



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ,
ПАТЕНТАМ И ТОВАРНЫМ ЗНАКАМ

(12) ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ

(21), (22) Заявка: 2004116908/04, 31.10.2002

(30) Приоритет: 03.11.2001 GB 0126433.2

(43) Дата публикации заявки: 10.11.2005 Бюл. № 31

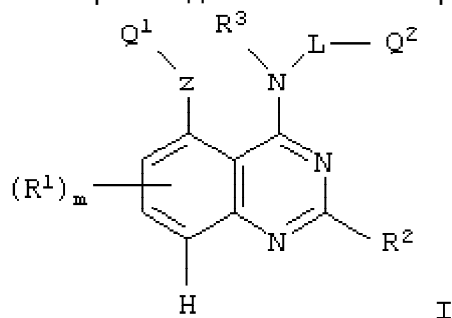
(85) Дата перевода заявки РСТ на национальную фазу: 03.06.2004

(86) Заявка РСТ:
GB 02/04932 (31.10.2002)(87) Публикация РСТ:
WO 03/040109 (15.05.2003)Адрес для переписки:
101000, Москва, М.Златоустинский пер., 10,
кв.15, "ЕВРОМАРКПАТ", И.А.Веселицкой(71) Заявитель(и):
АСТРАЗЕНЕКА АБ (SE)(72) Автор(ы):
ЭННЕКЕН Лоран Франсуа Андре (GB),
КЕТТЛ Джейсон Грант (GB),
ПАСС Мартин (GB),
БРЭДБЕРИ Роберт Хью (GB)(74) Патентный поверенный:
Веселицкая Ирина Александровна

(54) ПРОИЗВОДНЫЕ ХИНАЗОЛИНА В КАЧЕСТВЕ ПРОТИВООПУХОЛЕВЫХ СРЕДСТВ

Формула изобретения

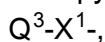
1. Производное хиназолина формулы I



где m представляет собой 0, 1 или 2;

каждая R¹ группа, которая может быть одинаковой или разной, выбрана из галогена, трифторметила, циано, изоциано, нитро, гидроксид, меркапто, амино, формил, карбоксил, карбамоил, C₁-C₆-алкил, C₂-C₈-алкенил, C₂-C₈-алкинил, C₁-C₆-алкокси, C₂-C₆-алкенилокси, C₂-C₆-алкинилокси, C₁-C₆-алкилтио, C₁-C₆-алкилсульфинил, C₁-C₆-алкилсульфонил, C₁-C₆-алкиламино, ди-[C₁-C₆-алкил]амино, C₁-C₆-алкоксикарбонил, N-C₁-C₆-алкилкарбамоил, N,N-ди-[C₁-C₆-алкил]карбамоил, C₂-C₆-алканоил, C₂-C₆-алканоилокси, C₂-C₆-алканоиламино, N-C₁-C₆-алкил-C₂-C₆-алканоиламино, C₃-C₆-алкеноиламино, N-C₁-C₆-алкил-C₃-C₆-алкеноиламино, C₃-C₆-алкиноиламино, N-C₁-C₆-алкил-C₃-C₆-алкиноиламино, N-C₁-C₆-алкилсульфамоил, N,N-ди-[C₁-C₆-алкил]сульфамоил, C₁-C₆-алкансульфониламино и N-C₁-C₆-алкил-C₁-C₆-алкансульфониламино,

или из группы формулы



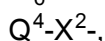
в которой X^1 представляет собой простую связь или выбран из O, S, SO, SO₂, N(R⁴), CO, CH(OR⁴), CON(R⁴), N(R⁴)CO, SO₂N(R⁴), N(R⁴)SO₂, OC(R⁴)₂, SC(R⁴)₂ и N(R⁴)C(R⁴)₂, где каждый R⁴ независимо представляет собой водород или C₁-C₆-алкил;

и Q³ представляет собой арил,

арил-C₁-C₆-алкил, C₃-C₇-циклоалкил, C₃-C₇-циклоалкил-C₁-C₆-алкил, C₃-C₇-циклоалкенил, C₃-C₇-циклоалкенил-C₁-C₆-алкил, гетероарил, гетероарил-C₁-C₆-алкил, гетероцикл или гетероцикл-C₁-C₆-алкил, или (R¹)_m представляет собой C₁-C₃-алкилендиокси,

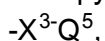
и в которой смежные атомы углерода в любой C₂-C₆-алкиленовой цепи в пределах R¹ заместителя необязательно разделены вставленной в цепь группой, выбранной из O, S, SO, SO₂, N(R⁵), CO, CH(OR⁵), CON(R⁵), N(R⁵)CO, SO₂N(R⁵), N(R⁵)SO₂, CH=CH и C=C, где R⁵ представляет собой водород или C₁-C₆-алкил,

и где любая CH₂=CH- или HC=C- группа в пределах R¹ заместителя необязательно имеет на CH₂= конце или HC= положении заместитель, выбранный из галогена, карбокси, карбамоила, C₁-C₆-алкоксикарбонила, N-C₁-C₆-алкилкарбамоила, N,N-ди-[C₁-C₆-алкил]карбамоила, амино-C₁-C₆-алкила, C₁-C₆-алкиламино-C₁-C₆-алкила и ди-[C₁-C₆-алкил]амино-C₁-C₆-алкила или из группы формулы



в которой X^2 представляет собой простую связь или выбран из CO и N(R⁶)CO, где R⁶ представляет собой водород или C₁-C₆-алкил, и Q⁴ представляет собой арил, арил-C₁-C₆-алкил, гетероарил, гетероарил-C₁-C₆-алкил, гетероцикл или гетероцикл-C₁-C₆-алкил,

и где любая CH₂ или CH₃ группа в пределах R¹ заместителя необязательно имеет на каждой указанной CH₂ или CH₃ группе один или более галогеновых или C₁-C₆-алкильных заместителей или заместитель, выбранный из гидроксид, циано, амино, карбокси, карбамоила, C₁-C₆-алкокси, C₁-C₆-алкилтио, C₁-C₆-алкилсульфинила, C₁-C₆-алкилсульфонила, C₁-C₆-алкиламино, ди-[C₁-C₆-алкил]амино, C₁-C₆-алкоксикарбонила, N-C₁-C₆-алкилкарбамоила, N,N-ди-[C₁-C₆-алкил]карбамоила, C₂-C₆-алканоила, C₂-C₆-алканоилокси, C₂-C₆-алканоиламино, N-C₁-C₆-алкил-C₂-C₆-алканоиламино, N-C₁-C₆-алкилсульфамоила, N,N-ди-[C₁-C₆-алкил]сульфамоила, C₁-C₆-алкансульфониламино и N-C₁-C₆-алкил-C₁-C₆-алкансульфониламино, или из группы формулы

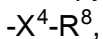


в которой X^3 представляет собой простую связь или выбран из O, S, SO, SO₂, N(R⁷), CO, CH(OR⁷), CON(R⁷), N(R⁷)CO, SO₂N(R⁷), N(R⁷)SO₂, C(R⁷)₂O, C(R⁷)₂S и N(R⁷)C(R⁷)₂, где R⁷ представляет собой водород или C₁-C₆-алкил, и Q⁵ представляет собой арил, арил-C₁-C₆-алкил, C₃-C₇-циклоалкил, C₃-C₇-циклоалкил-C₁-C₆-алкил, C₃-C₇-циклоалкенил, C₃-C₇-циклоалкенил-C₁-C₆-алкил, гетероарил, гетероарил-C₁-C₆-алкил, гетероцикл или гетероцикл-C₁-C₆-алкил,

и где любая арильная, гетероарильная или гетероциклическая группа в пределах заместителя на R¹ необязательно имеет 1, 2 или 3 заместителя, которые могут быть одинаковыми или разными, выбранных из галогена, трифторметила, циано, нитро, гидроксид, амино, карбокси, карбамоила, формила,

меркапто, C₁-C₆-алкила, C₂-C₆-алкенила, C₂-C₆-алкинила, C₁-C₆-алкокси, C₂-C₆-алкенилокси, C₂-C₆-алкинилокси, C₁-C₆-алкилтио, C₁-C₆-алкилсульфинила, C₁-C₆-алкилсульфонила, C₁-C₆-алкиламино, ди-[C₁-C₆-алкил]амино, C₁-C₆-алкоксикарбонила, N-C₁-C₆-алкилкарбамоила, N,N-ди-[C₁-C₆-алкил]карбамоила, C₂-C₆-алканоила, C₂-C₆-алканоилокси, C₂-C₆-алканоиламино, N-C₁-C₆-алкил-C₂-C₆-алканоиламино, аминоC₂-C₆-алканоила, N-C₁-C₆-алкиламиноC₂-C₆-алканоила, N,N-ди-[C₁-C₆-алкил]аминоC₂-C₆-алканоила, N-C₁-C₆-алкилсульфамоила, N,N-ди-[C₁-C₆-алкил]сульфамоила, C₁-C₆-алкансульфониламино, и N-C₁-C₆-алкил-C₁-C₆-алкансульфониламино,

или из группы формулы



в которой X^4 представляет собой простую связь или выбран из O и $N(R^9)$, где R представляет собой водород или C_1-C_6 -алкил, и R^8 представляет собой галоген- C_1-C_6 -алкил, гидроксид- C_1-C_6 -алкил,

карбоксит- C_1-C_6 -алкил, C_1-C_6 -алкоксид- C_1-C_6 -алкил, циано- C_1-C_6 -алкил,

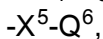
амино- C_1-C_6 -алкил, C_1-C_6 -алкиламино- C_1-C_6 -алкил, ди- $[C_1-C_6$ -алкил]

амино- C_1-C_6 -алкил, C_2-C_6 -алканоиламино- C_1-C_6 -алкил, C_1-C_6 -алкоксикарбониламино- C_1-C_6

-алкил, карбамоил- C_1-C_6 -алкил, N- C_1-C_6 -алкилкарбамоил- C_1-C_6 -алкил, N,N-ди- $[C_1-C_6$ -алкил]

карбамоил- C_1-C_6 -алкил, C_2-C_6 -алканоил- C_1-C_6 -алкил

или C_1-C_6 -алкоксикарбонил- C_1-C_6 -алкил, или из группы формулы



в которой X^5 представляет собой простую связь или выбран из O, CO и $N(R^{10})$,

где R^{10} представляет собой водород или C_1-C_6 -алкил, и Q^6 представляет собой арил,

арил- C_1-C_6 -алкил, гетероарил, гетероарил- C_1-C_6 -алкил, гетероцикл или

гетероцикл- C_1-C_6 -алкил, который необязательно имеет 1 или 2 заместителя, которые

могут быть одинаковыми или разными, выбранных из галогена, гидроксид,

амино, C_1-C_6 -алкила, C_1-C_6 -алкокси, C_1-C_6 -алкиламино и ди- $[C_1-C_6$ -алкил]амино,

и где любая гетероциклическая группа в пределах заместителя на R^1 необязательно имеет 1 или 2 оксо или тиоксо заместителя;

R^2 представляет собой водород;

R^3 представляет собой водород или C_1-C_6 -алкил;

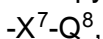
Z представляет собой простую связь или выбран из O, S, SO, SO_2 , $N(R^{11})$, CO, $CH(OR^{11})$, $CON(R^{11})$, $N(R^{11})CO$, $SO_2N(R^{11})$, $N(R^{11})SO_2$, $OC(R^{11})_2$, $SC(R^{11})_2$ и $N(R^{11})C(R^{11})_2$, где каждый R^{11} независимо представляет собой водород или C_1-C_6 -алкил;

Q^1 представляет собой арил,

арил- C_1-C_6 -алкил, C_3-C_7 -циклоалкил, C_3-C_7 -циклоалкил- C_1-C_6 -алкил, C_3-C_7 -циклоалкенил, C_3-C_7 -циклоалкенил- C_1-C_6 -алкил, гетероарил, гетероарил- C_1-C_6 -алкил, гетероцикл или гетероцикл- C_1-C_6 -алкил,

и в которой смежные атомы углерода в любой C_2-C_6 -алкиленовой цепи в пределах Q^1-Z группы необязательно разделены вставленной в цепь группой, выбранной из O, S, SO, SO_2 , $N(R^{12})$, CO, $CH(OR^{12})$, $CON(R^{12})$, $N(R^{12})CO$, $SO_2N(R^{12})$, $N(R^{12})SO_2$, $CH=CH$ и $C=C$, где R^{12} представляет собой водород или C_1-C_6 -алкил,

и где любая CH_2 или CH_3 группа в пределах Q^1-Z группы необязательно имеет на каждой указанной CH_2 или CH_3 группе один или более галогеновых или C_1-C_6 -алкильных заместителей или заместитель, выбранный из гидроксид, циано, амино, карбоксит, карбамоила, C_1-C_6 -алкокси, C_1-C_6 -алкилтио, C_1-C_6 -алкилсульфинила, C_1-C_6 -алкилсульфонил, C_1-C_6 -алкиламино, ди- $[C_1-C_6$ -алкил]амино, C_1-C_6 -алкоксикарбонила, N- C_1-C_6 -алкилкарбамоила, N,N-ди- $[C_1-C_6$ -алкил]карбамоила, C_2-C_6 -алканоила, C_2-C_6 -алканоилокси, C_2-C_6 -алканоиламино, N- C_1-C_6 -алкил- C_2-C_6 -алканоиламино, N- C_1-C_6 -алкилсульфамоила, N,N-ди- $[C_1-C_6$ -алкил]сульфамоила, C_1-C_6 -алкансульфониламино и N- C_1-C_6 -алкил- C_1-C_6 -алкансульфониламино, или из группы формулы



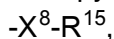
в которой X^7 представляет собой простую связь или выбран из O, S, SO, SO_2 , $N(R^{14})$, CO, $CH(OR^{14})$, $CON(R^{14})$, $N(R^{14})CO$, $SO_2N(R^{14})$, $N(R^{14})SO_2$, $C(R^{14})_2O$, $C(R^{14})_2S$ и

$N(R^{14})C(R^{14})_2$, где R^{14} представляет собой водород или C_1-C_6 -алкил, и Q^8 представляет собой арил,

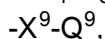
арил- C_1-C_6 -алкил, C_3-C_7 -циклоалкил, C_3-C_7 -циклоалкил- C_1-C_6 -алкил, C_3-C_7 -циклоалкенил,

C_3-C_7 -циклоалкенил- C_1-C_6 -алкил, гетероарил, гетероарил- C_1-C_6 -алкил, гетероцикл или гетероцикл- C_1-C_6 -алкил,

и где любая арильная, гетероарильная или гетероциклическая группа в пределах Q¹-Z- группы необязательно имеет 1, 2 или 3 заместителя, которые могут быть одинаковыми или разными, выбранных из галогена, трифторметила, циано, нитро, гидроксид, амино, карбокси, карбамоила, формила, C₁-C₆-алкила, C₂-C₈-алкенила, C₂-C₈-алкинила, C₁-C₆-алкокси, C₂-C₆-алкенилокси, C₂-C₆-алкинилокси, C₁-C₆-алкилтио, C₁-C₆-алкилсульфинила, C₁-C₆-алкилсульфонила, C₁-C₆-алкиламино, ди-[C₁-C₆-алкил]амино, C₁-C₆-алкоксикарбонила, N-C₁-C₆-алкилкарбамоила, N,N-ди-[C₁-C₆-алкил]карбамоила, C₂-C₆-алканоила, C₂-C₆-алканоилокси, C₂-C₆-алканоиламино, N-C₁-C₆-алкил-C₂-C₆-алканоиламино, аминоC₂-C₆-алканоила, N-C₁-C₆-алкиламиноC₂-C₆-алканоила, N,N-ди-[C₁-C₆-алкил]аминоC₂-C₆-алканоила, N-C₁-C₆-алкилсульфамоила, N,N-ди-[C₁-C₆-алкил]сульфамоила, C₁-C₆-алкансульфониламино и N-C₁-C₆-алкил-C₁-C₆-алкансульфониламино, или из группы формулы



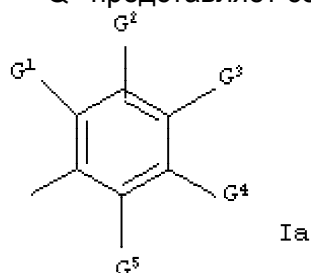
в которой X⁸ представляет собой простую связь или выбран из O и N(R¹⁶), где R¹⁶ представляет собой водород или C₁-C₆-алкил, и R¹⁵ представляет собой галоген-C₁-C₆-алкил, гидроксид-C₁-C₆-алкил, C₁-C₆-алкокси-C₁-C₆-алкил, циано-C₁-C₆-алкил, карбокси-C₁-C₆-алкил, амино-C₁-C₆-алкил, C₁-C₆-алкиламино-C₁-C₆-алкил, ди-[C₁-C₆-алкил]амино-C₁-C₆-алкил, карбамоил-C₁-C₆-алкил, N-C₁-C₆-алкилкарбамоил-C₁-C₆-алкил, N,N-ди-[C₁-C₆-алкил]карбамоил-C₁-C₆-алкил, C₂-C₆-алканоил-C₁-C₆-алкил или C₁-C₆-алкоксикарбонил-C₁-C₆-алкил, или из группы формулы



в которой X⁹ представляет собой простую связь или выбран из O, CO и N(R¹⁷), где R¹⁷ представляет собой водород или C₁-C₆-алкил, и Q⁹ представляет собой арил, арил-C₁-C₆-алкил, гетероарил, гетероарил-C₁-C₆-алкил, гетероцикл или гетероцикл-C₁-C₆-алкил, который необязательно имеет 1 или 2 заместителя, которые могут быть одинаковыми или разными, выбранных из галогена, C₁-C₆-алкила и C₁-C₆-алкокси,

и где любая гетероциклическая группа в пределах Q¹-Z- группы необязательно имеет 1 или 2 оксо или тиоксо заместителя;

Q² представляет собой арильную группу формулы 1a



где G¹ и G⁵ представляют собой водород;

G² и G⁴ каждый, независимо, выбран из водорода, галогена, трифторметила, циано, нитро, гидроксид, амино, карбокси, карбамоила, C₁-C₆-алкила, C₂-C₈-алкенила, C₂-C₈-алкинила, C₁-C₆-алкокси, C₂-C₆-алкенилокси, C₂-C₆-алкинилокси, C₁-C₆-алкиламино, ди-[C₁-C₆-алкил]амино, арила и гетероарила,

и где любая арильная или гетероарильная группа в пределах любого G² и G⁴ необязательно имеет 1 или 2 заместителя, которые могут быть одинаковыми или разными, выбранных из галогена, трифторметила, циано, нитро, гидроксид, амино, карбокси, карбамоила, C₁-C₆-алкила, C₂-C₈-алкенила, C₂-C₈-алкинила, C₁-C₆-алкокси, C₂-C₆-алкенилокси, C₂-C₆-алкинилокси, C₁-C₆-алкилтио, C₁-C₆-алкилсульфинила, C₁-C₆-

-алкилсульфонила, С₁-С₆-алкиламино и ди-[С₁-С₆-алкил]амино;

G³ выбран из водорода, галогена, трифторметила, циано, нитро, гидрокси, amino, карбокси,

карбамоила, С₁-С₆-алкила, С₂-С₈-алкенила, С₂-С₈-алкинила, С₁-С₆-алкокси, С₂-С₆-алкенилокси, С₂-С₆-алкинилокси, С₁-С₆-алкилтио, С₁-С₆-алкилсульфинила, С₁-С₆-алкилсульфонила, С₁-С₆-алкиламино, ди-[С₁-С₆-алкил]амино, С₁-С₆-алкоксикарбонила,

N-С₁-С₆-алкилкарбамоила, N,N-ди-[С₁-С₆-алкил]

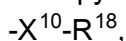
карбамоила, С₂-С₆-алканоила, С₂-С₆-алканоилокси, С₂-С₆-алканоиламино,

N-С₁-С₆-алкил-С₂-С₆-алканоиламино, С₃-С₆-алкеноиламино,

N-С₁-С₆-алкил-С₃-С₆-алкеноиламино, С₃-С₆-алкиноиламино,

N-С₁-С₆-алкил-С₃-С₆-алкиноиламино, N-С₁-С₆-алкилсульфамоила, N,N-ди-[С₁-С₆-алкил]

сульфамоила, С₁-С₆-алкансульфониламино и N-С₁-С₆-алкил-С₁-С₆-алкансульфониламино, или из группы формулы



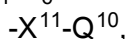
в которой X¹⁰ представляет собой простую связь или выбран из O и N(R¹⁹),

где R¹⁹ представляет собой водород или С₁-С₆-алкил, и R¹⁸ представляет собой

галоген-С₁-С₆-алкил, гидрокси-С₁-С₆-алкил, С₁-С₆-алкокси-С₁-С₆-алкил,

циано-С₁-С₆-алкил, amino-С₁-С₆-алкил, С₁-С₆-алкиламино-С₁-С₆-алкил или ди-

[С₁-С₆-алкил]амино-С₁-С₆-алкил, или из группы формулы



в которой X¹¹ представляет собой простую связь или выбран из O, S, SO, SO₂, N(R²⁰),

CO, CH(OR²⁰), CON(R²⁰), N(R²⁰)CO, SO₂N(R²⁰), N(R²⁰)SO₂, C(R²⁰)₂O, C(R²⁰)₂S,

C(R²⁰)₂N(R²⁰) и N(R²⁰)₂, где R²⁰ представляет собой водород или С₁-С₆-алкил,

и Q¹⁰ представляет собой арил,

арил-С₁-С₆-алкил, С₃-С₇-циклоалкил, С₃-С₇-циклоалкил-С₁-С₆-алкил, С₃-С₇-циклоалкенил, С₃-С₇-циклоалкенил-С₁-С₆-алкил, гетероарил, гетероарил-С₁-С₆-алкил, гетероцикл или

гетероцикл-С₁-С₆-алкил,

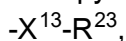
и где Q¹⁰ необязательно имеет 1, 2 или 3 заместителя, которые могут быть одинаковыми или разными, выбранных из галогена, трифторметила, циано, нитро, гидрокси, amino, карбокси, формила, карбамоила, сульфамоила,

меркапто, С₁-С₆-алкила, С₂-С₈-алкенила, С₂-С₈-алкинила, С₁-С₆-алкокси, С₂-С₆-алкенилокси, С₂-С₆-алкинилокси, С₁-С₆-алкилтио, С₁-С₆-алкилсульфинила, С₁-С₆-алкилсульфонила, С₁-С₆-алкиламино, ди-[С₁-С₆-алкил]амино, С₁-С₆-алкоксикарбонила, N-С₁-С₆-алкилкарбамоила, N,N-ди-[С₁-С₆-алкил]

карбамоила, С₂-С₆-алканоила, С₂-С₆-алканоилокси, С₂-С₆-алканоиламино,

N-С₁-С₆-алкил-С₂-С₆-алканоиламино, N-С₁-С₆-алкилсульфамоила, N,N-ди-[С₁-С₆-алкил]

сульфамоила, С₁-С₆-алкансульфониламино и N-С₁-С₆-алкил-С₁-С₆-алкансульфониламино, или из группы формулы



в которой X¹³ представляет собой простую связь или выбран из O и N(R²⁴),

где R²⁴ представляет собой водород или С₁-С₆-алкил, и R²³ представляет собой

галоген-С₁-С₆-алкил, гидрокси-С₁-С₆-алкил, С₁-С₆-алкокси-С₁-С₆-алкил,

циано-С₁-С₆-алкил, карбокси-С₁-С₆-алкил,

амино-С₁-С₆-алкил, С₁-С₆-алкиламино-С₁-С₆-алкил, ди-[С₁-С₆-алкил]амино-С₁-С₆-алкил,

карбамоил-С₁-С₆-алкил, N-С₁-С₆-алкилкарбамоил-С₁-С₆-алкил, N,N-ди-[С₁-С₆-алкил]

карбамоил-С₁-С₆-алкил, С₂-С₆-алканоил-С₁-С₆-алкил

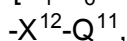
или С₁-С₆-алкоксикарбонил-С₁-С₆-алкил,

и где любая гетероциклическая группа в пределах Q¹⁰ необязательно имеет 1 или 2 оксо или тиоксо заместителя,

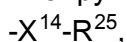
или G³ и G⁴ вместе образуют группу формулы -CH=CH-CH=CH-, -N=CH-CH=CH-, -CH=N-CH=CH-, -CH=CH-N=CH-, -CH=CH-CH=N-, -N=CH-N=CH-, -CH=N-CH=N-, -N=CH-CH=N-, -N=CH=CH-, -CH=CH-N=N-, -CH=CH-O-, -O-CH=CH-, -CH=CH-S-, -S-CH=CH-, -CH₂-CH₂-O-

, -O-CH₂-CH₂-, -CH₂-CH₂-S-, -S-CH₂-CH₂-, -O-CH₂-O-, -O-CH₂-CH₂-O-, -S-CH₂-S-, -S-CH₂-CH₂-S-, -CH=CH-NH-, -NH-CH=CH-, -CH₂-CH₂-NH-, -NH-CH₂-CH₂-, -N=CH-NH-, -NH-CH=N-, -NH-CH₂-NH-, -O-CH=N-, -N=CH-O-, -S-CH=N-, -N=CH-S-, -O-CH₂-NH-, -NH-CH₂-O-, -S-CH₂-NH-, -NH-CH₂-S-, -O-N=CH-, -CH=N-O-, -S-N=CH-, -CH=N-S-, -O-NH-CH₂-, -CH₂-NH-O-, -S-NH-CH₂-, -CH₂-NH-S-, -NH-N=CH-, -CH=N-NH-, -NH-NH-CH₂-, -CH₂-NH-NH-, -N=N-NH- или -NH-N=N-,

и образованное 9- или 10-членное бициклическое гетероарильное или гетероциклическое кольцо, когда G³ и G⁴ связаны вместе, необязательно имеет в гетероарильной или гетероциклической части бициклического кольца 1, 2 или 3 заместителя, которые могут быть одинаковыми или разными, выбранных из галогена, трифторметила, циано, нитро, гидроксид, amino, C₁-C₆-алкила, C₂-C₈-алкенила, C₂-C₈-алкинила, C₁-C₆-алкокси, C₁-C₆-алкиламино, ди-[C₁-C₆-алкил]амино и группы формулы



в которой X¹² представляет собой простую связь или выбран из O, SO, SO₂, N(R²¹), SO₂N(R²¹) и CO, где R²¹ представляет собой водород или C₁-C₆-алкил и Q¹¹ представляет собой арил, арил-C₁-C₆-алкил, гетероарил, гетероарил-C₁-C₆-алкил, гетероцикл или гетероцикл-C₁-C₆-алкил, который необязательно имеет 1 или 2 заместителя, которые могут быть одинаковыми или разными, выбранных из галогена, трифторметила, циано, нитро, гидроксид, amino, карбокси, формил, карбамоил, сульфоамид, меркапто, C₁-C₆-алкила, C₂-C₈-алкенила, C₂-C₈-алкинила, C₁-C₆-алкокси, C₂-C₆-алкенилокси, C₂-C₆-алкинилокси, C₁-C₆-алкилтио, C₁-C₆-алкилсульфинил, C₁-C₆-алкилсульфонил, C₁-C₆-алкиламино, ди-[C₁-C₆-алкил]амино, C₁-C₆-алкоксикарбонил, N-C₁-C₆-алкилкарбамоил, N,N-ди-[C₁-C₆-алкил]карбамоил, C₂-C₆-алканоил, C₂-C₆-алканоилокси, C₂-C₆-алканоиламино, N-C₁-C₆-алкил-C₂-C₆-алканоиламино, N-C₁-C₆-алкилсульфоамид, N,N-ди-[C₁-C₆-алкил]сульфоамид, C₁-C₆-алкансульфониламино и N-C₁-C₆-алкил-C₁-C₆-алкансульфониламино, или из группы формулы



в которой X¹⁴ представляет собой простую связь или выбран из O и N(R²⁶), где R²⁶ представляет собой водород или C₁-C₆-алкил, и R²⁵ представляет собой галоген-C₁-C₆-алкил, гидроксид-C₁-C₆-алкил, C₁-C₆-алкокси-C₁-C₆-алкил, циано-C₁-C₆-алкил, карбокси-C₁-C₆-алкил, amino-C₁-C₆-алкил, C₁-C₆-алкиламино-C₁-C₆-алкил, ди-[C₁-C₆-алкил]амино-C₁-C₆-алкил, карбамоил-C₁-C₆-алкил, N-C₁-C₆-алкилкарбамоил-C₁-C₆-алкил, N,N-ди-[C₁-C₆-алкил]карбамоил-C₁-C₆-алкил, C₂-C₆-алканоил-C₁-C₆-алкил или C₁-C₆-алкоксикарбонил-C₁-C₆-алкил; и

L представляет собой простую связь или -[C(R²²)₂]_n-, где n представляет собой 1 или 2, и каждый R²² независимо представляет собой водород или C₁-C₄-алкил,

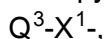
и когда L представляет собой простую связь, по крайней мере один из G², G³ и G⁴ не представляет собой водород,

или его фармацевтически приемлемая соль.

2. Производное хиназолина в соответствии с п.1, или его фармацевтически приемлемая соль, где m имеет значения, указанные в п.1, и

каждая R¹ группа, которая может быть одинаковой или разной, выбрана из галогена, трифторметила, циано, изоциано, нитро, гидроксид, меркапто, amino, формил, карбокси, карбамоил, C₁-C₆-алкила, C₂-C₈-алкенила, C₂-C₈-алкинила, C₁-C₆-алкокси, C₂-C₆-алкенилокси, C₂-C₆-алкинилокси, C₁-C₆-алкилтио, C₁-C₆-алкилсульфинил, C₁-C₆-алкилсульфонил, C₁-C₆-алкиламино, ди-[C₁-C₆-алкил]амино, C₁-C₆-алкоксикарбонил, N-C₁-C₆-алкилкарбамоил, N,N-ди-[C₁-C₆-алкил]карбамоил, C₂-C₆-алканоил, C₂-C₆-алканоилокси, C₂-C₆-алканоиламино, N-C₁-C₆-алкил-C₂-C₆-алканоиламино, C₃-C₆-алканоиламино, N-C₁-C₆-алкил-C₃-C₆-алканоиламино, C₃-C₆-алкиноиламино,

N-C₁-C₆-алкил-C₃-C₆-алкиноиламино, N-C₁-C₆-алкилсульфамоила, N,N-ди-[C₁-C₆-алкил]сульфамоила, C₁-C₆-алкансульфониламино и N-C₁-C₆-алкил-C₁-C₆-алкансульфониламино, или из группы формулы



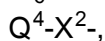
в которой X¹ представляет собой простую связь или выбран из O, S, SO, SO₂, N(R⁴), CO, CH(OR⁴), CON(R⁴), N(R⁴)CO, SO₂N(R⁴), N(R⁴)SO₂, OC(R⁴)₂, SC(R⁴)₂ и N(R⁴)C(R⁴)₂, где каждый R⁴ независимо представляет собой водород или C₁-C₆-алкил,

и Q³ представляет собой арил,

арил-C₁-C₆-алкил, C₃-C₇-циклоалкил, C₃-C₇-циклоалкил-C₁-C₆-алкил, C₃-C₇-циклоалкенил, C₃-C₇-циклоалкенил-C₁-C₆-алкил, гетероарил, гетероарил-C₁-C₆-алкил, гетероцикл или гетероцикл-C₁-C₆-алкил, или (R¹)_m представляет собой C₁-C₃-алкилендиокси,

и в которой смежные атомы углерода в любой C₂-C₆-алкиленовой цепи в пределах R¹ заместителя необязательно разделены вставленной в цепь группой, выбранной из O, S, SO, SO₂, N(R⁵), CO, CH(OR⁵), CON(R⁵), N(R⁵)CO, SO₂N(R⁵), N(R⁵)SO₂, CH=CH и C=C, где R⁵ представляет собой водород или C₁-C₆-алкил,

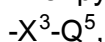
и где любая CH₂=CH- или HC=C- группа в пределах R¹ заместителя необязательно имеет на CH₂= конце или HC= положении заместитель, выбранный из галогена, карбокси, карбамоила, C₁-C₆-алкоксикарбонила, N-C₁-C₆-алкилкарбамоила, N,N-ди-[C₁-C₆-алкил]карбамоила, амино-C₁-C₆-алкила, C₁-C₆-алкиламино-C₁-C₆-алкила и ди-[C₁-C₆-алкил]амино-C₁-C₆-алкила или из группы формулы



в которой X² представляет собой простую связь или выбран из CO и N(R⁶)CO, где R⁶ представляет собой водород или C₁-C₆-алкил, и Q⁴ представляет собой арил, арил-C₁-C₆-алкил, гетероарил, гетероарил-C₁-C₆-алкил, гетероцикл или гетероцикл-C₁-C₆-алкил,

и где любая CH₂ или CH₃ группа в пределах R¹ заместителя необязательно имеет на каждой указанной CH₂ или CH₃ группе один или более галогеновых C₁-C₆-алкильных заместителей или заместитель, выбранный из гидроксид, циано, амино, карбокси, карбамоила, C₁-C₆-алкокси, C₁-C₆-алкилтио, C₁-C₆-алкилсульфинила, C₁-C₆-алкилсульфонила, C₁-C₆-алкиламино, ди-[C₁-C₆-алкил]амино, C₁-C₆-алкоксикарбонила, N-C₁-C₆-алкилкарбамоила, N,N-ди-[C₁-C₆-алкил]

карбамоила, C₂-C₆-алканоила, C₂-C₆-алканоилокси, C₂-C₆-алканоиламино, N-C₁-C₆-алкил-C₂-C₆-алканоиламино, N-C₁-C₆-алкилсульфамоила, N,N-ди-[C₁-C₆-алкил]сульфамоила, C₁-C₆-алкансульфониламино и N-C₁-C₆-алкил-C₁-C₆-алкансульфониламино, или из группы формулы



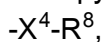
в которой X³ представляет собой простую связь или выбран из O, S, SO, SO₂, N(R⁷), CO, CH(OR⁷), CON(R⁷), N(R⁷)CO, SO₂NCR⁷), N(R⁷)SO₂, C(R⁷)₂O, C(R⁷)₂S и N(R⁷)C(R⁷)₂, где R⁷ представляет собой водород или C₁-C₆-алкил, и Q⁵ представляет собой арил, арил-C₁-C₆-алкил, C₃-C₇-циклоалкил, C₃-C₇-циклоалкил-C₁-C₆-алкил, C₃-C₇-циклоалкенил, C₃-C₇-циклоалкенил-C₁-C₆-алкил, гетероарил, гетероарил-C₁-C₆-алкил, гетероцикл или гетероцикл-C₁-C₆-алкил,

и где любая арильная, гетероарильная или гетероциклическая группа в пределах заместителя на R¹ необязательно имеет 1, 2 или 3 заместителя, которые могут быть одинаковыми или разными, выбранных из галогена, трифторметила, циано, нитро, гидроксид, амино, карбокси,

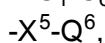
карбамоила, C₁-C₆-алкила, C₂-C₈-алкенила, C₂-C₈-алкинила, C₁-C₆-алкокси, C₂-C₆-алкенилокси, C₂-C₆-алкинилокси, C₁-C₆-алкилтио, C₁-C₆-алкилсульфинила, C₁-C₆-алкилсульфонила, C₁-C₆-алкиламино, ди-[C₁-C₆-алкил]амино, C₁-C₆-алкоксикарбонила, N-C₁-C₆-алкилкарбамоила, N,N-ди-[C₁-C₆-алкил]

карбамоила, C₂-C₆-алканоила, C₂-C₆-алканоилокси, C₂-C₆-алканоиламино, N-C₁-C₆-алкил-C₂-C₆-алканоиламино, N-C₁-C₆-алкилсульфамоила, N,N-ди-[C₁-C₆-алкил]сульфамоила, C₁-C₆-алкансульфониламино, и N-C₁-C₆-алкил-C₁-C₆-алкансульфониламино,

или из группы формулы



в которой X^4 представляет собой простую связь или выбран из O и $N(R^9)$, где R^9 представляет собой водород или C_1-C_6 -алкил, и R^8 представляет собой галоген- C_1-C_6 -алкил, гидрокси- C_1-C_6 -алкил, C_1-C_6 -алкокси- C_1-C_6 -алкил, циано- C_1-C_6 -алкил, amino- C_1-C_6 -алкил, C_1-C_6 -алкиламино- C_1-C_6 -алкил, ди- $[C_1-C_6$ -алкил] amino- C_1-C_6 -алкил, C_2-C_6 -алканоиламино- C_1-C_6 -алкил или C_1-C_6 -алкоксикарбониламино- C_1-C_6 -алкил, или из группы формулы



в которой X^5 представляет собой простую связь или выбран из O, CO и $N(R^{10})$, где R^{10} представляет собой водород или C_1-C_6 -алкил, и Q^6 представляет собой арил, арил- C_1-C_6 -алкил, гетероарил, гетероарил- C_1-C_6 -алкил, гетероцикл или гетероцикл- C_1-C_6 -алкил, который необязательно имеет 1 или 2 заместителя, которые могут быть одинаковыми или разными, выбранных из галогена, C_1-C_6 -алкила и C_1-C_6 -алкокси,

и где любая гетероциклическая группа в пределах заместителя на R^1 необязательно имеет 1 или 2 оксо или тиоксо заместителя;

R^2 представляет собой водород;

R^3 представляет собой водород или C_1-C_6 -алкил;

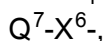
Z представляет собой простую связь или выбран из O, S, SO, SO_2 , $N(R^{11})$, CO, $CH(OR^{11})$, $CON(R^{11})$, $N(R^{11})CO$, $SO_2N(R^{11})$, $N(R^{11})SO_2$, $OC(R^{11})_2$, $SC(R^{11})_2$ и $N(R^{11})C(R^{11})_2$, где каждый R^{11} независимо представляет собой водород или C_1-C_6 -алкил;

Q^1 представляет собой арил,

арил- C_1-C_6 -алкил, C_3-C_7 -циклоалкил, C_3-C_7 -циклоалкил- C_1-C_6 -алкил, C_3-C_7 -циклоалкенил, C_3-C_7 -циклоалкенил- C_1-C_6 -алкил, гетероарил, гетероарил- C_1-C_6 -алкил, гетероцикл или гетероцикл- C_1-C_6 -алкил,

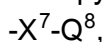
и где смежные атомы углерода в любой C_2-C_6 -алкиленовой цепи в пределах Q^1-Z -группы необязательно разделены вставленной в цепь группой, выбранной из O, S, SO, SO_2 , $N(R^{12})$, CO, $CH(OR^{12})$, $CON(R^{12})$, $N(R^{12})CO$, $SO_2N(R^{12})$, $N(R^{12})SO_2$, $CH=CH$ и $C=C$, где R^{12} представляет собой водород или C_1-C_6 -алкил,

и где любая $CH_2=CH-$ или $HC=C-$ группа в пределах Q^1-Z -группы необязательно имеет на конце $CH_2=$ или в $HC=$ положении заместитель, выбранный из галогена, карбокси, карбамоила, C_1-C_6 -алкоксикарбонила, N- C_1-C_6 -алкилкарбамоила, N,N-ди- $[C_1-C_6$ -алкил] карбамоила, amino- C_1-C_6 -алкил, C_1-C_6 -алкиламино- C_1-C_6 -алкила и ди- $[C_1-C_6$ -алкил] amino- C_1-C_6 -алкила или из группы формулы



в которой X^6 представляет собой простую связь или выбран из CO и $N(R^{13})CO$, где R^{13} представляет собой водород или C_1-C_6 -алкил, и Q^7 представляет собой арил, арил- C_1-C_6 -алкил, гетероарил, гетероарил- C_1-C_6 -алкил, гетероцикл или гетероцикл- C_1-C_6 -алкил,

и где любая CH_2 или CH_3 группа в пределах Q^1-Z -группы необязательно имеет на каждой указанной CH_2 или CH_3 группе один или более галогеновых или C_1-C_6 -алкильных заместителей или заместитель, выбранный из гидрокси, циано, amino, карбокси, карбамоила, C_1-C_6 -алкокси, C_1-C_6 -алкилтио, C_1-C_6 -алкилсульфинила, C_1-C_6 -алкилсульфонил, C_1-C_6 -алкиламино, ди- $[C_1-C_6$ -алкил]амино, C_1-C_6 -алкоксикарбонила, N- C_1-C_6 -алкилкарбамоила, N,N-ди- $[C_1-C_6$ -алкил] карбамоила, C_2-C_6 -алканоила, C_2-C_6 -алканоилокси, C_2-C_6 -алканоиламино, N- C_1-C_6 -алкил- C_2-C_6 -алканоиламино, N- C_1-C_6 -алкилсульфамоила, N,N-ди- $[C_1-C_6$ -алкил] сульфамоила, C_1-C_6 -алкансульфониламино и N- C_1-C_6 -алкил- C_1-C_6 -алкансульфониламино, или из группы формулы



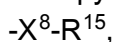
в которой X^7 представляет собой простую связь или выбран из O, S, SO, SO₂, N(R¹⁴), CO, CH(OR¹⁴), CON(R¹⁴), N(R¹⁴)CO, SO₂N(R¹⁴), N(R¹⁴)SO₂, C(R¹⁴)₂O, C(R¹⁴)₂S и N(R¹⁴)C(R¹⁴)₂, где R¹⁴ представляет собой водород или C₁-C₆-алкил, и Q⁸ представляет собой арил,

арил-C₁-C₆-алкил, C₃-C₇-циклоалкил, C₃-C₇-циклоалкил-C₁-C₆-алкил, C₃-C₇-циклоалкенил, C₃-C₇-циклоалкенил-C₁-C₆-алкил, гетероарил, гетероарил-C₁-C₆-алкил, гетероцикл или гетероцикл-C₁-C₆-алкил,

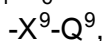
и где любая арильная, гетероарильная или гетероциклическая группа в пределах Q¹-Z- группы необязательно имеет 1, 2 или 3 заместителя, которые могут быть одинаковыми или разными, выбранных из галогена, трифторметила, циано, нитро, гидроксид, амино, карбокси,

карбамоила, C₁-C₆-алкила, C₂-C₈-алкенила, C₂-C₈-алкинила, C₁-C₆-алкокси, C₂-C₆-алкенилокси, C₂-C₆-алкинилокси, C₁-C₆-алкилтио, C₁-C₆-алкилсульфинила, C₁-C₆-алкилсульфонила, C₁-C₆-алкиламино, ди-[C₁-C₆-алкил]амино, C₁-C₆-алкоксикарбонила, N-C₁-C₆-алкилкарбамоила, N,N-ди-[C₁-C₆-алкил]

карбамоила, C₂-C₆-алканоила, C₂-C₆-алканоилокси, C₂-C₆-алканоиламино, N-C₁-C₆-алкил-C₂-C₆-алканоиламино, N-C₁-C₆-алкилсульфамоила, N,N-ди-[C₁-C₆-алкил]сульфамоила, C₁-C₆-алкансульфониламино и N-C₁-C₆-алкил-C₁-C₆-алкансульфониламино, или из группы формулы



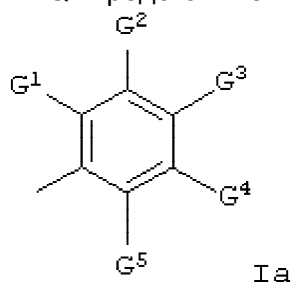
в которой X^8 представляет собой простую связь или выбран из O и N(R¹⁶), где R¹⁶ представляет собой водород или C₁-C₆-алкил, и R¹⁵ представляет собой галоген-C₁-C₆-алкил, гидроксид-C₁-C₆-алкил, C₁-C₆-алкокси-C₁-C₆-алкил, циано-C₁-C₆-алкил, амино-C₁-C₆-алкил, C₁-C₆-алкиламино-C₁-C₆-алкил или ди-[C₁-C₆-алкил]амино-C₁-C₆-алкил, или из группы формулы



в которой X^9 представляет собой простую связь или выбран из O, CO и N(R¹⁷), где R¹⁷ представляет собой водород или C₁-C₆-алкил, и Q⁹ представляет собой арил, арил-C₁-C₆-алкил, гетероарил, гетероарил-C₁-C₆-алкил, гетероцикл или гетероцикл-C₁-C₆-алкил, который необязательно имеет 1 или 2 заместителя, которые могут быть одинаковыми или разными, выбранных из галогена, C₁-C₆-алкила и C₁-C₆-алкокси,

и где любая гетероциклическая группа в пределах Q¹-Z- группы необязательно имеет 1 или 2 оксо или тиоксо заместителя;

Q² представляет собой арильную группу формулы



где G¹ и G⁵ представляют собой водород;

G² и G⁴ каждый, независимо, выбран из водорода, галогена, трифторметила, циано, нитро, гидроксид, амино, карбокси, карбамоила, C₁-C₆-алкила, C₂-C₈-алкенила, C₂-C₈-алкинила, C₁-C₆-алкокси, C₂-C₆-алкенилокси, C₂-C₆-алкинилокси, C₁-C₆-алкиламино, ди-[C₁-C₆-алкил]амино, арила и гетероарила,

и где любая арильная или гетероарильная группа в пределах любого G² и G⁴ необязательно имеет 1 или 2 заместителя, которые могут быть одинаковыми или разными, выбранных из галогена, трифторметила, циано, нитро, гидроксид, амино, карбокси,

карбамоила, C₁-C₆-алкила, C₂-C₈-алкенила, C₂-C₈-алкинила, C₁-C₆-алкокси, C₂-C₆-алкенилокси, C₂-C₆-алкинилокси, C₁-C₆-алкилтио, C₁-C₆-алкилсульфинила, C₁-C₆-алкилсульфонила, C₁-C₆-алкиламино и ди-[C₁-C₆-алкил]амино;

G³ выбран из водорода, галогена, трифторметила, циано, нитро, гидрокси, амина, карбоксии,

карбамоила, C₁-C₆-алкила, C₂-C₈-алкенила, C₂-C₈-алкинила, C₁-C₆-алкокси, C₂-C₆-алкенилокси, C₂-C₆-алкинилокси, C₁-C₆-алкилтио, C₁-C₆-алкилсульфинила, C₁-C₆-алкилсульфонила, C₁-C₆-алкиламино, ди-[C₁-C₆-алкил]амино, C₁-C₆-алкоксикарбонила, N-C₁-C₆-алкилкарбамоила, N,N-ди-[C₁-C₆-алкил]

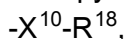
карбамоила, C₂-C₆-алканоила, C₂-C₆-алканоилокси, C₂-C₆-алканоиламино,

N-C₁-C₆-алкил-C₂-C₆-алканоиламино, C₃-C₆-алкеноиламино,

N-C₁-C₆-алкил-C₃-C₆-алкеноиламино, C₃-C₆-алкиноиламино,

N-C₁-C₆-алкил-C₃-C₆-алкиноиламино, N-C₁-C₆-алкилсульфамоила, N,N-ди-[C₁-C₆-алкил]

сульфамоила, C₁-C₆-алкансульфониламино и N-C₁-C₆-алкил-C₁-C₆-алкансульфониламино, или из группы формулы



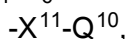
в которой X¹⁰ представляет собой простую связь или выбран из O и N(R¹⁹),

где R¹⁹ представляет собой водород или C₁-C₆-алкил, и R¹⁸ представляет собой

галоген-C₁-C₆-алкил, гидрокси-C₁-C₆-алкил, C₁-C₆-алкокси-C₁-C₆-алкил,

циано-C₁-C₆-алкил, амина-C₁-C₆-алкил, C₁-C₆-алкиламино-C₁-C₆-алкил или ди-

[C₁-C₆-алкил]амино-C₁-C₆-алкил, или из группы формулы



в которой X¹¹ представляет собой простую связь или выбран из O, S, SO, SO₂, N(R²⁰),

CO, CH(OR²⁰), CON(R²⁰), N(R²⁰)CO, SO₂N(R²⁰), N(R²⁰)SO₂, C(R²⁰)₂O, C(R²⁰)₂S и

N(R²⁰)C(R²⁰)₂, где R²⁰ представляет собой водород или C₁-C₆-алкил, и Q¹⁰ представляет собой арил,

арил-C₁-C₆-алкил, C₃-C₇-циклоалкил, C₃-C₇-циклоалкил-C₁-C₆-алкил, C₃-C₇-циклоалкенил, C₃-C₇-циклоалкенил-C₁-C₆-алкил, гетероарил, гетероарил-C₁-C₆-алкил, гетероцикл или

гетероцикл-C₁-C₆-алкил,

и где Q¹⁰ необязательно имеет 1, 2 или 3 заместителя, которые могут быть одинаковыми или разными, выбранных из галогена, трифторметила, циано, нитро, гидрокси, амина, карбоксии,

карбамоила, C₁-C₆-алкила, C₂-C₈-алкенила, C₂-C₈-алкинила, C₁-C₆-алкокси, C₂-C₆-алкенилокси, C₂-C₆-алкинилокси, C₁-C₆-алкилтио, C₁-C₆-алкилсульфинила, C₁-C₆-алкилсульфонила, C₁-C₆-алкиламино, ди-[C₁-C₆-алкил]амино, C₁-C₆-алкоксикарбонила, N-C₁-C₆-алкилкарбамоила, N,N-ди-[C₁-C₆-алкил]

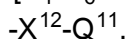
карбамоила, C₂-C₆-алканоила, C₂-C₆-алканоилокси, C₂-C₆-алканоиламино, N-C₁-C₆-алкил-C₂-C₆-алканоиламино, N-C₁-C₆-алкилсульфамоила, N,N-ди-[C₁-C₆-алкил]

сульфамоила, C₁-C₆-алкансульфониламино и N-C₁-C₆-алкил-C₁-C₆-алкансульфониламино, и где любая гетероциклическая группа в пределах Q¹⁰ необязательно имеет 1 или 2 оксо или тиоксо заместителя,

или G³ и G⁴ вместе образуют группу формулы -CH=CH-CH=CH-, -N=CH-CH=CH-, -CH=N-CH=CH-, -CH=CH-N=CH-, -CH=CH-CH=N-, -N=CH-N=CH-, -CH=N-CH=N-, -N=N-CH=CH-, -CH=CH-N=N-, -CH=CH-O-, -O-CH=CH-, -CH=CH-S-, -S-CH=CH-, -CH₂-CH₂-O-, -O-CH₂-CH₂-, -CH₂-CH₂-S-, -S-CH₂-CH₂-, -O-CH₂-O-, -O-CH₂-CH₂-O-, -S-CH₂-S-, -S-CH₂-CH₂-S-, -CH=CH-NH-, -NH-CH=CH-, -CH₂-CH₂-NH-, -NH-CH₂-CH₂-, -N=CH-NH-, -NH-CH=N-, -NH-CH₂-NH-, -O-CH=N-, -N=CH-O-, -S-CH=N-, -N=CH-S-, -O-CH₂-NH-, -NH-CH₂-O-, -S-CH₂-NH-, -NH-CH₂-S-, -O-N=CH-, -CH=N-O-, -S-N=CH-, -CH=N-S-, -O-NH-CH₂-, -CH₂-NH-O-, -S-NH-CH₂-, -CH₂-NH-S-, -NH-N=CH-, -CH=N-NH-, -NH-NH-CH₂-, -CH₂-NH-NH-, -N=N-NH- или -NH-N=N-,

и образованное 9- или 10-членное бициклическое гетероарильное или гетероциклическое кольцо, когда G³ и G⁴ связаны вместе, необязательно имеет в гетероарильной или гетероциклической части бициклического кольца 1, 2 или 3

заместителя, которые могут быть одинаковыми или разными, выбранных из галогена, трифторметила, циано, нитро, гидроксид, амино, C₁-C₆-алкила, C₂-C₈-алкенила, C₂-C₈-алкинила, C₁-C₆-алкокси, C₁-C₆-алкиламино и ди-[C₁-C₆-алкил]амино, или из группы формулы



в которой X¹² представляет собой простую связь или выбран из O, SO, SO₂, N(R²¹) и CO, где R²¹ представляет собой водород или C₁-C₆-алкил и Q¹¹ представляет собой арил, арил-C₁-C₆-алкил, гетероарил, гетероарил-C₁-C₆-алкил, гетероцикл или гетероцикл-C₁-C₆-алкил, который необязательно имеет 1 или 2 заместителя, которые могут быть одинаковыми или разными, выбранных из галогена, C₁-C₆-алкила и C₁-C₆-алкокси, и любое бициклическое гетероциклическое кольцо, образованное таким образом, необязательно имеет 1 или 2 оксо или тиоксо группы; и

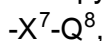
L представляет собой простую связь или $-[C(R^{22})_2]_n$, представляет собой 1 или 2, и каждый R²² независимо представляет собой водород или C₁-C₄-алкил, и когда L представляет собой простую связь, по крайней мере один из G², G³ и G⁴ не представляет собой водород,

или его фармацевтически приемлемая соль.

3. Производное хиназолина в соответствии с п.1, или его фармацевтически приемлемая соль, где каждый из m, R¹, R², R³, L и Q² имеет значения, указанные в п.1, и

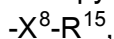
Z выбран из O, S, SO, SO₂, N(R¹¹), CO, CH(OR¹¹), CON(R¹¹), N(R¹¹)CO, SO₂N(R¹¹), N(R¹¹)SO₂, OC(R¹¹)₂, SC(R¹¹)₂ и N(R¹¹)C(R¹¹)₂, где R¹¹ представляет собой водород или C₁-C₆-алкил; и

Q¹ выбран из C₃-C₇-циклоалкила, C₃-C₇-циклоалкенила, и гетероцикла, и где любая CH₂ или CH₃ группа в пределах Q¹-Z- группы необязательно имеет на каждой указанной CH₂ или CH₃ группе один или более галогеновых или C₁-C₆-алкильных заместителей или заместитель, выбранный из гидроксид, циано, амино, карбокси, карбамоила, C₁-C₆-алкокси, C₁-C₆-алкилтио, C₁-C₆-алкилсульфинила, C₁-C₆-алкилсульфонила, C₁-C₆-алкиламино, ди-[C₁-C₆-алкил]амино, C₁-C₆-алкоксикарбонила, N-C₁-C₆-алкилкарбамоила, N,N-ди-[C₁-C₆-алкил]карбамоила, C₂-C₆-алканоила, C₂-C₆-алканоилокси, C₂-C₆-алканоиламино, N-C₁-C₆-алкил-C₂-C₆-алканоиламино, N-C₁-C₆-алкилсульфамоила, N,N-ди-[C₁-C₆-алкил]сульфамоила, C₁-C₆-алкансульфониламино и N-C₁-C₆-алкил-C₁-C₆-алкансульфониламино, или из группы формулы



в которой X⁷ представляет собой простую связь или выбран из O, S, SO, SO₂, N(R¹⁴), CO, CH(OR¹⁴), CON(R¹⁴), N(R¹⁴)CO, SO₂N(R¹⁴), N(R¹⁴)SO₂, C(R¹⁴)₂O, C(R¹⁴)₂S и N(R¹⁴)C(R¹⁴)₂, где R¹⁴ представляет собой водород или C₁-C₆-алкил, и Q⁸ представляет собой C₃-C₇-циклоалкил, C₃-C₇-пиклоалкил-C₁-C₆-алкил, C₃-C₇-циклоалкенил, C₃-C₇-циклоалкенил-C₁-C₆-алкил, гетероцикл или гетероцикл-C₁-C₆-алкил,

и где любая гетероциклическая группа в пределах Q¹-Z- группы необязательно имеет 1, 2 или 3 заместителя, которые могут быть одинаковыми или разными, выбранных из галогена, трифторметила, циано, нитро, гидроксид, амино, карбокси, карбамоила, формила, C₁-C₆-алкила, C₂-C₈-алкенила, C₂-C₈-алкинила, C₁-C₆-алкокси, C₂-C₆-алкенилокси, C₂-C₆-алкинилокси, C₁-C₆-алкилтио, C₁-C₆-алкилсульфинила, C₁-C₆-алкилсульфонила, C₁-C₆-алкиламино, ди-[C₁-C₆-алкил]амино, C₁-C₆-алкоксикарбонила, N-(C₁-C₆)алкилкарбамоила, N,N-ди-[C₁-C₆-алкил]карбамоила, C₂-C₆-алканоила, C₂-C₆-алканоилокси, C₂-C₆-алканоиламино, N-C₁-C₆-алкил-C₂-C₆-алканоиламино, аминоC₂-C₆-алканоила, N-C₁-C₆-алкиламиноC₂-C₆-алканоила, N,N-ди-[C₁-C₆-алкил]аминоC₂-C₆-алканоила, N-C₁-C₆-алкилсульфамоила, N,N-ди-[C₁-C₆-алкил]сульфамоила, C₁-C₆-алкансульфониламино и N-C₁-C₆-алкил-C₁-C₆-алкансульфониламино, или из группы формулы



в которой X^8 представляет собой простую связь или выбран из O и $N(R^{16})$, где R^{16} представляет собой водород или C_1-C_6 -алкил, и R^{15} представляет собой галоген- C_1-C_6 -алкил, гидроксигруппу- C_1-C_6 -алкил, C_1-C_6 -алкокси- C_1-C_6 -алкил, циано- C_1-C_6 -алкил, карбокси- C_1-C_6 -алкил, амино- C_1-C_6 -алкил, C_1-C_6 -алкиламино- C_1-C_6 -алкил, ди- $[C_1-C_6$ -алкил]амино- C_1-C_6 -алкил, карбамоил- C_1-C_6 -алкил, N- C_1-C_6 -алкилкарбамоил- C_1-C_6 -алкил, N,N-ди- $[C_1-C_6$ -алкил]карбамоил- C_1-C_6 -алкила, C_1-C_6 -алканойл- C_1-C_6 -алкила или C_1-C_6 -алкоксикарбонил- C_1-C_6 -алкила, или из группы формулы $-X^9-Q^9$,

в которой X^9 представляет собой простую связь или выбран из O, CO и $N(R^{17})$, где R^{17} представляет собой водород или C_1-C_6 -алкил, и Q^9 представляет собой гетероцикл или гетероцикл- C_1-C_6 -алкил, который необязательно имеет 1 или 2 заместителя, которые могут быть одинаковыми или разными, выбранных из галогена, C_1-C_6 -алкила и C_1-C_6 -алкокси,

и где любая гетероциклическая группа в пределах Q^1-Z - группы необязательно имеет 1 или 2 оксо или тиоксо заместителя.

4. Производное хиназолина в соответствии с п.1, или его фармацевтически приемлемая соль, где каждый из R^2 , R^3 , L, Z, Q^1 и Q^2 имеет значения, указанные в п.1; и m представляет собой 1; и

R^1 группа расположена в 7-м положении и представляет собой группу формулы Q^3-X^1 ,

в которой X^1 представляет собой O и Q^3 выбран из гетероцикл-пропила или гетероцикл-бутила, где указанная гетероциклическая группа содержит по крайней мере один атом азота,

и в которой смежные атомы углерода в любой C_2-C_6 -алкиленовой цепи в пределах R^1 заместителя необязательно разделены вставленной в цепь группой, выбранной из O, S, $N(R^5)$, CO, $CH=CH$ и $C=C$, где R^5 представляет собой водород или C_1-C_6 -алкил,

и где любая гетероциклическая группа в пределах R^1 необязательно имеет 1 или 2 заместителя, которые могут быть одинаковыми или разными, выбранных из галогена, гидроксигруппы, карбамоила, C_1-C_4 -алкила, C_1-C_4 -алкокси, C_2-C_4 -алкенила, C_2-C_4 -алкинила, C_2-C_4 -алканойла, C_1-C_4 -алкилсульфонила, C_1-C_4 -алкоксикарбонила, N- C_1-C_4 -алкилкарбамоила и N,N-ди- $[C_1-C_4$ -алкил]карбамоила, или необязательно имеет 1 заместитель, выбранный из группы формулы

$-X^4-R^8$,

в которой X^4 представляет собой простую связь или выбран из O и NH, и R^8 представляет собой 2-гидроксиэтил, 3-гидроксипропил, 2-метоксиэтил, 3-метоксипропил, фторметил, 2-фторэтил, хлорметил, 2-хлорэтил, ацетилметил, ацетамидометил, карбамоилметил, 2-карбамоилэтил, N-метилкарбамоилметил, N,N-диметилкарбамоилметил, 2-карбамоилэтил, 2-(N-метилкарбамоил)этил, 2-(N,N-диметилкарбамоил)этил, цианометил, цианоэтил, метоксикарбониламинометил или этоксикарбониламинометил, и где любая гетероциклическая группа в пределах R^1 необязательно имеет 1 оксо заместитель.

5. Производное хиназолина в соответствии с п.1 или 2, или его фармацевтически приемлемая соль, где каждый из R^2 , R^3 , L, Z, Q^1 и Q^2 имеет значения, указанные в п.1 или 2;

и m представляет собой 1; и

R^1 -группа расположена в 7-м положении и выбрана из гидроксигруппы, амино, метила, этила, пропила, метокси, этокси, пропокси, бутокси, пентокси, пирролидин-1-ила, 2-пирролидин-1-илэтокси, 3-пирролидин-1-илпропокси, 2-пиперидиноэтокси, 3-пиперидинопропокси, 2-пиперидин-3-илэтокси, 3-пиперидин-3-илпропокси, 2-пиперидин-4-илэтокси, 3-пиперидин-4-

илпропокси, 2-пиперазин-1-илэтокс, 3-пиперазин-1-илпропокси, 2-морфолиноэтокс, 3-морфолинопропокси, 2-гомопиперидиноэтокс, 3-гомопиперидинопропокси, 2-гомопиперазин-1-илэтокс и 3-гомопиперазин-1-илпропокси,

и в которой смежные атомы углерода в любой C_2 - C_6 -алкокси цепи в пределах R^1 заместителя необязательно разделены вставленной в цепь группой, выбранной из O, NH и $N(CH_3)$,

и где любая концевая CH_3 группа в пределах C_1 - C_6 -алкокси цепи в R^1 заместителе необязательно имеет на концевой CH_3 группе заместитель, выбранный из гидрокси, amino и N-(1-метилпирролидин-3-ил)-N-метиламино,

и где любая пирролидинильная или пиперидинильная группа в пределах R^1 заместителя необязательно имеет заместитель, выбранный из гидрокси, метила, amino, метиламино и диметиламино,

и где любая пиперазин-1-ильная или гомопиперазин-1-ильная группа в пределах R^1 заместителя необязательно имеет заместитель в 4-м положении, выбранный из метила, этила, изопропила, 2-метоксиэтила, тетрагидрофурфурила, 2-морфолиноэтила и 1-метилпиперидин-4-ила.

6. Производное хиназолина в соответствии с п.1, или его фармацевтически приемлемая соль, где каждый из R^2 , R^3 , L, Z, Q^1 и Q^2 имеет значения, указанные в п.1; и m представляет собой 1; и

R^1 группа расположена в 7-м положении и представляет собой C_1 - C_3 -алкокси или C_1 - C_3 -алкокси- C_1 - C_3 -алкокси.

7. Производное хиназолина в соответствии с п.1, или его фармацевтически приемлемая соль, где каждый из R^1 , R^2 , R^3 , m, L и Q^2 имеет значения, указанные в п.1; и Z представляет собой O; и

Q^1 -Z- группа выбрана из пирролидин-3-ила, пиперидин-3-ила и пиперидин-4-ила, и где любая NH-группа в пределах пирролидинильной или пиперидинильной группы в Q^1 необязательно имеет заместитель, выбранный из метила, этила, аллила, ацетила, карбамоила, метоксикарбонила, этоксикарбонила, N-метилкарбамоила, N,N-диметилкарбамоила, 2-фторэтила, 2-метоксиэтила карбамоилметила, N-метилкарбамоилметила, N,N-диметилкарбамоилметила, ацетилметила и метоксикарбонилметила, и где любая пирролидинильная или пиперидинильная группа в пределах Q^1 -Z- группы необязательно имеет 1 оксо заместитель.

8. Производное хиназолина в соответствии с п.1, или его фармацевтически приемлемая соль, где каждый из R^1 , R^2 , R^3 , m, L и Q^2 имеет значения, указанные в п.1, и Z представляет собой O; и

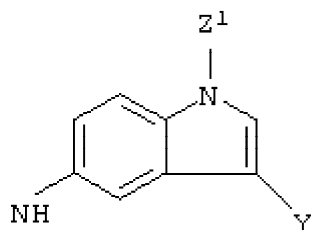
Q^1 выбран из тетрагидрофуран-3-ила, тетрагидропиран-3-ила и тетрагидропиран-4-ила, и где любая тетрагидрофуранильная или тетрагидропиранильная группа в пределах Q^1 необязательно имеет 1 или 2 заместителя, выбранных из фтора, хлора, гидрокси, метила, этила и amino, и

где любая тетрагидрофуранильная или тетрагидропиранильная группа в пределах Q^1 -Z- группы необязательно имеет 1 оксо заместитель.

9. Производное хиназолина в соответствии с п.1, или его фармацевтически приемлемая соль, где каждый из R^1 , R^2 , m, Z и Q^1 имеет значения, указанные в п.1; и

группа $Q^2LN(R^3)$ выбрана из 3-хлор-4-фторанилино, 3-хлор-4-гидроксианилино, 3-фторанилино, 3-броманилино, 3-хлоранилино, 3-метиланилино и 3-этиниланилино.

10. Производное хиназолина в соответствии с п.1, или его фармацевтически приемлемая соль, где каждый из R^1 , R^2 , m, Z и Q^1 имеет значения, указанные в п.1; и группа $Q^2LN(R^3)$ представляет собой группу формулы Ic

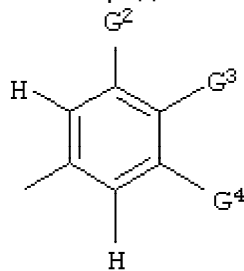


Ic

где Z^1 представляет собой водород или C_1 - C_4 -алкил; и
 Y выбран из водорода, галогена, C_1 - C_4 -алкила и циано.

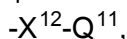
11. Производное хиназолина в соответствии с п.1 или 2, или его фармацевтически приемлемая соль, где каждый из R^1 , R^2 , R^3 , m , L , Z и Q^1 имеет значения, указанные в п.1 или 2; и

Q^2 представляет собой арильную группу формулы Ib



Ib

где G^3 и G^4 вместе образуют группу формулы $-NH-CH=CH-$ или $-NH-N=CH-$, и образованное 9-членное бициклическое гетероарильное кольцо, когда G^3 и G^4 связаны вместе, необязательно имеет на NH группе гетероарильной части бициклического кольца группу формулы



в которой X^{12} представляет собой простую связь или представляет собой SO_2 и Q^{11} представляет собой бензил или 2-пиридилметил, который необязательно имеет 1 или 2 заместителя, которые могут быть одинаковыми или разными, выбранных из фтора, хлора, брома, циано, гидрокси и метила;

и образованное 9-членное бициклическое гетероарильное кольцо, когда G^3 и G^4 связаны вместе, необязательно имеет в 3-м положении гетероарильной части бициклического кольца 1 заместитель, выбранный из фтора, хлора, брома, циано, гидрокси, amino, метила, этила и этинила;

и G^2 выбран из водорода, фтора, хлора, брома, циано, гидрокси, amino, метила, этила и этинила.

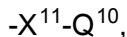
12. Производное хиназолина в соответствии с п.1, или его фармацевтически приемлемая соль, где каждый из R^2 , R^3 , Z , L и Q^1 имеет значения, указанные в п.1; и

Q^2 представляет собой группу формулы 1a, как указано в п.1, в которой

G^1 , G^2 и G^5 представляют собой водород;

G^4 выбран из водорода, галогена, C_1 - C_6 -алкила и C_2 - C_6 -алкинила; и

G^3 представляет собой группу формулы



в которой X^{11} представляет собой O и Q^{10} выбран из бензила и гетероарилметила, и где любая фенильная или гетероарильная группа в пределах Q^{10} необязательно имеет 1 или 2 заместителя, которые могут быть одинаковыми или разными, выбранных из галогена, гидрокси, циано, amino, C_1 - C_6 -алкила, C_1 - C_6 -алкокси, C_1 - C_6 -алкиламино и ди- $[C_1$ - C_6 -алкил] amino, карбамоила, N- C_1 - C_6 -алкилкарбамоила, N,N-ди- $[C_1$ - C_6 -алкил]карбамоила, галоген- C_1 - C_6 -алкила, гидрокси- C_1 - C_6 -алкила, C_1 - C_6 -алкокси- C_1 - C_6 -алкила, циано- C_1 - C_6 -алкила, amino- C_1 - C_6 -алкила, C_1 - C_6 -алкиламино- C_1 - C_6 -алкила, ди- $[C_1$ - C_6 -алкил] amino- C_1 - C_6 -алкила, карбамоил- C_1 - C_6 -алкила,

N-C₁-C₆-алкилкарбамоил-C₁-C₆-алкила и N,N-ди-[C₁-C₆-алкил]карбамоил-C₁-C₆-алкила; m представляет собой 1; и

R¹ расположена в 7-м положении и имеет значения, указанные в п.1.

13. Производное хиразолина формулы I, как указано в п.1, в которой m представляет собой 0 или 1 и R¹ группа, если она присутствует, расположена в 7-м положении и выбрана из гидроксидной, аминной, метильной, этильной, пропиловой, метоксидной, этоксидной, пропоксидной, бутоксидной, пентоксидной, пирролидин-1-ильной, 2-пирролидин-1-илэтоксидной, 3-пирролидин-1-илпропоксидной, 2-пиперидиноэтоксидной, 3-пиперидинопропоксидной, 2-пиперидин-3-илэтоксидной, 3-пиперидин-3-илпропоксидной, 2-пиперидин-4-илэтоксидной, 3-пиперидин-4-илпропоксидной, 2-пиперазин-1-илэтоксидной, 3-пиперазин-1-илпропоксидной, 2-морфолиноэтоксидной, 3-морфолинопропоксидной, 2-гомопиперидиноэтоксидной, 3-гомопиперидинопропоксидной, 2-гомопиперазин-1-илэтоксидной и 3-гомопиперазин-1-илпропоксидной,

и в которой смежные атомы углерода в любой C₂-C₆-алкоксидной цепи в пределах R¹ заместителя необязательно разделены вставленной в цепь группой, выбранной из O, NH и N(CH₃),

и где любая концевая CH₃ группа в пределах C₁-C₆-алкоксидной цепи в R¹ заместителе необязательно имеет на указанной концевой CH₃ группе заместитель, выбранный из гидроксидной, аминной и N-(1-метилпирролидин-3-ил)-N-метиламиной,

и где любая пирролидинильная или пиперидинильная группа в пределах R¹ заместителя необязательно имеет заместитель, выбранный из гидроксидной, метильной, аминной, метиламиной и диметиламиной,

и где любая пиперазин-1-ильная или гомопиперазин-1-ильная группа в пределах R¹ заместителя необязательно имеет заместитель в 4-м положении, выбранный из метильной, этильной, изопропиловой, 2-метоксиэтильной, тетрагидрофурурильной, 2-морфолиноэтильной и 1-метилпиперидин-4-ильной;

Q¹-Z- группа выбрана из циклопентилоксидной, тетрагидрофуран-3-илоксидной, тетрагидропиран-4-илоксидной, тетрагидротиипиран-4-илоксидной, 1,1-диоксотетрагидротиипиран-4-илоксидной, 1-оксотетрагидротиипиран-4-илоксидной, тетрагидротииен-3-илоксидной, 1,1-диоксодотетрагидротииен-3-илоксидной, 1-оксотетрагидротииен-3-илоксидной, пирролидин-3-илоксидной, пирролидин-2-илоксидной, пиперидин-3-илоксидной, пиперидин-4-илоксидной, гомопиперидин-3-илоксидной, гомопиперидин-4-илоксидной и азетидин-3-илоксидной,

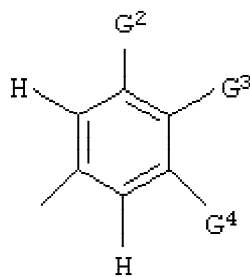
и где азетидинильная, пирролидинильная, пиперидинильная или гомопиперидинильная группа в пределах Q¹-Z- группы необязательно замещена у атома азота заместителем, выбранным из метильной, этильной, n-пропиловой, изопропиловой, n-бутильной, изобутильной, трет-бутильной, аллильной, 2-пропинильной, ацетиловой, пропиононильной, метоксикарбонильной, этоксикарбонильной, пропоксикарбонильной, трет-бутоксикарбонильной, метилсульфонильной, этилсульфонильной, 2-метоксиэтильной, карбамоилметильной, N-метилкарбамоилметильной, N,N-диметилкарбамоилметильной, 2-карбамоилэтильной, 2-(N-метилкарбамоил)этильной, 2-(N,N-диметилкарбамоил)этильной, ацетилметильной, 2-ацетилэтильной, метоксикарбонилметильной и 2-метоксикарбонилэтильной,

и где любая гетероциклическая группа в пределах Q¹-Z- группы необязательно имеет 1 или 2 оксо заместителя;

R² и R³ представляют собой водород;

L представляет собой простую связь; и

Q² представляет собой арильную группу формулы Ib



Ib

где G² представляет собой водород, и G³ и G⁴, которые могут быть одинаковыми или разными, выбраны из водорода, фтора, хлора, брома, циано, гидроксид, метила, этила, и этинила, при условии, что по крайней мере один из G³ и G⁴ не представляет собой водород, или G³ и G⁴ вместе образуют группу формулы -CH=CH-NH-, -NH-CH=CH-, -NH-N=CH-, -CH=N-NH-, и образованное при этом 9-членное бициклическое гетероарильное кольцо необязательно имеет в гетероарильной части бициклического кольца 1 или 2 заместителя, которые могут быть одинаковыми или разными, выбранных из фтора, хлора, брома, циано, и метила,

или его фармацевтически-приемлемая кислото-аддитивная соль.

14. Производное хиназолина формулы I, как указано в п.1, в которой

m представляет собой 1 и R¹ группа расположена в 7-м положении и выбрана из гидроксид, амино, метила, этила, пропила, метокси, этокси, пропокси, бутокси, пентокси, пирролидин-1-ила, 2-пирролидин-1-илэтокси, 3-пирролидин-1-илпропокси, 2-пиперидиноэтокси, 3-пиперидинопропокси, 2-пиперидин-3-илэтокси, 3-пиперидин-3-илпропокси, 2-пиперидин-4-илэтокси, 3-пиперидин-4-илпропокси, 2-пиперазин-1-илэтокси, 3-пиперазин-1-илпропокси, 2-морфолиноэтокси, 3-морфолинопропокси, 2-гомопиперидиноэтокси, 3-гомопиперидинопропокси, 2-гомопиперазин-1-илэтокси и 3-гомопиперазин-1-илпропокси,

и в которой смежные атомы углерода в любой C₂-C₆-алкокси цепи в пределах R¹ заместителя необязательно разделены вставленной в цепь группой, выбранной из O, NH и N(CH₃),

и где любая концевая CH₃ группа в пределах C₁-C₆-алкокси цепи в R¹ заместителе необязательно имеет на концевой CH₃ группе заместитель, выбранный из гидроксид, амино и N-(1-метилпирролидин-3-ил)-N-метиламино,

и где любая пирролидинильная или пиперидинильная группа в пределах R¹ заместителя необязательно имеет заместитель, выбранный из гидроксид, метила, амино, метиламино и диметиламино,

и где любая пиперазин-1-ильная или гомопиперазин-1-ильная группа в пределах R¹ заместителя необязательно имеет заместитель в 4-м положении, выбранный из метила, этила, изопропила, 2-метоксиэтила, тетрагидрофурфурила, 2-морфолиноэтила и 1-метилпиперидин-4-ила;

Q¹-Z- группа выбрана из циклопентилокси, тетрагидрофуран-3-илокси, тетрагидропиран-4-илокси, тетрагидротиипиран-4-илокси, 1,1-диоксотетрагидротиипиран-4-илокси, 1-оксотетрагидротиипиран-4-илокси, тетрагидротииен-3-илокси, 1,1-диоксотетрагидротииен-3-илокси, 1-оксотетрагидротииен-3-илокси, пирролидин-3-илокси, пирролидин-2-илокси, пиперидин-3-илокси, пиперидин-4-илокси, гомопиперидин-3-илокси, гомопиперидин-4-илокси и азетидин-3-илокси,

и где азетидинильная, пирролидинильная, пиперидинильная или гомопиперидинильная группа в пределах Q¹-Z- группы необязательно замещена у атома азота заместителем, выбранным из метила, этила, n-пропила, изопропила, n-бутила, изобутила, трет-бутила, аллила, 2-пропинала, ацетила, пропионила, метоксикарбонила, этоксикарбонила, пропоксикарбонила, трет-бутоксикарбонила, метилсульфонила, этилсульфонила, 2-метоксиэтила, карбамоилметила, N-метилкарбамоилметила, N,N-диметилкарбамоилметила, 2-карбамоилэтила, 2-(N-метилкарбамоил)этила, 2-(N,N-ди-

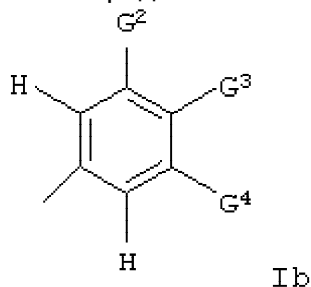
метилкарбамоил)этила, ацетилметила, 2-ацетилэтила, метоксикарбонилметила и 2-метоксикарбонилэтила,

и где любая гетероциклическая группа в пределах Q^1 -Z- группы необязательно имеет 1 или 2 оксо заместителя;

R^2 и R^3 представляют собой водород;

L представляет собой простую связь; и

Q^2 представляет собой арильную группу формулы Ib



где G^3 представляет собой группу формулы

$-X^{11}-Q^{10}$,

в которой X^{11} представляет собой простую связь или выбран из O, S, $N(R^{20})$, CO, $CH(OR^{20})$ и $C(R^{20})_2NR^{20}$, где R^{20} представляет собой водород или метил,

и Q^{10} представляет собой фенильную или бензильную группу, которая необязательно замещена одним или двумя заместителями, выбранными из фтора, хлора, брома, трифторметила, нитро, метила, этила, изопропила, этинила и циано, или Q^{10} представляет собой гетероарильную часть, выбранную из 2-1H-имидазолила, 2-1H-имидазолилметила, 4-тиазолилметила, 2-тиенилметила, 1,2,5-тиадиазол-3-ила, 1,2,5-тиадиазол-3-илметила, 3-изоксазолилметила, 2-, 3- или 4-пиридила, 2-, 3- или 4-пиридилметила, 8-хинолинила, и 8-хинолилметила, где гетероарильная часть необязательно замещена одним или двумя заместителями, выбранными из фтора, хлора, брома, трифторметила, метила, этинила и циано, и каждый из G^2 и G^4 независимо выбран из водорода, фтора, хлора, брома, метила, и этинила,

или его фармацевтически приемлемая соль.

15. Производное хиназолина формулы I, как указано в п.1, в которой

m представляет собой 1 и R^1 группа расположена в 7-м положении и выбрана из 3-пирролидин-1-илпропокси, 3-пирролидин-2-илпропокси, 3-пирролидин-3-илпропокси, 3-морфолинопропокси, 3-пиперидинопропокси, 3-пиперидин-2-илпропокси, 3-пиперидин-3-илпропокси, 3-пиперидин-4-илпропокси и 3-пиперазин-1-илпропокси,

и где любая гетероциклическая группа в пределах R^1 заместителя необязательно имеет заместитель, выбранный из гидрокси, карбамоила, метила, этила, аллила, ацетила, N-метилкарбамоила, N,N-диметилкарбамоила, 2-метоксиэтила, карбамоилметила, N,N-диметилкарбамоилметила, ацетилметила и цианометила,

и где любая гетероциклическая группа в пределах заместителя на R^1 необязательно имеет 1 оксо заместитель;

Z представляет собой O;

Q^1 представляет собой тетрагидрофуран-3-ил, тетрагидропиран-4-ил или тетрагидропиран-3-ил;

R^2 представляет собой водород; и

$Q^2LN(R^3)$ выбран из 3-хлор-4-фторанилино, 3-фторанилино, 3-броманилино, 3-хлоранилино, 3-метиланилино и 3-этиниланилино,

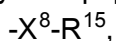
или его фармацевтически приемлемая соль.

16. Производное хиназолина формулы I, как указано в п.1, в которой

m представляет собой 0 или 1 и R^1 группа, если она присутствует, расположена в 7-м положении и выбрана из C_1 - C_3 -алкокси и C_1 - C_3 -алкокси- C_1 - C_3 -алкокси;

Z представляет собой O;

Q¹ выбран из пирролидин-3-ила, пиперидин-3-ила и пиперидин-4-ила, и где любая NH-группа в пределах пирролидинильной или пиперидинильной группы в Q¹ необязательно имеет заместитель, выбранный из C₁-C₃-алкила, аллила, ацетила, карбамоила, метоксикарбонила, этоксикарбонила, N-метилкарбамоила, N,N-диметилкарбамоила, или из группы формулы

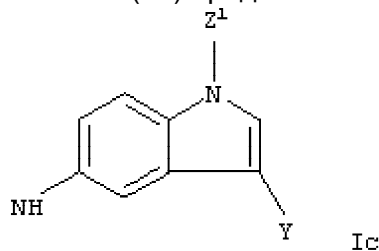


в которой X⁸ представляет собой простую связь и R¹⁵ представляет собой галоген-C₁-C₃-алкил, метокси-C₁-C₃-алкил, этокси-C₁-C₃-алкил, карбамоил-C₁-C₃-алкил, N-метилкарбамоил-C₁-C₃-алкил, N,N-диметилкарбамоил-C₁-C₃-алкил, ацетил-C₁-C₃-алкил или метоксикарбонил-C₁-C₃-алкил,

где любая пирролидинильная или пиперидинильная группа в пределах Q¹-Z- группы необязательно имеет 1 оксо заместитель;

R² представляет собой водород; и

Q²LN (R³) представляет собой группу формулы 1c

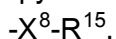


где Z¹ представляет собой водород или C₁-C₄-алкил; и Y выбран из водорода, галогена, C₁-C₄-алкила и циано, или его фармацевтически приемлемая соль.

17. Производное хиназолина формулы I, как указано в п.1, в которой m представляет собой 1 и R¹ группа расположена в 7-м положении и выбрана из C₁-C₃-алкокси и C₁-C₃-алкоксиC₁-C₃-алкокси;

Z представляет собой O;

Q¹ выбран из пирролидин-3-ила, пиперидин-3-ила и пиперидин-4-ила, и где любая NH-группа в пределах пирролидинильной или пиперидинильной группы в Q¹ необязательно имеет заместитель, выбранный из C₁-C₃-алкила, аллила, ацетила, карбамоила, метоксикарбонила, этоксикарбонила, N-метилкарбамоила и N,N-диметилкарбамоила, или из группы формулы



в которой X⁸ представляет собой простую связь, и R¹⁵ представляет собой галоген-C₁-C₃-алкил, метокси-C₁-C₃-алкил, этокси-C₁-C₃-алкил, карбамоил-C₁-C₃-алкил, N-метилкарбамоил-C₁-C₃-алкил, N,N-диметилкарбамоил-C₁-C₃-алкил, ацетил-C₁-C₃-алкил или метоксикарбонил-C₁-C₃-алкил, и где любая пирролидинильная или пиперидинильная группа в пределах Q¹-Z- группы необязательно имеет 1 оксо заместитель;

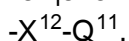
R² и R³ представляют собой водород;

L представляет собой простую связь; и

Q² представляет собой группу формулы 1a, как указано в п.1, в которой

G¹, G² и G⁵ представляют собой водород; и

G³ и G⁴ вместе образуют группу формулы -NH-CH=CH-, и индолильное кольцо, образованное при этом G³ и G⁴ вместе с атомами углерода, к которым они присоединены, замещено в 1-м положении группой формулы



в которой X¹² представляет собой простую связь и Q¹¹ представляет собой бензил, который необязательно замещен 1 или 2 заместителями, которые могут быть одинаковыми или разными, выбранными из фтора, хлора, брома, циано, метила и этила, и

где индолильное кольцо, образованное при этом G³ и G⁴ вместе с атомами углерода, к

которым они присоединены, необязательно замещено в 3-м положении заместителем, выбранным из хлора и брома,

или его фармацевтически приемлемая соль.

18. Производное хиразолина формулы I, как указано в п.1, в которой m представляет собой 1 и R¹ группа расположена в 7-м положении и выбрана из C₁-C₃-алкокси, C₁-C₃-алкоксиC₁-C₃-алкокси и пиперидин-4-илметокси;

Z представляет собой O;

Q¹ выбран из пирролидин-3-ила, пиперидин-3-ила, пиперидин-4-ила и тетрагидропиран-4-ила, и

где любая NH-группа в пределах пирролидинильной или пиперидинильной группы в Q¹ необязательно имеет заместитель, выбранный из C₁-C₃-алкила, аллила, ацетила, карбамоила, метоксикарбонила, этоксикарбонила, N-метилкарбамоила, N,N-диметилкарбамоила, или из группы формулы

-X⁸-R¹⁵,

в которой X⁸ представляет собой простую связь, и R¹⁵ представляет собой галоген-C₁-C₃-алкил, метокси-C₁-C₃-алкил, этокси-C₁-C₃-алкил, карбамоил-C₁-C₃-алкил, N-метилкарбамоил-C₁-C₃-алкил, N,N-ди-метилкарбамоил-C₁-C₃-алкил, ацетил-C₁-C₃-алкил или метоксикарбонил-C₁-C₃-алкил, и где любая пирролидинильная или пиперидинильная группа в пределах Q¹-Z- группы необязательно имеет 1 оксо заместитель;

R² и R³ представляют собой водород;

L представляет собой простую связь; и

Q² представляет собой группу формулы 1а, как указано в п.1, в которой

G¹, G² и G⁵ представляют собой водород;

G⁴ выбран из хлора, метила и этинила; и

G³ представляет собой группу формулы

-X¹¹-Q¹⁰,

в которой X¹¹ представляет собой O и Q¹ представляет собой бензил, который необязательно замещен 1 или 2 заместителями, которые могут быть одинаковыми или разными, выбранными из фтора, циано и метила,

или его фармацевтически приемлемая соль.

19. Производное хиразолина формулы I, как указано в п.1, в которой m представляет собой 1 и R¹ группа расположена в 7-м положении и выбрана из C₁-C₃-алкокси и C₁-C₃-алкоксиC₁-C₃-алкокси;

Z представляет собой O;

Q¹ выбран из пирролидин-3-ила, пиперидин-3-ила и пиперидин-4-ила, и где любая NH-группа в пределах пирролидинильной или пиперидинильной группы в Q¹ необязательно имеет заместитель, выбранный из C₁-C₃-алкила, аллила, ацетила, карбамоила, метоксикарбонила, этоксикарбонила, N-метилкарбамоила, N,N-диметилкарбамоила, или из группы формулы

-X⁸-R¹⁵,

в которой X⁸ представляет собой простую связь, и R¹⁵ представляет собой галоген-C₁-C₃-алкил, метокси-C₁-C₃-алкил, этокси-C₁-C₃-алкил, карбамоил-C₁-C₃-алкил, N-метилкарбамоил-C₁-C₃-алкил, N,N-ди-метилкарбамоил-C₁-C₃-алкил, ацетил-C₁-C₃-алкил или метоксикарбонил-C₁-C₃-алкил,

и где любая пирролидинильная или пиперидинильная группа в пределах Q¹-Z- группы необязательно имеет 1 оксо заместитель;

R² и R³ представляют собой водород;

L представляет собой простую связь; и

Q² представляет собой группу формулы 1а, как указано в п.1, в которой

G¹, G² и G⁵ представляют собой водород;

G⁴ выбран из хлора и метила; и

G³ представляет собой группу формулы

-X¹¹-Q¹⁰,

в которой X¹¹ представляет собой O и Q¹⁰ выбран из изоксазолметила и тиазолметила, и где гетероарильная группа в пределах Q¹⁰ необязательно имеет метильный заместитель,

или его фармацевтически приемлемая соль.

20. Производное хиназолина формулы I, как указано в п. 1, выбранное из 4-(3-хлоранилино)-7-(3-(R)-диметиламинопирролидин-1-ил)-5-(1-метилпиперидин-4-илокси)хиназолина;

4-(3-хлориндол-5-иламино)-5-(1-метилпиперидин-4-илокси)хиназолина;

4-(3-броманилино)-7-метокси-5-(1-метилпиперидин-4-илокси)хиназолина;

4-(3-хлориндол-5-иламино)-7-метокси-5-(1-метилпиперидин-4-илокси)хиназолина;

4-(3-этиниланилино)-7-метокси-5-(1-метилпиперидин-4-илокси)хиназолина;

4-(3-хлор-4-фторанилино)-7-метокси-5-(1-метилпиперидин-4-илокси)хиназолина;

4-(3-хлоранилино)-7-метокси-5-(1-метилпиперидин-4-илокси)хиназолина;

7-метокси-4-(3-метиланилино)-5-(1-метилпиперидин-4-илокси)хиназолина;

4-(индол-5-иламино)-7-метокси-5-(1-метилпиперидин-4-илокси)хиназолина;

4-(3-броманилино)-7-(2-метоксиэтокси)-5-(1-метилпиперидин-4-илокси)хиназолина;

4-(3-хлор-4-фторанилино)-7-метокси-5-(пиперидин-4-илокси)хиназолина;

4-(3-хлор-4-фторанилино)-5-(1-метилпиперидин-4-илокси)-7-(3-(пиперидин-1-ил)пропокси)хиназолина;

4-(3-хлор-4-фторанилино)-5-(1-метилпиперидин-4-илокси)-7-(2-(4-изопропил-пиперазин-1-ил)этокси)хиназолина;

4-(3-хлор-4-фторанилино)-7-[3-(N-(2-гидроксиэтил)-N-метиламино)пропокси]-5-(тетрагидропиран-4-илокси)хиназолина;

4-(3-хлор-4-фторанилино)-7-[3-(N-(2-диметиламиноэтил)-N-метиламино)пропокси]-5-(тетрагидропиран-4-илокси)хиназолина; и 4-(3-хлор-4-фторанилино)-7-(3-(4-метилпиперазин-1-ил)пропокси)-5-(тетрагидрофуран-3-илокси)хиназолина;

или его фармацевтически приемлемой кислото-аддитивной соли.

21. Производное хиназолина формулы I, как указано в п. 1, выбранное из:

4-(3-броманилино)-7-(3-(R)-диметиламинопирролидин-1-ил)-5-(1-метилпиперидин-4-илокси)хиназолина;

4-(3-броминдол-5-иламино)-7-метокси-5-(1-метилпиперидин-4-илокси)хиназолина;

4-(3-хлор-4-бензилоксианилино)-7-метокси-5-(1-метилпиперидин-4-илокси)хиназолина;

4-(3-хлор-4-(3-фторбензилокси)анилино)-7-метокси-5-(1-метилпиперидин-4-илокси)хиназолина;

4-(3-метил-4-(5-метилизоксазол-3-илметокси)анилино)-7-метокси-5-(1-метилпиперидин-4-илокси)хиназолина;

4-(3-метил-4-(тиазол-4-илметокси)анилино)-7-метокси-5-(1-метилпиперидин-4-илокси)хиназолина;

4-(1-(3-фторбензил)индол-5-иламино)-7-метокси-5-(1-метилпиперидин-4-илокси)хиназолина;

4-(1-(2-фторбензил)индол-5-иламино)-7-метокси-5-(1-метилпиперидин-4-илокси)хиназолина;

4-(3-хлор-4-фторанилино)-7-(3-морфолинопропокси)-5-(тетрагидрофуран-3-илокси)хиназолина;

4-(3-хлор-4-фторанилино)-7-(3-пирролидин-1-илпропокси)-5-(тетрагидрофуран-3-илокси)хиназолина;

2-[4-(4-(3-хлор-4-фторанилино)-7-метоксихиназолин-5-илокси)пиперидин-1-ил]ацетамида;

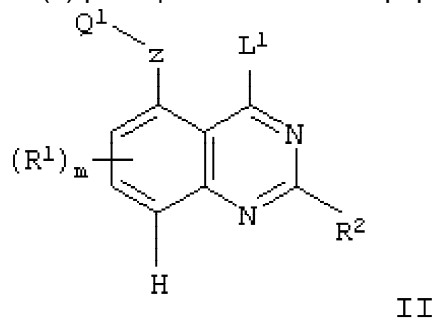
4-(3-хлор-4-фторанилино)-7-(2-метоксиэтокси)-5-(1-метилпиперидин-4-илокси)хиназолина; и

4-(3-хлор-4-фторанилино)-7-[3-(4-(N,N-диметилкарбамоилметил)пиперазин-1-

ил)пропокси]-5-(тетрагидрофуран-3-илокси)хиназолина,
или его фармацевтически приемлемой кислото-аддитивной соли.

22. Способ получения производного хиназолина формулы I или его фармацевтически приемлемой соли, в соответствии с п.1, который предусматривает

(а) реакцию хиназолина формулы II

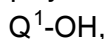


где L¹ представляет собой вытесняемую группу и Q¹, Z, m, R¹ и R² имеют значения, указанные в п.1, за исключением того, что любая функциональная группа, при необходимости, защищена, с соединением формулы

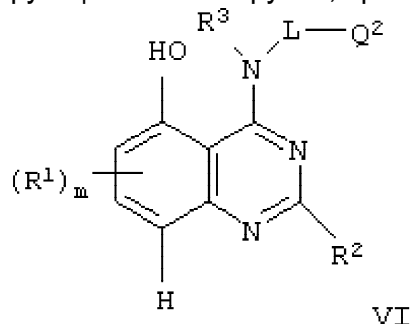


где Q², L и R³ имеют значения, указанные в п.1, за исключением того, что любая функциональная группа, при необходимости, защищена, затем любую имеющуюся защитную группу удаляют при помощи обычных способов; или

(б) для получения тех соединений формулы I, в которых Z представляет собой атом кислорода, сочетание, как правило, в присутствии подходящего осушителя, спирта формулы

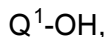


где Q¹ имеет значения, указанные в п.1, за исключением того, что любая функциональная группа, при необходимости, защищена, с хиназолином формулы VI

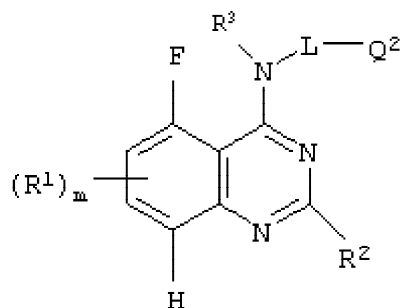


где m, R¹, R², R³, L и Q² имеют значения, указанные в п.1, за исключением того, что любая функциональная группа, при необходимости, защищена, затем любую имеющуюся защитную группу удаляют при помощи обычных способов; или

(в) для получения тех соединений формулы I, в которых Z представляет собой O, реакцию спирта формулы



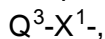
где Q¹ имеет значения, указанные в п.1, за исключением того, что любая функциональная группа, при необходимости, защищена, с хиназолином формулы VIII



VIII

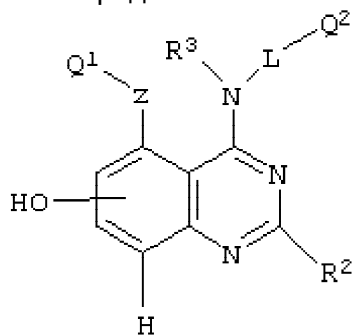
где m , R^1 , R^2 , R^3 , L и Q^2 имеют значения, указанные в п.1, за исключением того, что любая функциональная группа, при необходимости, защищена, затем любую имеющуюся защитную группу удаляют при помощи обычных способов; или

(г) для получения тех соединений формулы I, в которых m представляет собой 1 и R^1 представляет собой группу формулы



где Q^3 представляет собой

арил- C_1 - C_6 -алкильную, C_3 - C_7 -циклоалкил- C_1 - C_6 -алкильную, C_3 - C_7 -циклоалкенил- C_1 - C_6 -алкильную, гетероарил- C_1 - C_6 -алкильную или гетероцикл- C_1 - C_6 -алкильную группу и X^1 представляет собой O, сочетание хиназолина формулы XI



XI

где Q^1 , Z , L , R^2 , R^3 и Q^2 имеют значения, указанные в п.1, за исключением того, что любая функциональная группа, при необходимости, защищена, со спиртом формулы Q^3OH , где любая функциональная группа в Q^3 , при необходимости, защищена, затем любую имеющуюся защитную группу удаляют при помощи обычных способов; или

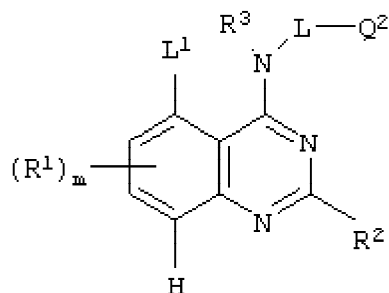
(д) для получения тех соединений формулы I, в которых R^1 представляет собой гидроксильную группу, расщепление производного хиназолина формулы I, где R^1 представляет собой C_1 - C_6 -алкокси или арилметокси группу; или

(е) для получения тех соединений формулы I, в которых Q^1 , R^1 или Q^2 содержит первичную или вторичную аминогруппу, расщепление соответствующего соединения формулы I, где Q^1 , R^1 или Q^2 содержит защищенную первичную или вторичную аминогруппу; или

(ж) для получения тех соединений формулы I, в которых Q^1 , R^1 или Q^2 содержит C_1 - C_6 -алкокси или замещенную C_1 - C_6 -алкокси группу или C_1 - C_6 -алкиламино или замещенную C_1 - C_6 -алкиламино группу, алкилирование производного хиназолина формулы I, где Q^1 , R^1 или Q^2 содержит гидроксильную группу или первичную или вторичную аминогруппу, если это является приемлемым; или

(з) для получения тех соединений формулы I, в которых Q^1 , R^1 или Q^2 содержит аминоксигидрокси-замещенную C_1 - C_6 -алкокси группу, реакцию соединения формулы I, где Q^1 , R^1 или Q^2 содержит эпокси-замещенную C_1 - C_6 -алкокси группу, с гетероциклическим соединением или подходящим амином; или

(и) реакцию хиназолина формулы XII



XII

где L^1 представляет собой вытесняемую группу и m , R^1 , R^2 , R^3 и Q^2 имеют значения, указанные в п.1, за исключением того, что любая функциональная группа, при необходимости, защищена, с соединением формулы



где Q^1 и Z имеют значения, указанные в п.1, за исключением того, что любая функциональная группа, при необходимости, защищена, затем любую имеющуюся защитную группу удаляют при помощи обычных способов; или

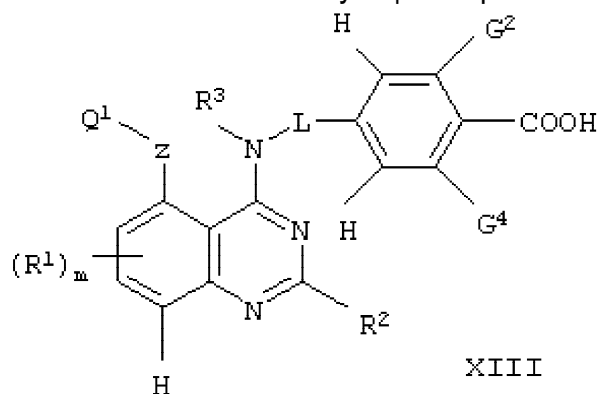
(к) для получения тех соединений формулы I, в которых Q^1 , R^1 или Q^2 содержит аминозамещенную C_1 - C_6 -алкокси группу, реакцию соединения формулы I, где Q^1 , R^1 или Q^2 содержит галоген-замещенную C_1 - C_6 -алкокси группу, с гетероциклическим соединением или подходящим амином; или

(л) для получения тех соединений формулы I, в которых гетероциклическая группа в R^1 , Q^1 или Q^3 содержит S- или N-оксид, окисление кольцевого атома азота или серы в соединении формулы (I); или

(м) для получения тех соединений формулы I, в которых Q^2 представляет собой группу формулы 1a и

(I) G^3 представляет собой группу формулы $\text{CON}(R^{20})Q^{10}$, где R^{20} и Q^{10} имеют значения, указанные в п.1, или

(II) G^3 представляет собой группу формулы $\text{CO}Q^{10}$ и Q^{10} представляет собой связанную с атомом азота гетероциклическую группу, сочетание соответствующего карбокси-замещенного хиназолина формулы XIII



XIII

или его реакционноспособного производного, с амином формулы $\text{NH}(R^{20})Q^{10}$ или $Q^{10}\text{H}$, если это является приемлемым, где R^1 , R^2 , R^3 , R^{20} , Q^1 , Q^{10} , Z , L , m , G^2 и G^4 имеют значения, указанные выше, за исключением того, что любая функциональная группа, при необходимости, защищена, затем любую имеющуюся защитную группу удаляют при помощи обычных способов; или

(н) для получения тех соединений формулы I, в которых G^3 в Q^2 представляет собой группу формулы $\text{O}Q^{10}$, где Q^{10} представляет собой арил C_1 - C_6 -алкил, гетероарил C_1 - C_6 -алкил, или гетероарил, взаимодействие соединения формулы I, где G^3 в Q^2 представляет собой OH , с соединением формулы $Q^{10}\text{-}L^1$, где L^1 представляет собой вытесняемую группу, и любая функциональная группа в Q^{10} , при необходимости, защищена, и затем любую имеющуюся защитную группу удаляют при помощи обычных

способов; или

(о) для получения тех соединений формулы I, в которых любой из Q^1 , R^1 или Q^2 содержит C_2 - C_6 -алканоиламино, замещенную C_2 - C_6 -алканоиламино группу, ацилирование производного хиназолина формулы I, где Q_1 , R_1 или Q_2 содержит аминогруппу; или

(п) для получения тех соединений формулы I, в которых R^1 , Q^1 или Q^2 содержит C_1 - C_6 -алкиламино или замещенную C_1 - C_6 -алкиламино группу или связанную с атомом азота гетероциклическую группу, восстановительное аминирование альдегидной или кетонной группы в соединении формулы 1, с C_1 - C_6 -алкиламино, замещенной C_1 - C_6 -алкиламино группой или с гетероциклом, содержащим NH-группу, в присутствии подходящего восстановителя; или

(р) превращение одного соединения формулы I в другое соединение формулы I; и если требуется фармацевтически приемлемая соль производного хиназолина формулы I, то она может быть получена при помощи стандартной методики.

23. Фармацевтическая композиция, которая содержит производное хиназолина формулы I или его фармацевтически приемлемую соль, как указано в п.1, в сочетании с фармацевтически приемлемым разбавителем или носителем.

24. Производное хиназолина формулы I или его фармацевтически приемлемая соль, как указано в п.1, для применения в способе терапевтического лечения человека или животного.

25. Применение производного хиназолина формулы I или его фармацевтически приемлемой соли, как указано в п.1, для приготовления лекарственного средства для профилактики или лечения опухолей, которые чувствительны к ингибированию одной или более erbB рецепторных тирозинкиназ.