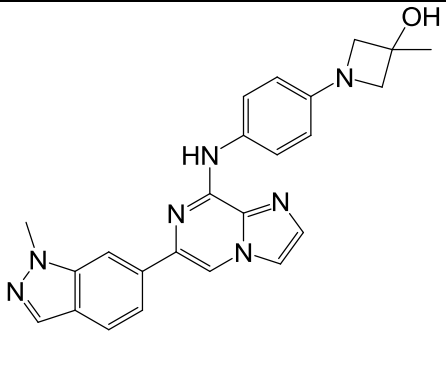
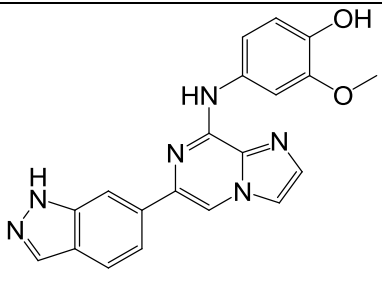
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	6-(1H-індазол-6-іл)-N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	412,4
	N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]-6-{1H-піроло[3,2-б]піридин-6-іл}імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	412,5
	1-(4-{[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)-піперидин-3-ол	426,2
	6-(1H-індол-6-іл)-N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	411,2
	2-(4-{[6-(1H-1,3-бензодіазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)-2-метилпропан-1-ол	399,1

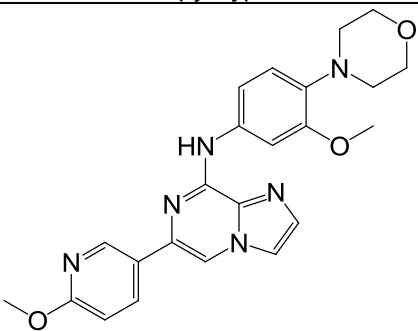
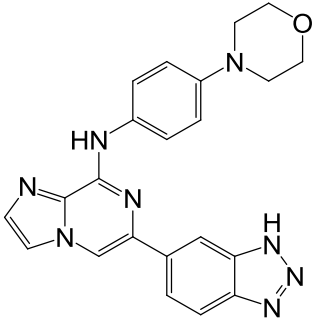
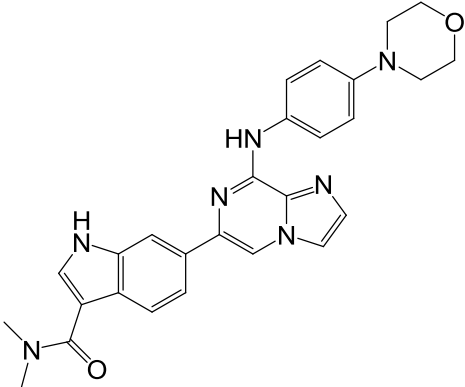
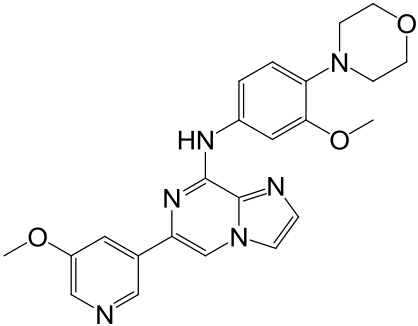
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	6-(8-[[4-(1-гідрокси-2-метилпропан-2-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-2,3-дигідро-1Н-індол-2-он	414,5
	2-(4-[[6-(1Н-індол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)-2-метилпропан-1-ол	398,2
	6-{8-[(4-етокси-3-метоксифеніл)аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл}-2,3-дигідро-1Н-індол-2-он	416,7
	2-(4-[[6-(3-аміно-1Н-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)-2-метилпропан-1-ол	414,4
	5-{8-[(4-етокси-3-метоксифеніл)аміно]імідазо[1,2-а]піразин-6-іл}-1Н-індазол-3-амін	416,7

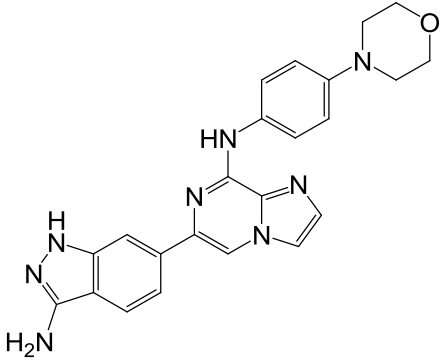
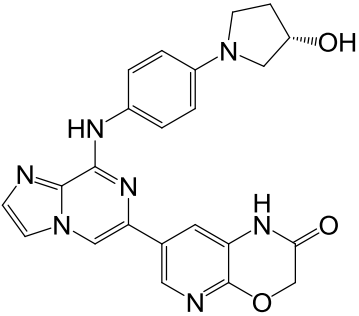
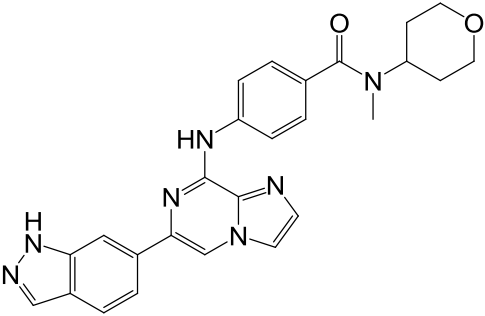
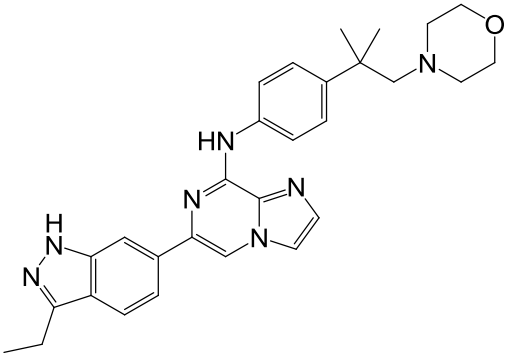
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	2-(4-{{[6-(3-аміно-1H-індазол-5-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)-2-метилпропан-1-ол	414,6
	(3S)-1-(4-{{[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}-2-метоксифеніл)-3-метилпіролідин-3-ол	456,1
	(3R)-1-(4-{{[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}-2-метоксифеніл)-3-метилпіролідин-3-ол	456,2
	7-(8-{{[4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-1,2-дигідрокінокалін-2-он	440,5
	N,N-диметил-6-(8-{{[4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-1H-індазол-3-карбоксамід	483,4

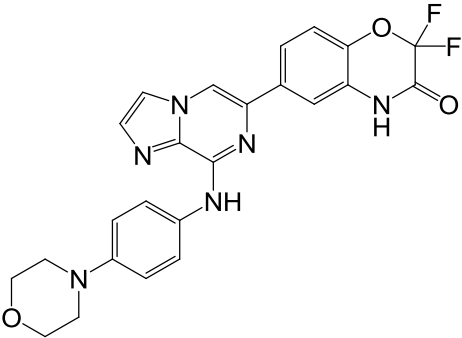
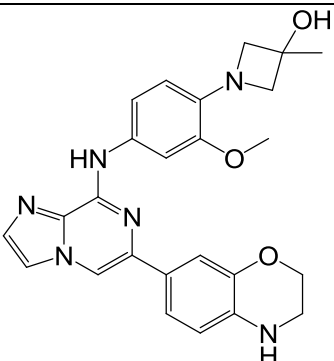
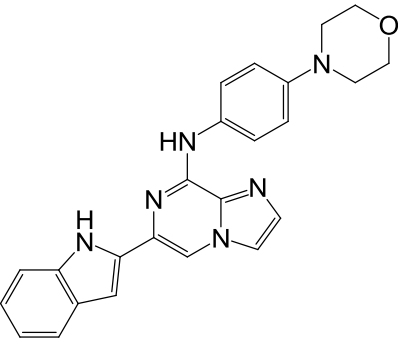
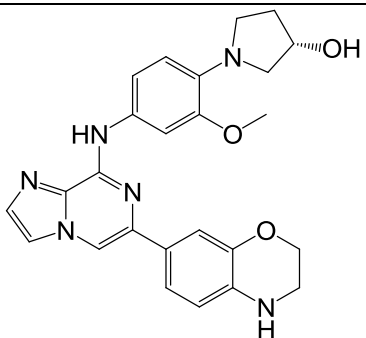
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	5-(8-([4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно)-імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-2,3-дигідро-1Н-1,3-бензодіазол-2-он	428,3
	1-(4-([6-(3,4-дигідро-2Н-1,4-бензоксазин-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно)феніл)-2-метилпропан-2-ол	416,8
	N-метил-2-(4-([6-(2-оксо-2,3-дигідро-1Н-індол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно)фенокси)ацетамід	429,4
	N-[3-(8-([4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно)імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)феніл]метансульфонамід	465,4
	N-[4-(8-([4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно)імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)феніл]метансульфонамід	465,4

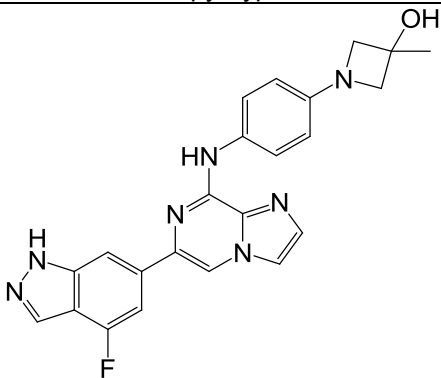
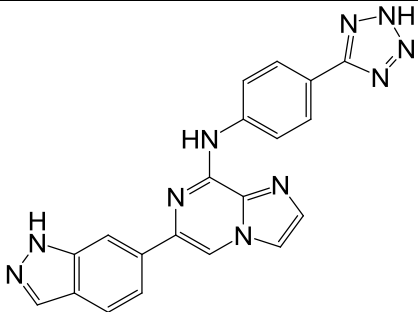
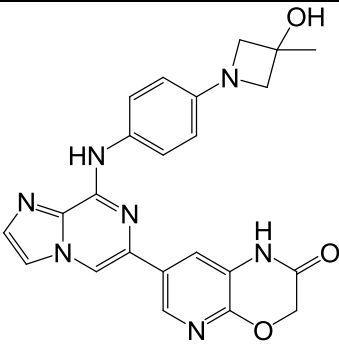
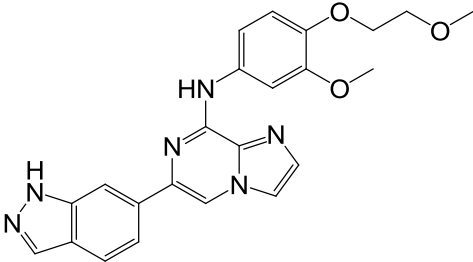
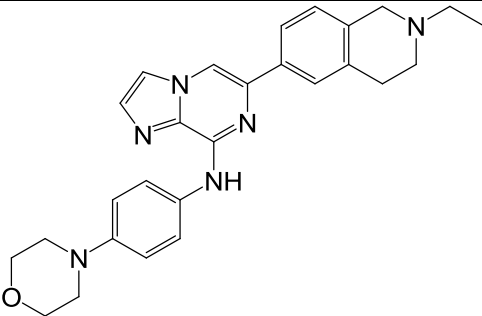
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	[(2S)-4-(4-([6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно)феніл)морфолін-2-іл]метанол	442,3
	[(2R)-4-(4-([6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно)феніл)морфолін-2-іл]метанол	442,3
	6-(8-([4-(2-гідрокси-2-метилпропіл)-феніл]аміно)імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-3-он	430,4
	1-(4-([6-(3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-7-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно)-2-метоксифеніл)-4-метилпіперидин-4-ол	487,5

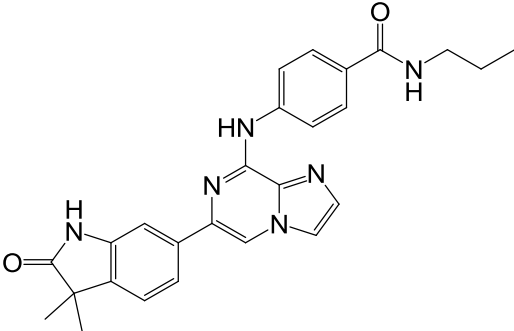
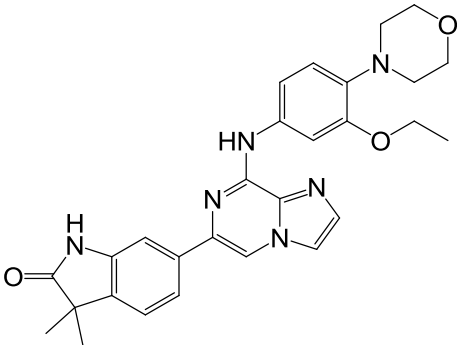
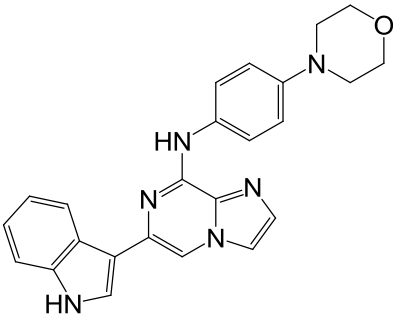
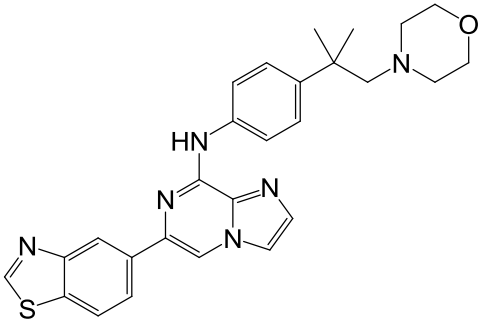
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	N-(2-гідроксиетил)-N-метил-6-(8-{[4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}-імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-1H-індол-3-карбоксамід	512,7
	6'-(8-{[4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-1',2'-дигідроспіро[циклопропан-1,3'-індол]-2'-он	453,1
	3-метил-1-(4-{[6-(1-метил-1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)азетидин-3-ол	426,3
	4-{[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}-2-метоксифенол	373,2

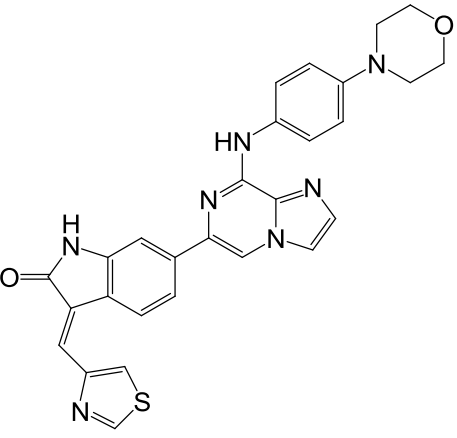
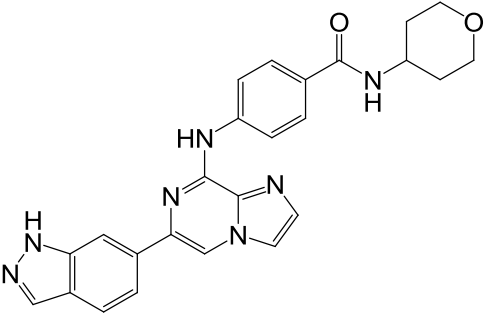
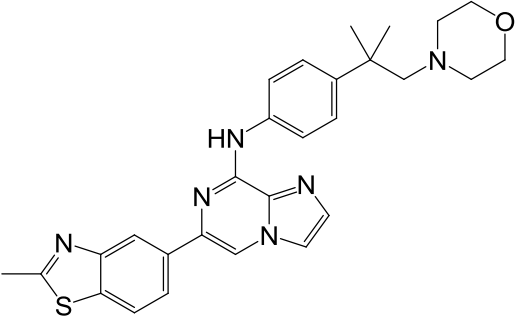
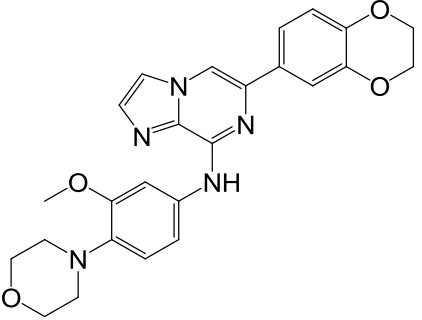
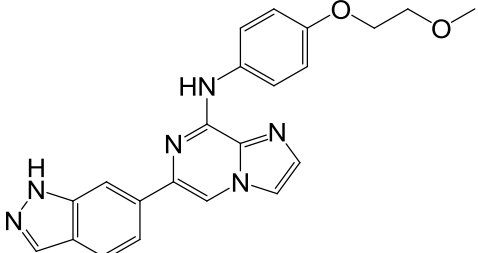
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	N-[3-метокси-4-(морфолін-4-іл)феніл]-6-(6-метоксипіридин-3-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	433,5
	6-(1H-1,2,3-бензотриазол-6-іл)-N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	413,5
	N, N-диметил-6-(8-{4-(морфолін-4-іл)феніл}аміно)імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-1H-індол-3-карбоксамід	482,4
	N-[3-метокси-4-(морфолін-4-іл)феніл]-6-(5-метоксипіридин-3-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	433,4

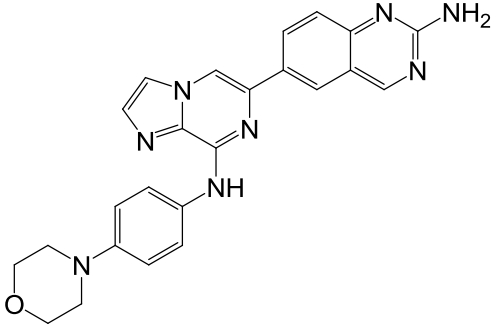
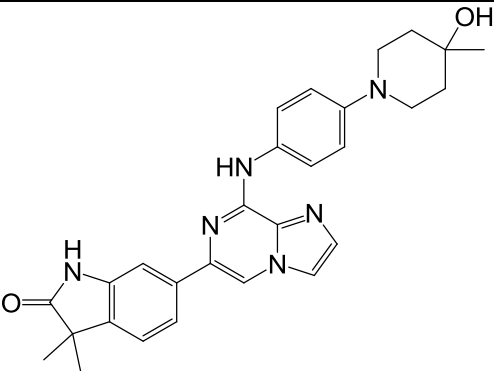
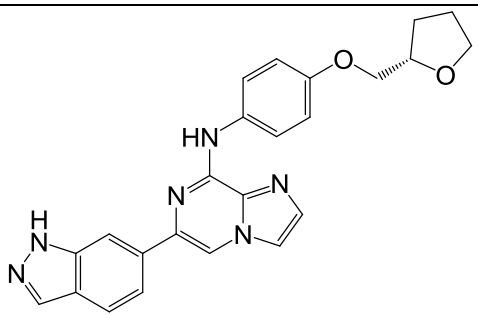
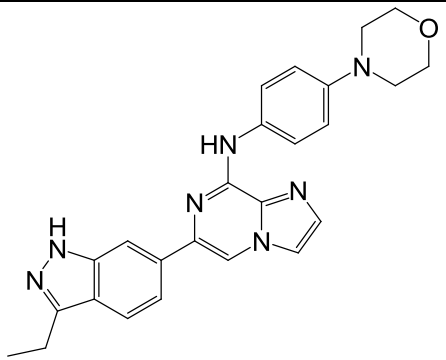
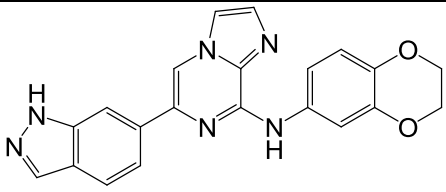
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	6-(8-({4-(морфолін-4-іл)феніл}аміно)імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-1H-індазол-3-амін	427,4
	7-[8-({4-[(3S)-3-гідроксипіролідін-1-іл]феніл}аміно)імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-1H, 2H, 3H-піrido[2,3-б][1,4]оксазин-2-он	444,8
	4-({[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}-N-метил-N-(оксан-4-іл)бензамід	468,2
	6-(3-етил-1H-індазол-6-іл)-N-{4-[2-метил-1-(морфолін-4-іл)пропан-2-іл]феніл}імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	496,9

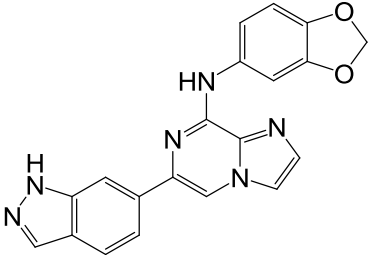
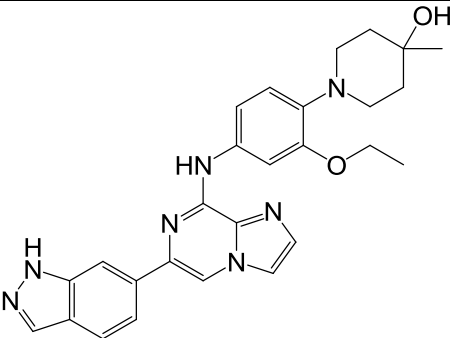
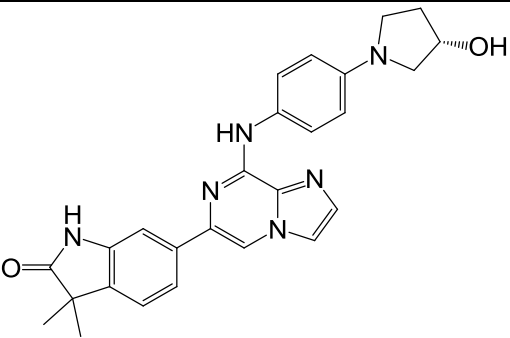
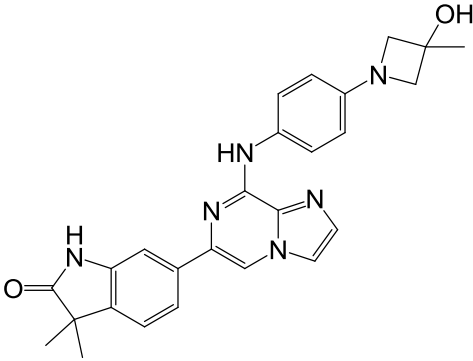
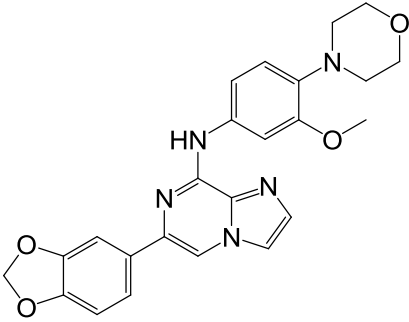
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	2,2-дифтор-6-(8-([4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно)імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-3,4-дигідро-2Н-1,4-бензоксазин-3-он	479,1
	1-(4-([6-(3,4-дигідро-2Н-1,4-бензоксазин-7-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно)-2-метоксифеніл)-3-метилазетидин-3-ол	459,3
	6-(1Н-індол-2-іл)-N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	411,3
	(3S)-1-(4-([6-(3,4-дигідро-2Н-1,4-бензоксазин-7-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно)-2-метоксифеніл)піролідин-3-ол	459,6

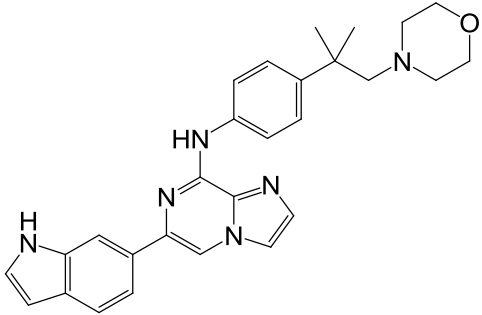
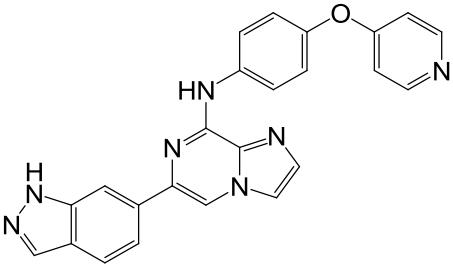
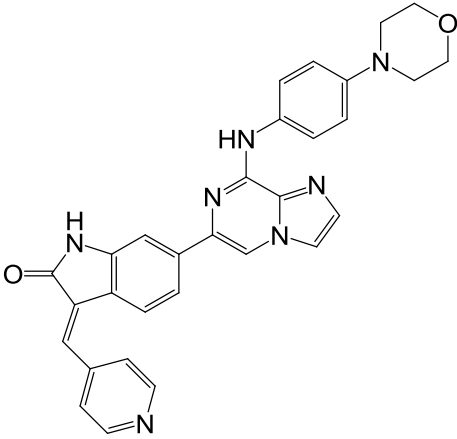
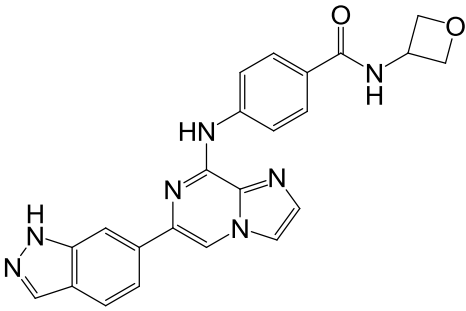
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	1-(4-([6-(4-фтор-1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно)феніл)-3-метилазетидин-3-ол	430,2
	6-(1H-індазол-6-іл)-N-[4-(2H-1,2,3,4-тетразол-5-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	395,1
	7-(8-([4-(3-гідрокси-3-метилазетидин-1-іл)феніл]аміно)імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-1H, 2H, 3H-піrido[2,3-b][1,4]оксазин-2-он	444,2
	6-(1H-індазол-6-іл)-N-[3-метокси-4-(2-метоксиетокси)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	431,5
	6-(2-етил-1,2,3,4-тетрагідроізохінолін-6-іл)-N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	455,4

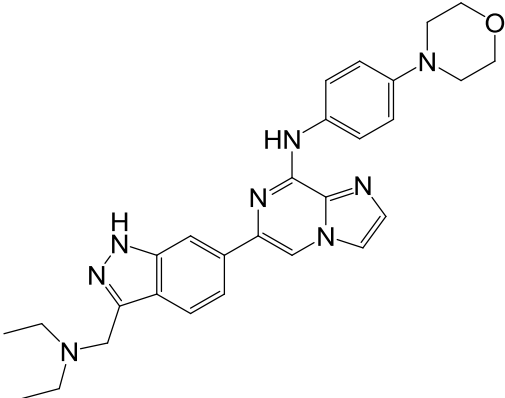
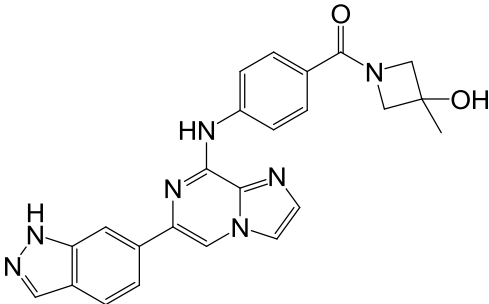
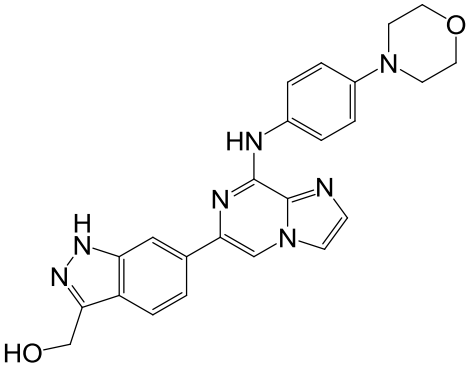
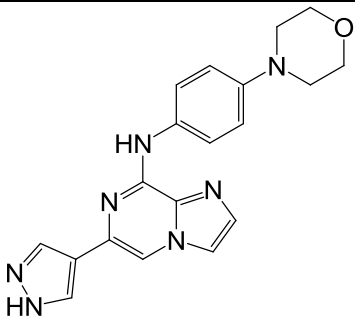
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	4-({6-((3,3-диметил-2-оксо-2,3-дигідро-1H-індол-6-іл)аміно)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл)аміно}-N-пропілбензамід	455,3
	6-(8-({3-етокси-4-(морфолін-4-іл)феніл)аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-3,3-диметил-2,3-дигідро-1H-індол-2-он	499,7
	6-(1H-індол-3-іл)-N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	411,2
	6-(1,3-бензотіазол-5-іл)-N-{4-[2-метил-1-(морфолін-4-іл)пропан-2-іл]феніл}імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	485,7

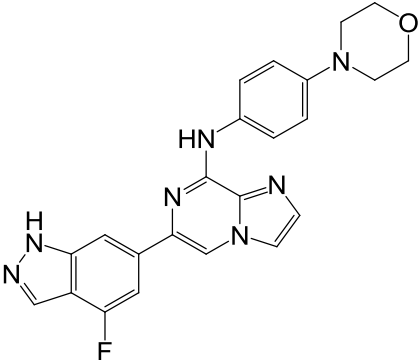
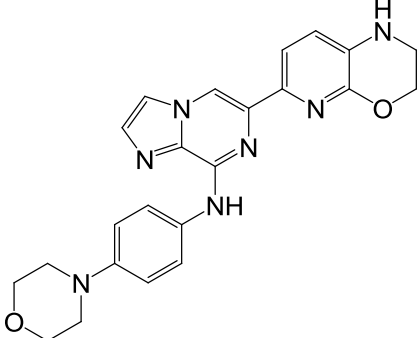
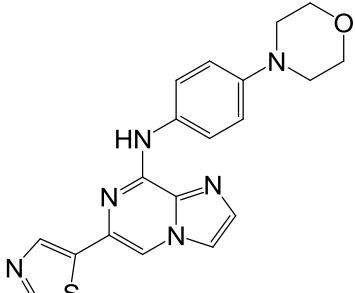
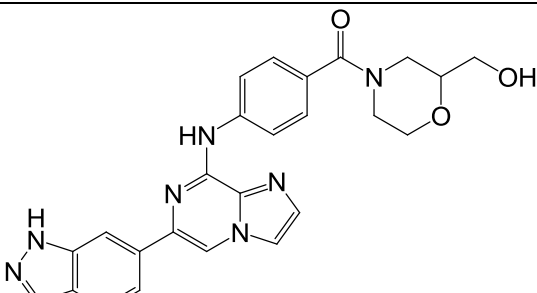
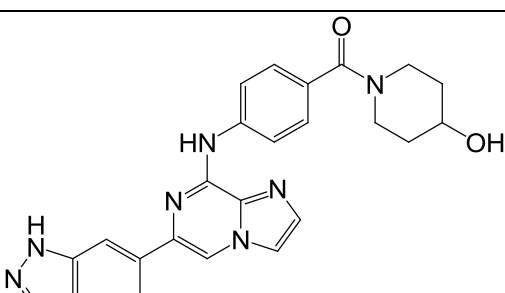
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	(3E)-6-(8-({4-(морфолін-4-іл)феніл}аміно)імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-3-(1,3-тіазол-4-ілметиліден)-2,3-дигідро-1H-індол-2-он	522,6
	4-([6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно)-N-(оксан-4-іл)бензамід	454
	6-(2-метил-1,3-бензотіазол-5-іл)-N-{4-[2-метил-1-(морфолін-4-іл)пропан-2-іл]феніл}імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	499,5
	6-(2,3-дигідро-1,4-бензодіоксин-6-іл)-N-[3-метокси-4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	460,6
	6-(1H-індазол-6-іл)-N-[4-(2-метоксиетокси)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	401,1

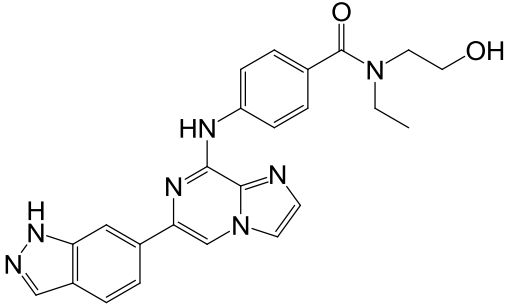
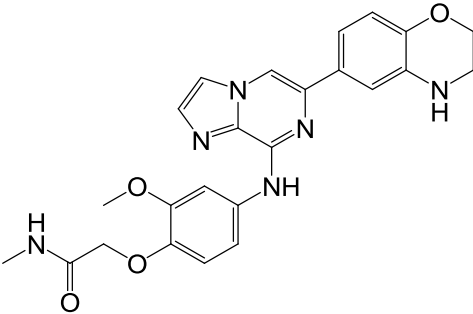
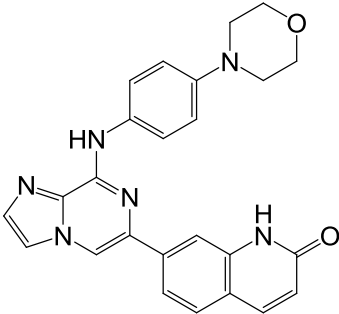
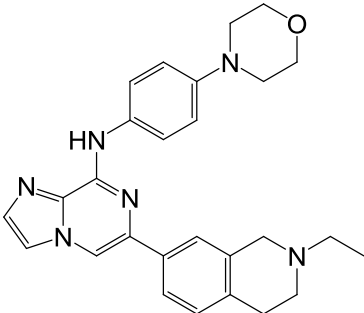
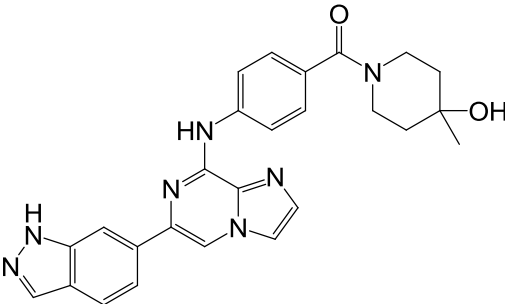
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	6-(8-([4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно)імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)хіназолін-2-амін	439,7
	6-(8-([4-(4-гідрокси-4-метилпіперидин-1-іл)феніл]-аміно)імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-3,3-диметил-2,3-дигідро-1H-індол-2-он	483,5
	6-(1H-індазол-6-іл)-N-{4-[(2S)-оксолан-2-ілметокси]феніл}-імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	427,1
	6-(3-етил-1H-індазол-6-іл)-N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	440,5
	N-(2,3-дигідро-1,4-бензодіоксин-6-іл)-6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	385,3

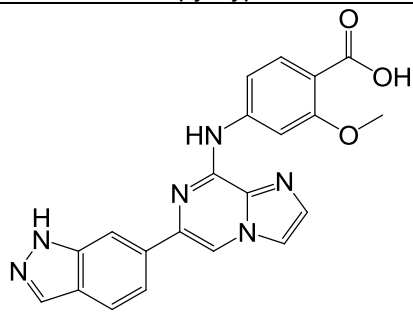
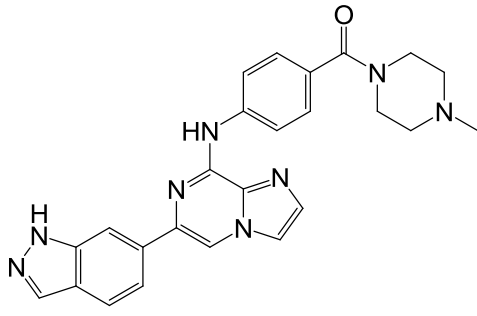
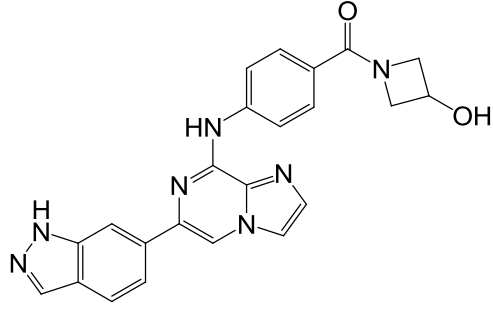
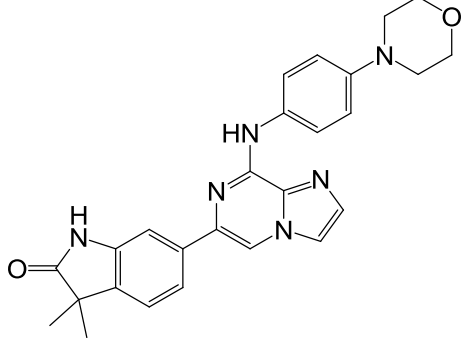
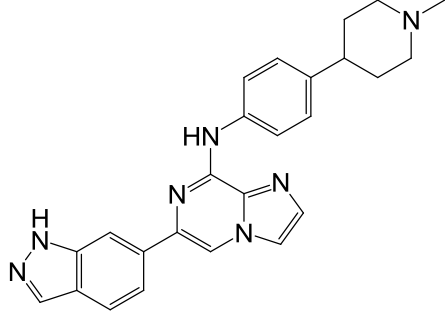
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	N-(2H-1,3-бензодіоксол-5-іл)-6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	371,2
	1-(2-етокси-4-{{6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл}аміно}феніл)-4-метилпіперидин-4-ол	484,7
	6-[8-({4-[(3S)-3-гідроксипіролідин-1-іл]феніл}аміно)імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-3,3-диметил-2,3-дигідро-1H-індол-2-он	455,2
	6-(8-{{4-[(3-гідрокси-3-метилазетидин-1-іл]феніл}аміно)імідазо[1,2-а]піразин-6-іл}-3,3-диметил-2,3-дигідро-1H-індол-2-он	455,3
	6-(2H-1,3-бензодіоксол-5-іл)-N-[3-метокси-4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	446,3

Структура	Назва	[M+H] ⁺
	6-(1H-індол-6-іл)-N-{4-[2-метил-1-(морфолін-4-іл)пропан-2-іл]феніл}імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	467,4
	6-(1H-індазол-6-іл)-N-[4-(піридин-4-ілокси)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	420,3
	(3E)-6-(8-({4-(морфолін-4-іл)феніл}аміно)імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-3-(піридин-4-ілметиліден)-2,3-дигідро-1H-індол-2-он	516,4
	4-([6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно)-N-(оксетан-3-іл)бензамід	426,1

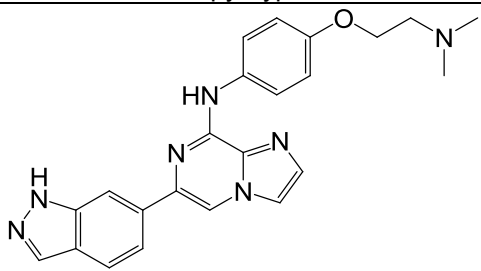
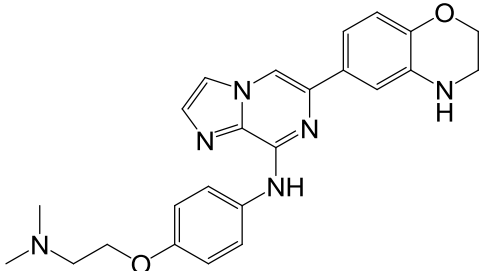
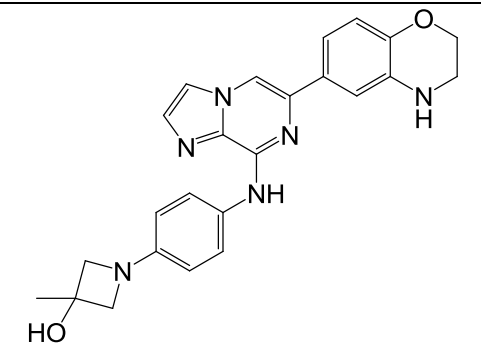
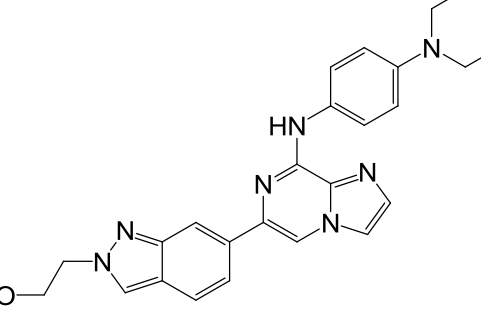
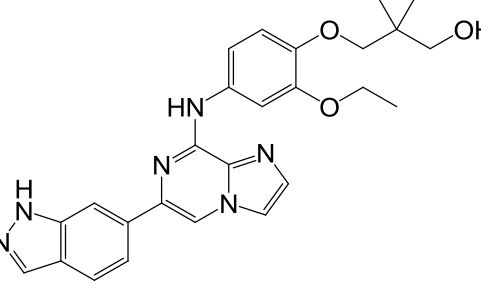
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	6-{3-[(діетиламіно)метил]-1H-індазол-6-іл}-N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	497,3
	1-[(4-{[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)карбоніл]-3-метилазетидин-3-ол	440,2
	[6-(8-{[4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-1H-індазол-3-іл]метанол	442,3
	N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]-6-(1H-піразол-4-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	362,6

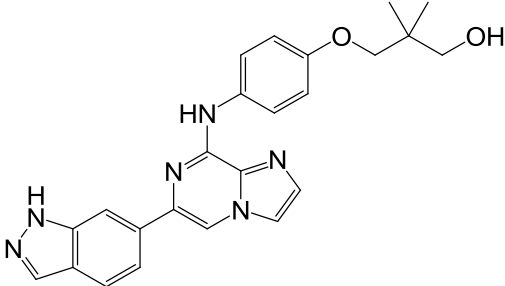
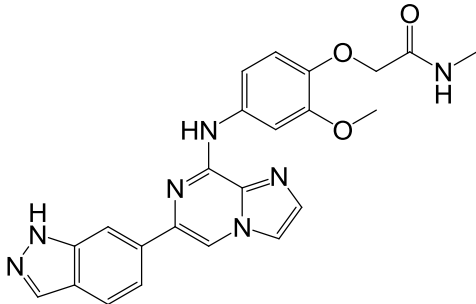
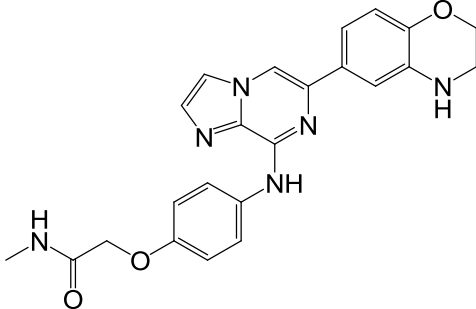
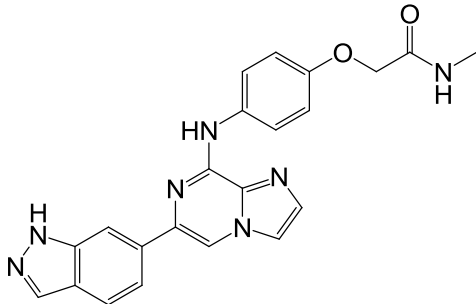
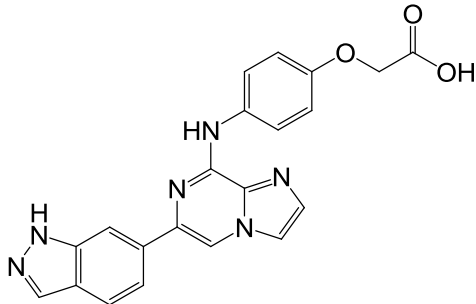
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	6-(4-фтор-1H-індазол-6-іл)-N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	430,3
	N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]-6-{1H, 2H, 3H-піридо[2,3-б][1,4]оксазин-6-іл}імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	430,3
	N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]-6-(1,3-тіазол-5-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	379,2
	{4-[(4-{[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)карбоніл]морфолін-2-іл}метанол	470,8
	1-[(4-{[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)карбоніл]піперидин-4-ол	454,1

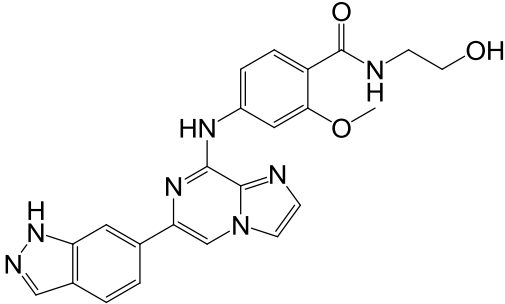
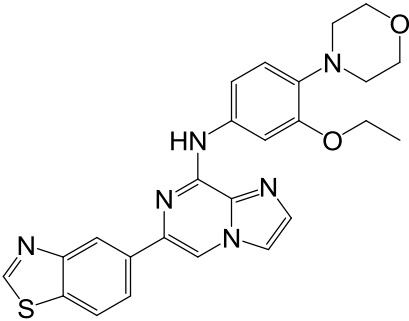
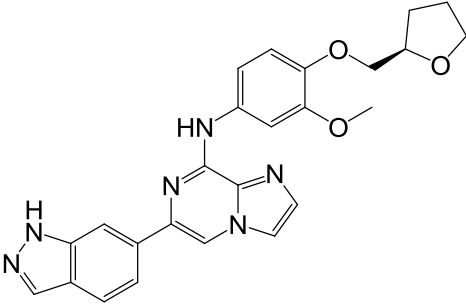
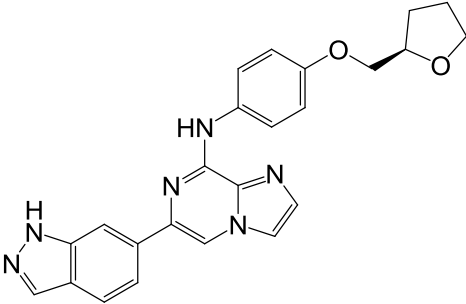
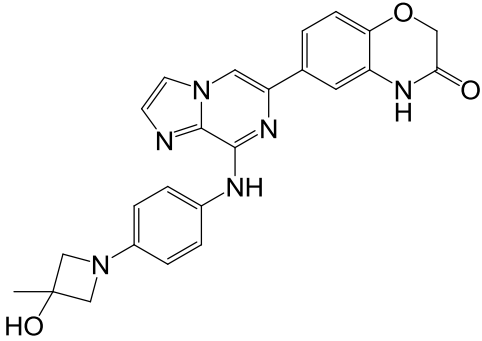
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	N-етил-N-(2-гідроксиетил)-4-{{6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл}аміно}бензамід	440,2
	2-(4-{{6-(3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл}аміно}-2-метоксифенокси)-N-метилацетамід	461,4
	7-(8-{{4-(морфолін-4-іл)феніл}аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-1,2-дигідрохінолін-2-он	439,5
	6-(2-етил-1,2,3,4-тетрагідроізохінолін-7-іл)-N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	455,4
	1-[(4-{{6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл}аміно}феніл)карбоніл]-4-метилпіперидин-4-ол	468,4

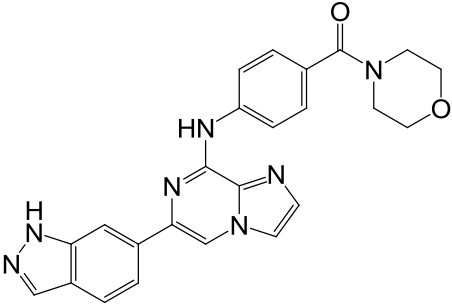
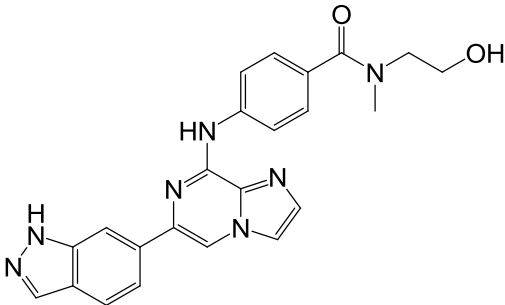
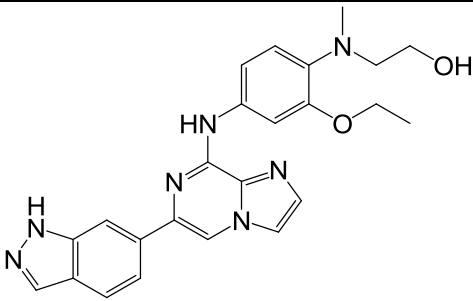
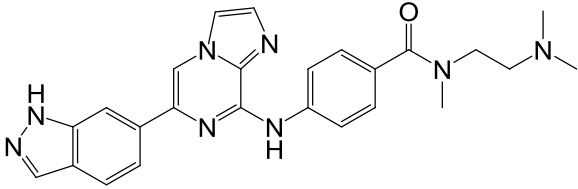
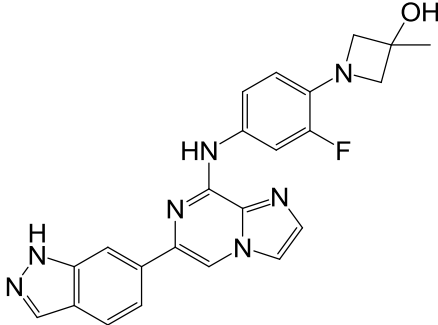
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	4-((6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл)аміно)-2-метоксибензойна кислота	401,1
	6-(1H-індазол-6-іл)-N-{4-[(4-метилпіперазин-1-іл)карбоніл]феніл}імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	453,1
	1-[(4-{[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)карбоніл]азетидин-3-ол	426,3
	3,3-диметил-6-(8-{[4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-2,3-дигідро-1H-індол-2-он	455,4
	6-(1H-індазол-6-іл)-N-[4-(1-метилпіперидин-4-іл)феніл]-імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	424,2

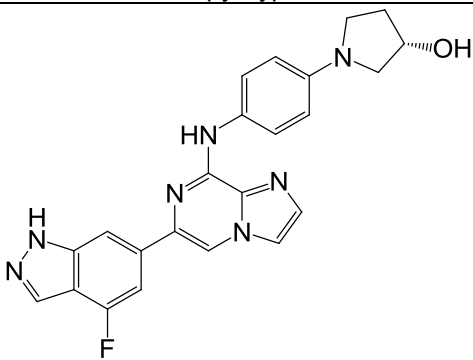
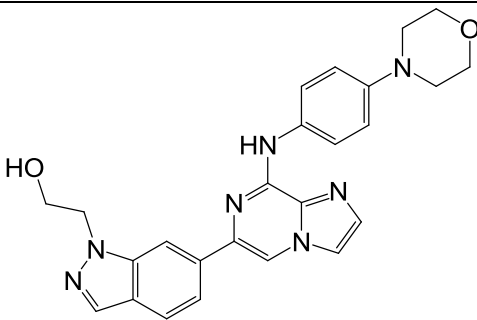
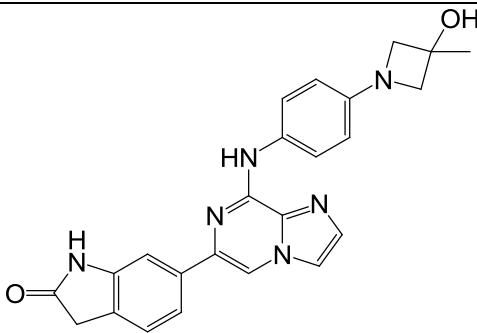
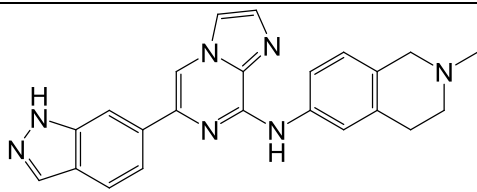
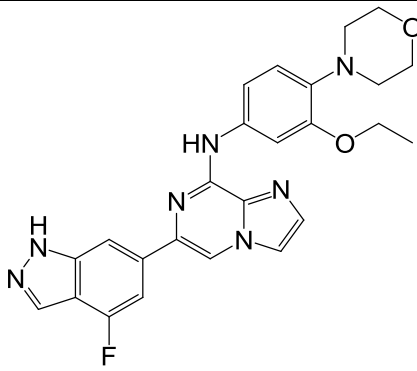
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	2-(4-({[6-(4-фтор-1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-a]піразин-8-іл]аміно}феніл)-2-метилпропан-1-ол	417,7
	2-[етил(4-({[6-(4-фтор-1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-a]піразин-8-іл]аміно}феніл)аміно)етан-1-ол	431,47
	6-(1H-індазол-7-іл)-N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-a]піразин-8-амін	412,2
	6-[8-({4-[етил(2-гідроксиетил)аміно]феніл)аміно}-імідазо[1,2-a]піразин-6-іл]-3,3-диметил-2,3-дигідро-1H-індол-2-он	457,6

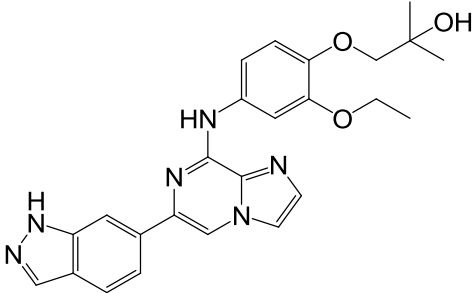
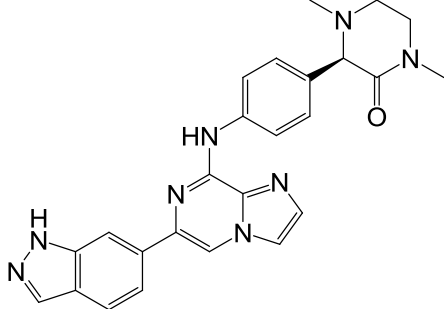
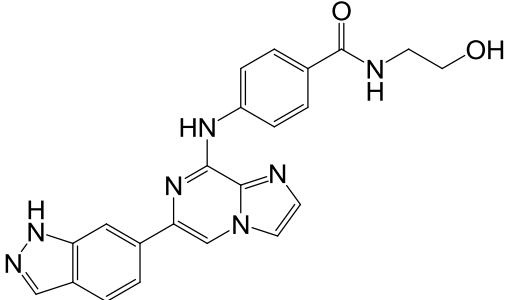
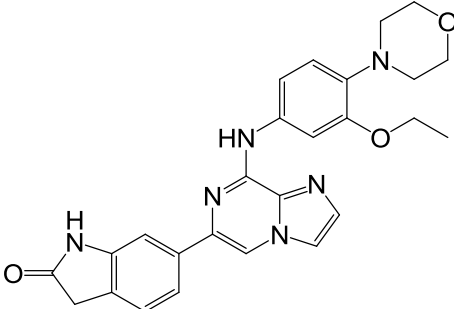
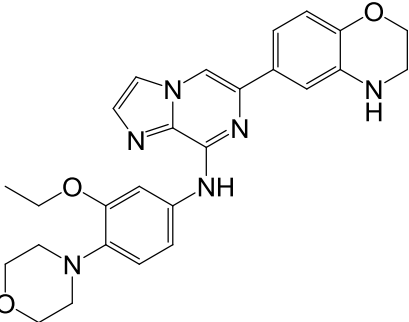
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	N-(4-[2-(диметиламіно)-етокси]феніл)-6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	414,6
	6-(3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-6-іл)-N-{4-[2-(диметиламіно)-етокси]феніл}імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	431,4
	1-(4-{[6-(3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)-3-метилазетидин-3-ол	429,3
	2-[6-(8-{[4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-2H-індазол-2-іл]етан-1-ол	456,3
	3-(2-етокси-4-{[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}фенокси)-2,2-диметилпропан-1-ол	473,4

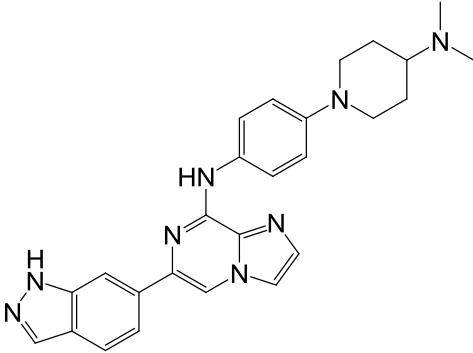
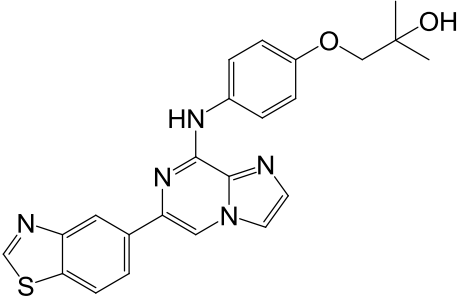
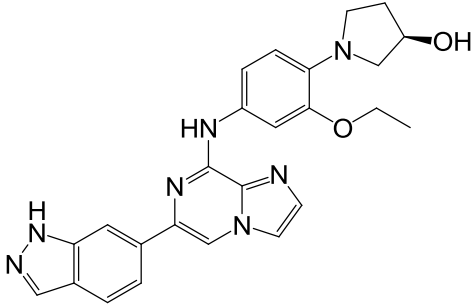
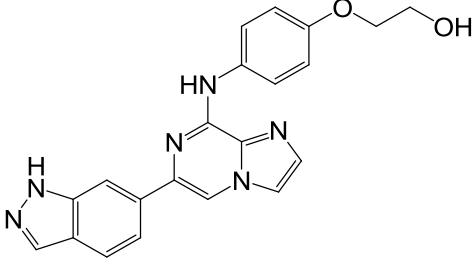
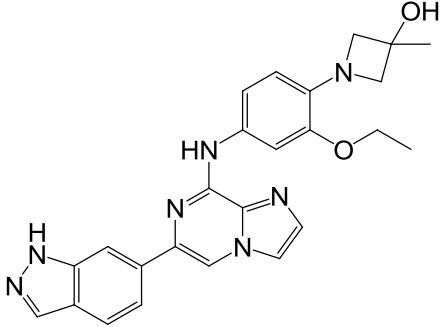
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	3-(4-{{[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}фенокси)-2,2-диметилпропан-1-ол	429,5
	2-(4-{{[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}-2-метоксифенокси)-N-метилацетамід	444,8
	2-(4-{{[6-(3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}фенокси)-N-метилацетамід	431,4
	2-(4-{{[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}фенокси)-N-метилацетамід	414,4
	2-(4-{{[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}фенокси)оцтова кислота	401,1
	N-(2-гідроксиетил)-4-{{[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}-2-метоксибензамід	442,1

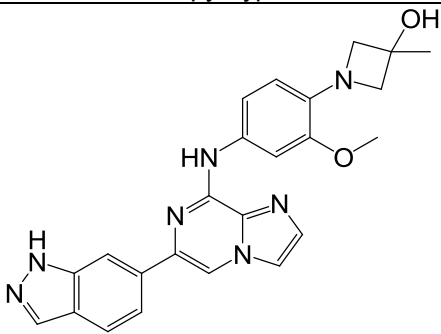
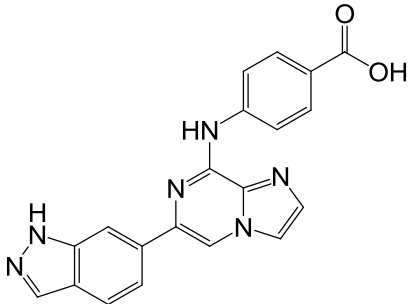
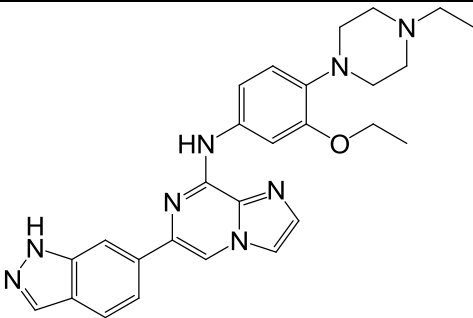
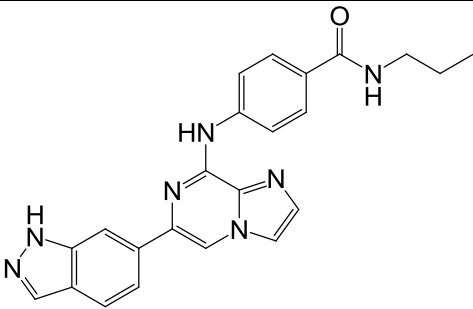
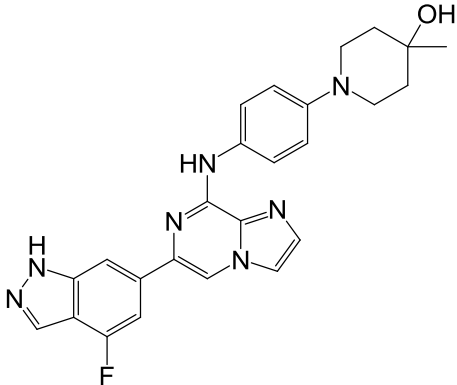
Структура	Назва	[M+H] ⁺
		
	6-(1,3-бензотіазол-5-іл)-N-[3-етокси-4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	473,2
	6-(1H-індазол-6-іл)-N-{3-метокси-4-[(2R)-оксолан-2-ілметокси]феніл}імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	457,4
	6-(1H-індазол-6-іл)-N-{4-[(2R)-оксолан-2-ілметокси]феніл}-імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	427
	6-(8-{[4-(3-гідрокси-3-метилазетидин-1-іл)феніл]аміно}-імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-3-он	443,2

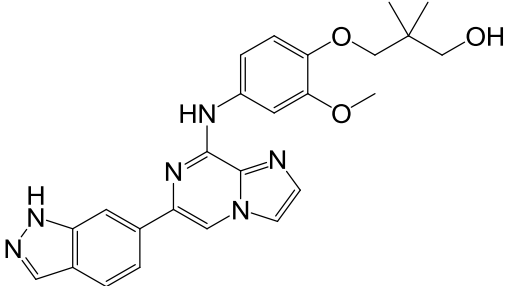
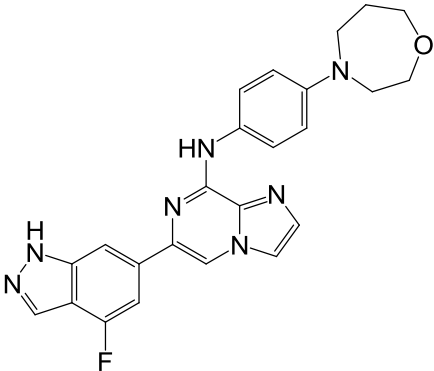
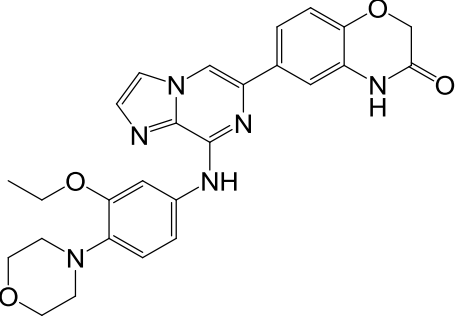
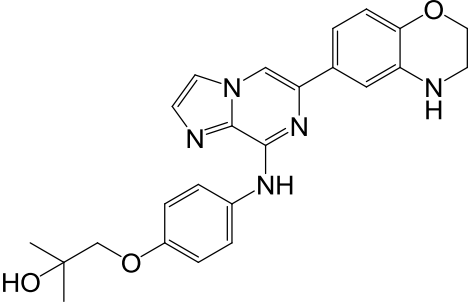
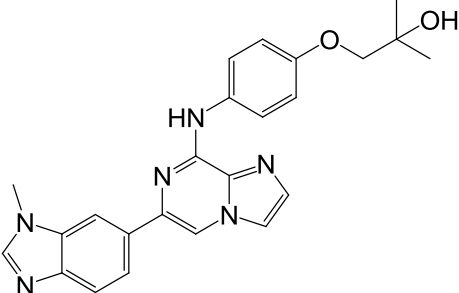
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	6-(1H-індазол-6-іл)-N-[4-(морфолін-4-ілкарбоніл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	440,3
	N-(2-гідроксиетил)-4-{{[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}-N-метилбензамід	428,2
	2-[(2-етокси-4-{{[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)(метил)аміно]етан-1-ол	444,6
	N-[2-(диметиламіно)етил]-4-{{[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}-N-метилбензамід	455,3
	1-(2-фтор-4-{{[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)-3-метилазетидин-3-ол	430,4

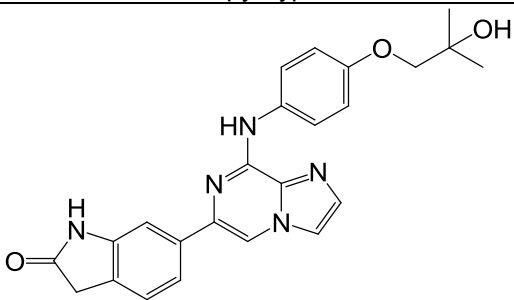
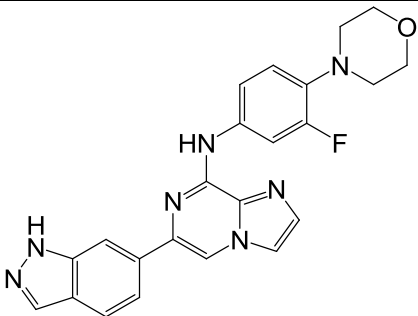
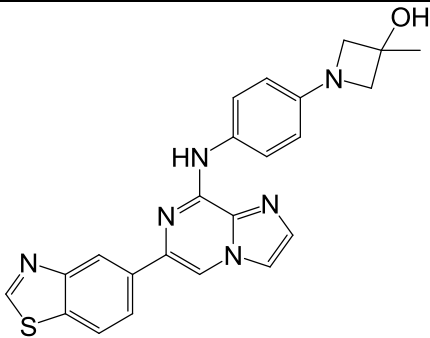
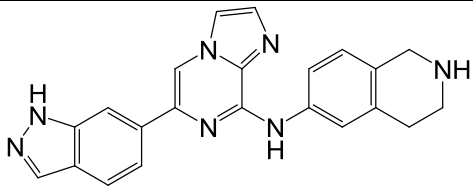
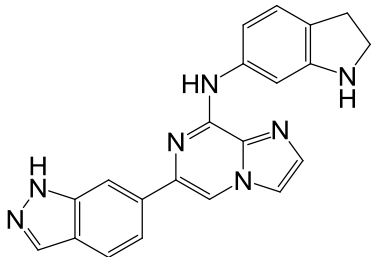
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	(3S)-1-(4-([6-(4-фтор-1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно)феніл)піролідин-3-ол	430,4
	2-[6-(8-([4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно)імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-1H-індазол-1-іл]етан-1-ол	456,3
	6-(8-([4-(3-гідрокси-3-метилазетидин-1-іл)феніл]аміно)імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-2,3-дигідро-1H-індол-2-он	427,2
	N-[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]-2-метил-1,2,3,4-тетрагідроізохінолін-6-амін	396,1
	N-[3-етокси-4-(морфолін-4-іл)феніл]-6-(4-фтор-1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	474,2

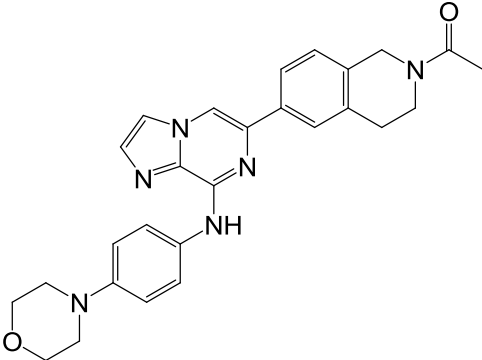
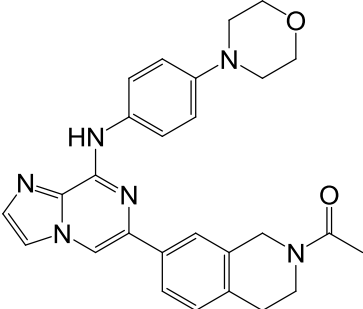
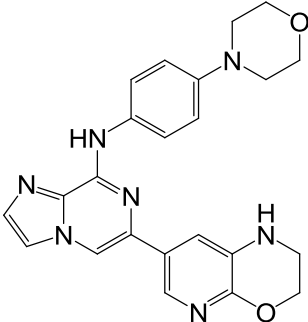
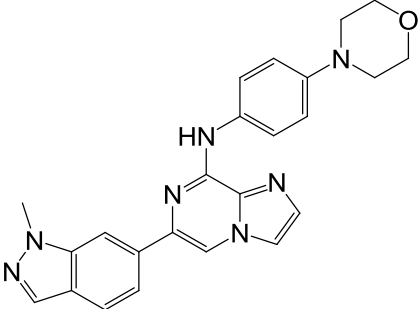
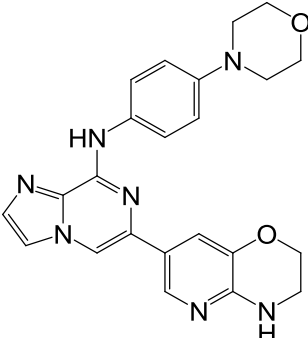
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	1-(2-етокси-4-{{6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл}аміно}фенокси)-2-метилпропан-2-ол	459,4
	(3R)-3-(4-{{6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл}аміно}феніл)-1,4-диметилпіперазин-2-он	453,4
	N-(2-гідроксиетил)-4-{{6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл}аміно}бензамід	414,5
	6-(8-{{3-етокси-4-(морфолін-4-іл)феніл}аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-2,3-дигідро-1H-індол-2-он	471,7
	6-(3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-6-іл)-N-[3-етокси-4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	473,2

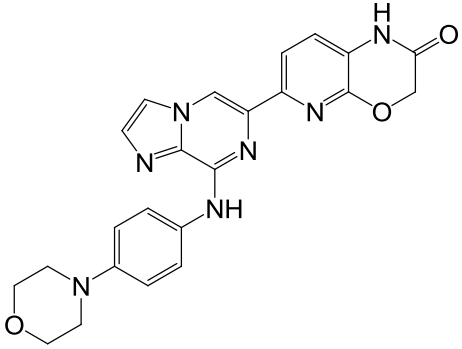
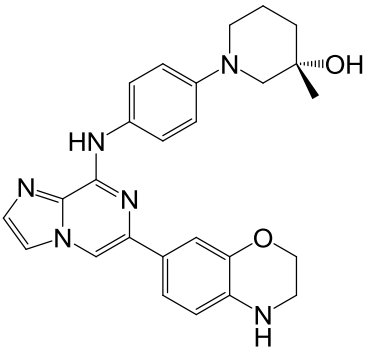
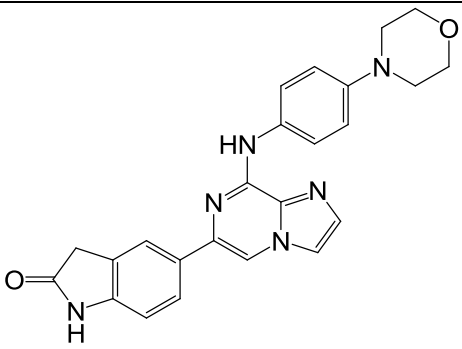
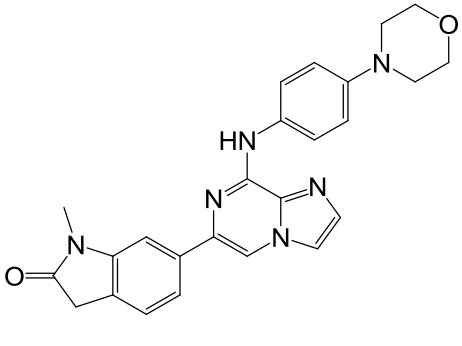
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	1-(4-({6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл}аміно)феніл)-N,N-диметилпіперидин-4-амін	453,1
	1-(4-({6-(1,3-бензотіазол-5-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл}аміно)фенокси)-2-метилпропан-2-ол	432,4
	(3R)-1-(2-етокси-4-({6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл}аміно)феніл)піролідин-3-ол	456,4
	2-(4-({6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл}аміно)фенокси)етан-1-ол	387,3
	1-(2-етокси-4-({6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл}аміно)феніл)-3-метилазетидин-3-ол	456,2

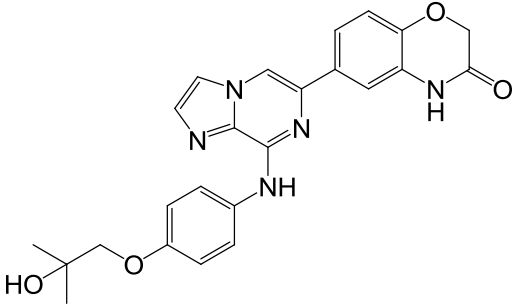
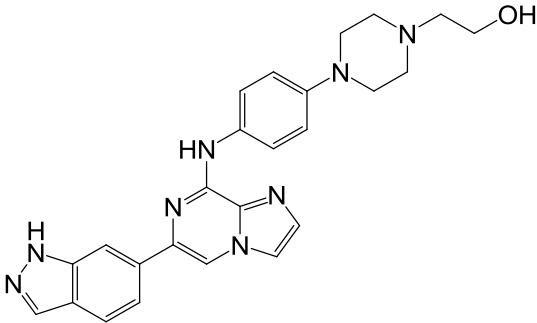
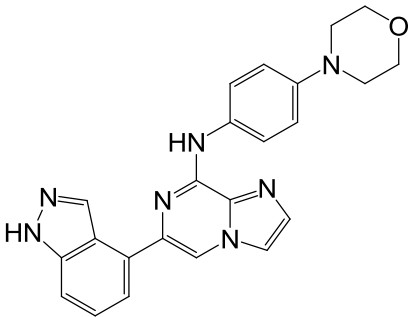
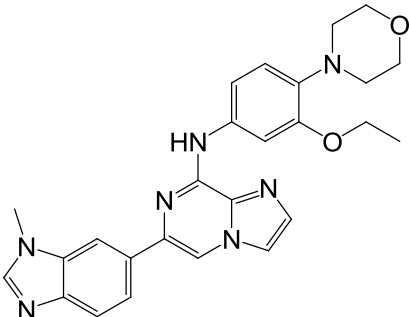
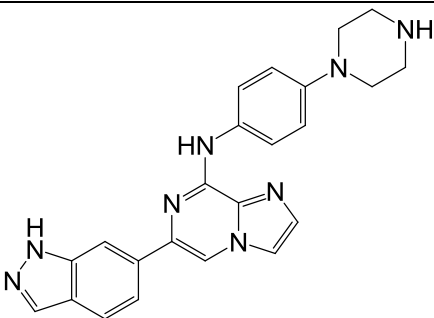
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	1-(4-{{6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл}аміно}-2-метоксифеніл)-3-метилазетидин-3-ол	442,2
	4-{{6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл}аміно}бензойна кислота	371
	N-[3-етокси-4-(4-етилпіперазин-1-іл)феніл]-6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	483,3
	4-{{6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл}аміно}-N-пропілбензамід	412,1
	1-(4-{{6-(4-фтор-1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл}аміно}феніл)-4-метилпіперидин-4-ол	458,6

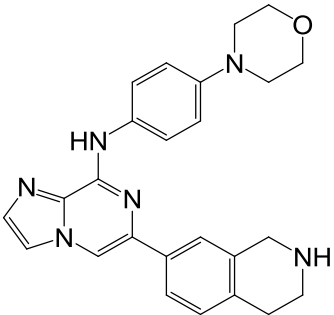
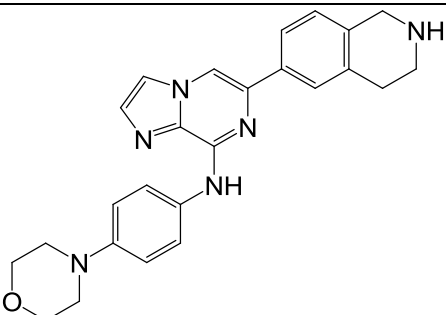
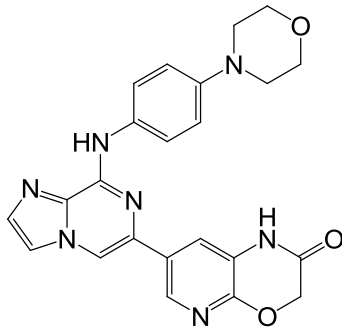
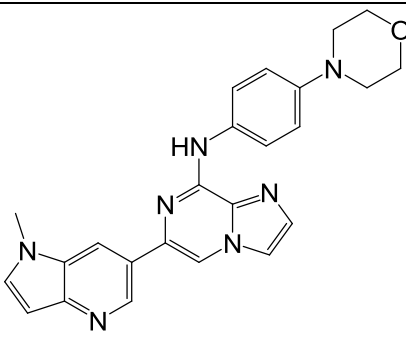
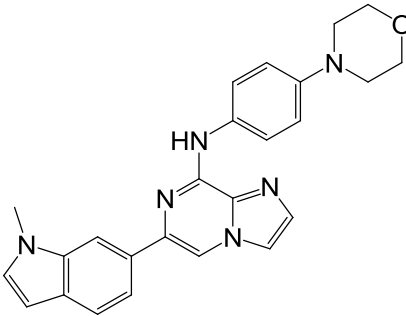
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	3-(4-({[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}-2-метоксифенокси)-2,2-диметилпропан-1-ол	459,5
	6-(4-фтор-1H-індазол-6-іл)-N-[4-(1,4-оксазепан-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	444,7
	6-(8-({[3-етокси-4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-3-он	487,5
	1-(4-({[6-(3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}фенокси)-2-метилпропан-2-ол	432,4
	2-метил-1-(4-({[6-(1-метил-1H-1,3-бензодіазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}-фенокси)пропан-2-ол	429,3

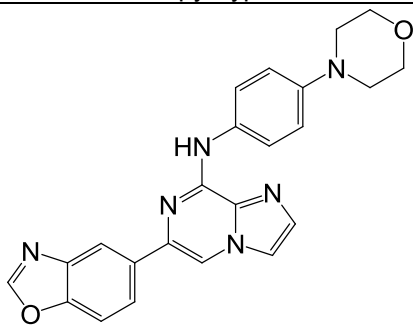
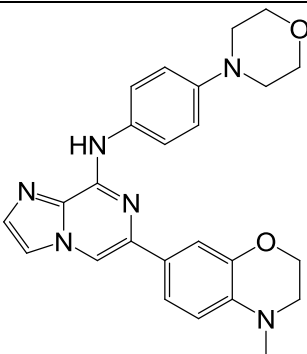
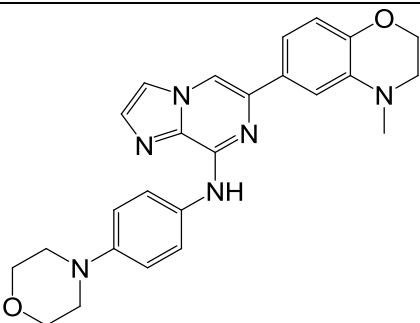
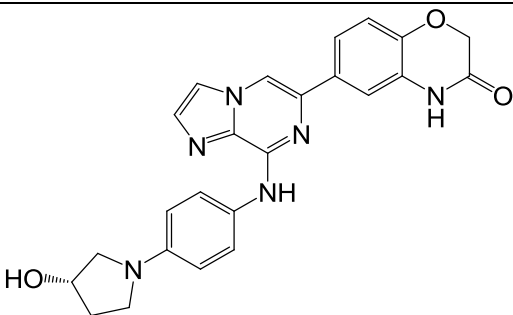
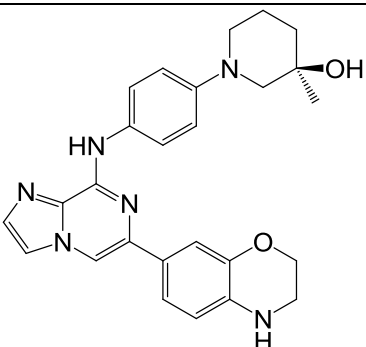
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	6-(8-([4-(2-гідрокси-2-метилпропокси)феніл]аміно)-імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-2,3-дигідро-1H-індол-2-он	430,2
	N-[3-фтор-4-(морфолін-4-іл)феніл]-6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	430,4
	1-(4-([6-(1,3-бензотіазол-5-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно)феніл)-3-метилазетидин-3-ол	429,1
	N-[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]-1,2,3,4-тетрагідроізохінолін-6-амін	382,2
	N-[6-(1H-індазол-6-іл)-імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]-2,3-дигідро-1H-індол-6-амін	368,2

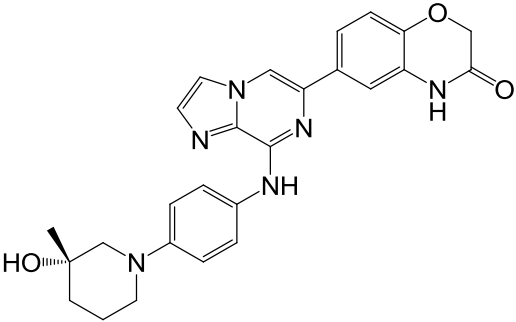
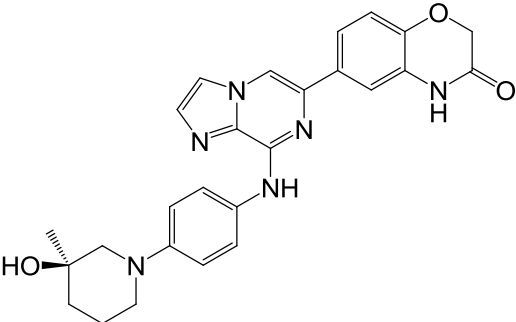
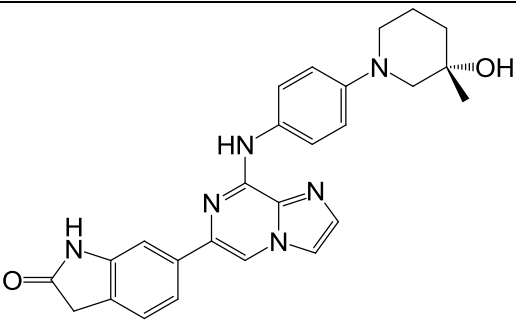
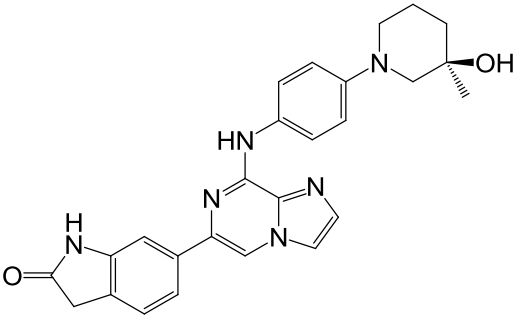
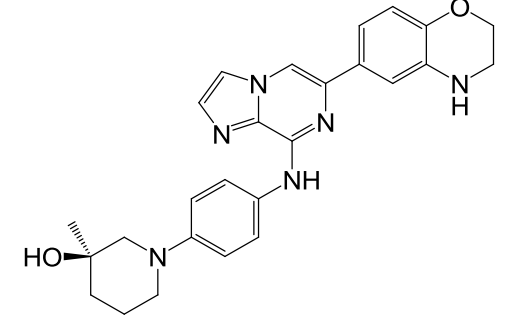
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	1-[6-(8-([4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно)імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-1,2,3,4-тетрагідроізохінолін-2-іл]етан-1-он	469,6
	1-[7-(8-([4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно)імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-1,2,3,4-тетрагідроізохінолін-2-іл]етан-1-он	469,7
	N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]-6-{1H, 2H, 3H-піридо[2,3-б][1,4]оксазин-7-іл}імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	430,4
	6-(1-метил-1H-індазол-6-іл)-N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	426,1
	N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]-6-{2H, 3H, 4H-піридо[3,2-б][1,4]оксазин-7-іл}імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	430,4

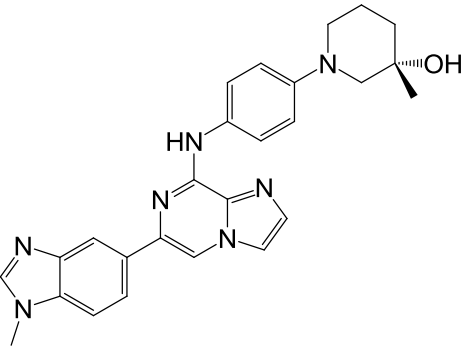
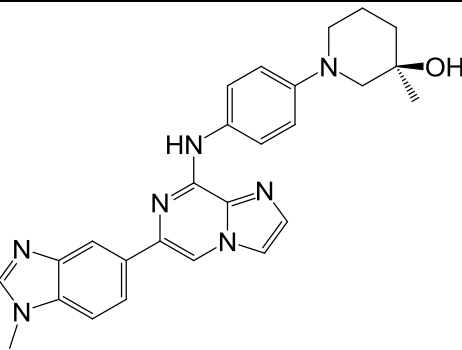
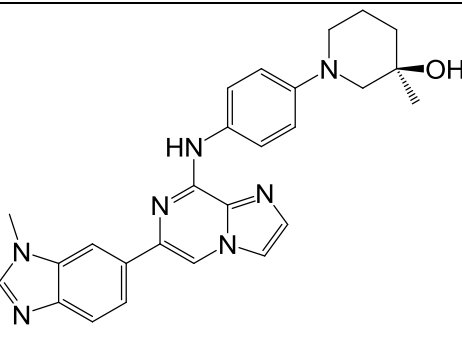
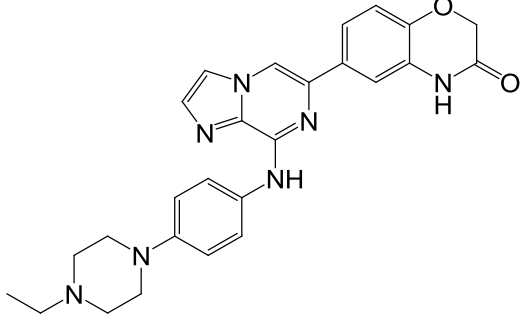
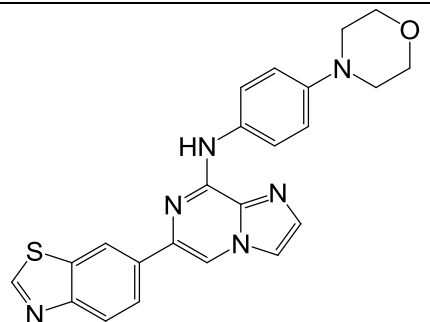
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	6-(8-({[4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-1Н, 2Н, 3Н-піrido[2,3-б][1,4]оксазин-2-он	444,2
	(3S)-1-(4-({[6-(3,4-дигідро-2Н-1,4-бензоксазин-7-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)-3-метилпіперидин-3-ол	457,2
	5-(8-({[4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-2,3-дигідро-1Н-індол-2-он	427
	1-метил-6-(8-({[4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-2,3-дигідро-1Н-індол-2-он	441,4

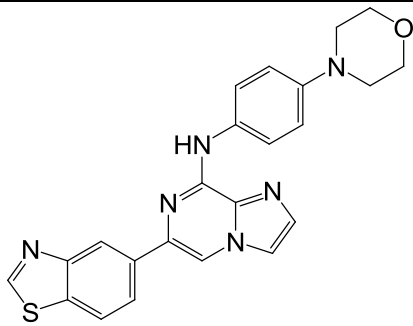
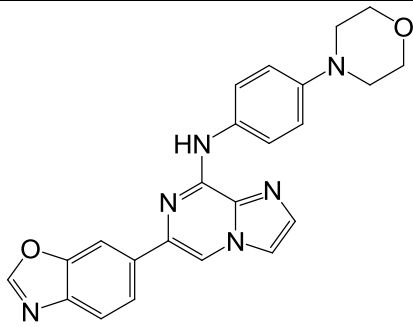
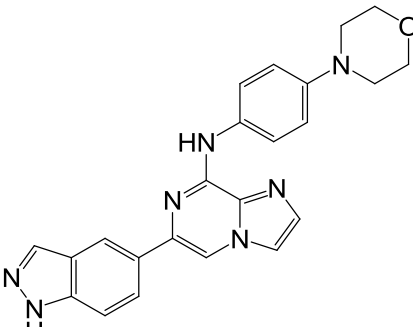
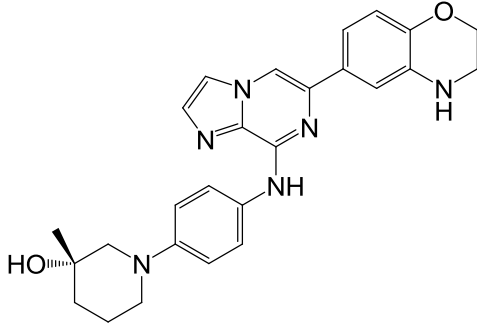
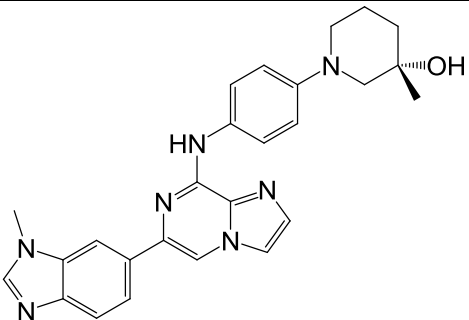
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	6-(8-({[4-(2-гідрокси-2-метилпропокси)феніл]аміно}-імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-3-он	446,3
	2-[4-(4-({[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)піперазин-1-іл)етан-1-ол	455,2
	6-(1H-індазол-4-іл)-N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	412,2
	N-[3-етокси-4-(морфолін-4-іл)феніл]-6-(1-метил-1H-1,3-бензодіазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	470,2
	6-(1H-індазол-6-іл)-N-[4-(піперазин-1-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	411,2

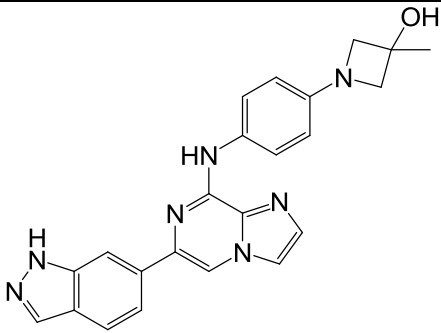
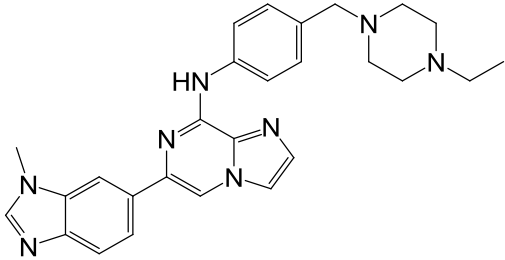
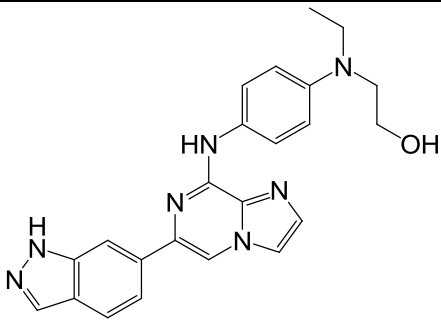
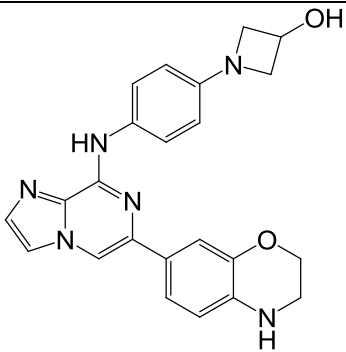
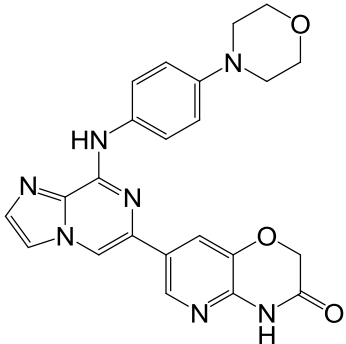
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]-6-(1,2,3,4-тетрагідроізохінолін-7-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	427,1
	N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]-6-(1,2,3,4-тетрагідроізохінолін-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	427
	7-(8-{[4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-1H, 2H, 3H-піrido[2,3-б][1,4]оксазин-2-он	444,8
	6-(1-метил-1H-піроло[3,2-б]піридин-6-іл)-N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	426,2
	6-(1-метил-1H-індол-6-іл)-N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	425,3

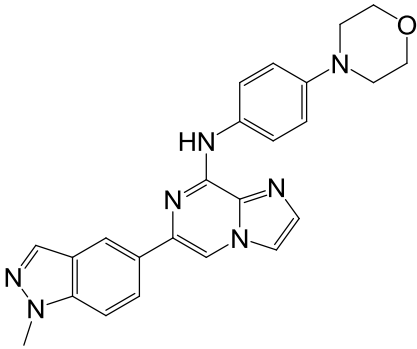
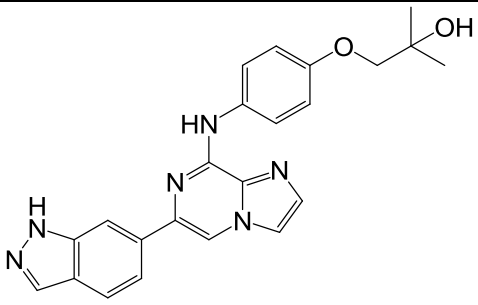
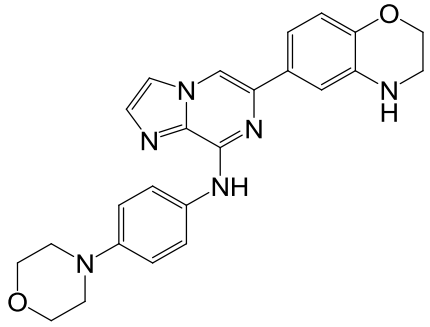
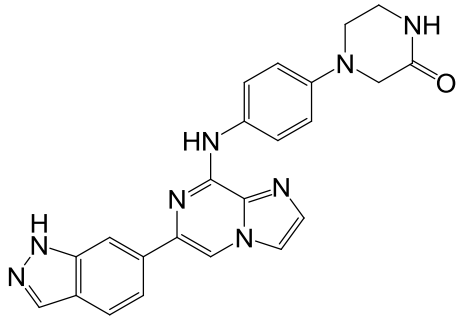
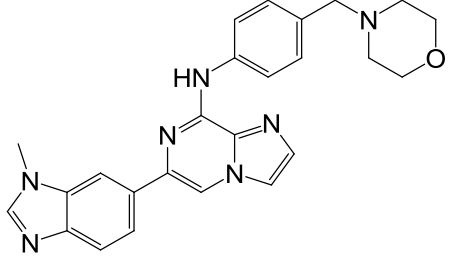
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	6-(1,3-бензоксазол-5-іл)-N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	413,5
	6-(4-метил-3,4-дигідро-2Н-1,4-бензоксазин-7-іл)-N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	443,6
	6-(4-метил-3,4-дигідро-2Н-1,4-бензоксазин-6-іл)-N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	443,9
	6-[8-({4-[(3S)-3-гідроксипіролідін-1-іл]феніл}аміно)імідазо[1,2-а]піразин-6-іл]-3,4-дигідро-2Н-1,4-бензоксазин-3-он	443,7
	(3R)-1-(4-({6-(3,4-дигідро-2Н-1,4-бензоксазин-7-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл}аміно)феніл)-3-метилпіперидин-3-ол	457,2

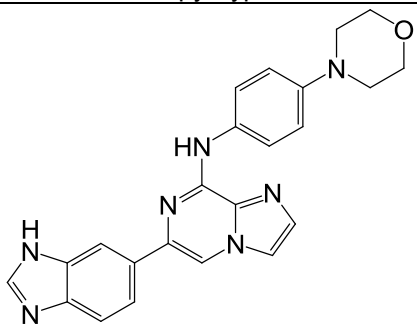
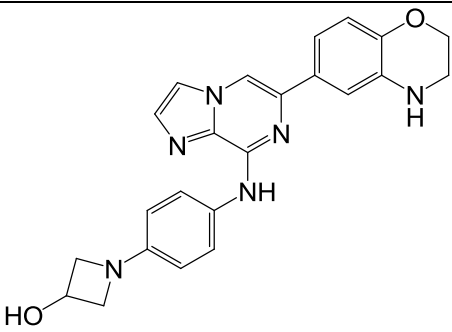
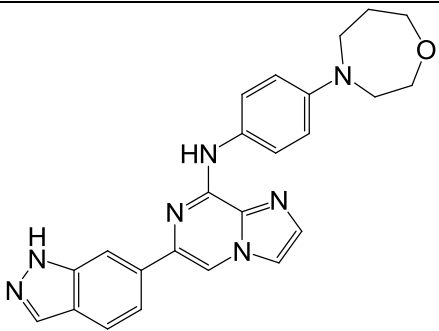
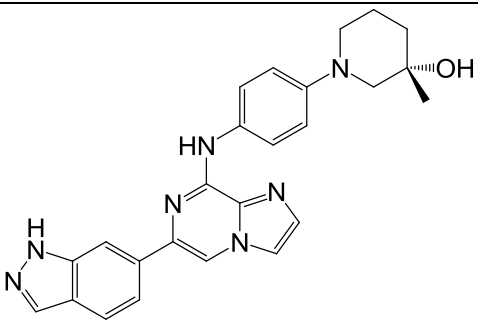
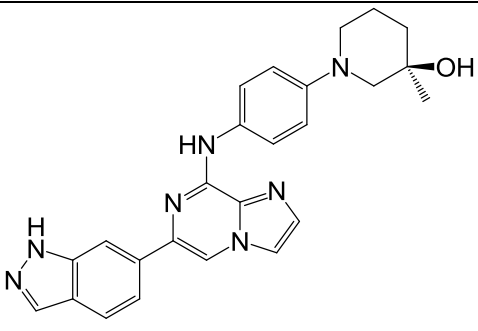
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	6-[8-({4-[(3S)-3-гідрокси-3-метилпіперидин-1-іл]феніл}-аміно)імідазо[1,2-а]піразин-6-іл]-3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-3-он	471,7
	6-[8-({4-[(3R)-3-гідрокси-3-метилпіперидин-1-іл]феніл}-аміно)імідазо[1,2-а]піразин-6-іл]-3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-3-он	471,6
	6-[8-({4-[(3S)-3-гідрокси-3-метилпіперидин-1-іл]феніл}-аміно)імідазо[1,2-а]піразин-6-іл]-2,3-дигідро-1H-індол-2-он	455,4
	6-[8-({4-[(3R)-3-гідрокси-3-метилпіперидин-1-іл]феніл}-аміно)імідазо[1,2-а]піразин-6-іл]-2,3-дигідро-1H-індол-2-он	455,2
	(3R)-1-(4-{{6-(3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл}аміно}феніл)-3-метилпіперидин-3-ол	457,2

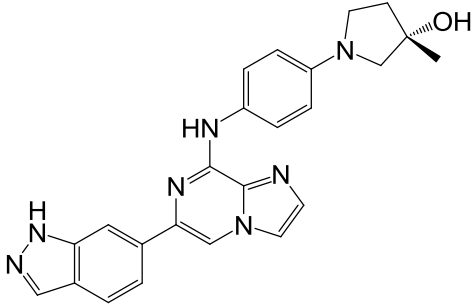
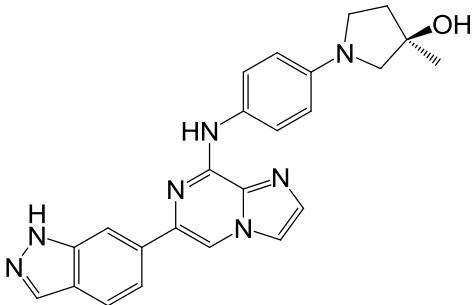
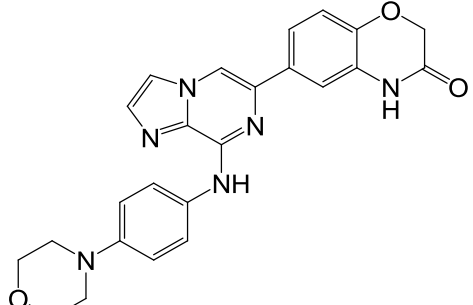
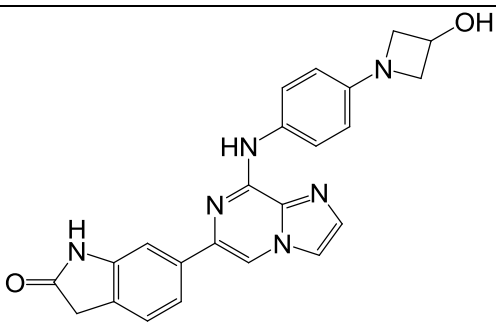
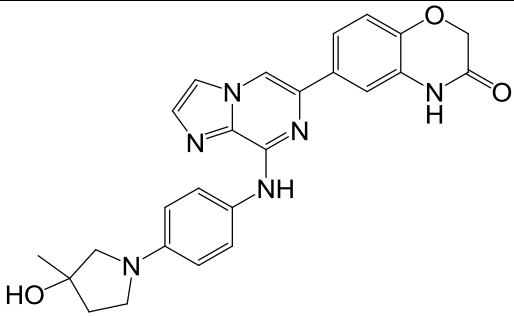
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	(3S)-3-метил-1-(4-{[6-(1-метил-1H-1,3-бензодіазол-5-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}-феніл)піперидин-3-ол	454,6
	(3R)-3-метил-1-(4-{[6-(1-метил-1H-1,3-бензодіазол-5-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}-феніл)піперидин-3-ол	454,2
	(3R)-3-метил-1-(4-{[6-(1-метил-1H-1,3-бензодіазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)-піперидин-3-ол	454,1
	6-(8-{[4-(4-етилпіперазин-1-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-3-он	470,8
	6-(1,3-бензотіазол-6-іл)-N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	429,3

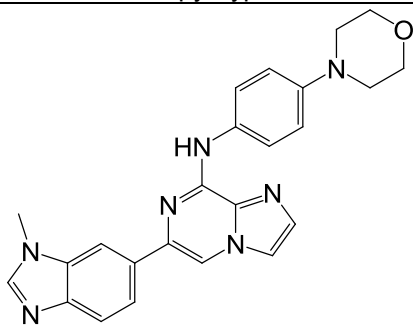
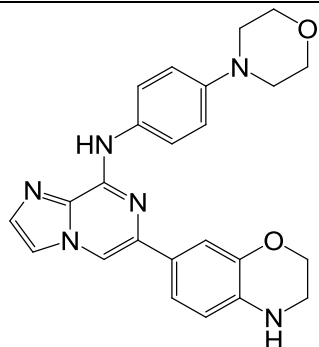
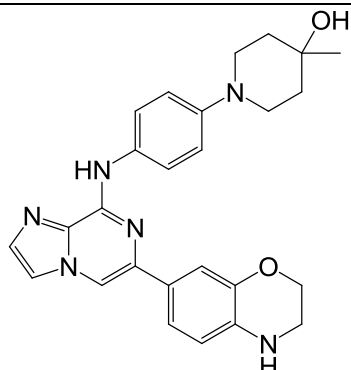
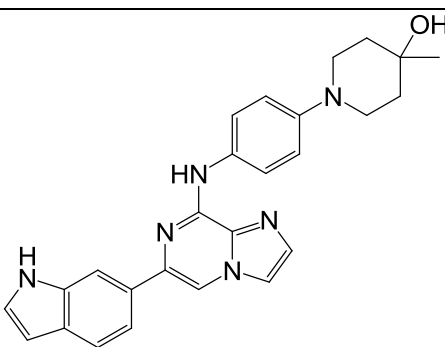
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	6-(1,3-бензотіазол-5-іл)-N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	429,4
	6-(1,3-бензоксазол-6-іл)-N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	413,5
	6-(1H-індазол-5-іл)-N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	412,3
	(3S)-1-(4-{[6-(3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)-3-метилпіперидин-3-ол	457,6
	(3S)-3-метил-1-(4-{[6-(1-метил-1H-1,3-бензодіазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)-піперидин-3-ол	450,4

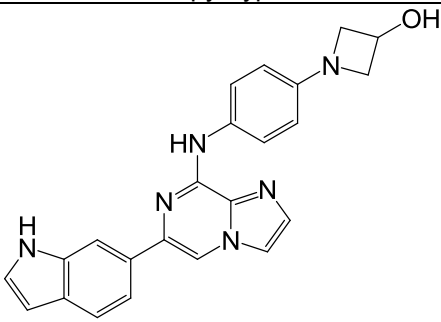
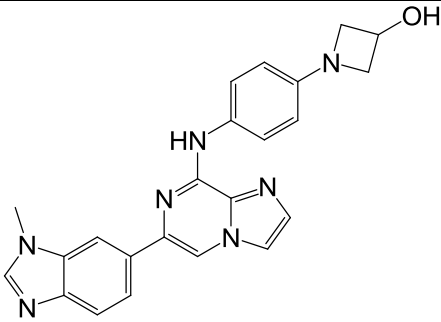
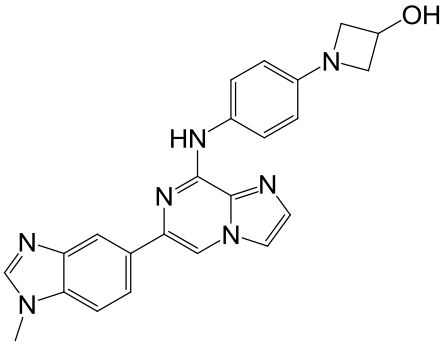
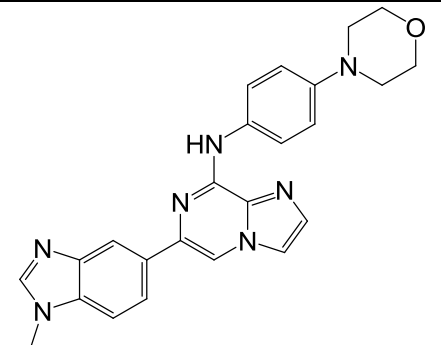
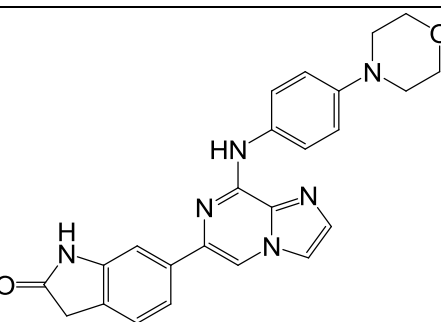
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	1-(4-{{6-((1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл)аміно}феніл)-3-метилазетидин-3-ол	412,3
	N-{4-{{(4-етилпіперазин-1-іл)метил}феніл}-6-((1-метил-1H-1,3-бензодіазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	467,5
	2-[етил(4-{{6-((1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл)аміно}феніл)аміно]етан-1-ол	414,4
	1-(4-{{6-((3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-7-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл)аміно}феніл)азетидин-3-ол	415,2
	7-(8-{{4-(морфолін-4-іл)феніл}аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-2H, 3H, 4H-піридо[3,2-б][1,4]оксазин-3-он	444,8

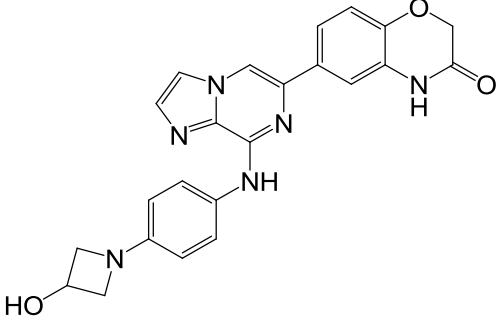
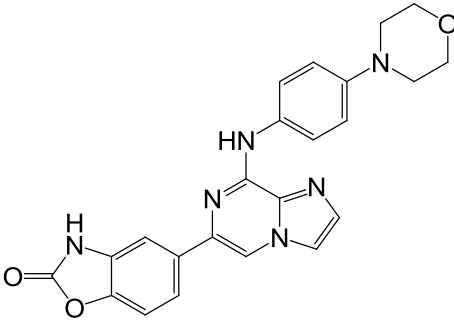
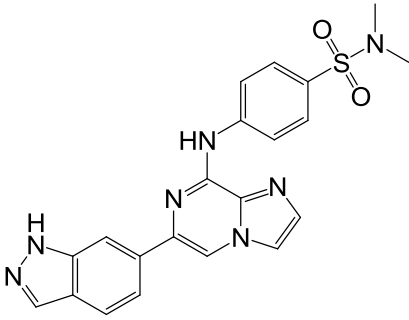
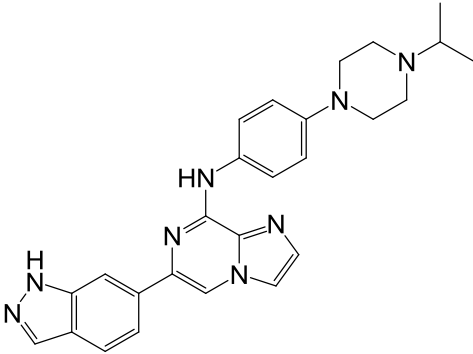
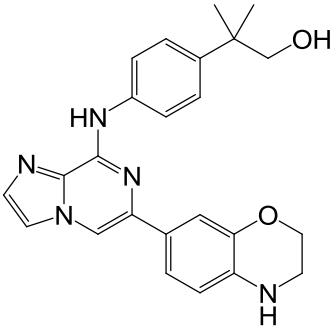
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	6-(1-метил-1H-індазол-5-іл)-N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	426,1
	1-(4-({6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}фенокси)-2-метилпропан-2-ол	415,4
	6-(3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-6-іл)-N-[4-(морфолін-4-іл)-феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	429,3
	4-(4-({6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)-піперазин-2-он	425,1
	6-(1-метил-1H-1,3-бензодіазол-6-іл)-N-[4-(морфолін-4-ілметил)-феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	440,4

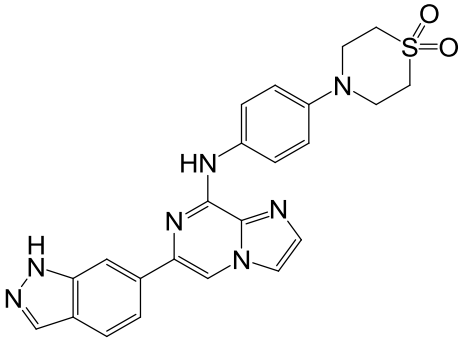
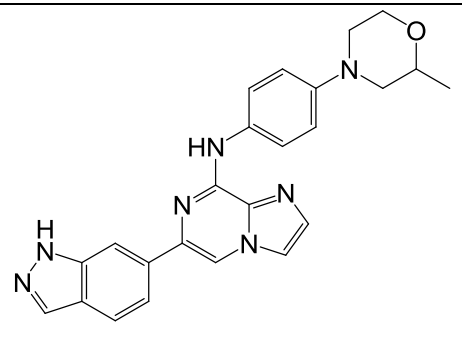
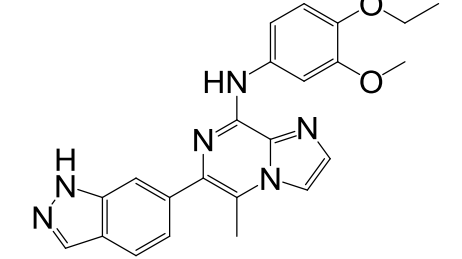
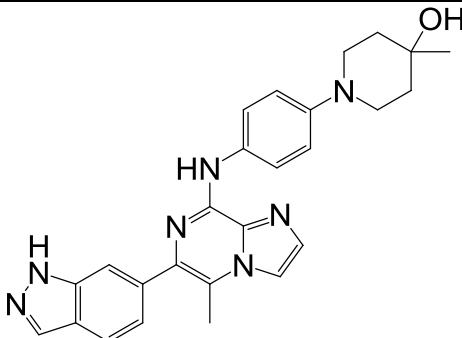
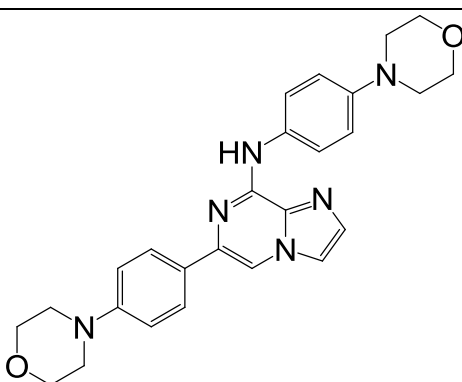
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	6-(1H-1,3-бензодіазол-6-іл)-N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	412,2
	1-(4-{{6-(3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл}аміно}феніл)азетидин-3-ол	415,4
	6-(1H-індазол-6-іл)-N-[4-(1,4-оксазепан-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	426,1
	(3S)-1-(4-{{6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл}аміно}феніл)-3-метилпіперидин-3-ол	440,3
	(3R)-1-(4-{{6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл}аміно}феніл)-3-метилпіперидин-3-ол	440,3

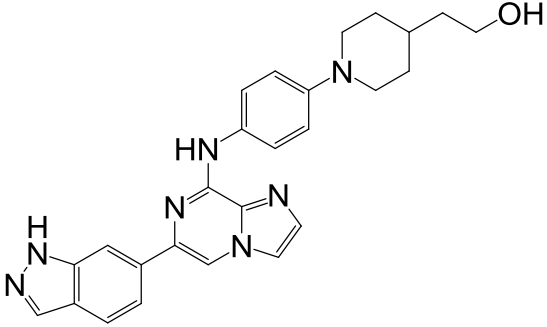
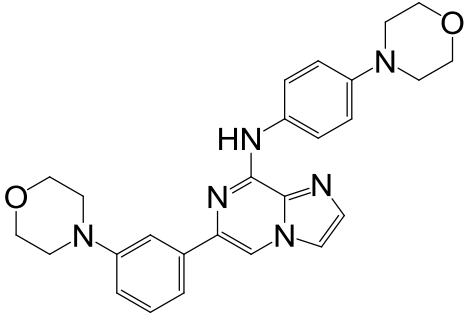
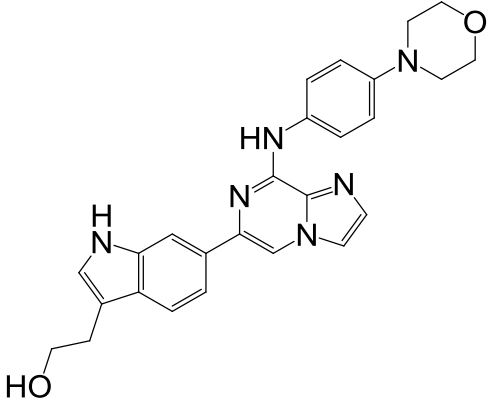
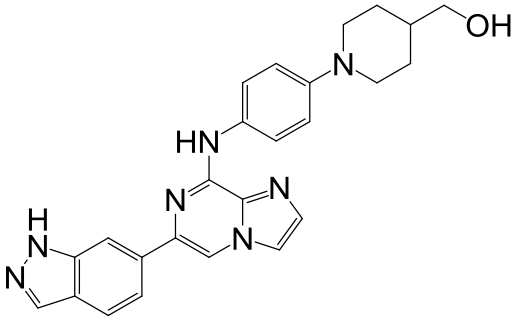
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	(3S)-1-(4-{{6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл}аміно}феніл)-3-метилпіролідин-3-ол	426,1
	(3R)-1-(4-{{6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл}аміно}феніл)-3-метилпіролідин-3-ол	426,2
	6-(8-{{4-(морфолін-4-іл)-феніл}аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-3-он	443,7
	6-(8-{{4-(3-гідроксiazетидин-1-іл)феніл}аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-2,3-дигідро-1H-індол-2-он	413,4
	6-(8-{{4-(3-гідрокси-3-метилпіролідин-1-іл)-феніл}аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-3-он	457,6

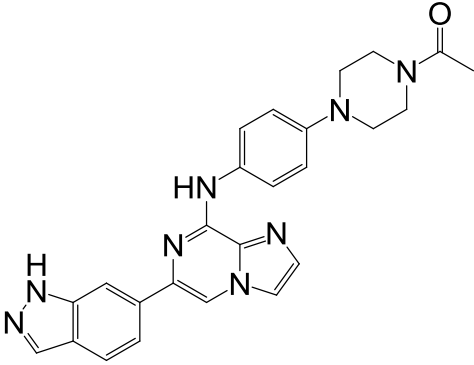
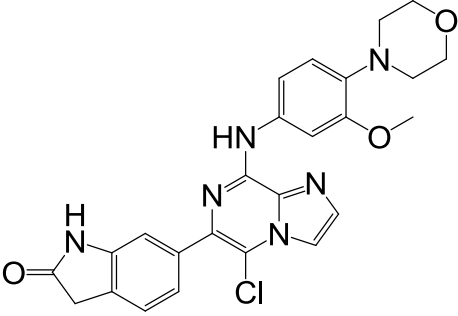
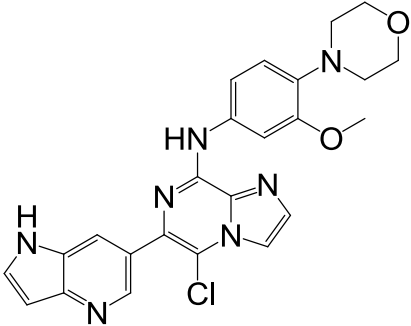
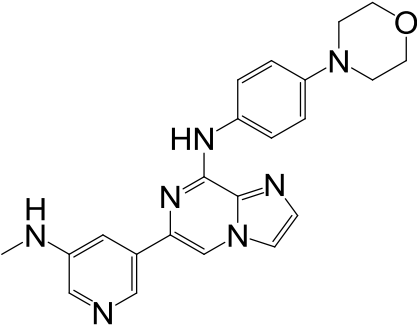
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	6-(1-метил-1H-1,3-бензодіазол-6-іл)-N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]-імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	426,2
	6-(3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-7-іл)-N-[4-(морфолін-4-іл)-феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	429,2
	1-(4-({[6-(3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-7-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)-4-метилпіперидин-4-ол	457,2
	1-(4-({[6-(1H-індол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)-4-метилпіперидин-4-ол	439,7

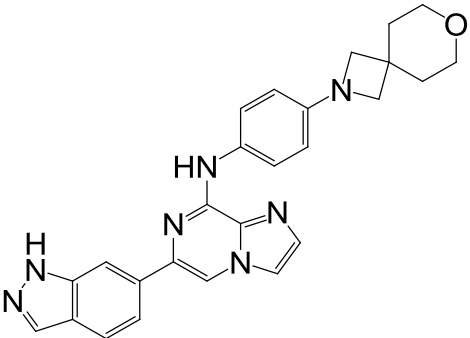
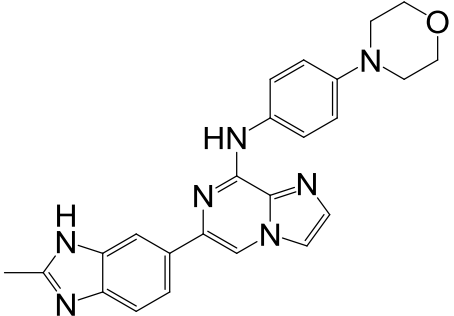
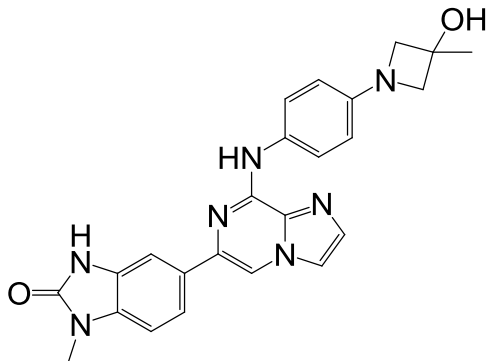
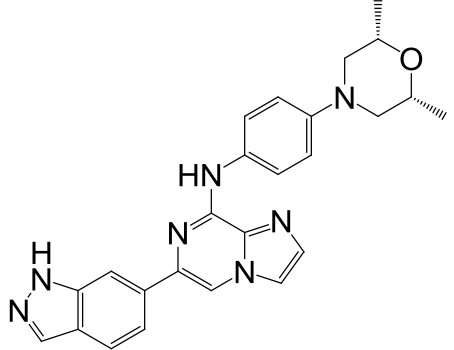
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	1-(4-({[6-(1H-індол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)азетидин-3-ол	397,1
	1-(4-({[6-(1-метил-1H-1,3-бензодіазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)азетидин-3-ол	412,3
	1-(4-({[6-(1-метил-1H-1,3-бензодіазол-5-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)азетидин-3-ол	412,2
	6-(1-метил-1H-1,3-бензодіазол-5-іл)-N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]-імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	426,1
	6-(8-({[4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-2,3-дигідро-1H-індол-2-он	427,1

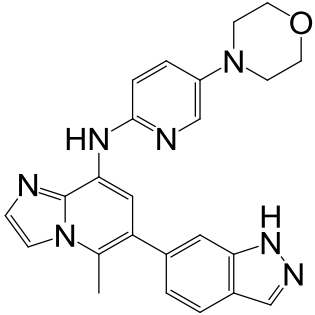
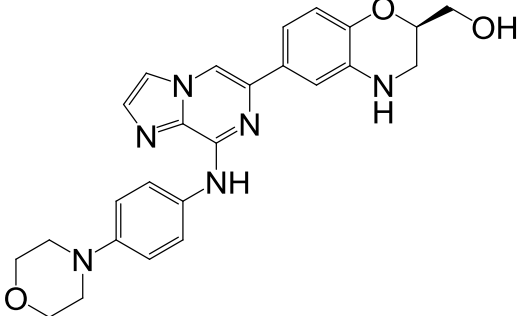
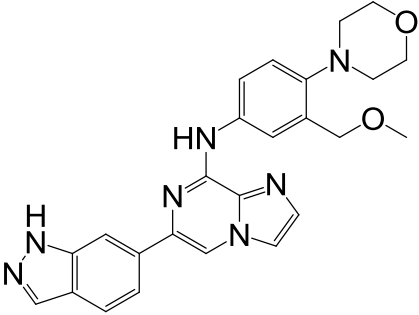
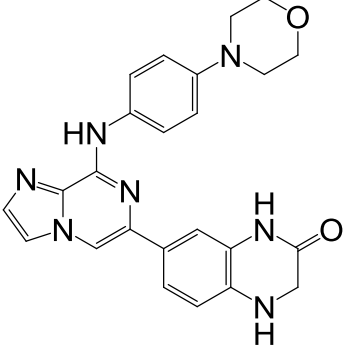
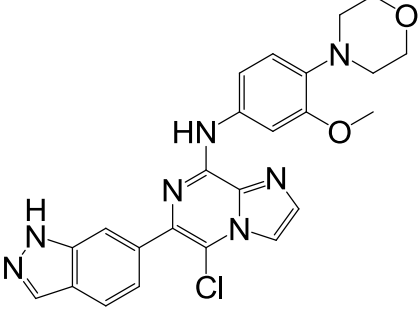
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	6-(8-([4-(3-гідроксiazетидин-1-іл)феніл]аміно)імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-3-он	429,3
	5-(8-([4-(морфолін-4-іл)феніл]-аміно)імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-2,3-дигідро-1,3-бензоксазол-2-он	429,3
	4-([6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно)-N, N-диметилбензол-1-сульфонамід	434,3
	6-(1H-індазол-6-іл)-N-{4-[4-(пропан-2-іл)піперазин-1-іл]феніл}імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	453,9
	2-(4-([6-(3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-7-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно)феніл)-2-метилпропан-1-ол	416,8

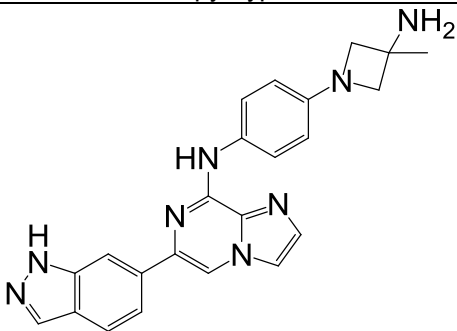
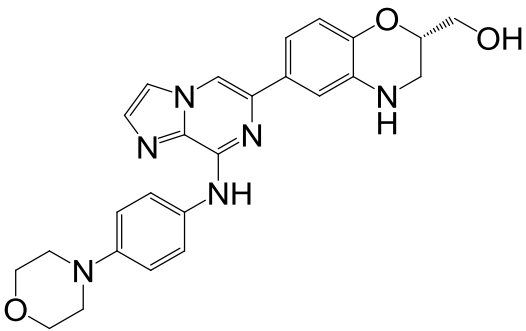
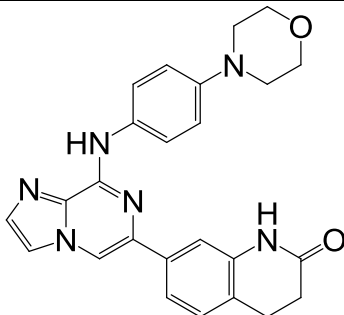
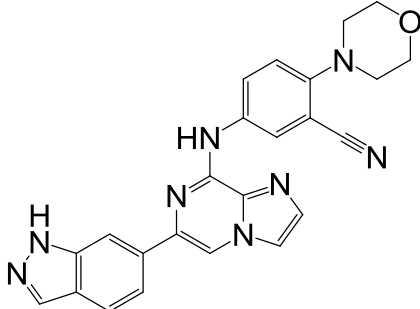
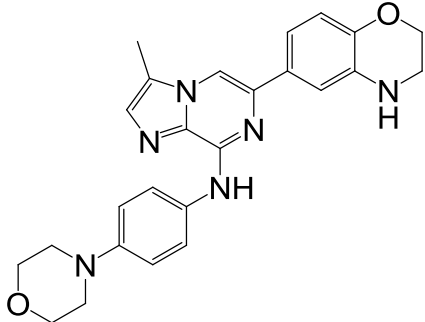
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	4-(4-({6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл}аміно)феніл)-тіоморфолін-1,1-діон	460,4
	6-(1H-індазол-6-іл)-N-[4-(2-метилморфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	426,1
	N-(4-етокси-3-метоксифеніл)-6-(1H-індазол-6-іл)-5-метилімідазо[1,2-а]піразин-8-амін	415,3
	1-(4-({6-(1H-індазол-6-іл)-5-метилімідазо[1,2-а]піразин-8-іл}аміно)феніл)-4-метилпіперидин-4-ол	454,2
	N,6-біс[4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	457,3

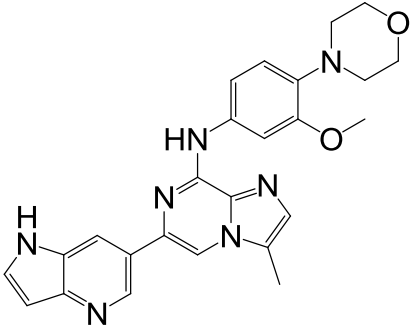
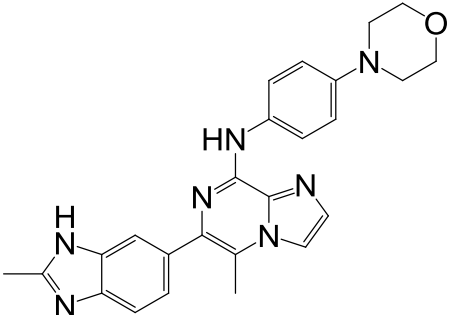
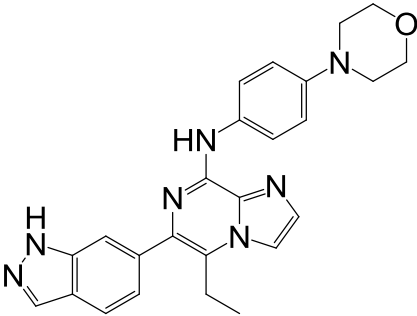
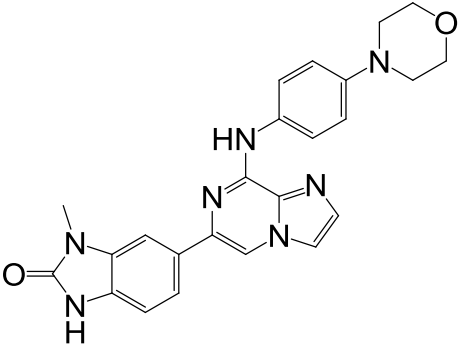
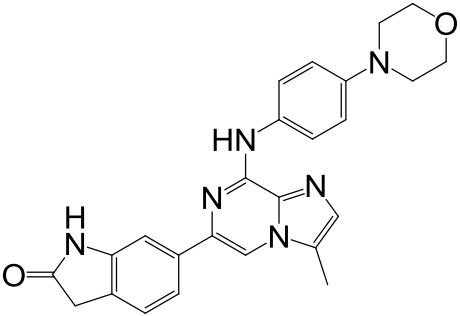
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	2-[1-(4-[[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)піперидин-4-іл]етан-1-ол	454,1
	6-[3-(морфолін-4-іл)феніл]-N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	457,6
	2-[6-(8-[[4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-1H-індол-3-іл]етан-1-ол	455,2
	[1-(4-[[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)піперидин-4-іл]метанол	440,4

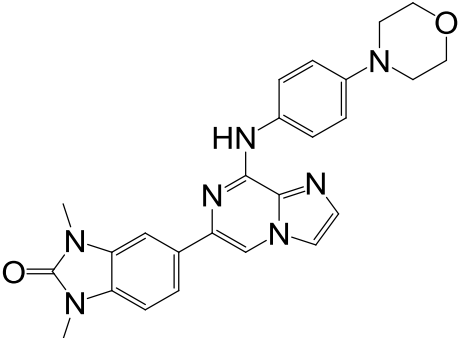
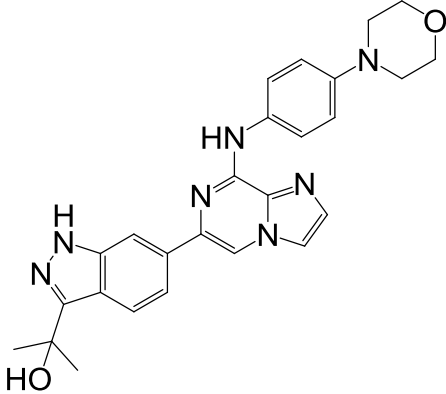
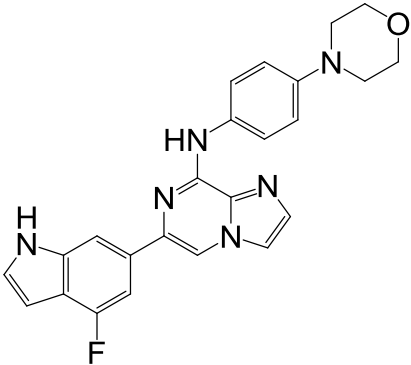
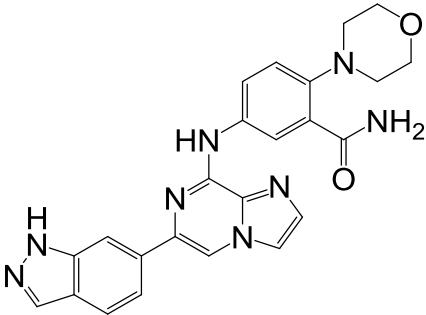
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	1-[4-(4-{[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)піперазин-1-іл]етан-1-он	453
	6-(5-хлор-8-{[3-метокси-4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}-імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-2,3-дигідро-1H-індол-2-он	491,3
	5-хлор-N-[3-метокси-4-(морфолін-4-іл)феніл]-6-{1H-піроло[3,2-б]піридин-6-іл}імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	476,4
	N-метил-5-(8-{[4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)піридин-3-амін	402,3

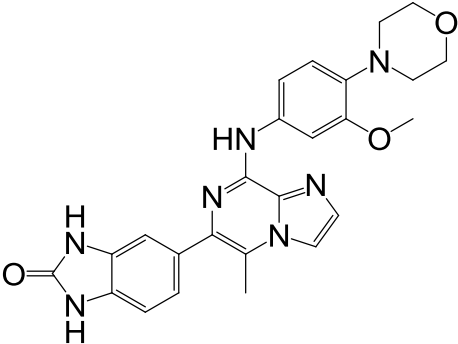
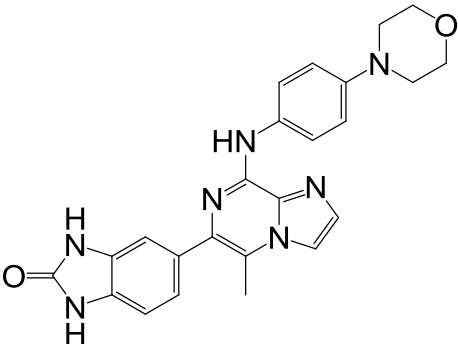
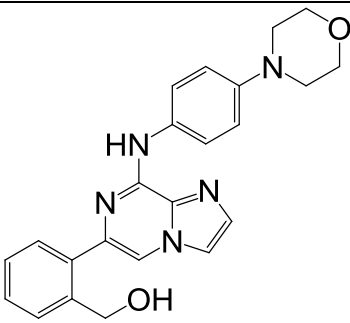
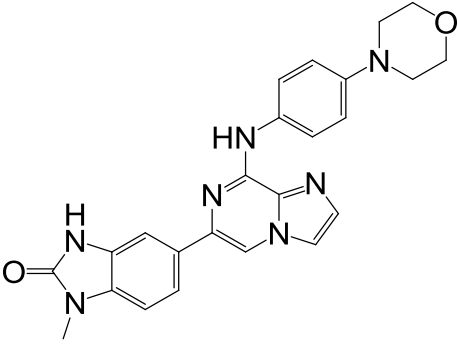
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	6-(1H-індазол-6-іл)-N-(4-{7-окса-2-азаспіро[3,5]нонан-2-іл}феніл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	452,3
	6-(2-метил-1H-1,3-бензодіазол-6-іл)-N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]-імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	426,2
	5-(8-{[4-(3-гідрокси-3-метилазетидин-1-іл)феніл]-аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-1-метил-2,3-дигідро-1H-1,3-бензодіазол-2-он	442,7
	N-{4-[(2R, 6S)-2,6-диметилморфолін-4-іл]феніл}-6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	440,3

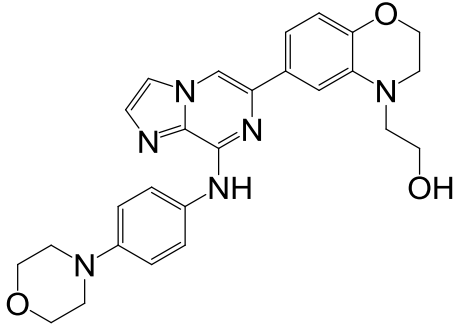
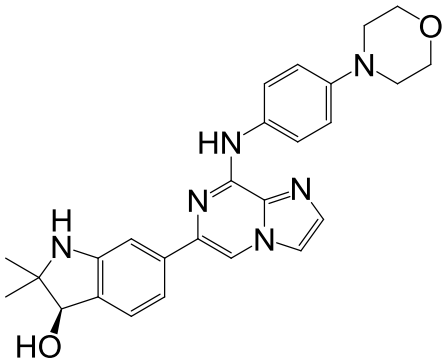
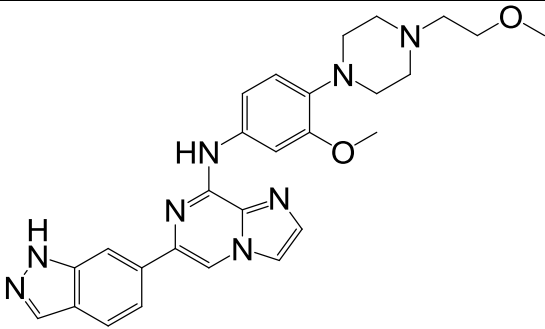
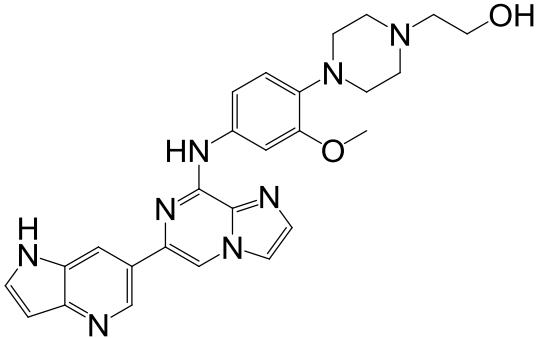
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	N-[6-(1H-індазол-6-іл)-5-метилімідазо[1,2-а]піридин-8-іл]-5-(морфолін-4-іл)піридин-2-амін	426,2
	[(2R)-6-(8-{[4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-2-іл]метанол	459,3
	6-(1H-індазол-6-іл)-N-[3-(метоксиметил)-4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	456,3
	7-(8-{[4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-1,2,3,4-тетрагідріноксалін-2-он	442,4
	5-хлор-6-(1H-індазол-6-іл)-N-[3-метокси-4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	476,1

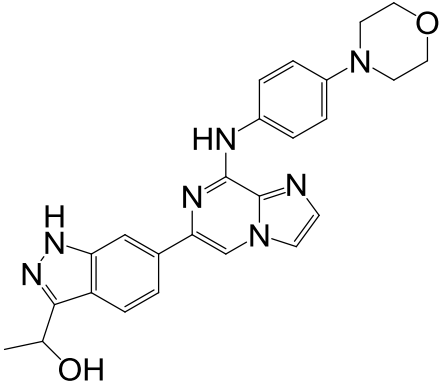
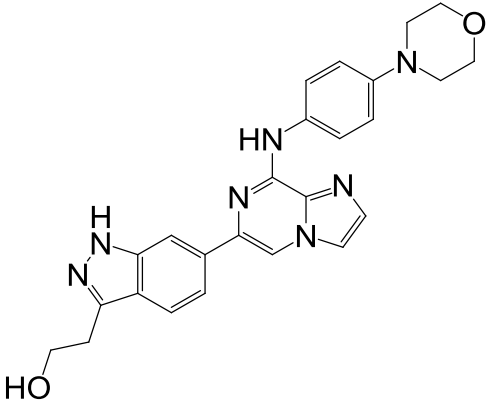
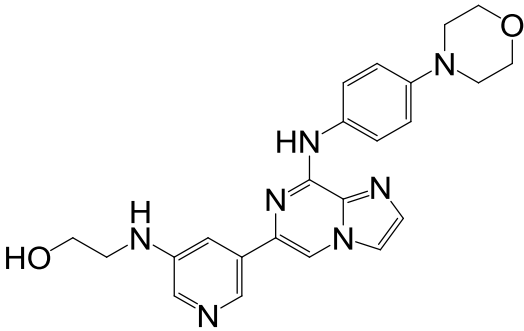
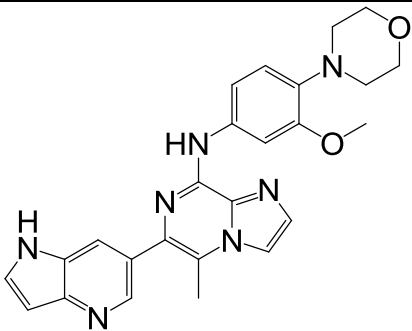
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	1-(4-({6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл}аміно)феніл)-3-метилазетидин-3-амін	411,3
	[(2S)-6-(8-({4-(морфолін-4-іл)феніл}аміно)імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-2-іл]метанол	459,3
	7-(8-({4-(морфолін-4-іл)феніл}аміно)імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-1,2,3,4-тетрагідрохінолін-2-он	441,5
	5-({6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл}аміно)-2-(морфолін-4-іл)бензонітрил	437,1
	6-(3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-6-іл)-3-метил-N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	443,9

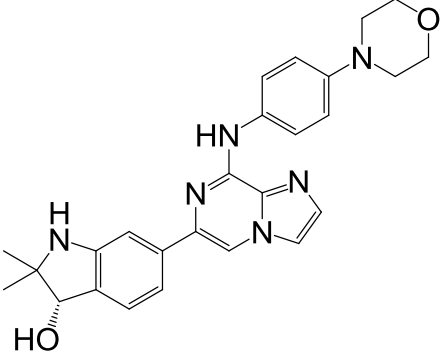
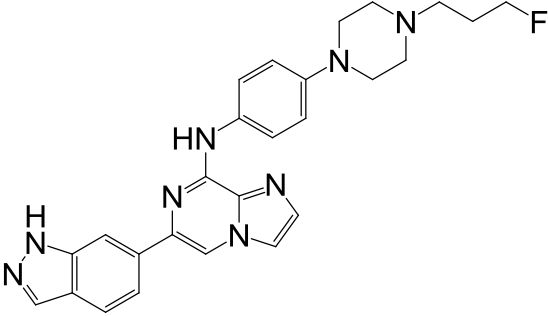
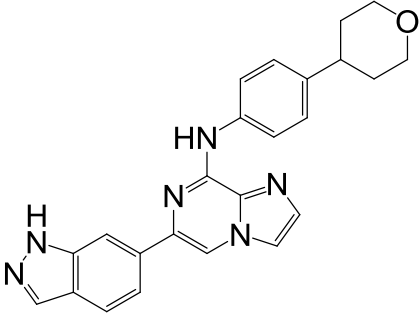
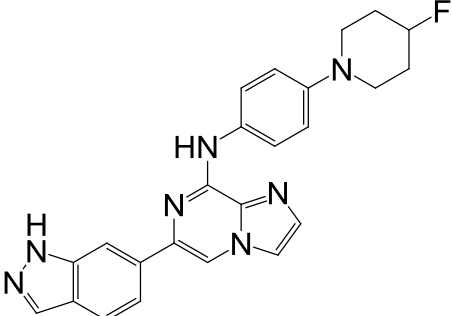
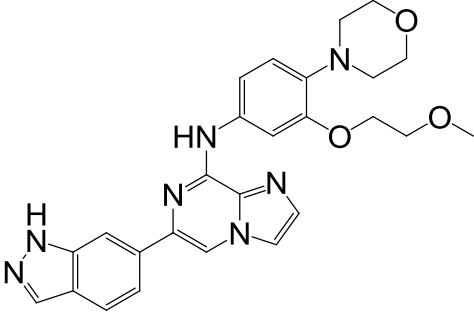
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	N-[3-метокси-4-(морфолін-4-іл)феніл]-3-метил-6-{1H-піроло[3,2-b]піридин-6-іл}імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	456,4
	5-метил-6-(2-метил-1H-1,3-бензодіазол-6-іл)-N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	440,2
	5-етил-6-(1H-індазол-6-іл)-N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	440,4
	1-метил-6-(8-({4-(морфолін-4-іл)феніл}аміно)імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-2,3-дигідро-1H-1,3-бензодіазол-2-он	442,7
	6-(3-метил-8-({4-(морфолін-4-іл)феніл}аміно)імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-2,3-дигідро-1H-індол-2-он	441,3

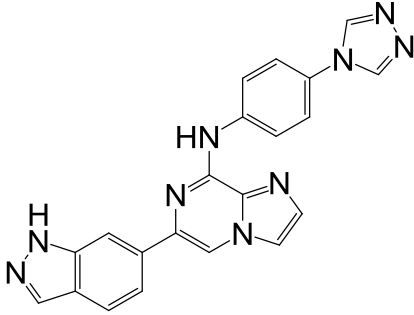
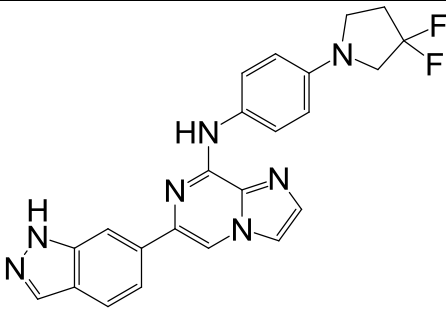
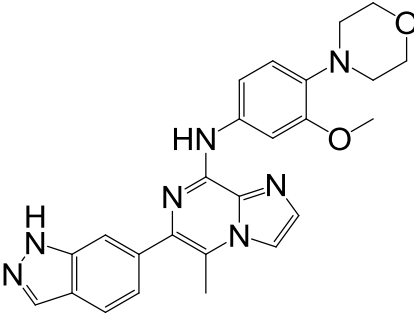
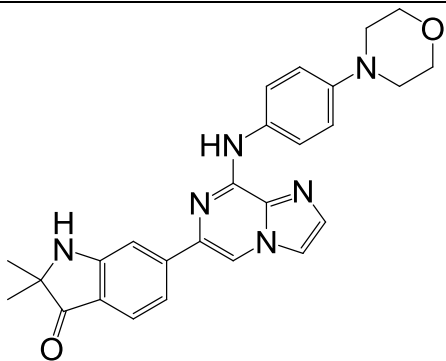
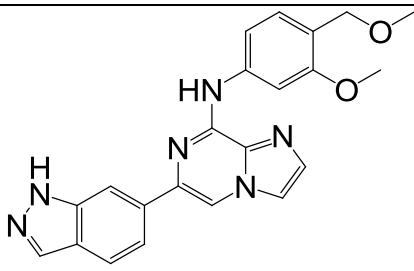
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	1,3-диметил-5-(8-{[4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-2,3-дигідро-1H-1,3-бензодіазол-2-он	456,2
	2-[6-(8-{[4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-1H-індазол-3-іл]пропан-2-ол	470,8
	6-(4-фтор-1H-індол-6-іл)-N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	429,3
	5-{[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}-2-(морфолін-4-іл)бензамід	455,2

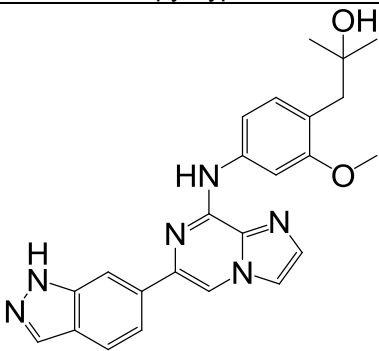
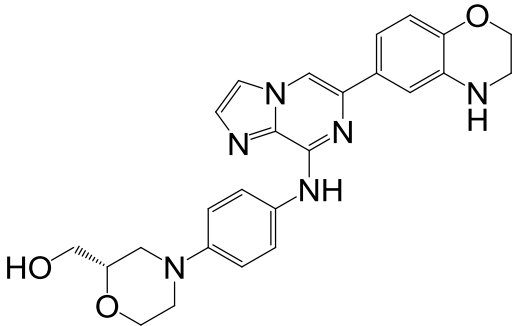
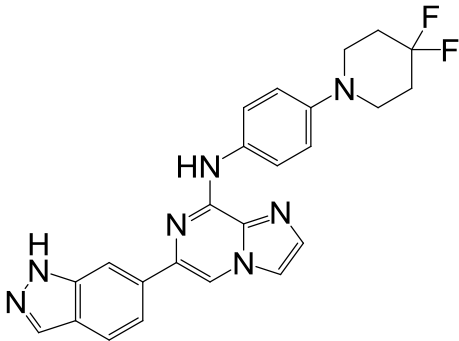
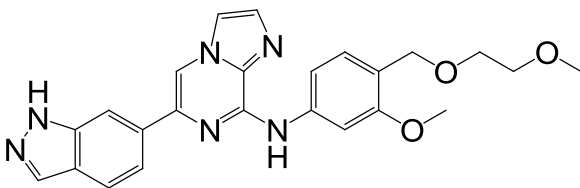
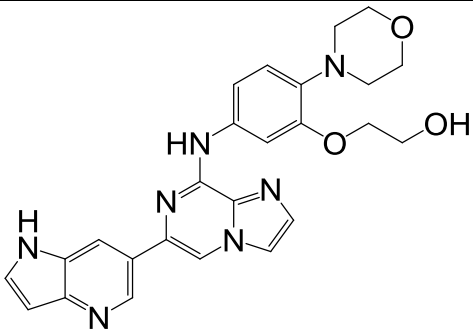
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	5-(8-({3-метокси-4-(морфолін-4-іл)феніл}аміно)-5-метилімідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-2,3-дигідро-1Н-1,3-бензодіазол-2-он	472,4
	5-(5-метил-8-({4-(морфолін-4-іл)феніл}аміно)імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-2,3-дигідро-1Н-1,3-бензодіазол-2-он	442,4
	[2-(8-({4-(морфолін-4-іл)феніл}аміно)імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)феніл]метанол	402,2
	1-метил-5-(8-({4-(морфолін-4-іл)феніл}аміно)імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-2,3-дигідро-1Н-1,3-бензодіазол-2-он	442,7

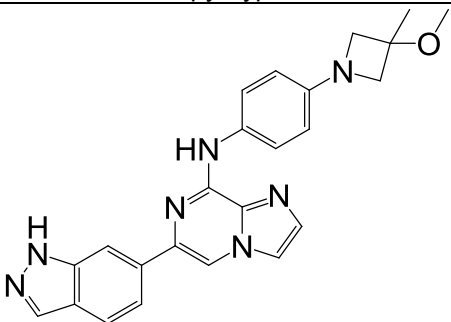
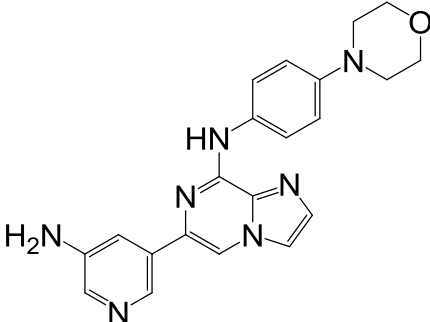
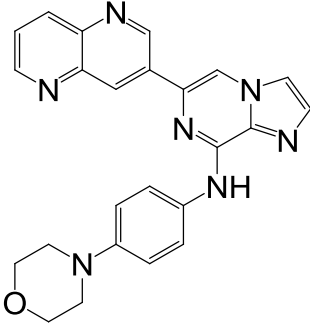
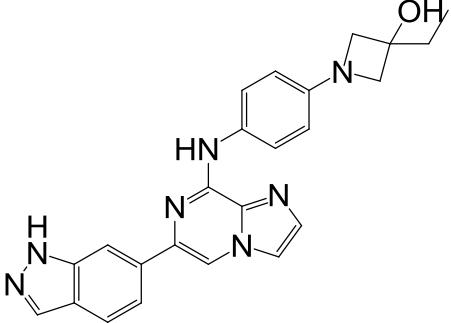
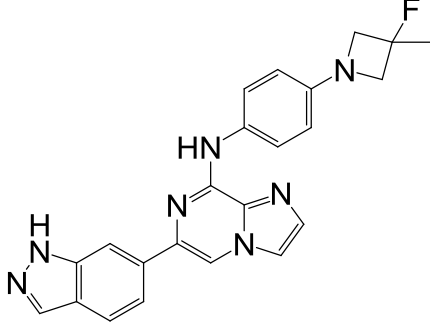
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	2-[6-(8-{[4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-3,4-дигідро-2Н-1,4-бензоксазин-4-іл]етан-1-ол	473,2
	(3R)-2,2-диметил-6-(8-{[4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-2,3-дигідро-1Н-індол-3-ол	457,6
	6-(1Н-індазол-6-іл)-N-{3-метокси-4-[4-(2-метоксиетил)піперазин-1-іл]феніл}імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	499,6
	2-(4-{2-метокси-4-[(6-{1Н-піроло[3,2-б]піридин-6-іл}імідазо[1,2-а]піразин-8-іл)аміно]феніл}піперазин-1-іл)етан-1-ол	485,7

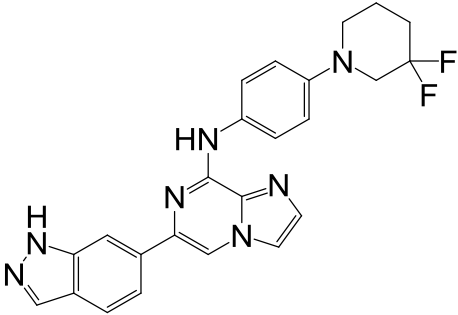
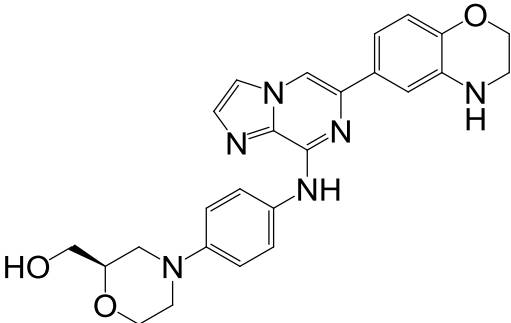
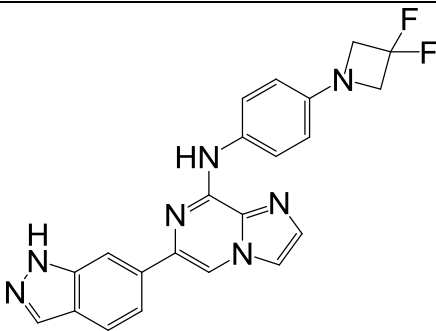
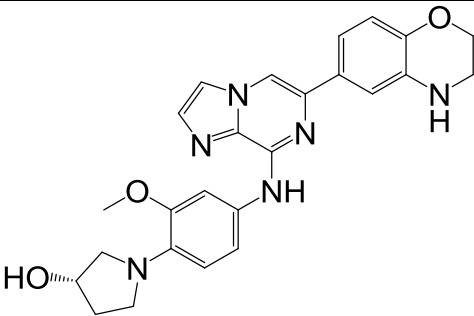
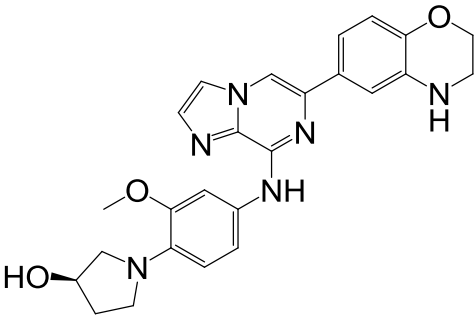
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	1-[6-(8-([4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно)імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-1H-індазол-3-іл]етан-1-ол	456,5
	2-[6-(8-([4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно)імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-1H-індазол-3-іл]етан-1-ол	456,5
	2-([5-(8-([4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно)імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)піридин-3-іл]аміно)етан-1-ол	432,6
	N-[3-метокси-4-(морфолін-4-іл)феніл]-5-метил-6-{1H-піроло[3,2-б]піридин-6-іл}імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	456,2

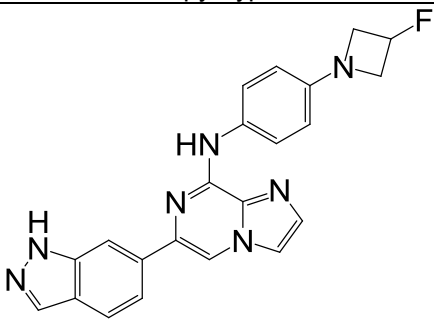
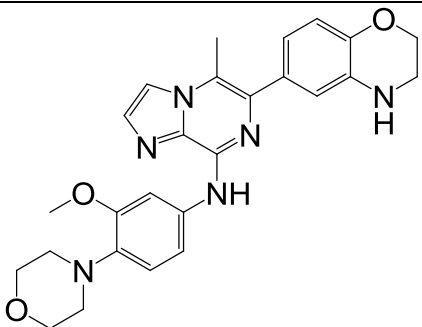
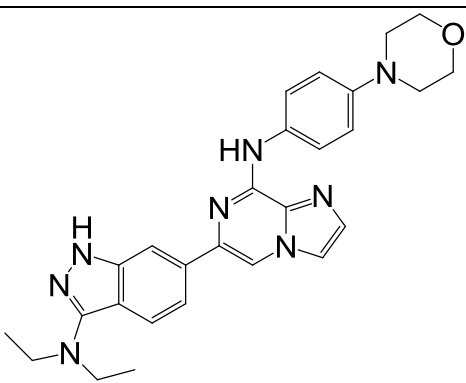
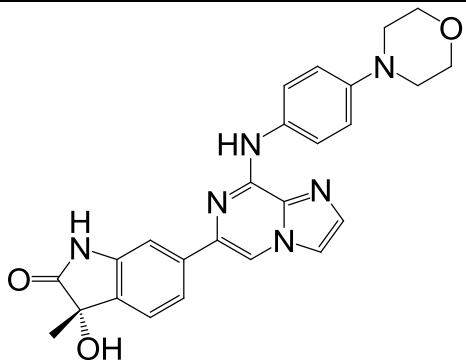
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	(3S)-2,2-диметил-6-(8-{[4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-2,3-дигідро-1H-індол-3-ол	457,8
	N-(4-[4-(3-фторпропіл)піперазин-1-іл]феніл)-6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	471,4
	6-(1H-індазол-6-іл)-N-[4-(оксан-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	411,3
	N-[4-(4-фторпіперидин-1-іл)феніл]-6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	428,2
	6-(1H-індазол-6-іл)-N-[3-(2-метоксиетокси)-4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	486,6

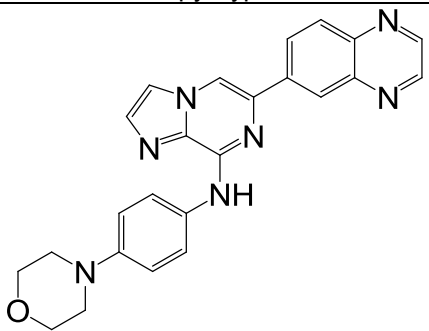
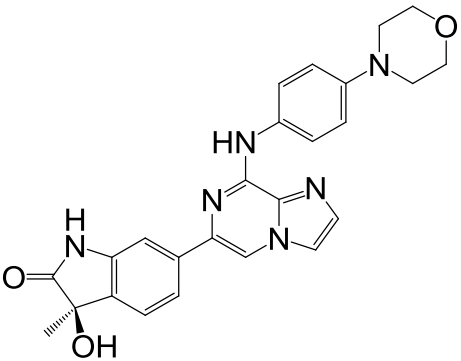
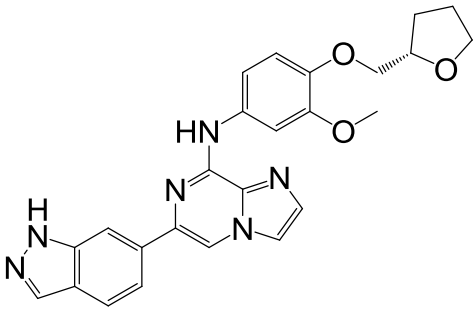
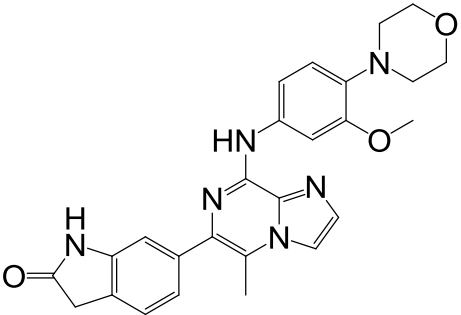
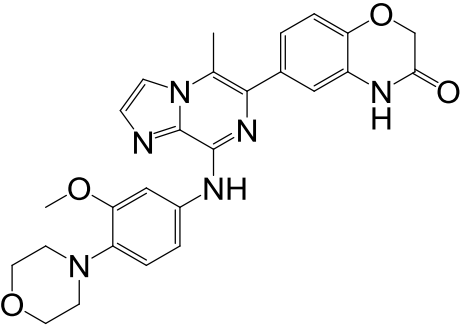
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	6-(1H-індазол-6-іл)-N-[4-(4H-1,2,4-триазол-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	394,3
	N-[4-(3,3-дифторпіролідін-1-іл)феніл]-6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	432,3
	6-(1H-індазол-6-іл)-N-[3-метокси-4-(морфолін-4-іл)феніл]-5-метилімідазо[1,2-а]піразин-8-амін	456,3
	2,2-диметил-6-(8-([4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно)імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-2,3-дигідро-1H-індол-3-он	455,3
	6-(1H-індазол-6-іл)-N-[3-метокси-4-(метоксиметил)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	401,2

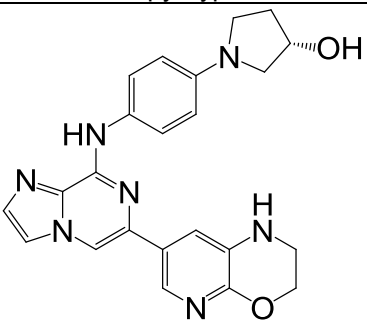
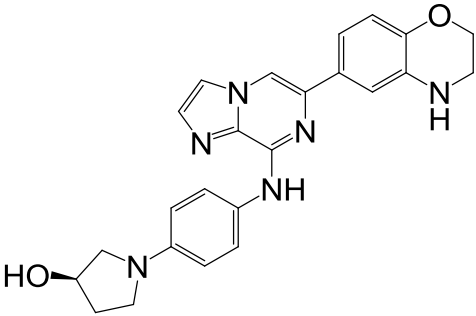
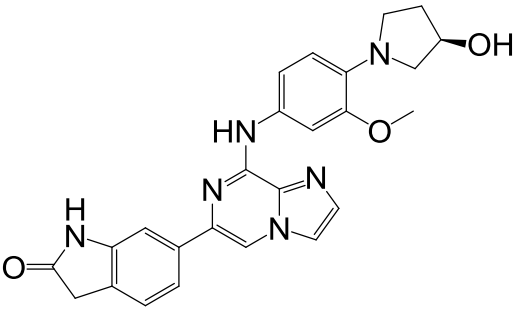
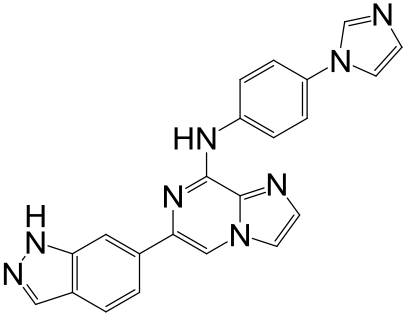
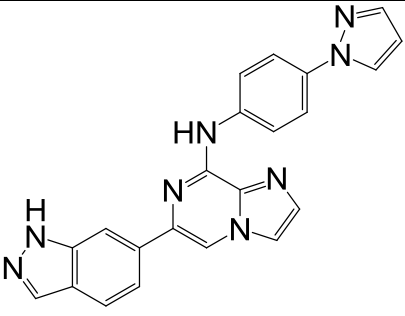
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	1-(4-({6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл}аміно)-2-метоксифеніл)-2-метилпропан-2-ол	429,4
	[(2S)-4-(4-({6-(3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл}аміно)-феніл)морфолін-2-іл]метанол	459,3
	N-[4-(4,4-дифторпіперидин-1-іл)феніл]-6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	446,3
	6-(1H-індазол-6-іл)-N-{3-метокси-4-[(2-метоксиетокси)-метил]феніл}імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	445,5
	2-[2-(морфолін-4-іл)-5-[(6-{1H-піроло[3,2-b]піридин-6-іл}імідазо[1,2-а]піразин-8-іл)аміно]фенокси]етан-1-ол	472,4

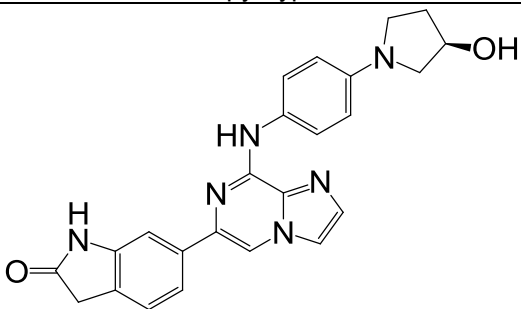
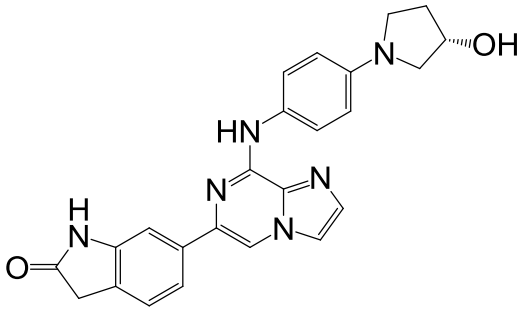
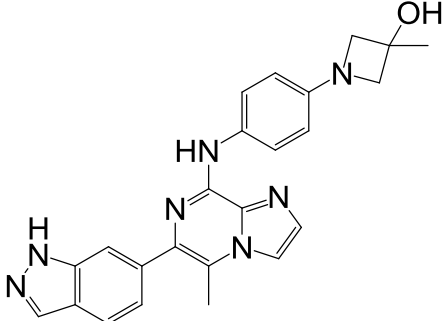
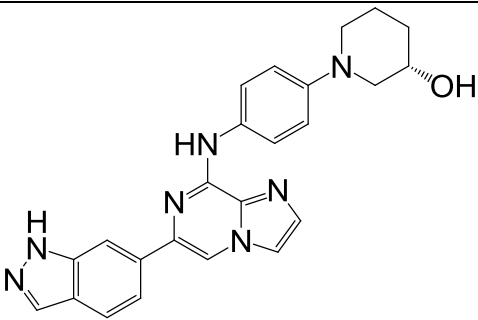
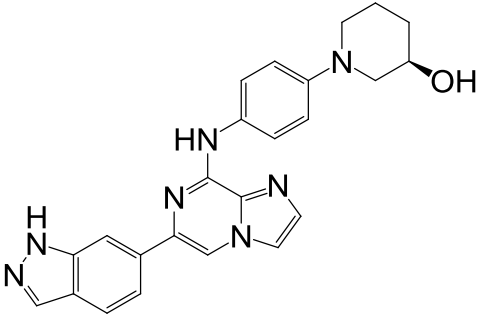
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	6-(1H-індазол-6-іл)-N-[4-(3-метокси-3-метилазетидин-1-іл)феніл]-імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	426,2
	5-(8-([4-(морфолін-4-іл)феніл]-аміно)імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)піридин-3-амін	388,8
	N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]-6-(1,5-нафтиридин-3-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	424,2
	3-етил-1-(4-([6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно)феніл)азетидин-3-ол	426
	N-[4-(3-фтор-3-метилазетидин-1-іл)феніл]-6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	414,5

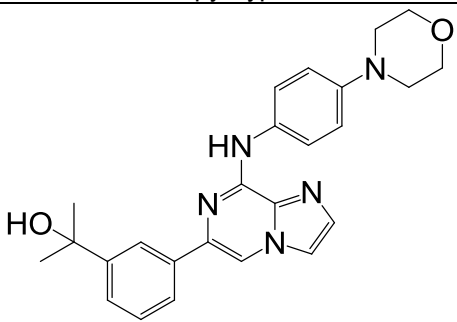
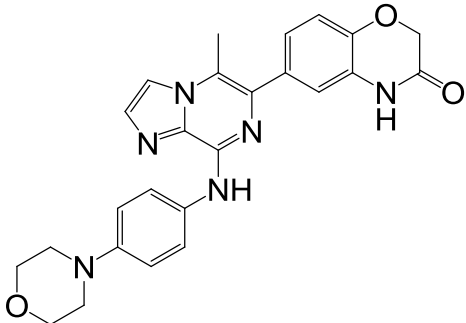
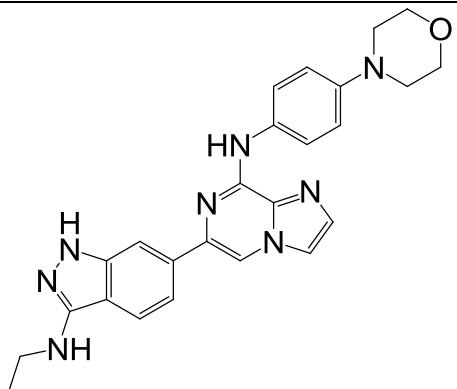
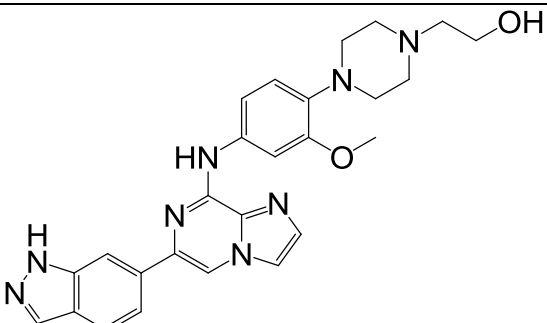
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	N-[4-(3,3-дифторпіперидин-1-іл)феніл]-6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	446,2
	[(2R)-4-(4-{[6-(3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}-феніл)морфолін-2-іл]метанол	459,4
	N-[4-(3,3-дифторазетидин-1-іл)феніл]-6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	418,6
	(3S)-1-(4-{[6-(3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}-2-метоксифеніл)піролідин-3-ол	459,5
	(3R)-1-(4-{[6-(3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}-2-метоксифеніл)піролідин-3-ол	459,5

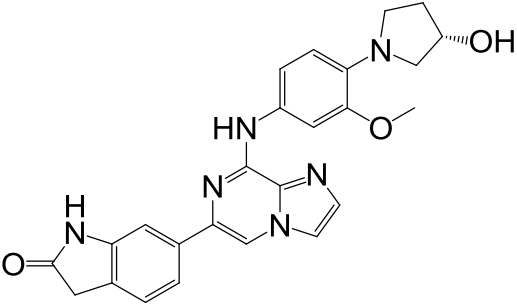
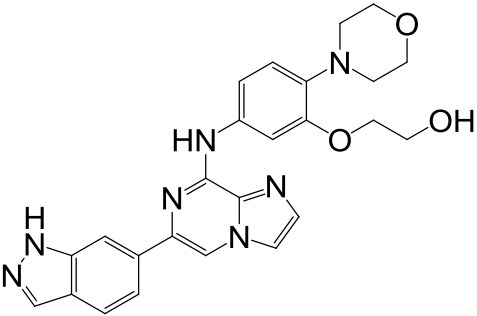
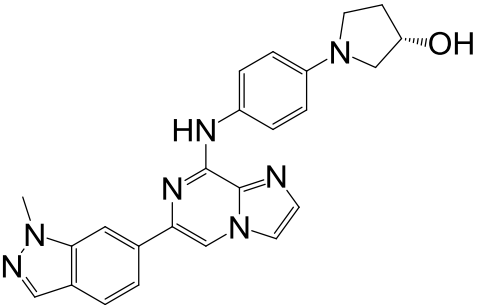
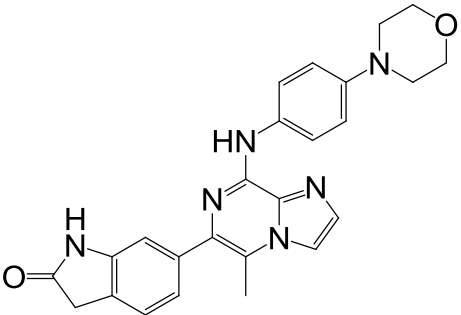
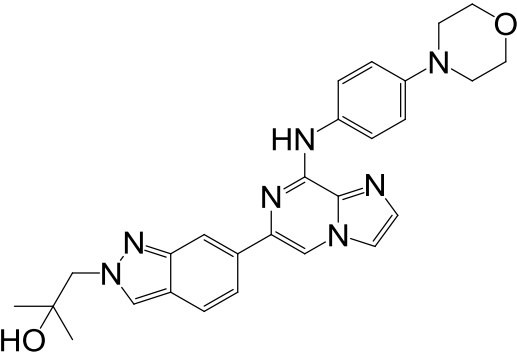
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	N-[4-(3-фторазетидин-1-іл)феніл]-6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	400,2
	6-(3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-6-іл)-N-[3-метокси-4-(морфолін-4-іл)феніл]-5-метилімідазо[1,2-а]піразин-8-амін	473,2
	N,N-діетил-6-(8-{[4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-1H-індазол-3-амін	483,6
	(3S)-3-гідрокси-3-метил-6-(8-{[4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-2,3-дигідро-1H-індол-2-он	457,6

Структура	Назва	[M+H] ⁺
	N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]-6-(хіноксалін-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	424,3
	(3R)-3-гідрокси-3-метил-6-(8-{[4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}-імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-2,3-дигідро-1H-індол-2-он	457,6
	6-(1H-індазол-6-іл)-N-{3-метокси-4-[(2S)-оксолан-2-ілметокси]феніл}імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	457,5
	6-(8-{[3-метокси-4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}-5-метилімідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-2,3-дигідро-1H-індол-2-он	471,7
	6-(8-{[3-метокси-4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}-5-метилімідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-3-он	487,5

Структура	Назва	[M+H] ⁺
	(3S)-1-(4-((6-((1H, 2H, 3H-пiридо[2,3-b][1,4]оксазин-7-ил)имідазо[1,2-a]піразин-8-ил)аміно)феніл)-піролідин-3-ол	430,4
	(3R)-1-(4-((6-(3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-6-ил)имідазо[1,2-a]піразин-8-ил)аміно)феніл)-піролідин-3-ол	429,4
	6-[8-((4-((3R)-3-гідроксипіролідин-1-ил)-3-метоксифеніл)-аміно)имідазо[1,2-a]піразин-6-ил]-2,3-дигідро-1H-індол-2-он	457,3
	N-[4-(1H-имідазол-1-ил)феніл]-6-(1H-індазол-6-ил)имідазо[1,2-a]піразин-8-амін	393,3
	6-(1H-індазол-6-ил)-N-[4-(1H-піразол-1-ил)феніл]имідазо[1,2-a]піразин-8-амін	393,2

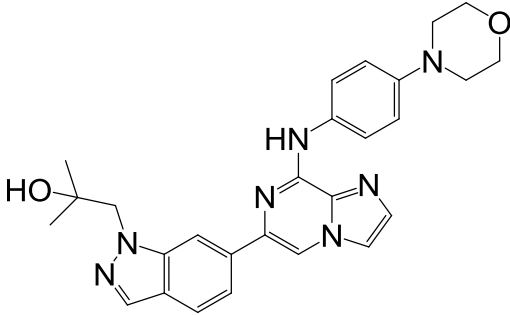
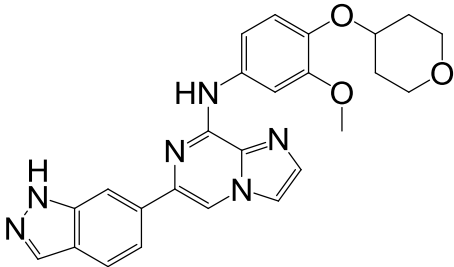
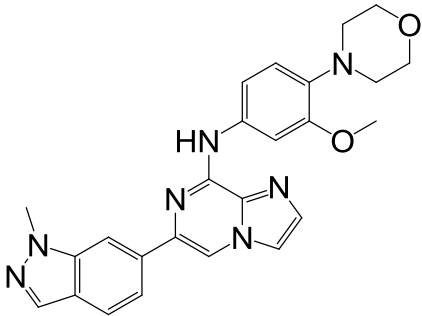
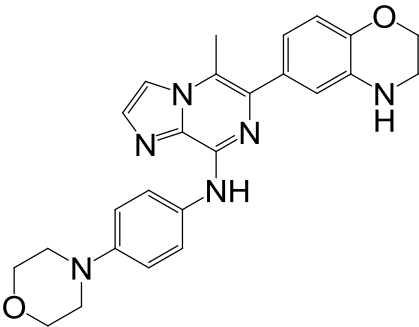
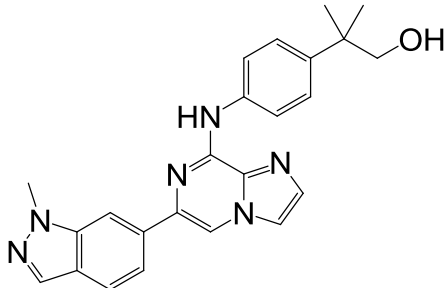
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	6-[8-({4-[(3R)-3-гідроксипіролідин-1-іл]феніл}аміно)імідазо[1,2-а]піразин-6-іл]-2,3-дигідро-1H-індол-2-он	427,1
	6-[8-({4-[(3S)-3-гідроксипіролідин-1-іл]феніл}аміно)імідазо[1,2-а]піразин-6-іл]-2,3-дигідро-1H-індол-2-он	427
	1-(4-{[6-(1H-індазол-6-іл)-5-метилімідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)-3-метилазетидин-3-ол	426,2
	(3S)-1-(4-{[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)піперидин-3-ол	426,2
	(3R)-1-(4-{[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)піперидин-3-ол	426,2

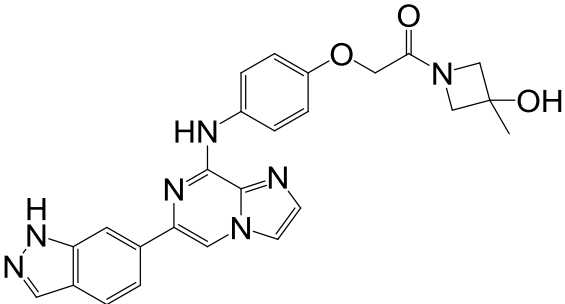
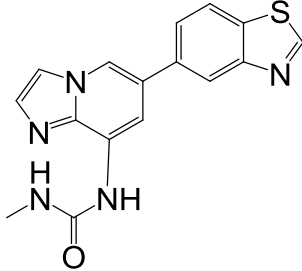
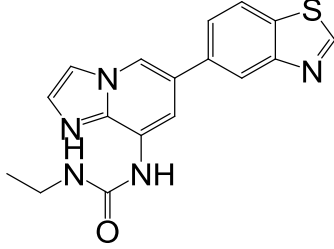
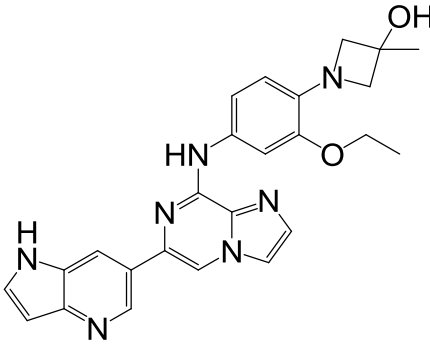
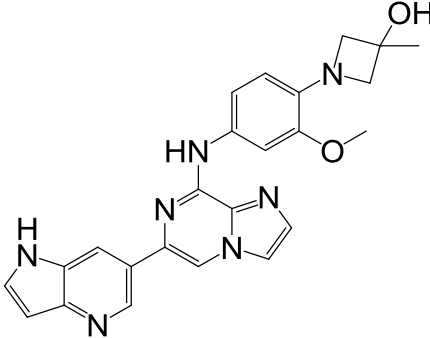
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	2-[3-(8-{[4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)феніл]пропан-2-ол	430,2
	6-(5-метил-8-{[4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-3,4-дигідро-2Н-1,4-бензоксазин-3-он	457,2
	N-етил-6-(8-{[4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-1Н-індазол-3-амін	455,2
	2-[4-(4-{[6-(1Н-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}-2-метоксифеніл)піперазин-1-іл]етан-1-ол	485,6
	6-[8-({4-[(3S)-3-гідроксипіролідин-1-іл]-3-метоксифеніл}-аміно)-імідазо[1,2-а]піразин-6-іл]-2,3-дигідро-1Н-індол-2-он	457,6

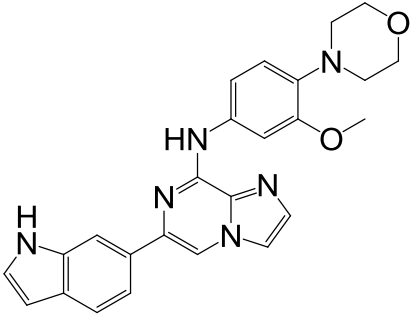
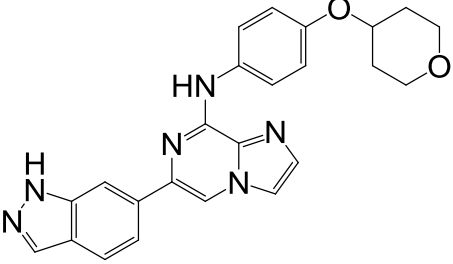
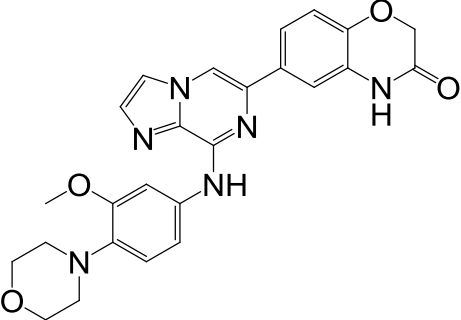
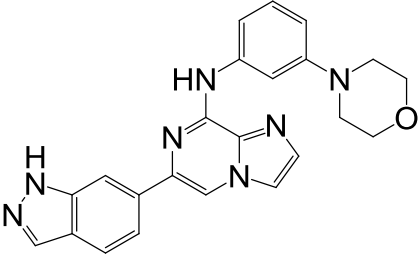
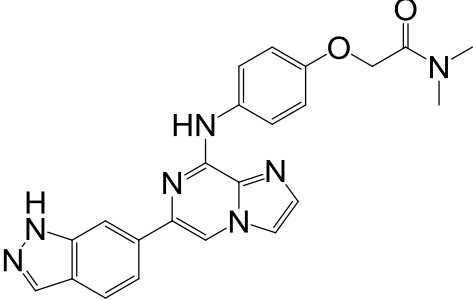
Структура	Назва	[M+H] ⁺
		
	2-(5-{{[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}-2-(морфолін-4-іл)феноксi)етан-1-ол	472,4
	(3S)-1-(4-{{[6-(1-метил-1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)піролідин-3-ол	426,2
	6-(5-метил-8-{{[4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-2,3-дигідро-1H-індол-2-он	441,3
	2-метил-1-[6-(8-{{[4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-2H-індазол-2-іл]пропан-2-ол	484,6

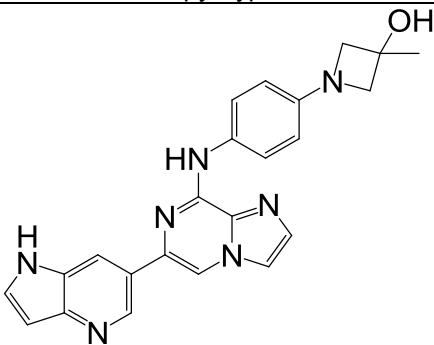
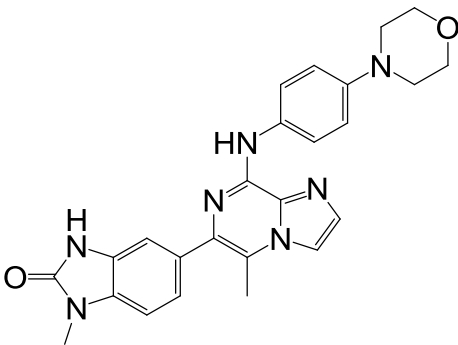
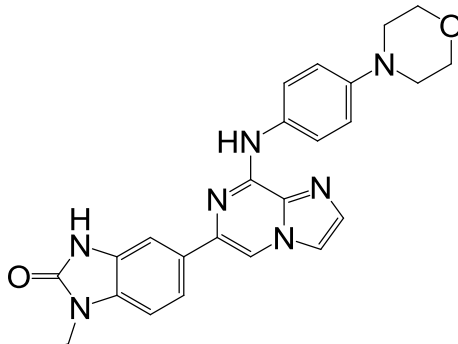
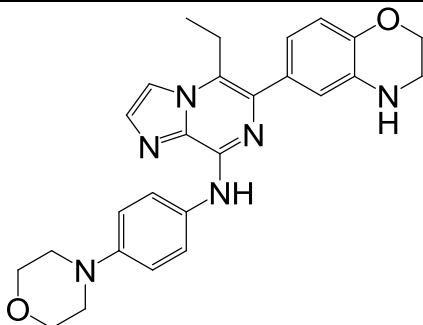
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	2-метил-1-{{4-[(6-{1H-піроло[3,2-b]піридин-6-іл}імідазо[1,2-а]піразин-8-іл)аміно]феніл}пропан-2-ол	399,2
	(3S)-1-(4-{[6-(3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)-піролідин-3-ол	429,4
	2-[4-(8-{[4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)феніл]пропан-2-ол	430,2
	6-(1H-індазол-6-іл)-3-метил-N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	426,2

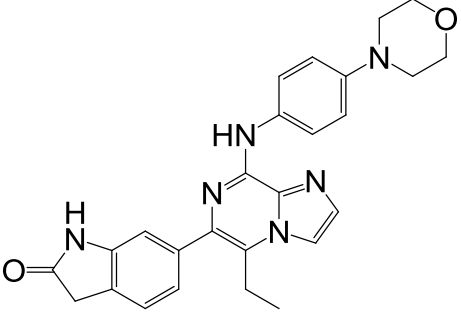
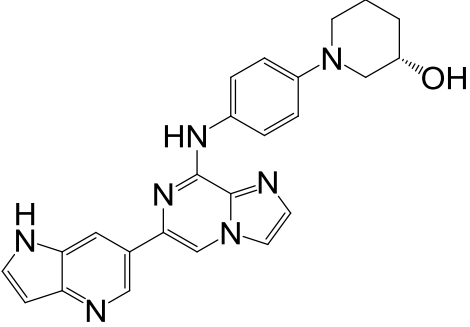
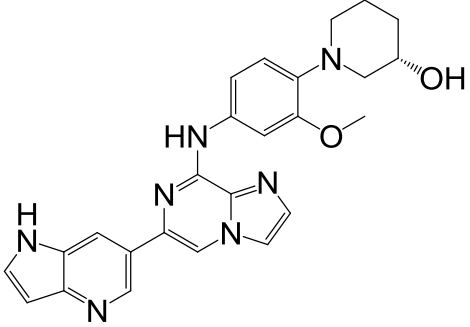
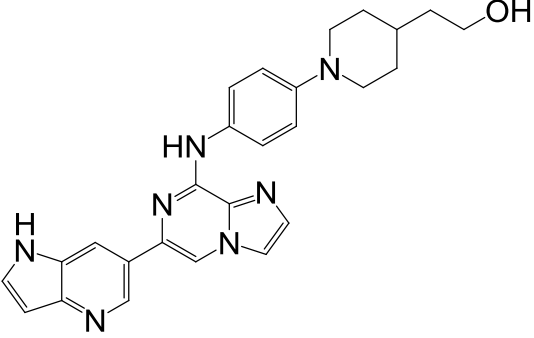
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	N-(2-гідроксиетил)-N-метил-6-(8-([4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно)-імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-1H-індазол-3-карбоксамід	513,6
	5-хлор-6-(1H-індазол-6-іл)-N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	446,4
	N-(2-гідроксиетил)-2-(4-([6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно)фенокси)ацетамід	444,8
	1-(4-([6-(1H-індол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно)-2-метоксифеніл)-3-метилазетидин-3-ол	441,4
	1-(4-([6-(1H-індол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно)феніл)-3-метилазетидин-3-ол	411,4

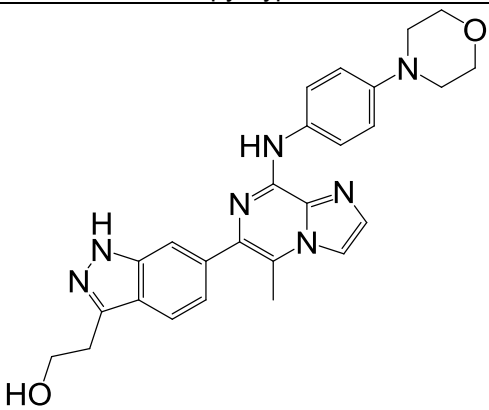
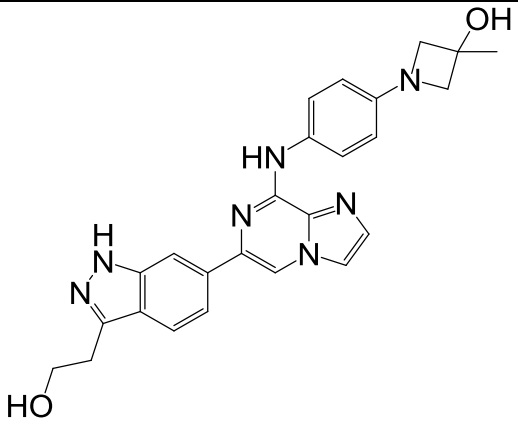
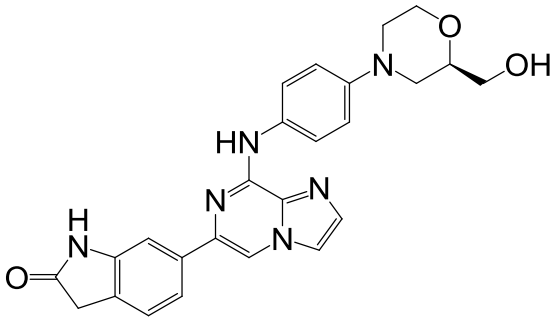
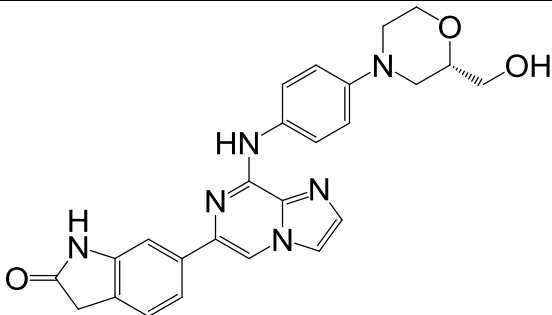
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	2-метил-1-[6-(8-{[4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-1H-індазол-1-іл]пропан-2-ол	484,7
	6-(1H-індазол-6-іл)-N-[3-метокси-4-(оксан-4-ілокси)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	457,6
	N-[3-метокси-4-(морфолін-4-іл)феніл]-6-(1-метил-1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	456,2
	6-(3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-6-іл)-5-метил-N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	443,3
	2-метил-2-(4-{[6-(1-метил-1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)пропан-1-ол	413,5

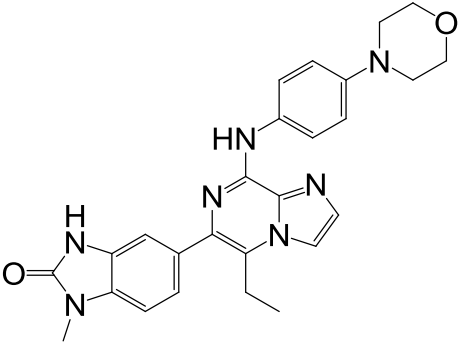
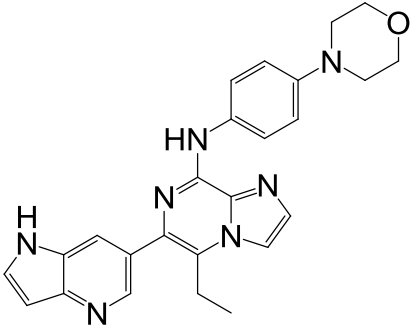
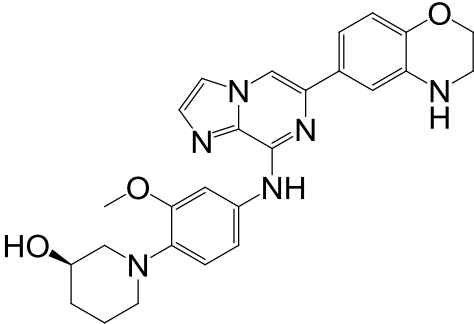
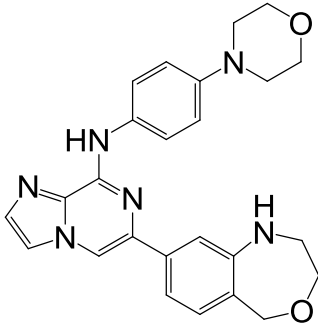
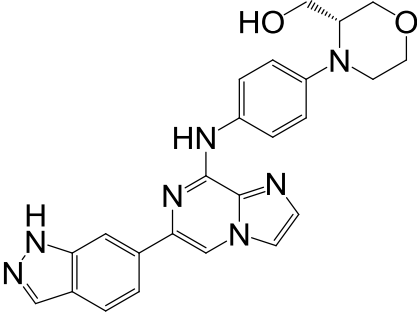
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	1-(3-гідрокси-3-метилазетидин-1-іл)-2-(4-[[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно]фенокси)етан-1-он	470,7
	1-[6-(1,3-бензотіазол-5-іл)імідазо[1,2-а]піридин-8-іл]-3-метилсечовина	324,2
	1-[6-(1,3-бензотіазол-5-іл)імідазо[1,2-а]піридин-8-іл]-3-етилсечовина	338,3
	1-{2-етокси-4-[(6-{1H-піроло[3,2-в]піридин-6-іл}імідазо[1,2-а]піразин-8-іл)аміно]феніл}-3-метилазетидин-3-ол	456,4
	1-{2-метокси-4-[(6-{1H-піроло[3,2-в]піридин-6-іл}імідазо[1,2-а]піразин-8-іл)аміно]феніл}-3-метилазетидин-3-ол	442,4

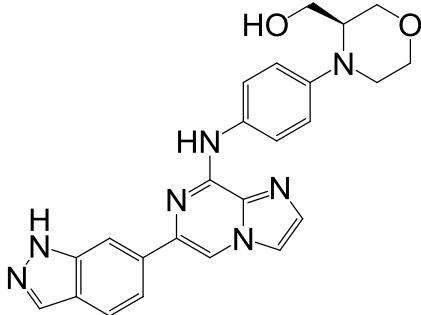
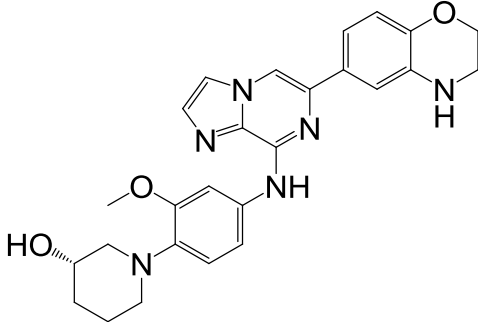
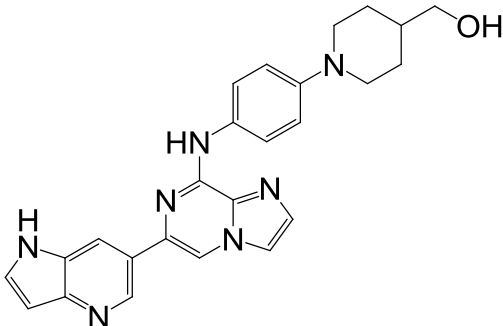
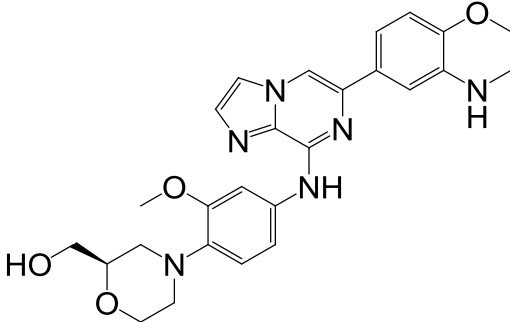
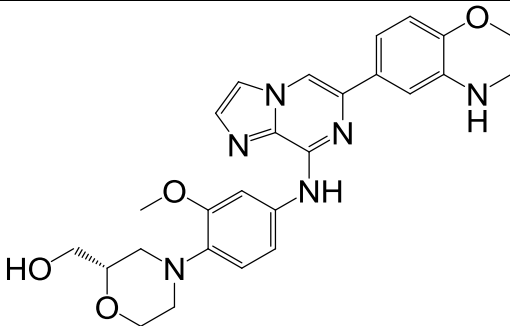
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	6-(1H-індол-6-іл)-N-[3-метокси-4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	441,5
	6-(1H-індазол-6-іл)-N-[4-(оксан-4-ілокси)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	427
	6-(8-{{3-метокси-4-(морфолін-4-іл)феніл}аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-3-он	473,2
	6-(1H-індазол-6-іл)-N-[3-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	412,5
	2-(4-{{6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл}аміно}фенокси)-N,N-диметилацетамід	N- 428,3

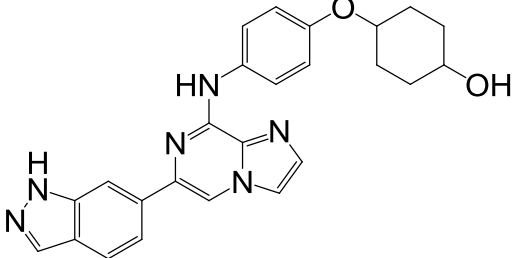
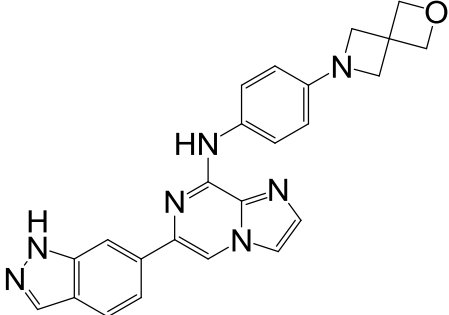
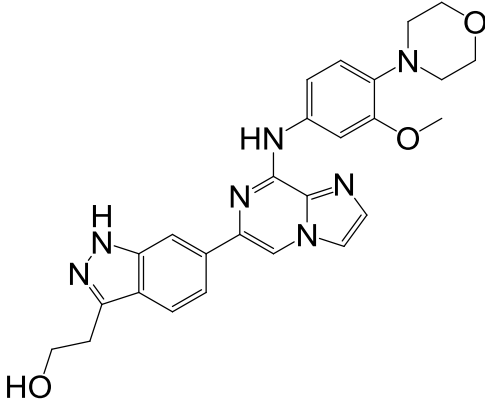
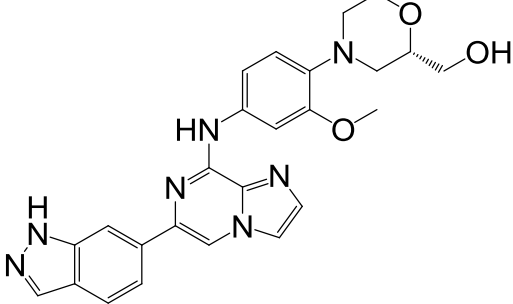
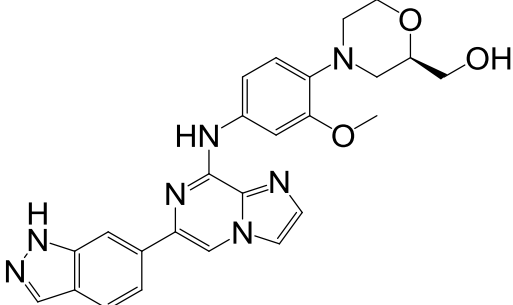
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	3-метил-1-{4-[(6-{1H-піроло[3,2-b]піридин-6-іл}імідазо[1,2-а]піразин-8-іл)аміно]феніл}азетидин-3-ол	412,3
	1-метил-5-(5-метил-8-{[4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-2,3-дигідро-1H-1,3-бензодіазол-2-он	456,5
	1-етил-5-(8-{[4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-2,3-дигідро-1H-1,3-бензодіазол-2-он	456,5
	6-(3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-6-іл)-5-етил-N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	457,6

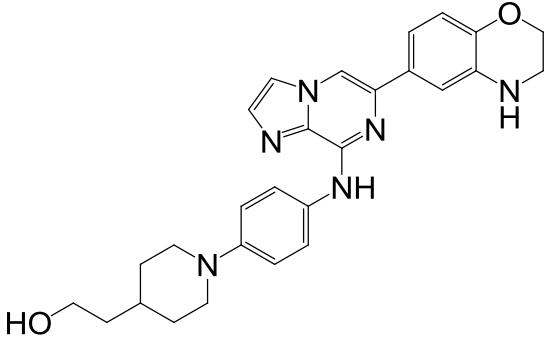
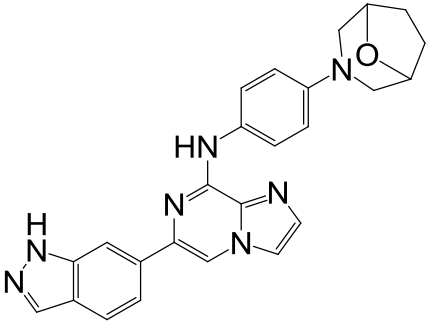
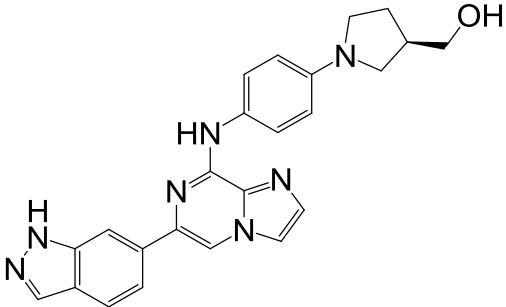
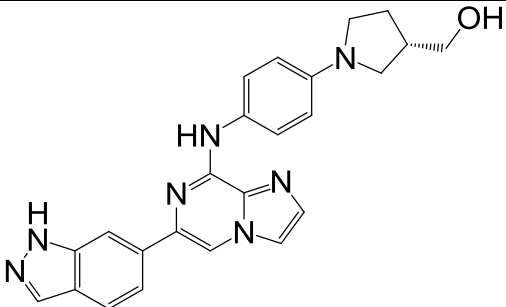
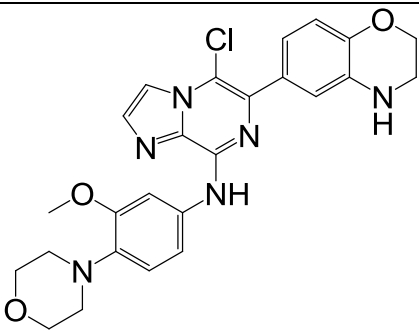
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	6-(5-етил-8-{{4-(морфолін-4-іл)феніл}аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-2,3-дигідро-1H-індол-2-он	455,1
	(3S)-1-{4-[(6-{1H-піроло[3,2-b]піридин-6-іл}аміно)феніл]піперидин-3-ол}імідазо[1,2-а]піразин-8-іл	426,2
	(3S)-1-{2-метокси-4-[(6-{1H-піроло[3,2-b]піридин-6-іл}аміно)феніл]піперидин-3-ол}імідазо[1,2-а]піразин-8-іл	456,2
	2-(1-{4-[(6-{1H-піроло[3,2-b]піридин-6-іл}аміно)феніл]піперидин-4-іл)етан-1-ол	454,2

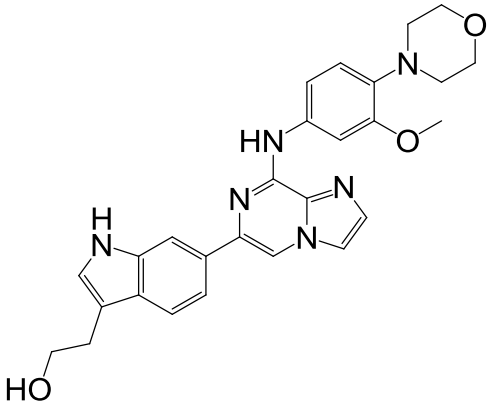
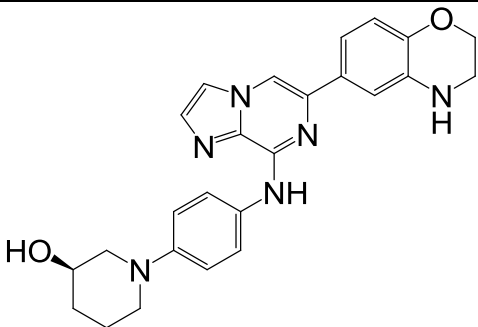
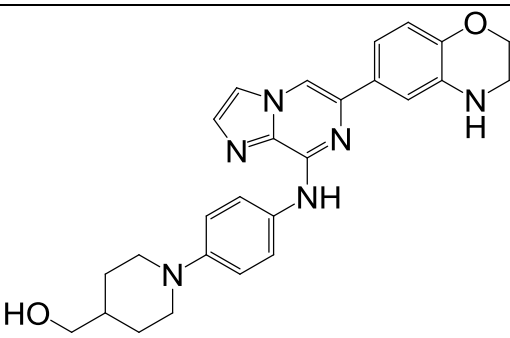
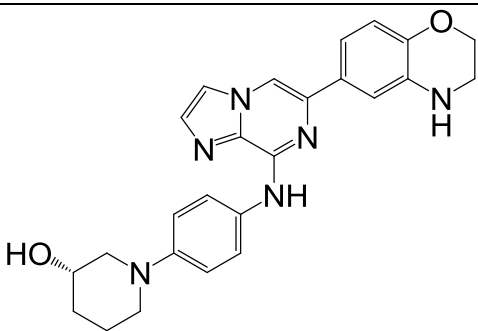
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	2-[6-(5-метил-8-{{4-(морфолін-4-іл)феніл}аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-1H-індазол-3-іл]етан-1-ол	470,6
	1-[4-({6-[3-(2-гідроксиетил)-1H-індазол-6-іл]імідазо[1,2-а]піразин-8-іл}аміно)феніл]-3-метилазетидин-3-ол	456,4
	6-[8-({4-[(2R)-2-(гідроксиметил)морфолін-4-іл]феніл}аміно)імідазо[1,2-а]піразин-6-іл]-2,3-дигідро-1H-індол-2-он	457,5
	6-[8-({4-[(2S)-2-(гідроксиметил)морфолін-4-іл]феніл}аміно)імідазо[1,2-а]піразин-6-іл]-2,3-дигідро-1H-індол-2-он	457,6

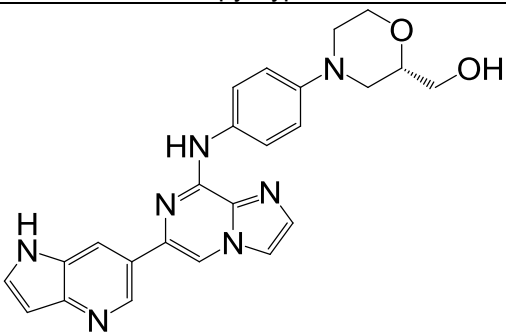
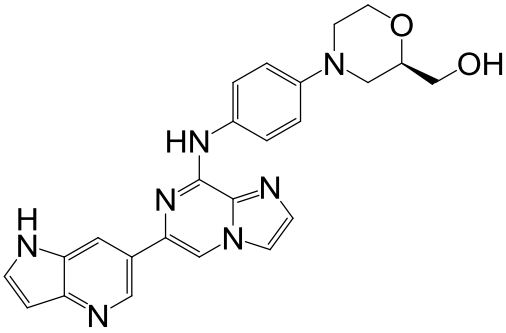
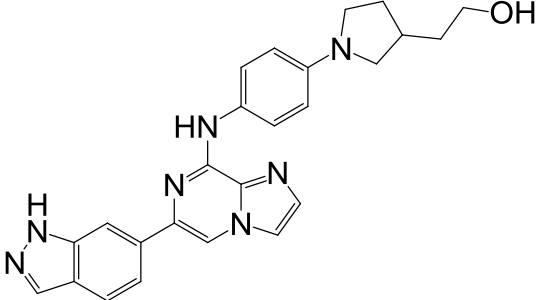
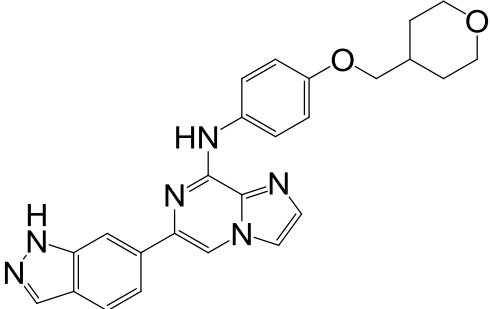
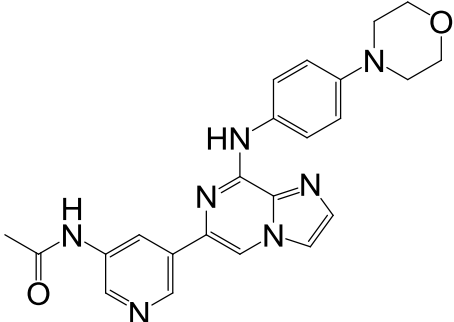
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	5-(5-етил-8-{{[4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл}-1-метил-2,3-дигідро-1H-1,3-бензодіазол-2-он	470,7
	5-етил-N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]-6-(1H-піроло[3,2-б]піридин-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	440,4
	(3R)-1-(4-{{[6-(3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}-2-метоксифеніл)піперидин-3-ол	473,3
	N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]-6-(1,2,3,5-тетрагідро-4,1-бензоксазепін-8-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	443,4
	[(3R)-4-(4-{{[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)морфолін-3-іл]метанол	442,3

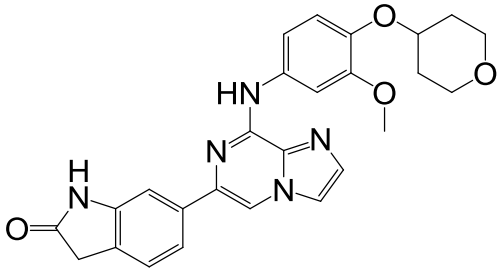
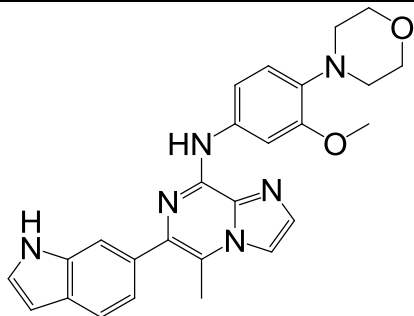
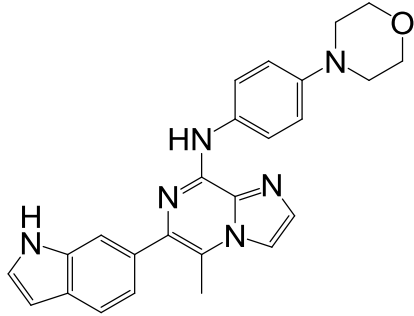
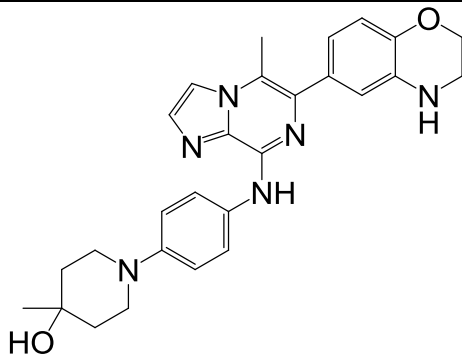
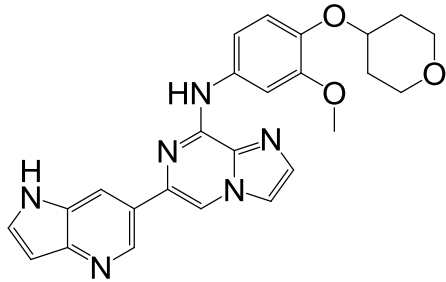
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	[(3S)-4-(4-[[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно]феніл)морфолін-3-іл]метанол	442,2
	(3S)-1-(4-[[6-(3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно]-2-метоксифеніл)піперидин-3-ол	473,2
	(1-{4-[[6-(1H-піроло[3,2-b]піридин-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно]феніл}піперидин-4-іл)метанол	440,3
	[(2R)-4-(4-[[6-(3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно]-2-метоксифеніл)морфолін-2-іл]метанол	489,4
	[(2S)-4-(4-[[6-(3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно]-2-метоксифеніл)морфолін-2-іл]метанол	489,4

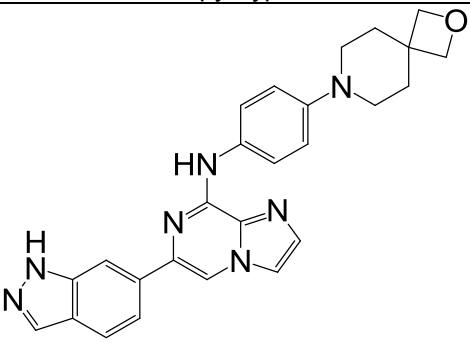
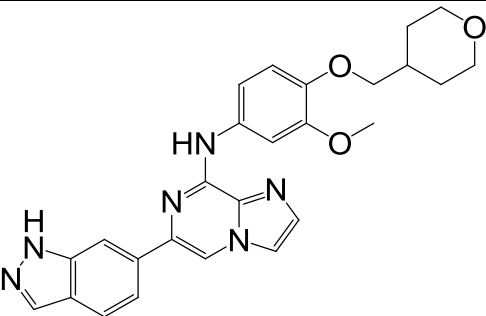
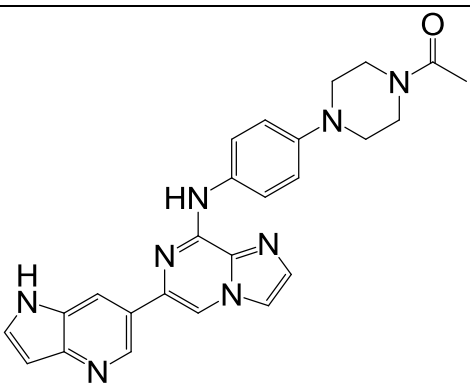
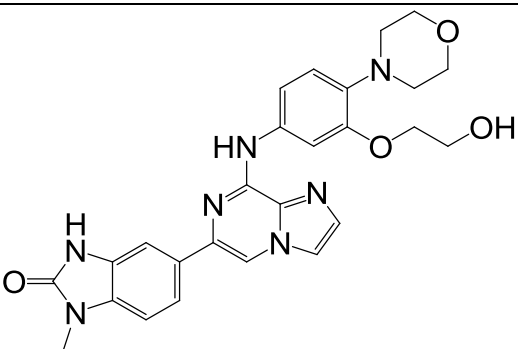
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	4-(4-([6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно)фенокси)-циклогексан-1-ол	441,5
	6-(1H-індазол-6-іл)-N-(4-{2-окса-6-азаспіро[3,3]гептан-6-іл}-феніл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	424,2
	2-[6-(8-([3-метокси-4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно)імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-1H-індазол-3-іл]етан-1-ол	486,6
	[(2S)-4-(4-([6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно)-2-метоксифеніл)морфолін-2-іл]метанол	472,4
	[(2R)-4-(4-([6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно)-2-метоксифеніл)морфолін-2-іл]метанол	472,4

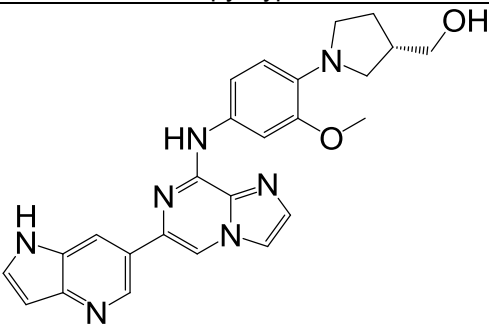
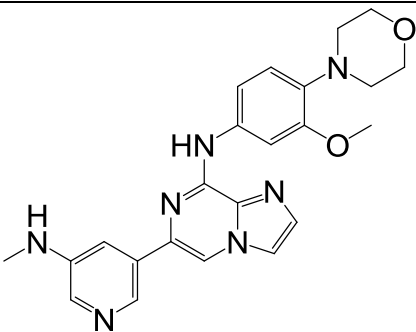
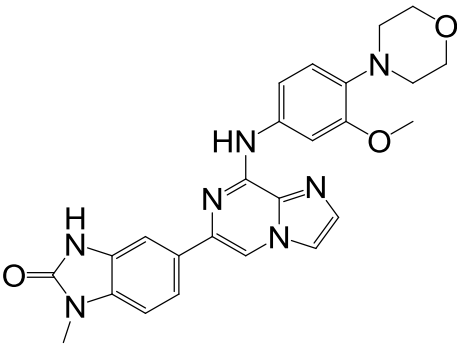
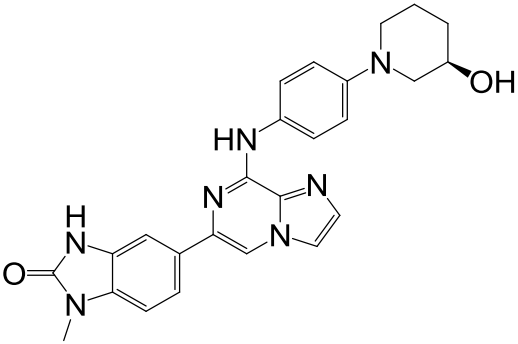
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	2-[1-(4-({6-(3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл)аміно}феніл)-піперидин-4-іл]етан-1-ол	471,8
	6-(1H-індазол-6-іл)-N-(4-{8-окса-3-азабіцикло[3,2,1]октан-3-іл}феніл)імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	438,3
	[(3R)-1-(4-({6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл)аміно}феніл)піролідин-3-іл]метанол	426,2
	[(3S)-1-(4-({6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл)аміно}феніл)піролідин-3-іл]метанол	426,2
	5-хлор-6-(3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-6-іл)-N-[3-метокси-4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	493,5

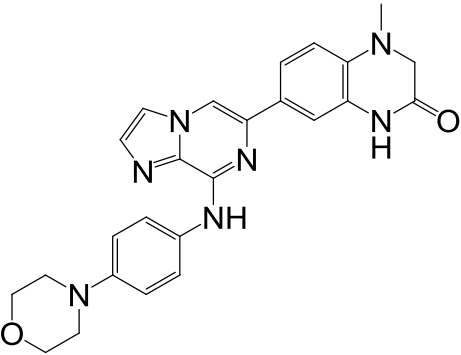
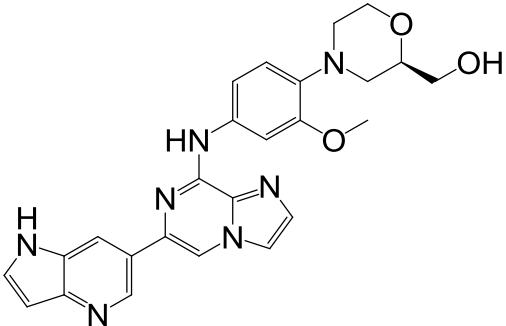
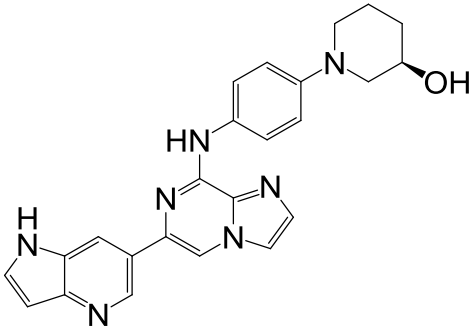
Структура	Назва	[M+H] ⁺
	2-[6-(8-({3-метокси-4-(морфолін-4-іл)феніл}аміно)імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-1H-індол-3-іл]етан-1-ол	485,6
	(3R)-1-(4-({[6-(3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}-феніл)піперидин-3-ол	443,8
	[1-(4-({[6-(3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}-феніл)піперидин-4-іл]метанол	457,5
	(3S)-1-(4-({[6-(3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}-феніл)-піперидин-3-ол	443,3

Структура	Назва	[M+H] ⁺
	[(2S)-4-{4-[(6-{1H-піроло[3,2- <i>b</i>]піридин-6-іл}аміно)феніл]морфолін-2-іл]метанол	442,7
	[(2R)-4-{4-[(6-{1H-піроло[3,2- <i>b</i>]піридин-6-іл}аміно)феніл]морфолін-2-іл]метанол	442,5
	2-[1-(4-{[6-(1H-індазол-6-іл)імідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл)піролідін-3-іл]етан-1-ол	440,3
	6-(1H-індазол-6-іл)-N-[4-(оксан-4-ілметокси)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	441,4
	N-[5-(8-{[4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)піридин-3-іл]ацетамід	430,4

Структура	Назва	[M+H] ⁺
	6-(8-{{[3-метокси-4-(оксан-4-ілокси)феніл]аміно}імідазо[1,2-а]піразин-6-іл}-2,3-дигідро-1H-індол-2-он	472,4
	6-(1H-індол-6-іл)-N-[3-метокси-4-(морфолін-4-іл)феніл]-5-метилімідазо[1,2-а]піразин-8-амін	455,2
	6-(1H-індол-6-іл)-5-метил-N-[4-(морфолін-4-іл)феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	425,2
	1-(4-{{[6-(3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-6-іл)-5-метилімідазо[1,2-а]піразин-8-іл]аміно}феніл}-4-метилпіперидин-4-ол	471,8
	N-[3-метокси-4-(оксан-4-ілокси)феніл]-6-{{1H-піроло[3,2-b]піридин-6-іл}імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	457,4

Структура	Назва	[M+H] ⁺
	6-(1H-індазол-6-іл)-N-(4-{2-окса-7-азаспіро[3,5]нонан-7-іл}феніл)-імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	452,2
	6-(1H-індазол-6-іл)-N-[3-метокси-4-(оксан-4-ілметокси)-феніл]імідазо[1,2-а]піразин-8-амін	471,8
	1-(4-{4-[(6-{1H-піроло[3,2-б]піридин-6-іл}імідазо[1,2-а]піразин-8-іл)аміно]феніл}піперазин-1-іл)етан-1-он	453,1
	5-(8-{[3-(2-гідроксиетокси)-4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}-імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-1-метил-2,3-дигідро-1H-1,3-бензодіазол-2-он	502,2

Структура	Назва	[M+H] ⁺
	[(3S)-1-{2-метокси-4-[(6-{1H-піроло[3,2-b]піридин-6-іл}імідазо[1,2-a]піразин-8-іл)аміно]феніл}піролідин-3-іл]метанол	456,5
	5-(8-{[3-метокси-4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-a]піразин-6-іл)-N-метилпіридин-3-амін	432,5
	5-(8-{[3-метокси-4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно}імідазо[1,2-a]піразин-6-іл)-1-метил-2,3-дигідро-1H-1,3-бензодіазол-2-он	472,3
	5-[8-({4-[(3R)-3-гідроксипіперидин-1-іл]феніл}аміно)імідазо[1,2-a]піразин-6-іл]-1-метил-2,3-дигідро-1H-1,3-бензодіазол-2-он	456,2

Структура	Назва	[M+H] ⁺
	4-метил-7-(8-([4-(морфолін-4-іл)феніл]аміно)імідазо[1,2-а]піразин-6-іл)-1,2,3,4-тетрагідрокіноксалін-2-он	456,5
	[(2R)-4-{2-метокси-4-[(6-{1H-піроло[3,2-b]піридин-6-іл]аміно}феніл]морфолін-2-іл]метанол	472,5
	(3R)-1-{4-[(6-{1H-піроло[3,2-b]піридин-6-іл]аміно}феніл]піперидин-3-ол	426

Приклад 3

Біохімічне дослідження активності Syk-кінази

Далі описана загальна методика проведення одного стандартного біохімічного дослідження активності тирозинкінази Syk, застосовного для тестування сполук, описаних у даній заявці.

Готували майстер-мікс за відсутності ферменту Syk, що містить однократний буфер для кінази клітинної сигналізації (25 mM Трис-HCl, pH 7,5, 5 mM бета-гліцерофосфат, 2 mM дитіотреїтол, 0,1 mM Na₃VO₄, 10 mM MgCl₂), 0,5 мкм біотинільований білковий субстрат 1 (Promega PTK), 0,01% казеїн, 0,01% Тритон-X100 та 0,25% гліцерол. Готували майстер-мікс із ферментом Syk, що містить однократний буфер для кінази клітинної сигналізації, 0,5 мкм біотинільований білковий субстрат 1 (Promega PTK), 0,01% казеїн, 0,01% Тритон-X100, 0,25% гліцерол та 0,4 нг на лунку ферменту Syk. Фермент Syk, експресований у бакуловірусі, отриманий в Cell Signaling Technologies та являє собою GST-мічений за N-кінцем повнорозмірний людський білок Syk дикого типу (номер доступу NM-00377). Білок Syk очищали на одному етапі з використанням глутатіонагарози. Чистоту кінцевого білкового препарату оцінювали за допомогою електрофорезу в поліакриламідному гелі в присутності ДСН (SDS-PAGE) та забарвлення Кумасі. Готували 200 мкМ розчину АТФ у воді та доводили значення pH до 7,4 за допомогою 1н NaOH. Кількість сполуки, рівну 1,25 мкл, в 5% ДМСО переносили в 96-лунковий полістерольний планшет з напіврозмірними лунками фірми Costar. Активність сполук оцінювали як окремо, так і за допомогою кривої залежності доза-ефект з 11 контрольними точками (початкова концентрація становила 10 - 1 мкМ; розведення 1:2). Кількість майстер-міксу у відсутності ферменту, рівну 18,75 мкл (як негативний контроль) та майстер-міксу в присутності ферменту наносили у відповідні лунки 96-лункового полістерольного

планшету з напіврозмірними лунками. 5 мкл 200 мкМ АТФ додавали до суміші в 96-лунковий полістирольний планшет з напіврозмірними лунками від Costar з кінцевою концентрацією АТФ, що становить 40 мкМ. Реакційну суміш інкубували впродовж 1 години при кімнатній температурі. Реакцію зупиняли за допомогою однократного детергуючого буферу від Perkin Elmer, що

5

містить 30 мМ ЕДТА, 80 нМ SA-APC та 4 нМ РТ66 Ab. Планшет аналізували відповідно до

методу флуоресценції з часовою роздільністю за допомогою планшетного аналізатора Envision

від Perkin Elmer з використанням фільтру збудження 330 нм, емісійного фільтру 665 нм та іншого емісійного фільтру 615 нм. Далі значення IC₅₀ розраховували з використанням алгоритму лінійної регресії.

10

Приклад 4

Дослідження на клітках лінії Ramos pBLNK(Y96)

Далі описана загальна методика для проведення іншого стандартного клітинного дослідження активності Сук-кінази, застосовного для дослідження сполук, описаних у даній заявці.

15

Клітини лінії Ramos інкубували в безсироватковому середовищі RPMI у концентрації 2×10^6 клітин /мл впродовж 1 години у вертикальній колбі Т175 (Falcon TC). Клітини центрифугували (1100 об./хвн. x 5 хв) та інкубували при щільності $0,5 \times 10^7$ клітин/мл у присутності досліджуваної сполуки або контролю ДМСО впродовж 1 години при 37 °С. Потім клітини стимулювали за допомогою інкубування з антитілами проти IgM F(ab)₂ людини в концентрації 10 мкг/мл впродовж 5 хвилин при 37 °С. Клітини осаджували, лізували в 40 мкл лізуючого буферу та змішували з навантажувальним буфером Invitrogen для електрофорезу в поліакриламідному гелі в присутності ДСН (SDS-PAGE). 20 мкл клітинного лізату з кожного зразка наносили на електрофорез у поліакриламідному гелі в присутності ДСН та проводили Вестерн-Блотинг з антитілами проти pBLNK(Tyr96) (Cell Signaling Technology #3601) для оцінки активності Сук-кінази та антитіл проти Syk (BD Transduction Labs #611116) для контролю загальної кількості білку в кожному лізаті. Зображення одержували за допомогою систем виявлення вторинної флуоресценції та програми LiCor Odyssey.

20

25

Приклад 5

Дослідження проліферації В-Клітин

Далі описана загальна методика проведення стандартного клітинного аналізу проліферації В-клітин, застосовного для дослідження сполук, описаних у даній заявці.

30

В-клітини очищали з селезінок 8-16-тижневих мишей Balb/c з використанням набору для виділення В-клітин (Miltenyi Biotec, Cat # 130-090-862). Досліджувані сполуки розбавляли в 0,25% ДМСО та інкубували з очищеними В-клітками селезінки миші в концентрації $2,5 \times 10^5$ впродовж 30 хв. з наступним додаванням додаткових анти-мишачих антитіл IgM (Southern Biotechnology Associates Cat # 1022-01) у концентрації 10мкг/мл у кінцевому об'ємі 100 мкл. Через 24 години інкубації додавали 1 μ Ci ³H-тимідину та планшети інкубували впродовж додаткових 36 годин з наступним аналізом відповідно до протоколу виробника для використання аналітичної системи захоплення SPA[³H]тимідину (Amersham Biosciences # RPNQ 0130). Флуоресцентний сигнал SPA-мікрогранул оцінювали на лічильнику Microbeta (Wallace Triplex 1450, Perkin Elmer).

35

40

Приклад 6

Дослідження проліферації Т-клітин

Далі представлений опис загальної методики проведення стандартного аналізу проліферації Т-клітин, застосовного для дослідження сполук, описаних у даній заявці.

45

Т-клітини очищали із селезінок 8-16-тижневих мишей Balb/c з використанням набору для ізоляції Т-клітин Pan (Miltenyi Biotec, Cat # 130-090-861). Досліджувані сполуки розбавляли в 0,25% ДМСО та інкубували з очищеними Т-клітками селезінки миші в концентрації $2,5 \times 10^5$ у кінцевому об'ємі 100 мкл у планшетах із плоским прозорим дном, попередньо оброблених кожним з антитіл проти CD3 (BD # 553057) та проти CD28 (BD # 553294) у концентрації 10 мкг/мл впродовж 90 хв. при температурі 37°С. Через 24 години інкубації додавали 1 μ Ci ³H-тимідину та планшети інкубували впродовж додаткових 36 годин з наступним аналізом відповідно до протоколу виробника для використання аналітичної системи захоплення SPA[³H]тимідину (Amersham Biosciences # RPNQ 0130). Флуоресцентний сигнал SPA-мікрогранул оцінювали на лічильнику Microbeta (Wallace Triplex 1450, Perkin Elmer).

50

55

Приклад 7

Дослідження здатності пригнічення CD69

Далі наведено опис загальної методики проведення стандартного аналізу здатності пригнічувати активність В-клітин, застосовного для дослідження сполук, описаних у даній заявці.

60

Тотальні спленоцити миші очищали з селезінок 8-16-тижневих мишей Balb/c за допомогою

розчину для лізису еритроцитів (BD Pharmingen #555899). Досліджувані сполуки розбавляли з одержанням концентрації ДМСО, що становить 0,5%, та інкубували зі спленоцитами в концентрації $1,25 \times 10^6$ у кінцевому об'ємі 200 мкл у планшетах з плоским прозорим дном (Falcon 353072) впродовж 60 хв. при 37°C. Потім клітини стимулювали за допомогою додавання 15 мкг/мл IgM (Jackson ImmunoResearch 115-006-020) та інкубували впродовж 16 годин при температурі 37°C, 5% CO₂. Через 16 годин інкубації клітини переносили в 96-лункові планшети з конічним прозорим дном та осаджували за допомогою центрифугування при 1200 x g впродовж 5 хв. Клітини обробляли CD16/CD32 (BD Pharmingen #553142), з наступним потрійним фарбуванням CD19-FITC (BD Pharmingen #553785), CD69-PE (BD Pharmingen #553237) та 7AAD (BD Pharmingen #51-68981E). Клітини сортували на проточному цитометрі фірми BD FACSCalibur та відбирали популяцію CD19⁺/7AAD⁻ клітин. Рівень експресії на поверхні клітин CD69 у популяції відсортованих клітин вимірювали та співвідносили з концентраціями досліджуваної сполуки.

Приклад 8

Дегрануляція гладких клітин кісткового мозку
Далі описана загальна методика проведення стандартного аналізу здатності викликати дегрануляцію мишачих гладких клітин, що походять з кісткового мозку (BMMC), застосовного для дослідження сполук, описаних у даній заявці.

Гладкі клітини, що походять з кісткового мозку культивували впродовж >4 тижнів у присутності інтерлейкіну IL-3 (10 нг/мл) та фактору стовбурних клітин ФСК (10 нг/мл). Як було показано за допомогою методу клітинного сортування зі збудженням флуоресценції (FACS), > 90% клітин на момент їх використання мали фенотип cKit⁺/FceRI⁺. Клітини (6×10^7 клітин/50 мл) інкубували в безсироватковому середовищі, що містить IgEα-ДНФ у концентрації 1 мкг/мл, у колбі T150 для культивування клітин впродовж 16 годин у відсутності IL-3 та ФСК. Сенсibiliзовані впродовж ночі клітини двічі промивали в розчині Тірде та ресуспендували в концентрації 5×10^6 клітин/мл. 5×10^5 клітин (100 мкл) наносили в лунки 96-лункового титрувального мікропланшету (Falcon 353072) та робили послідовне розведення в планшеті сполук для тестування з кінцевою концентрацією ДМСО, що становить 0,25%, та інкубували впродовж 1 години при 37°C, 5% CO₂. Лунки обробляли для антигенної стимуляції клітин антигеном ДНФ-БСА (50 нг/мл) та інкубували впродовж додаткових 30 хв. при температурі 37°C. Оцінювали рівень вивільнення гексозамінідази в супернатантах у порівнянні з контрольними лунками. Одночасно лізували клітини та оцінювали загальний рівень вивільнення гексозамінідази для визначення специфічного вивільнення. Криві залежності доза-ефект одержували за допомогою 4-параметричної логістичної моделі та розрахунків значень IC₅₀.

Приклад 9

Пасивна шкірна анафілаксія (ПША)

Далі описана загальна методика проведення дослідження на стандартній моделі ПША, застосовна для дослідження in vivo сенсibiliзації антитілами IgE проти динітрофенолу (ДНФ) та антигеном ДНФ, сполученим з бичачим сироватковим альбуміном (ДНФ-БСА), для стимуляції дегрануляції гладких клітин та вивільнення регуляторів імунної відповіді, що викликають різке підвищення проникності стінок кровоносних судин, при спостереженні за процесом в області запалення вуха миші за допомогою барвника Еванса синього.

Реагенти: Антитіла IgE проти ДНФ: одержували в концентрації 1,2 мг/мл у фосфатному сольовому буфері в присутності БСА як додаткового білка та азиду для забезпечення стерильності. Зазначені антитіла розбавляли у співвідношенні 1:100 у стерильному ФСБ з одержанням робочого розчину з концентрацією, що становить 12 мкг/мл, який потім розбавляли у ФСБ до одержання підходящої концентрації для ін'єкції. Подальше розведення у співвідношенні 1:5 приводило до одержання кінцевого розчину у співвідношенні 1:500 з концентрацією, що становить 2,4 нг/мкл (10 мкл/вухо = 24 нг). Стерильний ФСБ окремо використовували як негативний контроль. -ДНФ-БСА: готували в концентрації 4 мг/мл у стерильній дистильованій деіонізованій воді (ddH₂O) та зберігали в розчині при 40°C. Потім зазначений розчин розбавляли у співвідношенні 1:1 стерильним сольовим розчином перед використанням. Зазначений розчин або розчин, отриманий у результаті подальшого розведення сольовим розчином, розбавляли у співвідношенні 1:1 2% барвником Еванса синім у стерильному сольовому розчині, який фільтрували через фільтр 0,02 мкм та перефільтрували перед введенням. У зазначених експериментах може використовуватися кінцевий розчин з концентрацією ДНФ-БСА, що становить 0,5 мг/мл, в 1% барвнику Еванса синьому. Ін'єкції у хвостову вену проводили при постійній концентрації: 200 мкл = 100 мкг в 1% барвнику Еванса синьому. – Барвник Еванса синій: 2% сток у сольовому розчині стерильно фільтрували та розбавляли у співвідношенні 1:1 сольовим розчином ДНФ-БСА з одержанням

1%-го кінцевого розчину для ін'єкцій.

Загальний протокол дослідження ПША, викликаной внутрішньошкірною сенсibiliзацією вуха

1) Тварин, анестезованих ізофлуорином, піддавали пасивній сенсibiliзації шляхом внутрішньошкірних ін'єкцій антитіл IgE проти ДНФ з використанням інсулінового шприца з калібром голки 29 (День 0). Відповідно до умовного правила, у праве вухо виконували внутрішньошкірну ін'єкцію 10 мкл антитіл IgE проти ДНФ, тоді як у ліве вухо вводили ФСБ. 2) Через 20 годин після сенсibiliзації проводили стимуляцію антигеном за допомогою внутрішньовенної ін'єкції у хвостову вену ДНФ-БСА в 200 мкл 1% розчину барвника Еванса синього в сольовому розчині. Хвости занурювали в теплу воду перед внутрішньовенною ін'єкцією для підвищення чутливості реакції. 3) За 30 хвилин - 2 години до проведення зазначеної антигенної стимуляції лікарський засіб доставляли підшкірно або перорально в розчині 10% EtOH/ 20% кремофор/ 70% сольовий розчин. 4) Тварин умертвляли за допомогою інгаляції CO₂ через 30-60 хв. після антигенної стимуляції та видаляли вухо для екстракції барвника Еванса синього в 500 мкл формаміду впродовж ночі при температурі 65°C. 5) Кров збирали за допомогою пункції серця безпосередньо перед остаточним зсувом шийних хребців та обробляли з одержанням плазми для проведення дослідження фармакокінетичних властивостей. 6) Кількісне визначення барвника Еванса синього проводили шляхом вимірювання оптичної щільності 200 мкл екстрагованого розчину в титрувальних мікропланшетах при довжині хвилі 620 нм.

Схема проведення дослідження

У кожної тварину сенсibiliзували одне вухо (зазвичай праве вухо) антитілами IgE проти ДНФ та одне контрольне вухо (зазвичай ліве вухо) ФСБ. Групи 1-8: являли собою групи дослідження наповнювача та сполуки; Група 9: являла собою негативний контроль з відсутністю антигену; Група 10: являла собою негативний контроль з відсутністю сенсibiliзації за наявності антигенної стимуляції; Група 11: являла собою негативний контроль за відсутності антигенної стимуляції та відсутності сенсibiliзації (Групи 9-11 являли собою негативний контроль, необхідний винятково для оцінки рівня фону, та включали мінімальну кількість тварин на групу.)

Сполуки, описані відповідно до наведених вище прикладів, досліджували відповідно до біохімічного дослідження активності Syk-кінази, описаного в даній заявці (Приклад 3). Деякі з зазначених сполук характеризувалися значенням IC₅₀, меншим або рівним 1 мкМ. Деякі з зазначених сполук характеризувалися значенням IC₅₀, меншим або рівним 100 нМ. Деякі з зазначених сполук характеризувалися значенням IC₅₀, меншим або рівним 10 нМ. Деякі з зазначених сполук характеризувалися значенням IC₅₀, меншим або рівним 1 нМ.

Деякі зі сполук, описаних відповідно до прикладу 2, аналізували відповідно до дослідження впливу на проліферацію В-клітин (як описано відповідно до прикладу 5) та мали значення IC₅₀, менше або рівне 10 мкМ. Деякі з зазначених сполук характеризувалися значенням IC₅₀, меншим або рівним 1 мкМ.

Деякі із зазначених сполук не пригнічували проліферацію Т-клітин та характеризувалися значенням IC₅₀, більшим або рівним 5 мкМ при проведенні дослідження відповідно до умов, описаних у даній заявці (як описано в прикладі 6).

Деякі сполуки, описані в даній заявці, характеризувалися значеннями IC₅₀ для пригнічення проліферації Т-клітин, які щонайменше в 3 рази, а в деяких прикладах в 5 раз, перевищували значення IC₅₀ зазначених сполук для пригнічення проліферації В-клітин.

Деякі зі сполук, описаних у даній заявці, аналізували відповідно до дослідження здатності пригнічення активності В-клітин (в умовах відповідно до прикладу 7) та зазначені сполуки характеризувалися значенням IC₅₀, меншим або рівним 10 мкМ. Деякі з зазначених сполук характеризувалися значенням IC₅₀, меншим або рівним 1 мкМ.

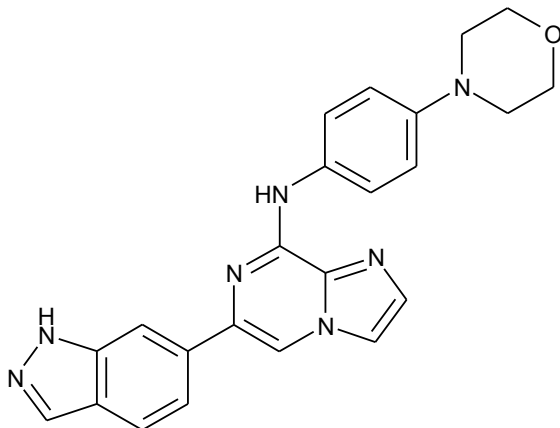
Деякі зі сполук, описаних у даній заявці, проявляли як біохімічну, так і клітинну активність. Наприклад, деякі зі сполук, описаних у даній заявці, характеризувалися значенням IC₅₀, меншим або рівним 10 мкМ у біохімічному дослідженні активності Syk-кінази, описаному в даній заявці (Приклад 3), та значенням IC₅₀, меншим або рівним 10 мкМ щонайменше в одному з клітинних аналізів (відмінному від аналізу Т-клітин), описаному в даній заявці (Приклади 4, 5, 7 або 8). Деякі з зазначених сполук характеризувалися значенням IC₅₀, меншим або рівним 1 мкМ у біохімічному аналізі активності Syk-кінази, описаному в даній заявці (Приклад 4), та значенням IC₅₀, меншим або рівним 10 мкМ щонайменше в одному з клітинних аналізів (відмінних від аналізу Т-клітин), описаних у даній заявці (Приклади 4, 5, 7 або 8). Деякі з зазначених сполук характеризувалися значенням IC₅₀, меншим або рівним 0,1 мкМ, та значенням IC₅₀, меншим або рівним 10 мкМ щонайменше в одному з клітинних аналізів (відмінних від аналізу Т-клітин), описаних у даній заявці (Приклади 4, 5, 7 або 8).

У межах суті та об'єму винаходу можливі різні модифікації та варіації описаних та пояснених

у даній заявці варіантів реалізації винаходу. Наприклад, не потрібно будь-яким чином обмежувати викладені нижче пункти формули винаходу а, отже, розглядати типові варіанти реалізації відповідно до опису в межах формули винаходу. Таким чином, необхідно розуміти, що даний винахід описаний за допомогою наведених варіантів реалізації та не обмежується об'ємом формули винаходу.

ФОРМУЛА ВИНАХОДУ

1. Сполука, що має структуру:



або її фармацевтично прийнятна сіль.

2. Фармацевтична композиція, яка містить ефективну кількість сполуки за п. 1 або її фармацевтично прийнятної солі та принаймні один фармацевтично прийнятний наповнювач, вибраний з-поміж носіїв, ад'ювантів та ексципієнтів.

Комп'ютерна верстка В. 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