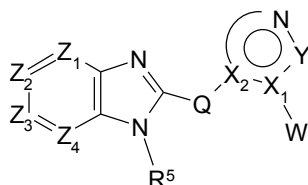


1. Сполука Формули:



або її фармацевтично прийнятна сіль, де:

Z₁ – азот або CR₁;

Z₂ – азот або CR₂;

Z₃ – азот або CR₃;

Z₄ – азот або CR₄;

за умови, що не більше двох із груп Z₁, Z₂, Z₃ і Z₄ є атомами азоту;

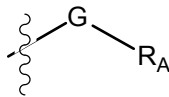
R₁, R₂, R₃ і R₄ незалежно один від одного вибрані із групи, до якої входять:

i) водень, галоїд, гідрокси-, нітро-, ціано-, аміногрупа, галоїдалкіл та галоїдалкоксигрупа,

ii) алкіл, алкоксигрупа, циклоалкіл, алкеніл, алкініл, (циклоалкіл)алкіл, -NH(R₁₀), -N(R₁₀)(R₁₁), гідроксіалкіл, аміноалкіл, (R₁₀)NH-алкіл-, (R₁₀)(R₁₁)N-алкіл-, алканоїл, алкоксикарбоніл, (гетероциклоалкіл)алкіл, алкілсульфоніл, алкілтіогрупа, моно- або діалкіламінокарбоніл, гетероциклоалкіл, арил і гетероарил, кожний з яких факультативно заміщений 1, 2, 3 або 4 групами R₂₀,

де R₁₀ і R₁₁ незалежно один від одного вибрані в кожному випадку із групи, до якої входять алкіл, алкеніл, алкініл, алкоксигрупа, циклоалкіл, (циклоалкіл)алкіл, арил, арилалкіл, алканоїл та моно- і діалкіламіноалкіл; і

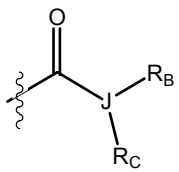
iii) група Формули:



де G – зв'язок, алкіл, -O-, -C(=O)- або -CH₂C(=O)- і

R_A – насичена, частково ненасичена або ароматична карбоциклічна система, яка складається з одного циклу або двох конденсованих, неконденсованих або з'єднаних спільним атомом циклів (спіроциклічна система), де кожний цикл містить 0, 1 або 2 гетероатоми, незалежно один від одного вибрані із групи, яка включає N, S та O, причому згадана насичена, частково ненасичена або ароматична карбоциклічна система факультативно заміщена 1, 2, 3 або 4 групами R₂₀,

iv) група Формули



де J – N, CH або C-алкіл, а

R_B і R_C незалежно один від одного вибрані із групи, до якої входять водень, алкіл, алкеніл, алкініл, алкоксигрупа, циклоалкіл, (циклоалкіл)алкіл, гетероциклоалкіл, арил, арилалкіл, алканоїл, гетероарил, моно- та діалкіламіноалкіл, кожний з яких факультативно заміщений 1 або 2 замісниками, незалежно один від одного вибраними із групи, яка включає галоїд, гідрокси-, ціано-, аміно-, нітро-, алкоксигрупу та алкіл; або R_B і R_C спільно з атомом, до якого вони приєднані, утворюють 4-10-членну моноциклічну або біциклічну систему, яка може містити:

a) один або кілька подвійних зв'язків,

b) одну або кілька оксогруп, O, S, SO, SO₂ або N-R_D, де R_D – водень, Ar₁, алкіл, циклоалкіл, гетероциклоалкіл або Ar₁-алкіл; де Ar₁ – арил або гетероарил, кожний з яких факультативно заміщений 1 або 2 замісниками, незалежно один від одного вибраними із групи, яка включає галоїд, гідрокси-, ціано-, аміно-, нітро-, алкоксигрупу та алкіл; та/або

c) один або кілька замісників R₂₀;

v) -OC(=O)R_E, -C(=O)OR_E, -C(=O)NH₂, -C(=O)NHR_E, -C(=O)NR_ER_F, -S(O)_nR_E, -S(O)_nNH₂, -S(O)_nNHR_E, -S(O)_nNR_ER_F, -NHC(=O)R_E, -C(=NR_E)R_F, -HC=N-OH, -HC=N-(алкокси), -HC=N-(алкіл), -NR_EC(=O)R_F, -NHS(O)_mR_E і -NR_ES(O)_mR_F, де m – 0, 1 або 2, і

R_E і R_F в кожному випадку незалежно один від одного вибрані із групи, яка включає алкіл, циклоалкіл, гетероциклоалкіл, алкоксигрупу, моно- або діалкіламіногрупу, арил або гетероарил, кожний з яких факультативно заміщений 1, 2 або 3 групами R₃₀;

R₂₀ незалежно вибраний в кожному випадку із групи, до якої входять: галоїд; гідрокси-; нітро-; ціано-; аміногрупа; алкіл; алкоксигрупа, факультативно заміщена аміногрупою або моно- чи діалкіламіногрупою; циклоалкіл; циклоалкілалкіл; циклоалкілалкоксигрупа; алкеніл; алкініл; галоїдний алкіл; оксо-; галоїдалкоксигрупа; моно- або діалкіламіногрупа; аміноалкіл та моно- та діалкіламіноалкіл;

R₃₀ незалежно вибраний в кожному випадку із групи, до якої входять: галоїд, гідрокси-, нітро-, ціано-, аміногрупа, алкіл, алкоксигрупа, факультативно заміщена аміногрупою або моно- чи діалкіламіногрупою, циклоалкіл, циклоалкілалкіл, циклоалкілалкоксигрупа, гетероциклоалкіл, алкеніл, алкініл, галоїдний алкіл, галоїдалкоксигрупа, оксогрупа, моно- або діалкіламіногрупа, аміноалкіл та моно- та діалкіламіноалкіл;

R₅ є водень або галоїдалкіл; або

R₅ є алкіл, циклоалкіл або (циклоалкіл)алкіл, кожний з яких може містити один або кілька подвійних або потрійних зв'язків і кожний з яких факультативно заміщений 1, 2 або 3 групами R₃₀, або

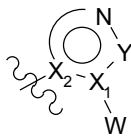
R_5 є арил, арилалкіл, гетероарил або гетероарилалкіл, кожний з яких факультативно заміщений 1, 2 або 3 замісниками, вибраними із групи, до якої входять галоїдалкіл, аміногрупа, $-\text{NH}(R_{10})$, $-\text{N}(R_{10})(R_{11})$, карбоксамідогрупа, $(R_{10})\text{NH}$ карбоніл, $(R_{10})(R_{11})\text{N}$ карбоніл, галоїд, гідрокси-, нітро-, ціано-, аміногрупа, алкіл, алкоксигрупа, факультативно заміщена аміногрупою або моно- чи діалкіламіногрупою, циклоалкіл, циклоалкілалкіл, циклоалкілалкоксигрупа, гетероциклоалкіл, алкеніл, алкініл, галоїдалкіл, галоїдалкоксигрупа, аміноалкіл та моно- та діалкіламіноалкіл;

Q є $-\text{C}(R_6)(R_7)$ або кисень,

за умови, що Q не є киснем, якщо X_2 – азот;

R_6 і R_7 незалежно один від одного є водень, фтор або алкіл;

група:



є 5-7-членний гетероарил або гетероциклоалкіл, що містить до 4 гетероатомів, вибраних із групи, яка включає азот, сірку та кисень, причому згаданий 5-7-членний гетероарил або гетероциклоалкіл заміщений при кожному атомі вуглецю групою R і при кожному атомі азоту, доступному для заміщення, групою R' ,

R незалежно в кожному випадку вибраний із групи, до якої входять водень, галоїд, аміногрупа, алкіл, алкеніл, алкініл, алкоксигрупа, циклоалкіл, (циклоалкіл)алкіл, галоїдний алкіл, галоїдалкокси-, карбоксамідогрупа та 3-7-членні карбоциклічні або гетероциклічні групи, які є насиченими, ненасиченими або ароматичними і які можуть бути додатково заміщені одним або кількома замісниками, незалежно один від одного вибраними із групи, яка включає галоїд, оксо-, гідроксигрупу, алкіл та алкоксигрупу;

R' незалежно в кожному випадку вибраний із групи, до якої входять алкіл, водень, циклоалкіл, циклоалкіл(алкіл) та 3-7-членні карбоциклічні або гетероциклічні групи, які є насиченими, ненасиченими або ароматичними, причому згадані 3-7-членні карбоциклічні або гетероциклічні групи факультативно заміщені одним або кількома замісниками, незалежно один від одного вибраними із групи, яка включає галоїд, оксо-, гідроксигрупу, алкіл та алкоксигрупу;

X_1 і X_2 незалежно один від одного є азот, вуглець або CH .

Y – азот, кисень, вуглець, $-\text{CH}$ -, $-\text{CH}_2$ - або є відсутнім.

W є арил або гетероарил, де арильна або гетероарильна група факультативно заміщена замісниками в кількості до 4, незалежно один від одного вибраними із групи, до якої входять R_{30} , $-\text{CO}_2\text{H}$, $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_E$, $-\text{C}(=\text{O})\text{NHR}_E$, $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_E\text{R}_F$, $-\text{C}(\text{O})\text{R}_E$, $-\text{S}(\text{O})_m\text{R}_E$, $-\text{OR}_E$, де R_{30} і R_E відповідають поданим вище визначенням і m – 0, 1 або 2.

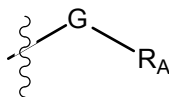
2. Сполука або сіль за п. 1, де

R_1 , R_2 , R_3 і R_4 незалежно один від одного вибрані із групи, до якої входять:

i) водень, галоїд, гідрокси-, нітро-, ціано-, аміногрупа, галоїд- $(\text{C}_1\text{-C}_6)$ -алкіл та галоїд- $(\text{C}_1\text{-C}_6)$ -алкоксигрупа;

ii) $(\text{C}_1\text{-C}_6)$ -алкіл, $(\text{C}_1\text{-C}_6)$ -алкоксигрупа, $(\text{C}_3\text{-C}_8)$ -циклоалкіл, $(\text{C}_2\text{-C}_6)$ -алкеніл, алкініл, $((\text{C}_3\text{-C}_8)$ -циклоалкіл)- $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -алкіл, $-\text{NH}(R_{10})$, $-\text{N}(R_{10})(R_{11})$, гідрокси- $(\text{C}_1\text{-C}_6)$ -алкіл, аміно- $(\text{C}_1\text{-C}_6)$ -алкіл, $(R_{10})\text{NH}$ - $(\text{C}_1\text{-C}_6)$ -алкіл, $(R_{10})(R_{11})\text{N}$ - $(\text{C}_1\text{-C}_6)$ -алкіл, $(\text{C}_1\text{-C}_6)$ -алканол, $(\text{C}_1\text{-C}_6)$ -алкоксикарбоніл, $(\text{C}_1\text{-C}_6)$ -алкілсульфоніл, $(\text{C}_1\text{-C}_6)$ -алкілтіогрупа, моно- або ді- $(\text{C}_1\text{-C}_6)$ -алкіламінокарбоніл, гетероциклоалкіл, (гетероциклоалкіл)- $\text{C}_1\text{-C}_4$ -алкіл, арил та гетероарил, кожний з яких факультативно заміщений 1, 2, 3 або 4 групами R_{20} , де R_{10} і R_{11} незалежно один від одного вибрані із групи, до якої входять $(\text{C}_1\text{-C}_6)$ -алкіл, $(\text{C}_2\text{-C}_6)$ -алкеніл, $(\text{C}_1\text{-C}_6)$ -алкоксигрупа, $(\text{C}_3\text{-C}_8)$ -циклоалкіл, $(\text{C}_3\text{-C}_8)$ -циклоалкілалкіл, арил, арил- $(\text{C}_1\text{-C}_6)$ -алкіл, $(\text{C}_1\text{-C}_6)$ -алканол, моно- та ді- $(\text{C}_1\text{-C}_6)$ -алкіламіноалкіл;

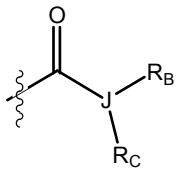
iii) група формули:



де G – $(\text{C}_1\text{-C}_6)$ -алкіл, $-\text{O}-$, $-\text{C}(=\text{O})-$ або $-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})-$, і

R_A – насичена, частково ненасичена або ароматична карбоциклічна система, яка складається з одного циклу або двох конденсованих, неконденсованих або з'єднаних спільним атомом циклів (спіроциклічна система), де кожний цикл складається з 3-8 атомів і містить 0, 1 або 2 гетероатоми, незалежно один від одного вибрані із групи, яка включає N , S та O , причому згадана насичена, частково ненасичена або ароматична карбоциклічна система факультативно заміщена 1, 2, 3 або 4 групами R_{20} ,

iv) група формули



де J – N , CH або $\text{C}-(\text{C}_1\text{-C}_6)$ -алкіл, та

R_B і R_C незалежно один від одного вибрані із групи, до якої входять водень, $(\text{C}_1\text{-C}_6)$ -алкіл, $(\text{C}_2\text{-C}_6)$ -алкеніл, $(\text{C}_2\text{-C}_6)$ -алкініл, $(\text{C}_1\text{-C}_6)$ -алкоксигрупа, $(\text{C}_3\text{-C}_8)$ -циклоалкіл, $(\text{C}_3\text{-C}_8)$ -циклоалкіл)- $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -алкіл, гетероциклоалкіл, арил, арил- $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -алкіл, $(\text{C}_1\text{-C}_6)$ -алканол, гетероарил та моно- або ді- $(\text{C}_1\text{-C}_6)$ -алкіламіно- $(\text{C}_1\text{-C}_6)$ -алкіл, кожний з яких факультативно заміщений 1 або 2 замісниками, незалежно один від одного вибраними із групи, яка включає галоїд, гідрокси-, ціано-, аміно-, нітро-, $\text{C}_1\text{-C}_6$ -алкоксигрупу та $\text{C}_1\text{-C}_6$ -алкіл; або

R_B і R_C спільно з атомом, до якого вони приєднані, утворюють 4-10-членну моноциклічну або біциклічну

систему, яка може містити:

а) один або кілька подвійних зв'язків,

б) одну або кілька оксогруп, O, S, SO, SO₂ або N-R_D, де R_D – водень, Ar₁, (C₁-C₆)-алкіл, (C₃-C₈)-циклоалкіл, гетероциклоалкіл або Ar₁-(C₁-C₆)-алкіл; де Ar₁ – арил або гетероарил, кожний з яких факультативно заміщений 1 або 2 замісниками, незалежно один від одного вибраними із групи, яка включає галоїд, гідрокси-, ціано-, аміно-, нітро-, C₁-C₆-алкоксигрупу та C₁-C₆-алкіл; та/або

с) один або кілька замісників R₂₀;

у) -OC(=O)R_E, -C(=O)OR_E, -C(=O)NH₂, -C(=O)NHR_E, -C(=O)NR_ER_F, -S(O)_nR_E, -S(O)_nNH₂, -S(O)_nNHR_E, -S(O)_nNR_ER_F, -NHC(=O)R_E, -C(=NR_E)R_F, -HC=N-OH, -HC=N-(C₁-C₆-алкокси), -HC=N-(C₁-C₆-алкіл), -NR_EC(=O)R_F, -NHS(O)_mR_E і -NR_ES(O)_mR_F, де m – 0, 1 або 2, і

R_E і R_F незалежно один від одного вибрані в кожному випадку із групи, яка включає (C₁-C₆)-алкіл, (C₃-C₈)-циклоалкіл, гетероциклоалкіл, (C₁-C₆)-алкоксигрупу, моно- або ді-(C₁-C₆)-алкіламіногрупу, арил та гетероарил, кожний з яких факультативно заміщений 1, 2 або 3 групами R₃₀;

R₂₀ незалежно вибраний в кожному випадку із групи, до якої входять: галоїд; гідрокси-; нітро-; ціано-; аміногрупа; (C₁-C₆)-алкіл; (C₁-C₆)-алкоксигрупа, факультативно заміщена аміногрупою або моно- чи ді-(C₁-C₆)-алкіламіногрупою; (C₃-C₈)-циклоалкіл; (C₃-C₈)-циклоалкіл-(C₁-C₄)-алкіл; (C₃-C₈)-циклоалкіл-(C₁-C₄)-алкоксигрупа; (C₂-C₆)-алкеніл; (C₂-C₆)-алкініл; галоїд-(C₁-C₆)-алкіл; галоїд-(C₁-C₆)-алкоксигрупа; оксогрупа; моно- та ді-(C₁-C₆)-алкіламіногрупа; аміно-(C₁-C₆)-алкіл; і моно- та ді-(C₁-C₆)-алкіламіно-(C₁-C₆)-алкіл;

R₃₀ незалежно вибраний в кожному випадку із групи, до якої входять галоїд, гідрокси-, нітро-, ціано-, аміногрупа, (C₁-C₆)-алкіл, (C₁-C₆)-алкоксигрупа, факультативно заміщена аміногрупою або моно- чи ді-(C₁-C₆)-алкіламіногрупою, (C₃-C₈)-циклоалкіл, (C₃-C₈)-циклоалкіл-(C₁-C₄)-алкіл, (C₃-C₈)-циклоалкіл-(C₁-C₄)-алкоксигрупа, гетероциклоалкіл, (C₂-C₆)-алкеніл, (C₂-C₆)-алкініл, галоїд-(C₁-C₆)-алкіл, галоїд-(C₁-C₆)-алкоксигрупа, оксогрупа, моно- та ді-(C₁-C₆)-алкіламіногрупа, аміно-(C₁-C₆)-алкіл та моно- та ді-(C₁-C₆)-алкіламіно-(C₁-C₆)-алкіл;

R₅ є водень або галоїд-(C₁-C₆)-алкіл; або

R₅ є (C₁-C₆)-алкіл, (C₃-C₈)-циклоалкіл або (C₃-C₈-циклоалкіл)-(C₁-C₄)-алкіл, кожний з яких може містити один або кілька подвійних або потрійних зв'язків і кожний з яких факультативно заміщений 1, 2 або 3 групами R₃₀, або

R₅ є арил, арил-(C₁-C₄)-алкіл, гетероарил або гетероарил-(C₁-C₄)-алкіл, кожний з яких факультативно заміщений 1, 2 або 3 замісниками, вибраними із групи, до якої входять:

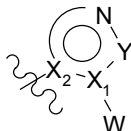
галоїд-(C₁-C₆)-алкіл, аміногрупа, -NH(R₁₀), -N(R₁₀)(R₁₁), карбоксамідогрупа, NH(R₁₀)карбоніл, N(R₁₀)(R₁₁)карбоніл, галоїд, гідрокси-, нітро-, ціано-, аміногрупа, (C₁-C₆)-алкіл, (C₁-C₆)-алкоксигрупа, факультативно заміщена аміногрупою або моно- або ді-(C₁-C₆)-алкіламіногрупою, (C₃-C₈)-циклоалкіл, (C₃-C₈)-циклоалкіл-(C₁-C₄)-алкіл, (C₃-C₈)-циклоалкіл-(C₁-C₄)-алкоксигрупа, гетероцикло-(C₁-C₄)-алкіл, (C₂-C₆)-алкеніл, (C₂-C₆)-алкініл, галоїд-(C₁-C₆)-алкіл, галоїд-(C₁-C₆)-алкоксигрупа, аміно-(C₁-C₆)-алкіл і моно- та ді-(C₁-C₆)-алкіламіно-(C₁-C₆)-алкіл;

Q є -C(R₆)(R₇) або кисень,

за умови, що Q не є киснем, якщо X₂ – азот;

R₆ та R₇ незалежно один від одного є водень, фтор або C₁-C₆-алкіл;

група:



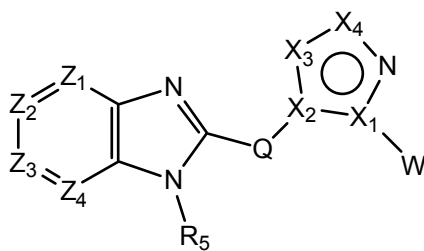
є 5-7-членний гетероарил або гетероциклоалкіл, що містить до 4 гетероатомів, вибраних із групи, яка включає азот, сірку та кисень, причому згаданий 5-7-членний гетероарил або гетероциклоалкіл заміщений при кожному атомі вуглецю групою R і при кожному атомі азоту, доступному для заміщення, групою R';

R незалежно в кожному випадку вибраний із групи, до якої входять водень, галоїд, аміногрупа, (C₁-C₆)-алкіл, (C₂-C₆)-алкеніл, (C₂-C₆)-алкініл, C₁-C₆-алкоксигрупа, (C₃-C₈)-циклоалкіл, (C₃-C₈-циклоалкіл)-(C₁-C₄)-алкіл, галоїд-(C₁-C₆)-алкіл, галоїдалкокси-, карбоксамідогрупа та 3-7-членні карбоциклічні або гетероциклічні групи, які є насиченими, ненасиченими або ароматичними і які можуть бути додатково заміщені одним або кількома замісниками, незалежно один від одного вибраними із групи, яка включає галоїд, оксо-, гідроксигрупу, C₁-C₄-алкіл та -O(C₁-C₄-алкіл);

R' незалежно в кожному випадку вибраний із групи, до якої входять водень, C₁-C₆-алкіл, C₃-C₈-циклоалкіл, C₃-C₈-циклоалкіл-(C₁-C₄-алкіл) та 3-7-членні карбоциклічні або гетероциклічні групи, які є насиченими, ненасиченими або ароматичними, причому згадані 3-7-членні карбоциклічні або гетероциклічні групи факультативно заміщені одним або кількома замісниками, незалежно один від одного вибраними із групи, яка включає галоїд, оксо-, гідроксигрупу, C₁-C₄-алкіл та -O(C₁-C₄-алкіл); і

X₁, X₂, W і Y відповідають визначенням за п. 1.

3. Сполука або сіль за п. 2 формули:



де $Z_1, Z_2, Z_3, Z_4, R_5, Q, X_1, X_2$ та W відповідають визначенням за п. 2;

X_3 і X_4 незалежно один від одного вибрані із групи, до якої входять вуглець, CR, N, O, S, NH і N-(C₁-C₆)-алкіл; за умови, що щонайменше одна з груп X_1, X_2, X_3 і X_4 є вуглець або CR, де

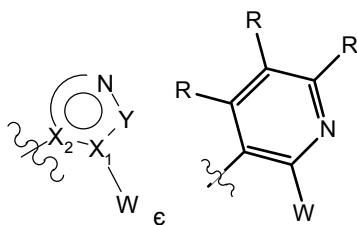
R незалежно вибраний в кожному випадку із групи, до якої входять водень, галогід, аміногрупа, (C₁-C₆)-алкіл, (C₁-C₆)-алкоксигрупа, (C₃-C₈)-циклоалкіл, (C₃-C₈)-циклоалкіл-(C₁-C₆)-алкіл, (C₂-C₆)-алкеніл, (C₂-C₆)-алкініл, галогід-(C₁-C₆)-алкіл, галогід-(C₁-C₆)-алкоксигрупа, карбоксамідогрупа та 3-7-членні карбоциклічні або гетероциклічні групи, які є насиченими, ненасиченими або ароматичними і які можуть бути додатково заміщені одним або кількома замісниками, незалежно один від одного вибраними із групи, яка включає галогід, оксо-, гідроксигрупу, C₁-C₄-алкіл та -O(C₁-C₄-алкіл).

4. Сполука або сіль за будь-яким із пп. 1-3, де Z_1 – CR₁; Z_2 – CR₂; Z_3 – CR₃ і Z_4 – CR₄.

5. Сполука або сіль за п. 2, де:

Z_1 – CR₁; Z_2 – CR₂; Z_3 – CR₃; Z_4 – CR₄;

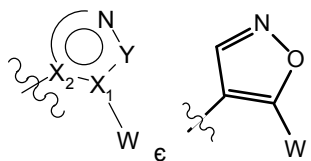
і група



6. Сполука або сіль за п. 2, де:

Z_1 – CR₁; Z_2 – CR₂; Z_3 – CR₃; Z_4 – CR₄;

і група



7. Сполука або сіль за п. 1, де одна і тільки одна із груп Z_1, Z_2, Z_3 і Z_4 є азотом.

8. Сполука або сіль за п. 2, де одна і тільки одна із груп Z_1, Z_2, Z_3 і Z_4 є азотом.

9. Сполука або сіль за п. 3, де:

Z_1 – CR₁; Z_2 – CR₂; Z_3 – CR₃; Z_4 – CR₄;

X_1 – вуглець; X_2 – азот; X_3 – CR; X_4 – азот; і Q – C(R₆)(R₇).

10. Сполука або сіль за п. 3, де:

Z_1 – CR₁; Z_2 – CR₂; Z_3 – CR₃; Z_4 – CR₄;

X_1 – вуглець; X_2 – азот; X_3 – азот; X_4 – CR; і Q – C(R₆)(R₇).

11. Сполука або сіль за п. 3, де:

Z_1 – CR₁; Z_2 – CR₂; Z_3 – CR₃; Z_4 – CR₄;

X_1 – вуглець; X_2 – вуглець; X_3 – S; X_4 – CR.

12. Сполука або сіль за п. 3, де:

Z_1 – CR₁; Z_2 – CR₂; Z_3 – CR₃; Z_4 – CR₄;

X_1 – азот; X_2 – вуглець; X_3 – азот; і X_4 – CR.

13. Сполука або сіль за п. 3, де:

Z_1 – CR₁; Z_2 – CR₂; Z_3 – CR₃; Z_4 – CR₄;

X_1 – вуглець; X_2 – вуглець; X_3 – NH або N-(C₁-C₆-алкіл); X_4 – CR.

14. Сполука або сіль за п. 3, де:

Z_1 – CR₁; Z_2 – CR₂; Z_3 – CR₃; Z_4 – CR₄;

X_1 – вуглець; X_2 – азот; X_3 – азот; і X_4 – азот; і Q – C(R₆)(R₇).

15. Сполука або сіль за п. 3, де:

Z_1 – CR₁; Z_2 – CR₂; Z_3 – CR₃; Z_4 – CR₄;

X_1 – азот; X_2 – вуглець; X_3 – CR; і X_4 – азот.

16. Сполука або сіль за п. 14, де Q є C(R₆)(R₇).

17. Сполука або сіль за п. 3, де:

Z_1 – CR₁; Z_2 – CR₂; Z_3 – CR₃; Z_4 – CR₄;

X_1 – азот; X_2 – вуглець; X_3 – азот; X_4 – азот.

18. Сполука або сіль за п. 3, де одна і тільки одна із груп Z_1, Z_2, Z_3 і Z_4 є азотом.

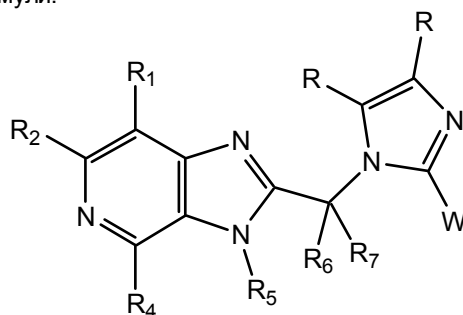
19. Сполука або сіль за п. 18, де:

Z_2 або Z_3 є азотом; і

W є 5-членна арильна або гетероарильна група, де згадана 5-членна арильна або гетероарильна група

факультативно заміщена групами в кількості до 4, незалежно одна від одної вибраними із групи, до якої входять R_{30} , $-CO_2H$, $-C(=O)OR_E$, $-C(=O)NHR_E$, $-C(=O)NR_ER_F$, $-C(O)R_E$, $-S(O)_mR_E$ і $-OR_E$, де R_{30} і R_E відповідають поданим вище визначенням і $m = 0, 1$ або 2 .

20. Сполука або сіль за п. 19 формули:



де $R, R_1, R_2, R_4, R_5, R_6, R_7$ і W відповідають визначенням за п. 19.

21. Сполука або сіль за п. 20, де:

R незалежно вибраний в кожному випадку із групи, до якої входять:

i) водень, галоїд, (C_1-C_6) -алкіл, (C_3-C_8) -циклоалкіл, (C_3-C_8) -циклоалкіл- (C_1-C_6) -алкіл, (C_1-C_6) -алкоксигрупа, галоїд- (C_1-C_6) -алкіл, галоїд- (C_1-C_6) -алкоксигрупа, і

ii) феніл та піридил, кожний з яких факультативно заміщений замісниками в кількості до 3, незалежно один від одного вибраними із групи, до якої входять галоїд, гідроксигрупа, C_1-C_4 -алкіл і $-O-(C_1-C_4)$ -алкіл;

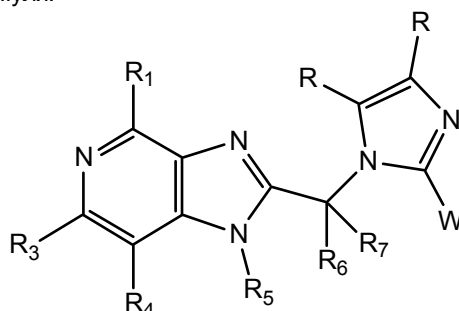
R_1, R_2 і R_4 незалежно один від одного вибрані із групи, до якої входять водень, галоїд, гідрокси-, нітро-, ціано-, аміногрупа, (C_1-C_6) -алкіл, (C_1-C_6) -алкоксигрупа, (C_3-C_8) -циклоалкіл, (C_3-C_8) -циклоалкіл- (C_1-C_6) -алкіл, (C_2-C_6) -алкеніл, (C_2-C_6) -алкініл, гетероциклоалкіл, галоїд- (C_1-C_6) -алкіл, галоїд- (C_1-C_6) -алкоксигрупа, моно- або ді- (C_1-C_6) -алкіламіногрупа, аміно- (C_1-C_6) -алкіл і моно- та ді- (C_1-C_6) -алкіламіно- (C_1-C_6) -алкіл;

R_5 є водень, (C_1-C_6) -алкіл, (C_3-C_8) -циклоалкіл, (C_3-C_8) -циклоалкіл- (C_1-C_6) -алкіл, феніл, бензил, тіофеніл, тiazоліл, піридил, імідазоліл, піразоліл або піримідиніл;

R_6 і R_7 незалежно один від одного є водень, фтор або C_1-C_6 -алкіл; і

W є тієніл, тiazоліл, імідазоліл, оксазоліл, триазоліл, тетразоліл, піразоліл або ізоксазоліл, кожний з яких факультативно заміщений групами R_{30} в кількості до 4.

22. Сполука або сіль за п. 19 формули:



де $R, R_1, R_3, R_4, R_5, R_6, R_7$ і W відповідають визначенням за п. 19.

23. Сполука або сіль за будь-яким із пп. 20 або 22, де:

R незалежно вибраний в кожному випадку із групи, до якої входять водень, галоїд і (C_1-C_2) -алкіл;

R_1 і R_4 незалежно один від одного вибрані із групи, до якої входять водень, галоїд, гідрокси-, нітро-, ціано-, аміногрупа, (C_1-C_6) -алкіл, (C_1-C_6) -алкоксигрупа, (C_3-C_8) -циклоалкіл, (C_3-C_8) -циклоалкіл- (C_1-C_6) -алкіл, галоїд- (C_1-C_6) -алкіл, галоїд- (C_1-C_6) -алкоксигрупа, моно- або ді- (C_1-C_6) -алкіламіногрупа, аміно- (C_1-C_6) -алкіл і моно- та ді- (C_1-C_6) -алкіламіно- (C_1-C_6) -алкіл;

R_5 є (C_1-C_6) -алкіл;

R_6 і R_7 є атоми водню; і

W є фураніл, тієніл, тiazоліл, імідазоліл, оксазоліл, триазоліл, тетразоліл, піразоліл або ізоксазоліл, кожний з яких факультативно заміщений групами R_{30} в кількості до 4.

24. Сполука або сіль за п. 23, де:

R_1 і R_4 незалежно один від одного вибрані із групи, до якої входять водень, галоїд, трифторметил, C_1-C_2 -алкіл і ціаногрупа; і

W – тiazоліл, факультативно заміщений одним або кількома замісниками, незалежно один від одного вибраними із групи, до якої входять галоїд, ціано-, гідрокси-, оксогрупа, C_1-C_2 -галоїдалкіл, C_1-C_2 -алкіл і C_1-C_2 -алкоксигрупа.

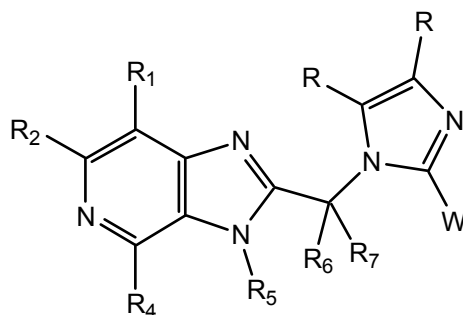
25. Сполука або сіль за п. 24, де W є 2-тіазоліл.

26. Сполука або сіль за п. 18, де:

Z_2 або Z_3 є атоми азоту; і

W є 6-членна арильна або гетероарильна група, де згадана 6-членна арильна або гетероарильна група факультативно заміщена групами в кількості до 4, незалежно одна від одної вибраними із групи, до якої входять R_{30} , $-CO_2H$, $-C(=O)OR_E$, $-C(=O)NHR_E$, $-C(=O)NR_ER_F$, $-C(O)R_E$, $-S(O)_mR_E$ і $-OR_E$, де R_{30} і R_E відповідають поданим вище визначенням і $m = 0, 1$ або 2 .

27. Сполука або сіль за п. 26 формули:



де R, R₁, R₂, R₄, R₅, R₆, R₇ і W відповідають визначенням за п. 26.

28. Сполука або сіль за п. 27, де:

R незалежно вибраний в кожному випадку із групи, до якої входять:

i) водень, галоїд, (C₁-C₆)-алкіл, (C₃-C₈)-циклоалкіл, (C₃-C₈)-циклоалкіл-(C₁-C₆)-алкіл, (C₁-C₆)-алкоксигрупа, галоїд-(C₁-C₆)-алкіл, галоїд-(C₁-C₆)-алкоксигрупа, і

ii) феніл та піридил, кожний з яких факультативно заміщений замісниками в кількості до 3, незалежно один від одного вибраними із групи, до якої входять галоїд, гідроксигрупа, C₁-C₄-алкіл і -O-(C₁-C₄-алкіл);

R₁, R₂ і R₄ незалежно один від одного вибрані із групи, до якої входять водень, галоїд, гідрокси-, нітро-, ціано-, аміногрупа, (C₁-C₆)-алкіл, (C₁-C₆)-алкоксигрупа, (C₃-C₈)-циклоалкіл, (C₃-C₈)-циклоалкіл-(C₁-C₆)-алкіл, (C₂-C₆)-алкеніл, (C₂-C₆)-алкініл, гетероциклоалкіл, галоїд-(C₁-C₆)-алкіл, галоїд-(C₁-C₆)-алкоксигрупа, моно- або ді-(C₁-C₆)-алкіламіногрупа, аміно-(C₁-C₆)-алкіл і моно- та ді-(C₁-C₆)-алкіламіно-(C₁-C₆)-алкіл;

R₅ є водень, (C₁-C₆)-алкіл, (C₃-C₈)-циклоалкіл, (C₃-C₈)-циклоалкіл-(C₁-C₆)-алкіл, феніл, бензил, тіофеніл, тіазоліл, піридил, імідазоліл, піразоліл або піримідиніл;

R₆ і R₇ незалежно один від одного є водень, фтор або C₁-C₆-алкіл; і

W є феніл, піримідиніл, піридил, піридазиніл або піразиніл, кожний з яких факультативно заміщений групами R₃₀ в кількості до 4.

29. Сполука або сіль за будь-яким із пп. 4, 19, 26, де X₂ – вуглець; і Q – кисень.

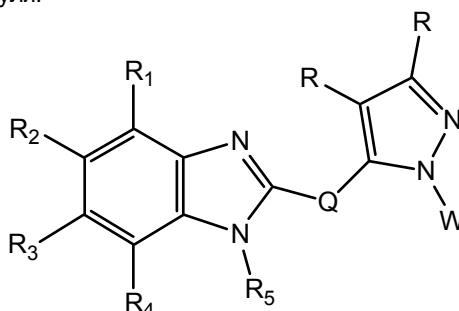
30. Сполука або сіль за будь-яким із пп. 4, 19, 26, де X₂ – N; і Q – C(R₆)(R₇).

31. Сполука або сіль за будь-яким із пп. 4, 19, 26, де X₂ – вуглець; і Q – C(R₆)(R₇).

32. Сполука або сіль за будь-яким із пп. 4, 19, 26, де X₁ – вуглець; X₂ – N і Q – C(R₆)(R₇).

33. Сполука або сіль за будь-яким із пп. 4, 19, 26, де X₁ – азот; X₂ – вуглець і Q – C(R₆)(R₇).

34. Сполука або сіль за п. 4 формули:



де R, R₁, R₂, R₃, R₄, R₅, Q і W відповідають визначенням за п. 4.

35. Сполука або сіль за будь-яким із пп. 19 або 26, де X₁ – вуглець; X₂ – азот; X₃ – CR; X₄ – азот і Q – C(R₆)(R₇).

36. Сполука або сіль за будь-яким із пп. 19 або 26, де X₁ – вуглець; X₂ – азот; X₃ – азот; X₄ – CR і Q – C(R₆)(R₇).

37. Сполука або сіль за будь-яким із пп. 19 або 26, де X₁ – вуглець; X₂ – вуглець; X₃ – S; і X₄ – CR.

38. Сполука або сіль за будь-яким із пп. 19 або 26, де X₁ – азот; X₂ – вуглець; X₃ – азот; і X₄ – CR.

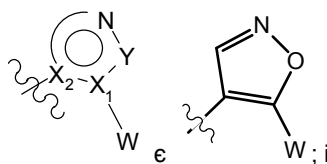
39. Сполука або сіль за будь-яким із пп. 19 або 26, де X₁ – вуглець; X₂ – вуглець; X₃ – NH або N-(C₁-C₆-алкіл); і X₄ – CR.

40. Сполука або сіль за будь-яким із пп. 19 або 26, де X₁ – вуглець; X₂ – азот; X₃ – азот; X₄ – азот; і Q – C(R₆)(R₇).

41. Сполука або сіль за п. 8, де:

Z₂ або Z₃ є атоми азоту; і

група



W є 5-членна гетероарильна група, де згадана 5-членна гетероарильна група факультативно заміщена групами в кількості до 4, незалежно одна від одної вибраними із групи, до якої входять R₃₀, -CO₂H, -C(=O)OR_E, -C(=O)NHR_E, -C(=O)NR_ER_F, -C(O)R_E, -S(O)_mR_E і -OR_E, де R₃₀ і R_E відповідають поданим вище визначенням і m – 0, 1 або 2.

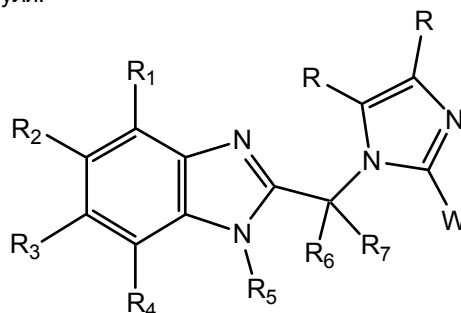
42. Сполука або сіль за п. 19, де X₁ – азот; X₂ – вуглець; X₃ – CR; і X₄ – азот.

43. Сполука або сіль за будь-яким із пп. 19 або 26, де X₁ – вуглець; X₂ – вуглець; X₃ – NH або NCH₃; і X₄ – CR.

44. Сполука або сіль за будь-яким із пп. 19 або 26, де X₁ – азот; X₂ – вуглець; X₃ – азот; і X₄ – азот.

45. Сполука або сіль за будь-яким із пп. 4, 5, 11, 17, 26, 34, 37, 42 або 44, де Q – C(R₆)(R₇).

46. Сполука або сіль за п. 4 формули:



де R, R₁, R₂, R₃, R₄, R₅, R₆, R₇ і W відповідають визначенням за п. 4.

47. Сполука або сіль за п. 46, де:

W є 6-членна арильна або гетероарильна група, де згадана 6-членна арильна або гетероарильна група факультативно заміщена групами в кількості до 4, незалежно одна від одної вибраними із групи, до якої входять R₃₀, -CO₂H, -C(=O)OR_E, -C(=O)NHR_E, -C(=O)NR_ER_F, -C(O)R_E і -S(O)_mR_E, -OR_E; і m є 0, 1 або 2.

48. Сполука або сіль за п. 46, де:

W є 5-членна арильна або гетероарильна група, де згадана 5-членна арильна або гетероарильна група факультативно заміщена групами в кількості до 4, незалежно одна від одної вибраними із групи, до якої входять R₃₀, -CO₂H, -C(=O)OR_E, -C(=O)NHR_E, -C(=O)NR_ER_F, -C(O)R_E і -S(O)_mR_E, -OR_E, і m – 0, 1 або 2.

49. Сполука або сіль за п. 46, де:

R незалежно вибраний в кожному випадку із групи, до якої входять водень, галоїд і (C₁-C₂)-алкіл;

R₁, R₃ і R₄ незалежно один від одного вибрані із групи, до якої входять водень, галоїд, гідрокси-, нітро-, ціано-, аміногрупа, (C₁-C₆)-алкіл, (C₁-C₆)-алкоксигрупа, (C₃-C₈)-циклоалкіл, (C₃-C₈)-циклоалкіл-(C₁-C₆)-алкіл, галоїд-(C₁-C₆)-алкіл, галоїд-(C₁-C₆)-алкоксигрупа, моно- або ді-(C₁-C₆)-алкіламіногрупа, аміно-(C₁-C₆)-алкіл і моно- та ді-(C₁-C₆)-алкіламіно-(C₁-C₆)-алкіл;

R₅ є (C₁-C₆)-алкіл;

R₆ і R₇ є атоми водню; і

W є феніл, фураніл, тієніл, тіазоліл, піридил, імідазоліл, оксазоліл, триазоліл, тетразоліл, піразоліл, ізоксазоліл, піримідиніл, бензимидазоліл, хінолініл, ізохінолініл, кожний з яких факультативно заміщений групами R₃₀ в кількості до 4.

50. Сполука або сіль за будь-яким з пп. 45 або 46, де:

R незалежно вибраний в кожному випадку із групи, до якої входять:

i) водень, галоїд, (C₁-C₆)-алкіл, (C₃-C₈)-циклоалкіл, (C₃-C₈)-циклоалкіл-(C₁-C₆)-алкіл, (C₁-C₆)-алкоксигрупа, галоїд-(C₁-C₆)-алкіл, галоїд-(C₁-C₆)-алкоксигрупа, і

ii) феніл та піридил, кожний з яких факультативно заміщений замісниками в кількості до 3, незалежно один від одного вибраними із групи, яка включає галоїд, гідроксигрупу, C₁-C₄-алкіл та -O-(C₁-C₄-алкіл);

R₁, R₂, R₃ і R₄ незалежно один від одного вибрані із групи, до якої входять водень, галоїд, гідрокси-, нітро-, ціано-, аміногрупа, (C₁-C₆)-алкіл, (C₁-C₆)-алкоксигрупа, (C₃-C₈)-циклоалкіл, (C₃-C₈)-циклоалкіл-(C₁-C₆)-алкіл, (C₂-C₆)-алкеніл, (C₂-C₆)-алкініл, гетероциклоалкіл, галоїд-(C₁-C₆)-алкіл, галоїд-(C₁-C₆)-алкоксигрупа, моно- або ді-(C₁-C₆)-алкіламіногрупа, аміно-(C₁-C₆)-алкіл і моно- та ді-(C₁-C₆)-алкіламіно-(C₁-C₆)-алкіл;

R₅ є водень, (C₁-C₆)-алкіл, (C₃-C₈)-циклоалкіл, (C₃-C₈)-циклоалкіл- (C₁-C₆)-алкіл, феніл, бензил, тіофеніл, тіазоліл, піридил, імідазоліл, піразоліл або піримідиніл;

R₆ і R₇ незалежно один від одного є водень, фтор або C₁-C₆-алкіл; і

W є феніл, тієніл, тіазоліл, піридил, імідазоліл, оксазоліл, триазоліл, тетразоліл, піразоліл, ізоксазоліл або піримідиніл, кожний з яких факультативно заміщений незалежно одна від одної вибраними групами R₃₀ в кількості до 4.

51. Сполука або сіль за п. 45, де:

R незалежно в кожному випадку вибраний із групи, до якої входять водень, галоїд і (C₁-C₂)-алкіл;

R₁, R₃ і R₄ незалежно один від одного вибрані із групи, до якої входять водень, галоїд, гідрокси-, нітро-, ціано-, аміногрупа, (C₁-C₆)-алкіл, (C₁-C₆)-алкоксигрупа, (C₃-C₈)-циклоалкіл, (C₃-C₈)-циклоалкіл-(C₁-C₆)-алкіл, галоїд-(C₁-C₆)-алкіл, галоїд-(C₁-C₆)-алкоксигрупа, моно- або ді-(C₁-C₆)-алкіламіногрупа, аміно-(C₁-C₆)-алкіл і моно- та ді-(C₁-C₆)-алкіламіно-(C₁-C₆)-алкіл;

R₅ є (C₁-C₆)-алкіл;

Q – CH₂; і

W є феніл, фураніл, тієніл, тіазоліл, піридил, імідазоліл, оксазоліл, триазоліл, тетразоліл, піразоліл, ізоксазоліл, піримідиніл, бензимидазоліл, хінолініл, ізохінолініл, кожний з яких факультативно заміщений групами R₃₀ у кількості до 4.

52. Сполука або сіль за будь-яким із пп. 49 або 51, де:

R₁, R₃ і R₄ незалежно один від одного вибрані із групи, до якої входять водень, галоїд, трифторметил, C₁-C₂-алкіл та ціан; і

W – феніл, піридил або тіазоліл, кожний з яких факультативно заміщений одним або кількома замісниками, незалежно один від одного вибраними із групи, до якої входять галоїд, ціано-, гідрокси-, оксогрупа, C₁-C₂-галоїдалкіл, C₁-C₂-алкіл і C₁-C₂-алкоксигрупа.

53. Сполука або сіль за п. 45, де:

R незалежно в кожному випадку вибраний із групи, до якої входять водень, галоїд і (C₁-C₂)-алкіл;

R₁, R₂ і R₄ незалежно один від одного вибрані із групи, до якої входять водень, галоїд, гідрокси-, нітро-, ціано-,

аміногрупа, (C₁-C₆)-алкіл, (C₁-C₆)-алкоксигрупа, (C₃-C₈)-циклоалкіл, (C₃-C₈)-циклоалкіл-(C₁-C₆)-алкіл, галоїд-(C₁-C₆)-алкіл, галоїд-(C₁-C₆)-алкоксигрупа, моно- або ді-(C₁-C₆)-алкіламіногрупа, аміно-(C₁-C₆)-алкіл і моно- та ді-(C₁-C₆)-алкіламіно-(C₁-C₆)-алкіл;

R₅ є (C₁-C₆)-алкіл;

Q є CH₂; і

W є феніл, фураніл, тієніл, тіазоліл, піридил, імідазоліл, оксазоліл, триазоліл, тетразоліл, піразоліл, ізоксазоліл, піримідиніл, бензимидазоліл, хінолініл, ізохінолініл, кожний з яких факультативно заміщений групами R₃₀ в кількості до 4.

54. Сполука або сіль за п. 46, де:

R незалежно вибраний в кожному випадку із групи, до якої входять водень, галоїд і (C₁-C₂)-алкіл;

R₁, R₂ і R₄ незалежно один від одного вибрані із групи, до якої входять водень, галоїд, гідрокси-, нітро-, ціано-, аміногрупа, (C₁-C₆)-алкіл, (C₁-C₆)-алкоксигрупа, (C₃-C₈)-циклоалкіл, (C₃-C₈)-циклоалкіл-(C₁-C₆)-алкіл, галоїд-(C₁-C₆)-алкіл, галоїд-(C₁-C₆)-алкоксигрупа, моно- або ді-(C₁-C₆)-алкіламіногрупа, аміно-(C₁-C₆)-алкіл і моно- та ді-(C₁-C₆)-алкіламіно-(C₁-C₆)-алкіл;

R₅ є (C₁-C₆)-алкіл;

R₆ і R₇ є атоми водню; і

W є феніл, фураніл, тієніл, тіазоліл, піридил, імідазоліл, оксазоліл, триазоліл, тетразоліл, піразоліл, ізоксазоліл, піримідиніл, бензимидазоліл, хінолініл, ізохінолініл, кожний з яких факультативно заміщений групами R₃₀ в кількості до 4.

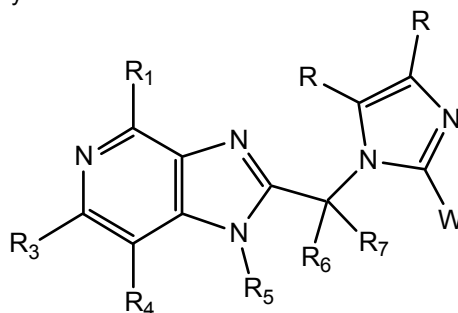
55. Сполука або сіль за будь-яким із п. 53 або п. 54, де:

R₁, R₂ і R₄ незалежно один від одного вибрані із групи, до якої входять водень, галоїд, трифторметил, C₁-C₂-алкіл і ціан; і

W є феніл, піридил або тіазоліл, кожний з яких факультативно заміщений одним або кількома замісниками, незалежно один від одного вибраними із групи, до якої входять галоїд, ціано-, гідрокси-, оксогрупа, C₁-C₂-галоїдалкіл, C₁-C₂-алкіл і C₁-C₂-алкоксигрупа.

56. Сполука або сіль за будь-яким із пп. 52 або 55, де W – 2-тіазоліл, 2-піримідиніл, 3-фторфеніл або 6-фтор-2-піридиніл.

57. Сполука або сіль за п. 26 формули:



де R, R₁, R₃, R₄, R₅, R₆, R₇ і W відповідають визначенням за п. 26.

58. Сполука або сіль за п. 57, де:

R незалежно вибраний в кожному випадку із групи, до якої входять:

i) водень, галоїд, (C₁-C₆)-алкіл, (C₃-C₈)-циклоалкіл, (C₃-C₈)-циклоалкіл-(C₁-C₆)-алкіл, (C₁-C₆)-алкоксигрупа, галоїд-(C₁-C₆)-алкіл, галоїд-(C₁-C₆)-алкоксигрупа, і

ii) феніл та піридил, кожний з яких факультативно заміщений замісниками в кількості до 3, незалежно один від одного вибраними із групи, до якої входять галоїд, гідроксигрупа, C₁-C₄-алкіл та -O-(C₁-C₄-алкіл);

R₁, R₃ і R₄ незалежно один від одного вибрані із групи, до якої входять водень, галоїд, гідрокси-, нітро-, ціано-, аміногрупа, (C₁-C₆)-алкіл, (C₁-C₆)-алкоксигрупа, (C₃-C₈)-циклоалкіл, (C₃-C₈)-циклоалкіл-(C₁-C₆)-алкіл, (C₂-C₆)-алкеніл, (C₂-C₆)-алкініл, гетероциклоалкіл, галоїд-(C₁-C₆)-алкіл, галоїд-(C₁-C₆)-алкоксигрупа, моно- або ді-(C₁-C₆)-алкіламіногрупа, аміно-(C₁-C₆)-алкіл і моно- та ді-(C₁-C₆)-алкіламіно-(C₁-C₆)-алкіл;

R₅ є водень, (C₁-C₆)-алкіл, (C₃-C₈)-циклоалкіл, (C₃-C₈)-циклоалкіл-(C₁-C₆)-алкіл, феніл, бензил, тіофеніл, тіазоліл, піридил, імідазоліл, піразоліл або піримідиніл;

R₆ і R₇ незалежно один від одного є водень, фтор або C₁-C₆-алкіл; і

W є феніл, піридил, піридазиніл, піримідиніл або піразиніл, кожний з яких факультативно заміщений групами R₃₀ в кількості до 4.

59. Сполука або сіль за будь-яким із пп. 27 або 58, де:

R незалежно вибраний в кожному випадку із групи, до якої входять водень, галоїд і (C₁-C₂)-алкіл;

R₁ і R₄ незалежно один від одного вибрані із групи, до якої входять водень, галоїд, гідрокси-, нітро-, ціано-, аміногрупа, (C₁-C₆)-алкіл, (C₁-C₆)-алкоксигрупа, (C₃-C₈)-циклоалкіл, (C₃-C₈)-циклоалкіл-(C₁-C₆)-алкіл, галоїд-(C₁-C₆)-алкіл, галоїд-(C₁-C₆)-алкоксигрупа, моно- або ді-(C₁-C₆)-алкіламіногрупа, аміно-(C₁-C₆)-алкіл і моно- та ді-(C₁-C₆)-алкіламіно-(C₁-C₆)-алкіл;

R₅ є (C₁-C₆)-алкіл;

R₆ і R₇ є атоми водню; і

W є феніл, піримідиніл, піридил, піридазиніл або піразиніл, кожний з яких факультативно заміщений групами R₃₀ в кількості до 4.

60. Сполука або сіль за п. 59, де:

R₁ і R₄ незалежно один від одного вибрані із групи, до якої входять водень, галоїд, трифторметил, C₁-C₂-алкіл і ціаногрупа; і

W – феніл або піридил, кожний з яких факультативно заміщений одним або кількома замісниками, незалежно

один від одного вибраними із групи, до якої входять галоїд, ціано-, гідроки-, оксогрупа, C₁-C₂-галоїдалкіл, C₁-C₂-алкіл і C₁-C₂-алкоксигрупа.

61. Сполука або сіль за п. 60, де W – 2-піримідиніл, 3-фторфеніл або 6-фтор-2-піридиніл.

62. Сполука або сіль за будь-яким із пп. 24, 52, 55 або 60, де R, R₁ і R₄ є атоми водню.

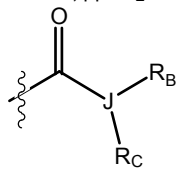
63. Сполука або сіль за будь-яким із пп. 24, 52, 55 або 60, де R₅ є етил або н-пропіл.

64. Сполука або сіль за будь-яким із пп. 24, 52 або 60, де R₂ вибраний із групи, до якої входять:

i) водень, галоїд, гідроки-, нітро-, ціано-, аміногрупа, галоїд-(C₁-C₆)-алкіл та галоїд-(C₁-C₆)-алкоксигрупа,

ii) C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-алкоксигрупа, C₃-C₈-циклоалкіл, C₂-C₆-алкеніл, C₂-C₆-алкініл, (C₃-C₈-циклоалкіл)-C₁-C₄-алкіл, -NH(R₁₀), -N(R₁₀)(R₁₁), (R₁₀)NH-(C₁-C₆)-алкіл, (R₁₀)(R₁₁)N-(C₁-C₆)-алкіл, (гетероциклоалкіл)алкіл і гетероциклоалкіл, кожний з яких факультативно заміщений 1, 2, 3 або 4 групами R₂₀.

65. Сполука або сіль за будь-яким із пп. 24, 52 або 60, де R₂ – група формули



де J – N, CH або C-(C₁-C₆)-алкіл, і

RB та RC незалежно один від одного вибрані із групи, до якої входять водень, (C₁-C₆)-алкіл, (C₂-C₆)-алкеніл, (C₂-C₆)-алкініл, (C₃-C₈)-циклоалкіл і (C₃-C₈-циклоалкіл)-(C₁-C₄)-алкіл; або

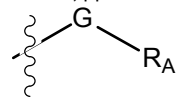
RB та RC спільно з атомом, до якого вони приєднані, утворюють 4-10-членну моноциклічну або біциклічну систему, яка може містити:

a) один або кілька подвійних зв'язків,

b) одну або кілька оксогруп, O, S, SO, SO₂ або N-R_D, де R_D – водень або (C₁-C₆)-алкіл;

c) один або кілька замісників R₂₀.

66. Сполука або сіль за будь-яким із пп. 52, 60 або 64, де R₂ – група формули



де G – зв'язок або C₁-C₂-алкіл;

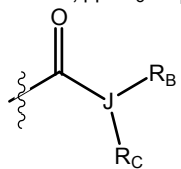
RA – насичена, частково ненасичена або ароматична карбоциклічна система, яка складається з одного циклу або двох конденсованих, неконденсованих або з'єднаних спільним атомом циклів (спіроциклічна система), де кожний цикл містить 0, 1 або 2 гетероатоми, незалежно один від одного вибрані із групи, яка включає N, S та O, причому згадана насичена, частково ненасичена або ароматична карбоциклічна система факультативно заміщена 1, 2, 3 або 4 групами R₂₀.

67. Сполука або сіль за будь-яким із пп. 24, 55 або 60, де R₃ вибраний із групи, до якої входять:

i) водень, галоїд, гідроки-, нітро-, ціано-, аміногрупа, галоїд-(C₁-C₆)-алкіл та галоїд-(C₁-C₆)-алкоксигрупа,

ii) C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-алкоксигрупа, C₃-C₈-циклоалкіл, C₂-C₆-алкеніл, C₂-C₆-алкініл, (C₃-C₈-циклоалкіл)-C₁-C₄-алкіл, -NH(R₁₀), -N(R₁₀)(R₁₁), (R₁₀)NH-(C₁-C₆)-алкіл, (R₁₀)(R₁₁)N-(C₁-C₆)-алкіл, (гетероциклоалкіл)-C₁-C₄-алкіл і гетероциклоалкіл, кожний з яких факультативно заміщений 1, 2, 3 або 4 групами R₂₀.

68. Сполука або сіль за будь-яким із пп. 24, 55 або 60, де R₃ є група формули



де J – N, CH або C-(C₁-C₆)-алкіл, і

RB і RC незалежно один від одного вибрані із групи, до якої входять водень, (C₁-C₆)-алкіл, (C₂-C₆)-алкеніл, (C₂-C₆)-алкініл, (C₃-C₈)-циклоалкіл та (C₃-C₈-циклоалкіл)-(C₁-C₄)-алкіл; або

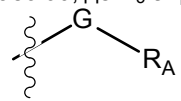
RB і RC спільно з атомом, до якого вони приєднані, утворюють 4-10-членну моноциклічну або біциклічну систему, яка може містити:

a) один або кілька подвійних зв'язків,

b) одну або кілька оксогруп, O, S, SO, SO₂ або N-R_D, де R_D – водень або (C₁-C₆)-алкіл;

c) один або кілька замісників R₂₀.

69. Сполука або сіль за будь-яким із пп. 24, 55 або 60, де R₃ є група формули



де G – зв'язок або C₁-C₂-алкіл; і

RA – насичена, частково ненасичена або ароматична карбоциклічна система, яка складається з одного циклу або двох конденсованих, неконденсованих або з'єднаних спільним атомом циклів (спіроциклічна система), де кожний цикл містить 0, 1 або 2 гетероатоми, незалежно один від одного вибрані із групи, яка включає N, S та O, причому згадана насичена, частково ненасичена або ароматична карбоциклічна система факультативно заміщена 1, 2, 3 або 4 групами R₂₀.

70. Сполука або сіль за будь-яким із пп. 24, 66 або 69, де RA вибраний із групи, до якої входять феніл, піроліл, піразоліл, тіазоліл, ізоксазоліл, триазоліл, тетразоліл, оксадіазоліл та оксазоліл, кожний з яких факультативно заміщений 1, 2, 3 або 4 групами R₂₀.

71. Сполука або сіль за будь-яким із пп. 52 або 55, де R_3 є $-HC=N-OH$ або $-HC=N-(C_1-C_6\text{-алкоксигрупа})$.
 72. Сполука або сіль за будь-яким із пп. 24, 52 або 60, де R_2 є $-HC=N-OH$ або $-HC=N-(C_1-C_6\text{-алкоксигрупа})$.
 73. Сполука або сіль за будь-яким із пп. 24 або 64, де R_2 вибраний із групи, до якої входять водень, галоїд, гідрокси-, нітро-, ціано-, аміногрупа, галоїд-(C_1-C_6)-алкіл та галоїд-(C_1-C_6)-алкоксигрупа.
 74. Сполука або сіль за п. 18, де:

R незалежно вибраний в кожному випадку із групи, до якої входять:

i) водень, галоїд, (C_1-C_6)-алкіл, (C_3-C_8)-циклоалкіл, (C_3-C_8)-циклоалкіл-(C_1-C_6)-алкіл, (C_1-C_6)-алкоксигрупа, галоїд-(C_1-C_6)-алкіл, галоїд-(C_1-C_6)-алкоксигрупа, і

ii) феніл та піридил, кожний з яких факультативно заміщений замісниками в кількості до 3, незалежно один від одного вибраними із групи, до якої входять галоїд, гідроксигрупа, C_1-C_4 -алкіл та $-O-(C_1-C_4\text{-алкіл})$;

R_1 , R_3 і R_4 незалежно один від одного вибрані із групи, до якої входять водень, галоїд, гідрокси-, нітро-, ціано-, аміногрупа, (C_1-C_6)-алкіл, (C_1-C_6)-алкоксигрупа, (C_3-C_8)-циклоалкіл, (C_3-C_8)-циклоалкіл-(C_1-C_6)-алкіл, (C_2-C_6)-алкеніл, (C_2-C_6)-алкініл, гетероциклоалкіл, галоїд-(C_1-C_6)-алкіл, галоїд-(C_1-C_6)-алкоксигрупа, моно- або ди-(C_1-C_6)-алкіламіногрупа, аміно-(C_1-C_6)-алкіл і моно- та ди-(C_1-C_6)-алкіламіно-(C_1-C_6)-алкіл;

R_5 є водень, (C_1-C_6)-алкіл, (C_3-C_8)-циклоалкіл, (C_3-C_8)-циклоалкіл-(C_1-C_6)-алкіл, феніл, бензил, тіофеніл, тіазоліл, піридил, імідазоліл, піразоліл або піримідиніл;

R_6 і R_7 незалежно один від одного є водень, фтор або C_1-C_6 -алкіл; і

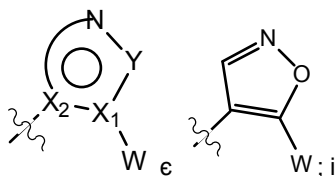
W є тієніл, тіазоліл, імідазоліл, оксазоліл, триазоліл, тетразоліл, піразоліл або ізоксазоліл, кожний з яких факультативно заміщений групами R_{30} в кількості до 4.

75. Сполука або сіль за п. 67, де R_3 вибраний із групи, до якої входять водень, галоїд, гідрокси-, нітро-, ціано-, аміногрупа, галоїд-(C_1-C_6)-алкіл та галоїд-(C_1-C_6)-алкоксигрупа.

76. Сполука або сіль за п. 44, де:

Z_2 або Z_3 є азот; і

група



W є 6-членна арильна або гетероарильна група, де згадана 6-членна арильна або гетероарильна група факультативно заміщена групами в кількості до 4, незалежно одна від одної вибраними із групи, до якої входять R_{30} , $-CO_2H$, $-C(=O)OR_E$, $-C(=O)NHR_E$, $-C(=O)NR_ER_F$, $-C(O)R_E$, $-S(O)_mR_E$ і $-OR_E$, де R_{30} і R_E відповідають поданим вище визначенням і $m = 0, 1$ або 2 .

77. Фармацевтична композиція, яка містить сполуку або сіль за п. 1 в комбінації із щонайменше одним фармацевтично прийнятним носієм або наповнювачем.

78. Спосіб змінювання активності рецептора ГАМК_A з передавання сигналів, який включає введення клітини, що експресує такий рецептор, у контакт з такою кількістю сполуки або солі за п. 1, що є достатньою для виявного змінювання електрофізіології згаданої клітини, причому виявна зміна електрофізіології згаданої клітини посвідчує зміну активності рецепторів ГАМК_A з передавання сигналів.

79. Спосіб змінювання активності рецептора ГАМК_A з передавання сигналів, який включає введення клітини, що експресує такий рецептор, у контакт з такою кількістю сполуки або солі за п. 1, що є достатньою для виявного змінювання хлоридної провідності *in vitro* клітини, що експресує рецептори ГАМК_A.

80. Спосіб за п. 79, який відрізняється тим, що клітина рекомбінантно експресує гетерологічний рецептор ГАМК_A, і зміну електрофізіології згаданої клітини виявляють шляхом внутрішньоклітинної реєстрації або реєстрації потенціалу на затискачах.

81. Спосіб за п. 79, який відрізняється тим, що згадана клітина є клітиною нервового волокна, на яку впливають в організмі тварини *in vivo*, причому згадану клітину вводять в контакт зі згаданою сполукою або сіллю, розчиною в біологічній рідині організму, а зміну електрофізіології згаданої клітини виявляють як зміну в поведінці тварини.

82. Спосіб за п. 81, який відрізняється тим, що твариною є людина, клітиною нервового волокна є клітина головного мозку, а біологічною рідиною організму є спинномозкова рідина.

83. Спосіб змінювання активності рецептора ГАМК_A з передавання сигналів, який включає забезпечення дії на клітину, що експресує рецептор ГАМК_A, такої кількості сполуки або солі за п. 1, що є достатньою для пригнічення зв'язування RO15-1788 *in vitro* із клітинами, що експресують рецептор ГАМК_A людини.

84. Спосіб демонстрації присутності рецептора ГАМК_A у зразку клітини або тканини, який включає:

введення зразка клітини або тканини в контакт з міченою сполукою або сіллю за п. 1;

промивання зразка клітини або тканини для видалення незв'язаної міченої сполуки або солі; і

виявлення присутності міченої сполуки або солі в зразку клітини або тканини.

85. Спосіб за п. 84, який відрізняється тим, що згаданим зразком клітини або тканини є гістологічний зріз.

86. Спосіб за п. 84, який відрізняється тим, що згадана мічена сполука або сіль містить радіоактивну мітку або пряму чи непряму люмінесцентну мітку.

87. Спосіб за п. 84, який відрізняється тим, що згаданим зразком клітини або тканини є гістологічний зріз, згадана мічена сполука або сіль містить радіоактивну мітку або пряму чи непряму люмінесцентну мітку, і мічену сполуку або сіль виявляють авторадіографічним способом з одержанням авторадіограми.

88. Спосіб демонстрації присутності рецептора ГАМК_A в гістологічному зрізі, який включає:

введення гістологічного зрізу в контакт зі сполукою або сіллю за п. 1, міченою радіоактивним ізотопом або люмінесцентною міткою, з одержанням обробленого гістологічного зрізу;

промивання гістологічного зрізу для видалення незв'язаної міченої сполуки або солі;

виявлення міченої сполуки або солі в згаданому гістологічному зрізі; і

зіставлення експозиційної густини згаданого гістологічного зрізу з експозиційною густиною іншого гістологічного зрізу, який не вводили в контакт зі сполукою або сіллю за п. 1.

89. Упаковка, яка містить фармацевтичну композицію за п. 77 в контейнері і додатково містить щонайменше один з перелічених нижче документів:

інструкції із застосування композиції у лікуванні пацієнта, який страждає на тривожний стан, або
інструкції із застосування композиції у лікуванні пацієнта, який страждає на депресію, або
інструкції із застосування композиції у лікуванні пацієнта, який страждає на порушення сну, або
інструкції із застосування композиції для лікування пацієнта, який страждає на шизофренію, або
інструкції із застосування композиції для лікування пацієнта, який страждає на дефіцит уваги з гіперкінетичним синдромом.

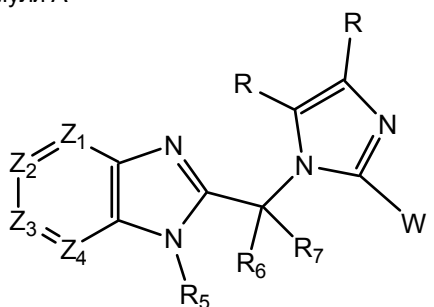
90. Упаковка, яка містить фармацевтичну композицію за п. 77 в контейнері і додатково містить документи, які включають щонайменше одну з таких інструкцій: інструкцію із застосування композиції у лікуванні пацієнта, який страждає на слабоумство, обумовлене хворобою Альцгеймера, або інструкцію із застосування композиції для покращення пам'яті пацієнта.

91. Застосування сполуки або солі за п. 1 для виготовлення лікарського препарату.

92. Застосування сполуки або солі за п. 1 для лікування тривожних станів, депресії, порушень сну, шизофренії або дефіциту уваги з гіперкінетичним синдромом.

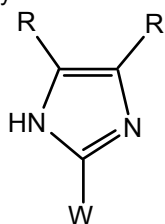
93. Застосування сполуки або солі за п. 1 для покращення пам'яті.

94. Спосіб одержання сполуки Формули А



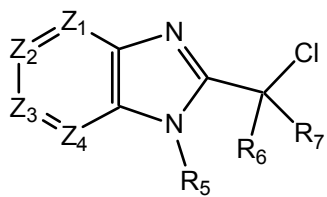
Формула А

який включає проведення реакції сполуки Формули В



Формула В

зі сполукою Формули С



Формула С

де:

Z₁ – азот або CR₁;

Z₂ – азот або CR₂;

Z₃ – азот або CR₃;

Z₄ – азот або CR₄;

за умови, що не більше двох із груп Z₁, Z₂, Z₃ і Z₄ є атомами азоту;

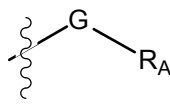
R₁, R₂, R₃ і R₄ незалежно один від одного вибрані із групи, до якої входять:

i) водень, галоїд, гідрокси-, нітро-, ціано-, аміногрупа, галоїдалкіл та галоїдалкоксигрупа,

ii) алкіл, алкоксигрупа, циклоалкіл, алкеніл, алкініл, (циклоалкіл)алкіл, -NH(R₁₀), -N(R₁₀)(R₁₁), гідроксialкіл, аміноалкіл, (R₁₀)NH-алкіл-, (R₁₀)(R₁₁)N-алкіл-, алканол, алкоксикарбоніл, (гетероциклоалкіл)алкіл, алкілсульфоніл, алкілтіюгрупа, моно- або діалкіламінокарбоніл, гетероциклоалкіл, арил і гетероарил, кожний з яких факультативно заміщений 1, 2, 3 або 4 групами R₂₀,

де R₁₀ і R₁₁ незалежно один від одного вибрані в кожному випадку із групи, до якої входять алкіл, алкеніл, алкініл, алкоксигрупа, алкіл, алкеніл, алкініл, алкоксигрупа, циклоалкіл, (циклоалкіл)алкіл, арил, ариалкіл, алканол та моно- і діалкіламіноалкіл; і

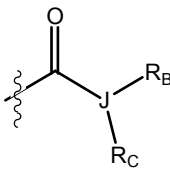
iii) група формули:



де G – зв'язок, алкіл, -O-, -C(=O)- або -CH₂C(=O)-; i

R_A – насичена, частково ненасичена або ароматична карбоциклічна система, яка складається з одного циклу або двох конденсованих, неконденсованих або з'єднаних спільним атомом циклів (спіроциклічна система), де кожний цикл містить 0, 1 або 2 гетероатоми, незалежно один від одного вибраних із групи, яка включає N, S та O, причому згадана насичена, частково ненасичена або ароматична карбоциклічна система факультативно заміщена 1, 2, 3 або 4 групами R₂₀, i

iv) група Формули



де J – N, CH або C-алкіл, а

R_B і R_C незалежно один від одного вибрані із групи, до якої входять водень, алкіл, алкеніл, алкініл, алкоксигрупа, циклоалкіл, (циклоалкіл)алкіл, гетероциклоалкіл, арил, ариалалкіл, алканоїл, гетероарил, моно- та діалкіламіноалкіл, кожний з яких факультативно заміщений 1 або 2 замісниками, незалежно один від одного вибраними із групи, яка включає галоїд, гідрокси-, ціано-, аміно-, нітро-, алкоксигрупу та алкіл; або

R_B і R_C спільно з атомом, до якого вони приєднані, утворюють 4-10-членну моноциклічну або біциклічну систему, яка може містити:

a) один або кілька подвійних зв'язків,

b) одну або кілька оксогруп, O, S, SO, SO₂ або N-R_D, де R_D – водень, Ar₁, алкіл, циклоалкіл, гетероциклоалкіл або Ar₁-алкіл; де Ar₁ – арил або гетероарил, кожний з яких факультативно заміщений 1 або 2 замісниками, незалежно один від одного вибраними із групи, яка включає галоїд, гідрокси-, ціано-, аміно-, нітро-, алкоксигрупу та алкіл; та/або

c) один або кілька замісників R₂₀;

v) -OC(=O)R_E, -C(=O)OR_E, -C(=O)NH₂, -C(=O)NHR_E, -C(=O)NR_ER_F, -S(O)_nR_E, -S(O)_nNH₂, -S(O)_nNHR_E, -S(O)_nNR_ER_F, -NHC(=O)R_E, -C(=NR_E)R_F, -HC=N-OH, -HC=N-(алокси), -HC=N-(алкіл), -NR_EC(=O)R_F, -NHS(O)_mR_E і -NR_ES(O)_mR_F, де m – 0, 1 або 2, i

R_E і R_F в кожному випадку незалежно один від одного вибрані із групи, яка включає алкіл, циклоалкіл, гетероциклоалкіл, алкоксигрупу, моно- або діалкіламіногрупу, арил або гетероарил, кожний з яких факультативно заміщений 1, 2 або 3 групами R₃₀;

R₂₀ незалежно вибраний в кожному випадку із групи, до якої входять: галоїд; гідрокси-; нітро-; ціано-; аміногрупа; алкіл; алкоксигрупа, факультативно заміщена аміногрупою або моно- чи діалкіламіногрупою; циклоалкіл; циклоалкілалкіл; циклоалкілалкоксигрупа; алкеніл; алкініл; галоїдний алкіл; оксо-; галоїдалкоксигрупа; моно- або діалкіламіногрупа; аміноалкіл; та моно- та діалкіламіноалкіл;

R₃₀ незалежно вибраний в кожному випадку із групи, до якої входять: галоїд, гідрокси-, нітро-, ціано-, аміногрупа, алкіл, алкоксигрупа, факультативно заміщена аміногрупою або моно- чи діалкіламіногрупою, циклоалкіл, циклоалкілалкіл, циклоалкілалкоксигрупа, гетероциклоалкіл, алкеніл, алкініл, галоїдний алкіл, галоїдалкоксигрупа, оксогрупа, моно- або діалкіламіногрупа, аміноалкіл та моно- та діалкіламіноалкіл;

R₅ є водень або галоїдалкіл; або

R₅ є алкіл, циклоалкіл або (циклоалкіл)алкіл, кожний з яких може містити один або кілька подвійних або потрійних зв'язків і кожний з яких факультативно заміщений 1, 2 або 3 групами R₃₀, або

R₅ є арил, ариалалкіл, гетероарил або гетероарилалкіл, кожний з яких факультативно заміщений 1, 2 або 3 замісниками, вибраними із групи, до якої входять галоїдалкіл, аміногрупа, -NH(R₁₀), -N(R₁₀)(R₁₁), карбоксамідогрупа, (R₁₀)NHкарбоніл, (R₁₀)(R₁₁)Nкарбоніл, галоїд, гідрокси-, нітро-, ціано-, аміногрупа, алкіл, алкоксигрупа, факультативно заміщена аміногрупою або моно- чи діалкіламіногрупою, циклоалкіл, циклоалкілалкіл, циклоалкілалкоксигрупа, гетероциклоалкіл, алкеніл, алкініл, галоїдалкіл, галоїдалкоксигрупа, аміноалкіл, та моно- та діалкіламіноалкіл;

R₆ і R₇ незалежно один від одного є водень, фтор або алкіл;

R незалежно в кожному випадку вибраний із групи, до якої входять водень, галоїд, аміногрупа, (C₁-C₆)-алкіл, (C₂-C₆)-алкеніл, (C₂-C₆)-алкініл, C₁-C₆-алкоксигрупа, (C₃-C₈)-циклоалкіл, (C₃-C₈-циклоалкіл)-(C₁-C₄)-алкіл, галоїд-(C₁-C₆)-алкіл, галоїдалокси-, карбоксамідогрупа та 3-7-членні карбоциклічні або гетероциклічні групи, які є насиченими, ненасиченими або ароматичними і які можуть бути додатково заміщені одним або кількома замісниками, незалежно один від одного вибраними із групи, яка включає галоїд, оксо-, гідроксигрупу, C₁-C₄-алкіл та -O(C₁-C₄-алкіл); i

W є арил або гетероарил, де арильна або гетероарильна група факультативно заміщена замісниками в кількості до 4, незалежно один від одного вибраними із групи, до якої входять R₃₀, -CO₂H, -C(=O)OR_E, -C(=O)NHR_E, -C(=O)NR_ER_F, -C(O)R_E, -S(O)_mR_E, -OR_E, де R₃₀ і R_E відповідають поданим вище визначенням і m – 0, 1 або 2.

95. Сполука за п. 1, яка є

1-пропіл-2-[[2-(2-фторпіридин-6-ил)-1H-імідазол-1-іл]метил]-5-ціан-1H-бензимидазолом;

1-етил-2-[[2-(3-фторфеніл)-піразол-3-іл]метил]-5-ціан-1H-бензимидазолом;

1-етил-2-[[2-(3-фторфеніл)-піразол-3-іл]метил]-5-ацетил-1H-бензимидазолом;

2-[[2-(2,5-дифторфеніл)-1H-імідазол-1-іл]метил]-1-етил-1H-імідазо[4,5-b]піридином;

2-[2-(6-фторпіридин-2-іл)-імідазол-1-ілметил]-1-пропіл-1H-імідазо[4,5-c]піридином;

[illegible]

[illegible]

[illegible]