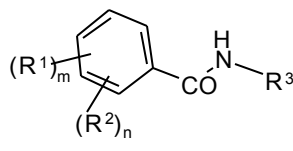


1. Сполука формули (Ib), або її сіль, сольват або проліки



в якій

$m = 0$  або  $1$ ,

$n = 1$  або  $2$ ,

$m+n = 2$  або  $3$ ,

кожний  $R^1$  незалежно вибраний з групи:  $OH$ ,  $-(CH_2)_{1-4}OH$ , галоген,  $OCH_3$ ,  $C_2H_5O$ ,  $C_{1-6}$ алкіл,  $C_{2-6}$ алкеніл,  $-NH-C_{1-4}$ алкіл,  $-N$ -ді- $(C_{1-4}$ алкіл),  $CN$ , форміл,

кожний  $R^2$  є групою  $Y-X$ ,

за умови, що  $Y-X$  не може бути  $CH_3O$ ,  $C_2H_5O$  або  $CH_3C(O)O$ -;

де кожний  $X$  є зв'язувальною ланкою, незалежно вибраною з групи:  $-CH_2O$ -,  $-CH_2NH$ -,  $-O$ -,  $CH_2OCH_2CH_2NH$ -,  $CH_2CH_2O$ -,  $-CH_2$ -,  $CH_2NCH_2$ -,  $NHCH_2$ -,  $-C(O)CH_2O$ -,  $-C(O)OCH_2$ -;

кожний  $Y$  незалежно вибраний з групи: арил, гетероцикліл,  $C_{3-7}$ циклоалкіл,  $C_{1-6}$ алкіл,  $C_{2-6}$ алкеніл,  $C_{2-6}$ алкініл,  $-(CH_2)_{1-4}CH_3$ -а $F_a$ , де кожний  $Y$  незалежно, необов'язково, заміщений групами  $R^4$  числом до 3;

кожний  $R^4$  незалежно вибраний з групи:  $CN$ ,  $C_{1-4}$ алкіл,  $-OC_{1-6}$ алкіл,  $OH$  або  $R^5-X^1$ -, де  $X^1$  незалежно вибраний з групи:  $-O$ -,  $-CO$ -,  $-SO_2$ -,  $-OC(O)$ -,  $NH$ -,  $-(Me)NCOCH_2$ -,  $-(Me)NCOCH_2$ -,  $-(Me)NCO$ -,  $-CH_2$ - і простий зв'язок;

$R^5$  вибраний з  $C_{1-6}$ алкілу,  $-CH_3$ -а $F_a$ , фенілу, гетероциклілу або  $C_{3-7}$ циклоалкілу;

і  $R^5$  є необов'язково заміщеним одним або декількома замісниками, незалежно вибраними з галогену або  $OH$ ;

$R^3$  є гетероциклілом, в якому атом у другому положенні гетероциклільного кільця відносно амідної групи, до якої  $R^3$  приєднаний, є гетероатомом, і де атом у другому положенні гетероциклільного кільця відносно амідної групи є нітрогеном, що є  $sp^2$ -гібридизованим нітрогеном, і  $R^3$  є, необов'язково, заміщеним групами  $R^7$  числом до 2;

кожний  $R^7$  незалежно вибраний з групи  $C_{1-6}$ алкіл,  $C_{2-6}$ алкеніл,  $C_{2-6}$ алкініл,  $(CH_2)_{0-3}$ зарил,  $(CH_2)_{0-3}$ гетероцикліл,  $OH$ , галоген,  $C_{1-6}$ алкілгалоген,  $OC_{1-6}$ алкіл,  $(CH_2)_{0-3}S(O)_{0-2}R^8$ ,  $SOH_3$ , тіоксо,  $NH_2$ ,  $CN$ ,  $(CH_2)_{0-3}NH SO_2R^8$ ,  $(CH_2)_{0-3}COOH$ ,  $(CH_2)_{0-3}O-(CH_2)_{0-3}R^8$ ,  $(CH_2)_{0-3}C(O)(CH_2)_{0-3}R^8$ ,  $(CH_2)_{0-3}C(O)OR^8$ ,  $(CH_2)_{0-3}C(O)NH_2$ ,  $(CH_2)_{0-3}C(O)NH(CH_2)_{0-3}R^8$ ,  $(CH_2)_{0-3}NH(CH_2)_{0-3}R^8$ ,  $(CH_2)_{0-3}NHC(O)(CH_2)_{0-3}R^8$ ,  $(CH_2)_{0-3}C(O)NH SO_2R^8$  та  $(CH_2)_{0-3}SO_2NHC(O)R^8$ , де алкільний ланцюг, циклоалкільне кільце або гетероциклічне кільце у  $R^7$ , необов'язково, заміщені одним або декількома замісниками, незалежно вибраними з групи  $C_{1-4}$ алкіл,  $OH$ , галоген,  $CN$ ,  $NH_2$ , та  $O-C_{1-4}$ алкіл;

$R^8$  вибраний з групи: гідроген,  $C_{1-6}$ алкіл, арил, гетероцикліл,  $C_{3-7}$ циклоалкіл,  $OH$ ,  $C_{1-6}$ алкіл- $OH$ ,  $COOH$ ,  $C(O)OC_{1-6}$ алкіл,  $N(R^6)C_{1-6}$ алкіл,  $OC_{1-6}$ алкіл,  $C_{0-6}$ алкіл $OC(O)C_{1-6}$ алкіл, де алкільний ланцюг або арильне, гетероциклільне або циклоалкільне кільце у  $R^8$ , як варіант, заміщені одним або декількома замісниками, незалежно вибраними з групи:  $C_{1-4}$ алкіл,  $OH$ , галоген,  $CN$ ,  $NH_2$ ,  $-NH-C_{1-4}$ алкіл,  $-N$ -ді- $(C_{1-4}$ алкіл) та  $O-C_{1-4}$ алкіл;

кожний  $a$  незалежно дорівнює 1, 2 або 3,

за умови, що

(i) коли  $R^3$  є 2-піридиллом, а  $X$  є відмінним від  $-CH_2$ - або  $-C(O)OCH_2$ -, тоді  $R^3$  не може бути монозаміщеним у 5-положенні групою  $R^7$ , вибраною з  $COOH$  або  $C(O)OC_{1-6}$ алкілу;

(ii) положення 3, 5 на фенольному кільці (до яких приєднано  $R^1$  та  $R^2$ ) відносно амідного зв'язку є заміщеними, а щонайменше одна з груп у положеннях 3 та 5 є  $R^2$ групою;

(iii) нерозгалужений, незаміщений алкільний ланцюг не може перевищувати  $C_{1-6}$ алкіл у довжину;

(iv) коли  $m+n$  дорівнює 3,  $m$  дорівнює 0 або 1, а  $R^1$  незалежно вибраний з групи: метил, метокси або гідрокси,  $n$  дорівнює 1 або 2,  $X$  незалежно вибраний з  $-O$ -,  $-CH_2$ -,  $Y$

вибрано з групи: піролідиніл, морфолініл, феніл, тетразоліл, або пропіл, причому Y необов'язково заміщений R<sup>4</sup>, і R<sup>4</sup> незалежно вибраний з метокси та C<sub>1-4</sub>алкілу, тоді R<sup>3</sup> не може бути незаміщеним тетразолілом, незаміщеним тіазолом, або тіазолілом, заміщеним етоксикарбоніметилом.

2. Сполука за п. 1 або її сіль, сольват або проліки, де кожний R<sup>1</sup> незалежно вибраний з групи: OH, форміл, галоген, C<sub>1-6</sub>алкіл, CN, (CH<sub>2</sub>)<sub>1-4</sub>OH.

3. Сполука за п. 1 або 2 або її сіль, сольват або проліки, де кожний R<sup>2</sup> є групою Y-X-, кожний X незалежно вибраний з групи: -CH<sub>2</sub>-, -O-, -C(O)OCH<sub>2</sub>-, -C(O)CH<sub>2</sub>O-, кожний Y незалежно вибраний з групи: C<sub>1-6</sub>алкіл, C<sub>2-6</sub>алкеніл, арил, гетероцикліл, C<sub>3-7</sub>циклоалкіл, -(CH<sub>2</sub>)<sub>1-4</sub>CH<sub>3-a</sub>F<sub>a</sub>, причому кожний Y незалежно, необов'язково, заміщено групою R<sup>4</sup>.

4. Сполука за будь-яким з пп. 1-3 або її сіль, сольват або проліки, де кожний R<sup>4</sup> незалежно вибраний з групи: CH<sub>3-a</sub>F<sub>a</sub>, CN, C<sub>1-4</sub>алкіл, OC<sub>1-6</sub>алкіл, CO-феніл, OH, або феніл.

5. Сполука за будь-яким з пп. 1-4 або її сіль, сольват або проліки, де R<sup>3</sup> є нітрогенвмісним гетероциклілом, необов'язково, заміщеним однією або двома групами R<sup>7</sup>.

6. Сполука за п. 5 або її сіль, проліки або сольват, де R<sup>3</sup> вибирають з групи: тіазоліл, бензотіазоліл, тіадіазоліл, піридин, піразин, піридазин, піразол, імідазол, піримідин, оксазол та індол.

7. Сполука за будь-яким з пп. 1-6 або її сіль, сольват або проліки, де R<sup>3</sup> є незаміщеним або заміщеним одною групою R<sup>7</sup>.

8. Сполука за будь-яким з пп. 1-7 або її сіль, сольват або проліки, де кожний R<sup>7</sup> незалежно вибраний з групи: OH, CN, NH<sub>2</sub>, SO<sub>3</sub>H, тїюксо, галоген, C<sub>1-4</sub>алкіл, O-C<sub>1-4</sub>алкіл, C<sub>1-4</sub>алкілгалоген, (CH<sub>2</sub>)<sub>0-1</sub>COOH, (CH<sub>2</sub>)<sub>0-1</sub>C(O)OR<sup>8</sup>, (CH<sub>2</sub>)<sub>0-1</sub>NH(CH<sub>2</sub>)<sub>0-2</sub>R<sup>8</sup>, (CH<sub>2</sub>)<sub>0-1</sub>NHC(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>0-2</sub>R<sup>8</sup>, (CH<sub>2</sub>)<sub>0-1</sub>C(O)NH(CH<sub>2</sub>)<sub>0-2</sub>R<sup>8</sup>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>0-2</sub>S(O)<sub>0-2</sub>R<sup>8</sup>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>0-1</sub>N(R<sup>6</sup>)SO<sub>2</sub>R<sup>8</sup>, (CH<sub>2</sub>)<sub>0-1</sub>C(O)N(R<sup>6</sup>)S(O)<sub>2</sub>R<sup>8</sup> або (CH<sub>2</sub>)<sub>0-1</sub>гетероцикліл.

9. Сполука за будь-яким з пп. 1-8 або її сіль, сольват або проліки, де Y означає феніл, необов'язково, заміщений C<sub>1-4</sub>алкілом.

10. Фармацевтична композиція, що містить сполуку за будь-яким з пп. 1-9 або її сіль, проліки або сольват, разом з фармацевтично прийнятним розріджувачем або носієм.

11. Застосування сполуки формули (Ib) за будь-яким з пп. 1-9 або її солі, проліків або сольвату для одержання медикаменту для комбінованого лікування або попередження діабету або тучності.