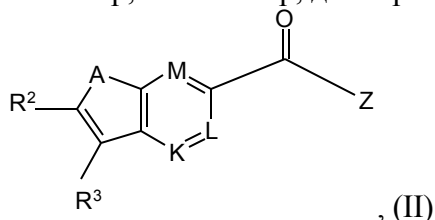


1. Ізомер, енантіомер, діастереомер або таутомер сполуки, представленої формулою II:



у якій:

A являє собою O, S, або  $\text{NR}^1$ , де  $\text{R}^1$  вибирають із групи, яка складається з H і  $(\text{C}_{1-6})$ алкілу, необов'язково заміщеного  $\text{OR}^{11}$ , де  $\text{R}^{11}$  являє собою H або  $(\text{C}_{1-6})$ алкіл;

$\text{R}^2$  вибирають з: H, галогену,  $\text{R}^{21}$ ,  $\text{OR}^{21}$ ,  $\text{SR}^{21}$ ,  $\text{COOR}^{21}$ ,  $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^{22})_2$ ,  $\text{N}(\text{R}^{22})_2$ ,  $\text{CON}(\text{R}^{22})_2$ ,  $\text{NR}^{22}\text{C}(\text{O})\text{R}^{22}$  або  $\text{NR}^{22}\text{C}(\text{O})\text{NR}^{22}$ , у яких  $\text{R}^{21}$  і кожен  $\text{R}^{22}$  незалежно являють собою H,  $(\text{C}_{1-6})$ алкіл, галогеналкіл,  $(\text{C}_{2-6})$ алкеніл,  $(\text{C}_{3-7})$ циклоалкіл,  $(\text{C}_{2-6})$ алкініл,  $(\text{C}_{5-7})$ циклоалкеніл, 6- або 10-членний арил або Het, причому вказані  $\text{R}^{21}$  і  $\text{R}^{22}$  необов'язково заміщені радикалом  $\text{R}^{20}$ , або обидва  $\text{R}^{22}$  з'єднані разом, з утворенням при цьому 5-, 6- або 7-членного насиченого гетероциклу з атомом азоту, до якого вони приєднані;

де  $\text{R}^{20}$  кожний являє собою:

1-4 замісники, вибрані з: галогену,  $\text{OPO}_3\text{H}$ ,  $\text{NO}_2$ , ціано, азидо,  $\text{C}(\text{=NH})\text{NH}_2$ ,  $\text{C}(\text{=NH})\text{NH}(\text{C}_{1-6})$ алкілу або  $\text{C}(\text{=NH})\text{NHCO}(\text{C}_{1-6})$ алкілу; або

1-4 замісники, вибраних з:

а)  $(\text{C}_{1-6})$ алкілу або галогеналкілу,  $(\text{C}_{3-7})$ циклоалкілу,  $(\text{C}_{3-7})$ спіроциклоалкілу, який необов'язково містить 1 або 2 гетероатоми,  $(\text{C}_{2-6})$ алкенілу,  $(\text{C}_{3-6})$ циклоалкенілу,  $(\text{C}_{2-8})$ алкінілу,  $(\text{C}_{1-6})$ алкіл- $(\text{C}_{3-7})$ циклоалкілу, кожний з яких необов'язково заміщений радикалом  $\text{R}^{150}$ ;

б)  $\text{OR}^{104}$ , де  $\text{R}^{104}$  являє собою H,  $(\text{C}_{1-6})$ алкіл,  $(\text{C}_{3-7})$ циклоалкіл або  $(\text{C}_{1-6})$ алкіл- $(\text{C}_{3-7})$ циклоалкіл, арил, Het,  $(\text{C}_{1-6})$ алкіларил або  $(\text{C}_{1-6})$ алкілHet, причому вказані алкіл, циклоалкіл, арил, Het,  $(\text{C}_{1-6})$ алкіларил або  $(\text{C}_{1-6})$ алкілHet необов'язково заміщені радикалом  $\text{R}^{150}$ ;

в)  $\text{OCOR}^{105}$ , де  $\text{R}^{105}$  являє собою  $(\text{C}_{1-6})$ алкіл,  $(\text{C}_{3-7})$ циклоалкіл,  $(\text{C}_{1-6})$ алкіл- $(\text{C}_{3-7})$ циклоалкіл, Het,  $(\text{C}_{1-6})$ алкіларил або  $(\text{C}_{1-6})$ алкілHet, причому вказані алкіл, циклоалкіл, арил, Het,  $(\text{C}_{1-6})$ алкіларил або  $(\text{C}_{1-6})$ алкілHet необов'язково заміщені радикалом  $\text{R}^{150}$ ;

г)  $\text{SR}^{108}$ ,  $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^{108})_2$  або  $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^{108})\text{C}(\text{O})\text{R}^{108}$ , у яких кожен  $\text{R}^{108}$  незалежно являє собою H,  $(\text{C}_{1-6})$ алкіл,  $(\text{C}_{3-7})$ циклоалкіл або  $(\text{C}_{1-6})$ алкіл- $(\text{C}_{3-7})$ циклоалкіл, арил, Het,  $(\text{C}_{1-6})$ алкіларил або  $(\text{C}_{1-6})$ алкілHet, або обидва  $\text{R}^{108}$  ковалентно зв'язані один з одним і з атомом азоту, до якого вони обидва приєднані, з утворенням при цьому 5-, 6- або 7-членного насиченого гетероциклу, причому вказані алкіл, циклоалкіл, арил, Het,  $(\text{C}_{1-6})$ алкіларил або  $(\text{C}_{1-6})$ алкілHet, або гетероцикл необов'язково заміщені радикалом  $\text{R}^{150}$ ;

д)  $\text{NR}^{111}\text{R}^{112}$ , де  $\text{R}^{111}$  являє собою H,  $(\text{C}_{1-6})$ алкіл,  $(\text{C}_{3-7})$ циклоалкіл або  $(\text{C}_{1-6})$ алкіл- $(\text{C}_{3-7})$ циклоалкіл, арил, Het,  $(\text{C}_{1-6})$ алкіларил або  $(\text{C}_{1-6})$ алкілHet, і  $\text{R}^{112}$  являє собою H, CN,  $(\text{C}_{1-6})$ алкіл,  $(\text{C}_{3-7})$ циклоалкіл або  $(\text{C}_{1-6})$ алкіл- $(\text{C}_{3-7})$ циклоалкіл, арил, Het,  $(\text{C}_{1-6})$ алкіларил,  $(\text{C}_{1-6})$ алкілHet,  $\text{COOR}^{115}$  або  $\text{SO}_2\text{R}^{115}$ , у яких  $\text{R}^{115}$  являє собою  $(\text{C}_{1-6})$ алкіл,  $(\text{C}_{3-7})$ циклоалкіл, або  $(\text{C}_{1-6})$ алкіл- $(\text{C}_{3-7})$ циклоалкіл, арил, Het,  $(\text{C}_{1-6})$ алкіларил або  $(\text{C}_{1-6})$ алкілHet, або обидва  $\text{R}^{111}$  і  $\text{R}^{112}$  ковалентно зв'язані один з одним і з атомом азоту, до якого вони обидва приєднані, з утворенням при цьому 5-, 6- або 7-членного насиченого гетероциклу, причому вказані алкіл, циклоалкіл, арил, Het,  $(\text{C}_{1-6})$ алкіларил або  $(\text{C}_{1-6})$ алкілHet, або гетероцикл необов'язково заміщені радикалом  $\text{R}^{150}$ ;

е)  $\text{NR}^{116}\text{COR}^{117}$ , де  $\text{R}^{116}$  і  $\text{R}^{117}$  кожний являє собою H,  $(\text{C}_{1-6})$ алкіл,  $(\text{C}_{3-7})$ циклоалкіл,  $(\text{C}_{1-6})$ алкіл- $(\text{C}_{3-7})$ циклоалкіл, арил, Het,  $(\text{C}_{1-6})$ алкіларил або  $(\text{C}_{1-6})$ алкілHet, причому вказані  $(\text{C}_{1-6})$ алкіл,  $(\text{C}_{3-7})$ циклоалкіл,  $(\text{C}_{1-6})$ алкіл- $(\text{C}_{3-7})$ циклоалкіл, арил, Het,  $(\text{C}_{1-6})$ алкіларил або  $(\text{C}_{1-6})$ алкілHet необов'язково заміщені радикалом  $\text{R}^{150}$ ;

ж)  $\text{NR}^{118}\text{CONR}^{119}\text{R}^{120}$ , де  $\text{R}^{118}$ ,  $\text{R}^{119}$  і  $\text{R}^{120}$  кожний являє собою H,  $(\text{C}_{1-6})$ алкіл,  $(\text{C}_{3-7})$ циклоалкіл,  $(\text{C}_{1-6})$ алкіл- $(\text{C}_{3-7})$ циклоалкіл, арил, Het,  $(\text{C}_{1-6})$ алкіларил або  $(\text{C}_{1-6})$ алкілHet, або  $\text{R}^{118}$  ковалентно приєднаний до радикала  $\text{R}^{119}$  і до атома азоту, до якого вони обидва приєднані, з утворенням

д) NR<sup>I11</sup>R<sup>I12</sup>, де R<sup>I11</sup> являє собою Н, (С<sub>1-6</sub>)алкіл, (С<sub>3-7</sub>)циклоалкіл або (С<sub>1-6</sub>)алкіл-(С<sub>3-7</sub>)циклоалкіл, арил, Het, (С<sub>1-6</sub>алкіл)арил або (С<sub>1-6</sub>алкіл)Het, і R<sup>I12</sup> являє собою Н, CN, (С<sub>1-</sub>

6) алкіл, (C<sub>3-7</sub>)циклоалкіл або (C<sub>1-6</sub>)алкіл-(C<sub>3-7</sub>)циклоалкіл, арил, Het, (C<sub>1-6</sub>алкіл)арил, (C<sub>1-6</sub>алкіл)Het, COOR<sup>115</sup> або SO<sub>2</sub>R<sup>115</sup>, у яких R<sup>115</sup> являє собою (C<sub>1-6</sub>)алкіл, (C<sub>3-7</sub>)циклоалкіл, або (C<sub>1-6</sub>)алкіл-(C<sub>3-7</sub>)циклоалкіл, арил, Het, (C<sub>1-6</sub>алкіл)арил або (C<sub>1-6</sub>алкіл)Het, або обидва R<sup>111</sup> і R<sup>112</sup> ковалентно зв'язані один з одним і з атомом азоту, до якого вони обидва приєднані, з утворенням при цьому 5-, 6- або 7-членного насиченого гетероциклу, причому вказані алкіл, циклоалкіл, арил, Het, (C<sub>1-6</sub>алкіл)арил або (C<sub>1-6</sub>алкіл)Het, або гетероцикл необов'язково заміщені радикалом R<sup>160</sup>;

е) NR<sup>116</sup>COR<sup>117</sup>, де R<sup>116</sup> і R<sup>117</sup> кожний являє собою H, (C<sub>1-6</sub>)алкіл, (C<sub>3-7</sub>)циклоалкіл, (C<sub>1-6</sub>)алкіл-(C<sub>3-7</sub>)циклоалкіл, арил, Het, (C<sub>1-6</sub>алкіл)арил або (C<sub>1-6</sub>алкіл)Het, причому вказані (C<sub>1-6</sub>)алкіл, (C<sub>3-7</sub>)циклоалкіл, (C<sub>1-6</sub>)алкіл-(C<sub>3-7</sub>)циклоалкіл, арил, Het, (C<sub>1-6</sub>алкіл)арил або (C<sub>1-6</sub>алкіл)Het необов'язково заміщені радикалом R<sup>160</sup>;

ж) NR<sup>118</sup>CONR<sup>119</sup>R<sup>120</sup>, де R<sup>118</sup>, R<sup>119</sup> і R<sup>120</sup> кожний являє собою H, (C<sub>1-6</sub>)алкіл, (C<sub>3-7</sub>)циклоалкіл, (C<sub>1-6</sub>)алкіл-(C<sub>3-7</sub>)циклоалкіл, арил, Het, (C<sub>1-6</sub>алкіл)арил або (C<sub>1-6</sub>алкіл)Het, або R<sup>118</sup> ковалентно зв'язаний з R<sup>119</sup> і з атомом азоту, до якого вони приєднані, з утворенням при цьому 5-, 6- або 7-членного насиченого гетероциклу, або R<sup>119</sup> і R<sup>120</sup> ковалентно зв'язані один з одним і з атомом азоту, до якого вони обидва приєднані, з утворенням при цьому 5-, 6- або 7-членного насиченого гетероциклу, причому вказані алкіл, циклоалкіл, (C<sub>1-6</sub>)алкіл-(C<sub>3-7</sub>)циклоалкіл, арил, Het, (C<sub>1-6</sub>алкіл)арил або (C<sub>1-6</sub>алкіл)Het, або гетероцикл необов'язково заміщені радикалом R<sup>160</sup>;

з) NR<sup>121</sup>COCOR<sup>122</sup>, де R<sup>121</sup> і R<sup>122</sup> кожний являє собою H, (C<sub>1-6</sub>)алкіл, (C<sub>3-7</sub>)циклоалкіл, (C<sub>1-6</sub>)алкіл-(C<sub>3-7</sub>)циклоалкіл, 6- або 10-членний арил, Het, (C<sub>1-6</sub>алкіл)арил або (C<sub>1-6</sub>алкіл)Het, причому вказані алкіл, циклоалкіл, алкіл-циклоалкіл, арил, Het, (C<sub>1-6</sub>алкіл)арил або (C<sub>1-6</sub>алкіл)Het необов'язково заміщені радикалом R<sup>160</sup>, або R<sup>122</sup> означає OR<sup>123</sup> або N(R<sup>124</sup>)<sub>2</sub>, у яких R<sup>123</sup> і кожен R<sup>124</sup> незалежно являє собою H, (C<sub>1-6</sub>)алкіл, (C<sub>3-7</sub>)циклоалкіл, або (C<sub>1-6</sub>)алкіл-(C<sub>3-7</sub>)циклоалкіл, арил, Het, (C<sub>1-6</sub>алкіл)арил або (C<sub>1-6</sub>алкіл)Het, або R<sup>124</sup> означає OH або O(C<sub>1-6</sub>алкіл), або обидва R<sup>124</sup> ковалентно зв'язані один з одним, з утворенням при цьому 5-, 6- або 7-членного насиченого гетероциклу, причому вказані алкіл, циклоалкіл, алкіл-циклоалкіл, арил, Het, (C<sub>1-6</sub>алкіл)арил або (C<sub>1-6</sub>алкіл)Het і гетероцикл необов'язково заміщені радикалом R<sup>160</sup>;

і) COR<sup>127</sup>, де R<sup>127</sup> являє собою H, (C<sub>1-6</sub>)алкіл, (C<sub>3-7</sub>)циклоалкіл або (C<sub>1-6</sub>)алкіл-(C<sub>3-7</sub>)циклоалкіл, арил, Het, (C<sub>1-6</sub>алкіл)арил або (C<sub>1-6</sub>алкіл)Het, причому вказані алкіл, циклоалкіл, арил, Het, (C<sub>1-6</sub>алкіл)арил або (C<sub>1-6</sub>алкіл)Het необов'язково заміщені радикалом R<sup>160</sup>;

к) тетразолу, COOR<sup>128</sup>, де R<sup>128</sup> являє собою H, (C<sub>1-6</sub>)алкіл, (C<sub>3-7</sub>)циклоалкіл або (C<sub>1-6</sub>)алкіл-(C<sub>3-7</sub>)циклоалкіл, арил, Het, (C<sub>1-6</sub>алкіл)арил або (C<sub>1-6</sub>алкіл)Het, причому вказані (C<sub>1-6</sub>)алкіл, (C<sub>3-7</sub>)циклоалкіл або (C<sub>1-6</sub>)алкіл-(C<sub>3-7</sub>)циклоалкіл, арил, Het, (C<sub>1-6</sub>алкіл)арил і (C<sub>1-6</sub>алкіл)Het необов'язково заміщені радикалом R<sup>160</sup>; і

л) CONR<sup>129</sup>R<sup>130</sup>, де R<sup>129</sup> і R<sup>130</sup> незалежно являють собою H, (C<sub>1-6</sub>)алкіл, (C<sub>3-7</sub>)циклоалкіл, (C<sub>1-6</sub>)алкіл-(C<sub>3-7</sub>)циклоалкіл, арил, Het, (C<sub>1-6</sub>алкіл)арил або (C<sub>1-6</sub>алкіл)Het, або обидва R<sup>129</sup> і R<sup>130</sup> ковалентно зв'язані один з одним і з атомом азоту, до якого вони обидва приєднані, з утворенням при цьому 5-, 6- або 7-членного насиченого гетероциклу, причому вказані алкіл, циклоалкіл, алкіл-циклоалкіл, арил, Het, (C<sub>1-6</sub>алкіл)арил, (C<sub>1-6</sub>алкіл)Het і гетероцикл необов'язково заміщені радикалом R<sup>160</sup>;

де R<sup>160</sup> визначають як 1 або 2 замісники, які вибирають з тетразолу, галогену, CN, (C<sub>1-6</sub>)алкілу, галогеналкілу, COOR<sup>161</sup>, SO<sub>3</sub>H, SR<sup>161</sup>, SO<sub>2</sub>R<sup>161</sup>, OR<sup>161</sup>, N(R<sup>162</sup>)<sub>2</sub>, SO<sub>2</sub>N(R<sup>162</sup>)<sub>2</sub>, NR<sup>162</sup>COR<sup>162</sup> або CON(R<sup>162</sup>)<sub>2</sub>, де R<sup>161</sup> і кожен R<sup>162</sup> незалежно являють собою H, (C<sub>1-6</sub>)алкіл, (C<sub>3-7</sub>)циклоалкіл або (C<sub>1-6</sub>)алкіл-(C<sub>3-7</sub>)циклоалкіл; або обидва R<sup>162</sup> ковалентно зв'язані один з одним і з атомом азоту, до якого вони обидва приєднані, з утворенням при цьому 5-, 6- або 7-членного насиченого гетероциклу,

R<sup>3</sup> вибирають з (C<sub>3-7</sub>)циклоалкілу,

K означає N або CR<sup>4</sup>, де R<sup>4</sup> являє собою H, галоген, або R<sup>4</sup> являє собою OR<sup>41</sup>, де R<sup>41</sup> являє собою H або (C<sub>1-6</sub>)алкіл;

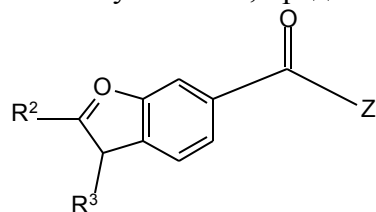
L являє собою N або CR<sup>5</sup>, де R<sup>5</sup> має ті ж самі значення, як і R<sup>4</sup>, визначений вище;  
 M являє собою N або CR<sup>7</sup>, де R<sup>7</sup> має ті ж самі значення, як і R<sup>4</sup>, визначений вище;  
 Z означає OR<sup>6</sup>, де R<sup>6</sup> являє собою H або (C<sub>1-6</sub>)алкіл; або її сіль.

2. Сполука за п. 1, у якій A означає NR<sup>1</sup>.

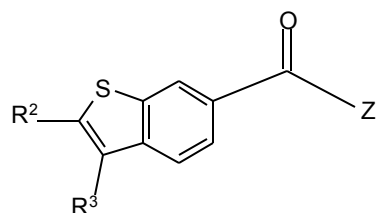
3. Сполука за п. 1, у якій M, K і L означають CH або N.

4. Сполука за п. 3, у якій M, K і L означають CH.

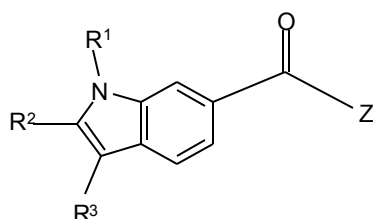
5. Сполука за п. 1, представлена наступними формулами:



IIa

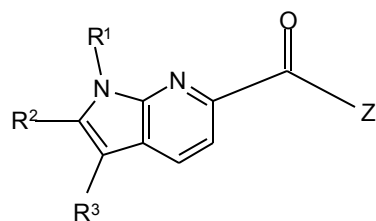


IIb



IIc

або



IIId

де R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> і Z є такими, як визначено в пункті 1.

6. Сполука за п. 1, у якій R<sup>1</sup> вибирають із групи, яка складається з H або (C<sub>1-6</sub>)алкілу.

7. Сполука за п. 6, у якій R<sup>1</sup> означає H, CH<sub>3</sub>, ізопропіл або ізобутіл.

8. Сполука за п. 7, у якій R<sup>1</sup> означає H або CH<sub>3</sub>.

9. Сполука за п. 8, у якій R<sup>1</sup> означає CH<sub>3</sub>.

10. Сполука за п. 1, у якій R<sup>2</sup> вибирають з H, галогену, (C<sub>2-6</sub>)алкенілу, (C<sub>5-7</sub>)циклоалкенілу, 6- або 10-членного арилу або Het; де (C<sub>2-6</sub>)алкеніл, (C<sub>5-7</sub>)циклоалкеніл, арил або Het необов'язково заміщені радикалом R<sup>20</sup>, де R<sup>20</sup> визначають як:

1-4 замісники, вибрані з галогену, NO<sub>2</sub>, ціано, азида, C(=NH)NH<sub>2</sub>, C(=NH)NH(C<sub>1-6</sub>)алкілу або C(=NH)NHCO(C<sub>1-6</sub>)алкілу; або

1-4 замісники, вибрані з:

а) (C<sub>1-6</sub>)алкілу або галогеналкілу, (C<sub>3-7</sub>)циклоалкілу, (C<sub>2-6</sub>)алкенілу, (C<sub>2-8</sub>)алкінілу, (C<sub>1-6</sub>)алкіл-(C<sub>3-7</sub>)циклоалкілу, кожний з яких необов'язково заміщений радикалом R<sup>150</sup>;

б) OR<sup>104</sup>, де R<sup>104</sup> являє собою H, (C<sub>1-6</sub>)алкіл, (C<sub>3-7</sub>)циклоалкіл або (C<sub>1-6</sub>)алкіл-(C<sub>3-7</sub>)циклоалкіл, арил, Het, (C<sub>1-6</sub>)алкіларил або (C<sub>1-6</sub>)алкілHet, причому вказані алкіл, циклоалкіл, арил, Het, (C<sub>1-6</sub>)алкіларил або (C<sub>1-6</sub>)алкілHet необов'язково заміщені радикалом R<sup>150</sup>;

в) OCOR<sup>105</sup>, де R<sup>105</sup> являє собою (C<sub>1-6</sub>)алкіл, (C<sub>3-7</sub>)циклоалкіл, (C<sub>1-6</sub>)алкіл-(C<sub>3-7</sub>)циклоалкіл, Het, (C<sub>1-6</sub>)алкіларил або (C<sub>1-6</sub>)алкілHet, причому вказані алкіл, циклоалкіл, арил, Het, (C<sub>1-6</sub>)алкіларил або (C<sub>1-6</sub>)алкілHet необов'язково заміщені радикалом R<sup>150</sup>;

г) SR<sup>108</sup>, SO<sub>2</sub>N(R<sup>108</sup>)<sub>2</sub> або SO<sub>2</sub>N(R<sup>108</sup>)C(O)R<sup>108</sup>, у яких кожен R<sup>108</sup> незалежно являє собою H, (C<sub>1-6</sub>)алкіл, (C<sub>3-7</sub>)циклоалкіл або (C<sub>1-6</sub>)алкіл-(C<sub>3-7</sub>)циклоалкіл, арил, Het, (C<sub>1-6</sub>)алкіларил або

(C<sub>1-6</sub>алкіл)Het, або обидва R<sup>108</sup> ковалентно зв'язані один з одним і з атомом азоту, до якого вони обидва приєднані, з утворенням при цьому 5-, 6- або 7-членного насиченого гетероциклу, причому вказані алкіл, циклоалкіл, арил, Het, (C<sub>1-6</sub>алкіл)арил або (C<sub>1-6</sub>алкіл)Het, або гетероцикл необов'язково заміщені радикалом R<sup>150</sup>;

д) NR<sup>111</sup>R<sup>112</sup>, де R<sup>111</sup> являє собою H, (C<sub>1-6</sub>)алкіл, (C<sub>3-7</sub>)циклоалкіл або (C<sub>1-6</sub>)алкіл-(C<sub>3-7</sub>)циклоалкіл, арил, Het, (C<sub>1-6</sub>алкіл)арил або (C<sub>1-6</sub>алкіл)Het, і R<sup>112</sup> являє собою H, CN, (C<sub>1-6</sub>)алкіл, (C<sub>3-7</sub>)циклоалкіл або (C<sub>1-6</sub>)алкіл-(C<sub>3-7</sub>)циклоалкіл, арил, Het, (C<sub>1-6</sub>алкіл)арил, (C<sub>1-6</sub>алкіл)Het, COOR<sup>115</sup> або SO<sub>2</sub>R<sup>115</sup>, де R<sup>115</sup> являє собою (C<sub>1-6</sub>)алкіл, (C<sub>3-7</sub>)циклоалкіл або (C<sub>1-6</sub>)алкіл-(C<sub>3-7</sub>)циклоалкіл, арил, Het, (C<sub>1-6</sub>алкіл)арил або (C<sub>1-6</sub>алкіл)Het, або обидва R<sup>111</sup> і R<sup>112</sup> ковалентно зв'язані один з одним і з атомом азоту, до якого вони обидва приєднані, з утворенням при цьому 5-, 6- або 7-членного насиченого гетероциклу, причому вказані алкіл, циклоалкіл, арил, Het, (C<sub>1-6</sub>алкіл)арил або (C<sub>1-6</sub>алкіл)Het, або гетероцикл необов'язково заміщені радикалом R<sup>150</sup>;

е) NR<sup>116</sup>COR<sup>117</sup>, де R<sup>116</sup> і R<sup>117</sup> кожний являє собою H, (C<sub>1-6</sub>)алкіл, (C<sub>3-7</sub>)циклоалкіл, (C<sub>1-6</sub>)алкіл-(C<sub>3-7</sub>)циклоалкіл, арил, Het, (C<sub>1-6</sub>алкіл)арил або (C<sub>1-6</sub>алкіл)Het, причому вказані (C<sub>1-6</sub>)алкіл, (C<sub>3-7</sub>)циклоалкіл, (C<sub>1-6</sub>)алкіл-(C<sub>3-7</sub>)циклоалкіл, арил, Het, (C<sub>1-6</sub>алкіл)арил або (C<sub>1-6</sub>алкіл)Het необов'язково заміщені радикалом R<sup>150</sup>;

ж) NR<sup>118</sup>CONR<sup>119</sup>R<sup>120</sup>, де R<sup>118</sup>, R<sup>119</sup> і R<sup>120</sup> кожний являє собою H, (C<sub>1-6</sub>)алкіл, (C<sub>3-7</sub>)циклоалкіл, (C<sub>1-6</sub>)алкіл-(C<sub>3-7</sub>)циклоалкіл, арил, Het, (C<sub>1-6</sub>алкіл)арил або (C<sub>1-6</sub>алкіл)Het, або R<sup>118</sup> ковалентно зв'язаний з R<sup>119</sup> і з атомом азоту, до якого вони обидва приєднані, з утворенням при цьому 5-, 6- або 7-членного насиченого гетероциклу; або R<sup>119</sup> і R<sup>120</sup> ковалентно зв'язані один з одним і з атомом азоту, до якого вони обидва приєднані, з утворенням при цьому 5-, 6- або 7-членного насиченого гетероциклу; вказані алкіл, циклоалкіл, (C<sub>1-6</sub>)алкіл-(C<sub>3-7</sub>)циклоалкіл, арил, Het, (C<sub>1-6</sub>алкіл)арил або (C<sub>1-6</sub>алкіл)Het, або гетероцикл необов'язково заміщені радикалом R<sup>150</sup>;

з) NR<sup>121</sup>COCOR<sup>122</sup>, де R<sup>121</sup> і R<sup>122</sup> кожний являє собою H, (C<sub>1-6</sub>)алкіл, (C<sub>3-7</sub>)циклоалкіл, (C<sub>1-6</sub>)алкіл-(C<sub>3-7</sub>)циклоалкіл, 6- або 10-членний арил, Het, (C<sub>1-6</sub>алкіл)арил або (C<sub>1-6</sub>алкіл)Het, причому вказані алкіл, циклоалкіл, алкіл-циклоалкіл, арил, Het, (C<sub>1-6</sub>алкіл)арил або (C<sub>1-6</sub>алкіл)Het необов'язково заміщені радикалом R<sup>150</sup>;

або R<sup>122</sup> означає OR<sup>123</sup> або N(R<sup>124</sup>)<sub>2</sub>, де R<sup>123</sup> і кожен R<sup>124</sup> незалежно являють собою H, (C<sub>1-6</sub>)алкіл, (C<sub>3-7</sub>)циклоалкіл або (C<sub>1-6</sub>)алкіл-(C<sub>3-7</sub>)циклоалкіл, арил, Het, (C<sub>1-6</sub>алкіл)арил або (C<sub>1-6</sub>алкіл)Het, або R<sup>124</sup> означає OH або O(C<sub>1-6</sub>алкіл), або обидва R<sup>124</sup> ковалентно зв'язані один з одним, з утворенням при цьому 5-, 6- або 7-членного насиченого гетероциклу, причому вказані алкіл, циклоалкіл, алкіл-циклоалкіл, арил, Het, (C<sub>1-6</sub>алкіл)арил або (C<sub>1-6</sub>алкіл)Het і гетероцикл необов'язково заміщені радикалом R<sup>150</sup>;

і) COR<sup>127</sup>, де R<sup>127</sup> являє собою H, (C<sub>1-6</sub>)алкіл, (C<sub>3-7</sub>)циклоалкіл або (C<sub>1-6</sub>)алкіл-(C<sub>3-7</sub>)циклоалкіл, арил, Het, (C<sub>1-6</sub>алкіл)арил або (C<sub>1-6</sub>алкіл)Het, причому вказані алкіл, циклоалкіл, арил, Het, (C<sub>1-6</sub>алкіл)арил або (C<sub>1-6</sub>алкіл)Het необов'язково заміщені радикалом R<sup>150</sup>;

к) COOR<sup>128</sup>, де R<sup>128</sup> являє собою H, (C<sub>1-6</sub>)алкіл, (C<sub>3-7</sub>)циклоалкіл або (C<sub>1-6</sub>)алкіл-(C<sub>3-7</sub>)циклоалкіл, арил, Het, (C<sub>1-6</sub>алкіл)арил або (C<sub>1-6</sub>алкіл)Het, причому вказані (C<sub>1-6</sub>)алкіл, (C<sub>3-7</sub>)циклоалкіл або (C<sub>1-6</sub>)алкіл-(C<sub>3-7</sub>)циклоалкіл, арил, Het, (C<sub>1-6</sub>алкіл)арил і (C<sub>1-6</sub>алкіл)Het необов'язково заміщені радикалом R<sup>150</sup>;

л) CONR<sup>129</sup>R<sup>130</sup>, де R<sup>129</sup> і R<sup>130</sup> незалежно являють собою H, (C<sub>1-6</sub>)алкіл, (C<sub>3-7</sub>)циклоалкіл, (C<sub>1-6</sub>)алкіл-(C<sub>3-7</sub>)циклоалкіл, арил, Het, (C<sub>1-6</sub>алкіл)арил або (C<sub>1-6</sub>алкіл)Het, або обидва R<sup>129</sup> і R<sup>130</sup> ковалентно зв'язані один з одним і з атомом азоту, до якого вони обидва приєднані, з утворенням при цьому 5-, 6- або 7-членного насиченого гетероциклу, причому вказані алкіл, циклоалкіл, алкіл-циклоалкіл, арил, Het, (C<sub>1-6</sub>алкіл)арил, (C<sub>1-6</sub>алкіл)Het і гетероцикл необов'язково заміщені радикалом R<sup>150</sup>;

м) арил, Het, (C<sub>1-6</sub>алкіл)арил або (C<sub>1-6</sub>алкіл)Het, кожний з яких необов'язково заміщений радикалом R<sup>150</sup>, де R<sup>150</sup> являє собою, переважно:

1-3 замісники, вибрані з: галогену, NO<sub>2</sub>, ціано або азидо; або

1-3 замісники, вибрані з:

- а)  $(C_{1-6})$ алкілу або галогеналкілу,  $(C_{3-7})$ циклоалкілу,  $(C_{2-6})$ алкенілу,  $(C_{2-8})$ алкінілу,  $(C_{1-6})$  алкіл- $(C_{3-7})$ циклоалкілу, кожний з яких необов'язково заміщений радикалом  $R^{160}$ ;
- б)  $OR^{104}$ , де  $R^{104}$  являє собою H,  $(C_{1-6})$ алкіл або  $(C_{3-7})$ циклоалкіл, причому вказані алкіл або циклоалкіл необов'язково заміщені радикалом  $R^{160}$ ;
- г)  $SR^{108}$ ,  $SO_2N(R^{108})_2$  або  $SO_2N(R^{108})C(O)R^{108}$ , де кожен  $R^{108}$  незалежно являє собою H,  $(C_{1-6})$ алкіл,  $(C_{3-7})$ циклоалкіл або  $(C_{1-6})$ алкіл- $(C_{3-7})$ циклоалкіл, арил, Het, або обидва  $R^{108}$  ковалентно зв'язані один з одним і з атомом азоту, до якого вони обидва приєднані, з утворенням при цьому 5-, 6- або 7-членного насиченого гетероциклу, причому вказані алкіл, циклоалкіл, арил, Het і гетероцикл необов'язково заміщені радикалом  $R^{160}$ ;
- д)  $NR^{111}R^{112}$ , де  $R^{111}$  являє собою H,  $(C_{1-6})$ алкіл або  $(C_{3-7})$ циклоалкіл, і  $R^{112}$  являє собою H,  $(C_{1-6})$ алкіл або  $(C_{3-7})$ циклоалкіл,  $COOR^{115}$  або  $SO_2R^{115}$ , де  $R^{115}$  являє собою  $(C_{1-6})$ алкіл або  $(C_{3-7})$ циклоалкіл, або обидва  $R^{111}$  і  $R^{112}$  ковалентно зв'язані один з одним і з атомом азоту, до якого вони обидва приєднані, з утворенням при цьому 5-, 6- або 7-членного насиченого гетероциклу, причому вказані алкіл, циклоалкіл і гетероцикл необов'язково заміщені радикалом  $R^{160}$ ;
- е)  $NR^{116}COR^{117}$ , де  $R^{116}$  і  $R^{117}$  кожний являє собою H,  $(C_{1-6})$ алкіл або  $(C_{3-7})$ циклоалкіл, причому вказані  $(C_{1-6})$ алкіл і  $(C_{3-7})$ циклоалкіл необов'язково заміщені радикалом  $R^{160}$ ;
- ж)  $NR^{118}CONR^{119}R^{120}$ , де  $R^{118}$ ,  $R^{119}$  і  $R^{120}$  кожний являє собою H,  $(C_{1-6})$ алкіл або  $(C_{3-7})$ циклоалкіл, або  $R^{118}$  ковалентно зв'язаний з радикалом  $R^{119}$  і з атомом азоту, до якого вони приєднані, з утворенням при цьому 5-, 6- або 7-членного насиченого гетероциклу, або  $R^{119}$  і  $R^{120}$  ковалентно зв'язані один з одним і з атомом азоту, до якого вони обидва приєднані, з утворенням при цьому 5-, 6- або 7-членного насиченого гетероциклу, причому вказані алкіл, циклоалкіл і гетероцикл необов'язково заміщені радикалом  $R^{160}$ ;
- з)  $NR^{121}COCOR^{122}$ , де  $R^{121}$  являє собою H,  $(C_{1-6})$ алкіл або  $(C_{3-7})$ циклоалкіл, причому вказані алкіл і циклоалкіл необов'язково заміщені радикалом  $R^{160}$ , або  $R^{122}$  означає  $OR^{123}$  або  $N(R^{124})_2$ , де  $R^{123}$  і кожен  $R^{124}$  незалежно являють собою H,  $(C_{1-6})$ алкіл або  $(C_{3-7})$ циклоалкіл, або обидва  $R^{124}$  ковалентно зв'язані один з одним, з утворенням при цьому 5-, 6- або 7-членного насиченого гетероциклу, причому вказані алкіл, циклоалкіл і гетероцикл необов'язково заміщені радикалом  $R^{160}$ ;
- і)  $COR^{127}$ , де  $R^{127}$  являє собою H,  $(C_{1-6})$ алкіл або  $(C_{3-7})$ циклоалкіл, причому вказані алкіл і циклоалкіл необов'язково заміщені радикалом  $R^{160}$ ;
- к)  $COOR^{128}$ , де  $R^{128}$  являє собою H,  $(C_{1-6})$ алкіл або  $(C_{3-7})$ циклоалкіл, причому вказані  $(C_{1-6})$ алкіл і  $(C_{3-7})$ циклоалкіл необов'язково заміщені радикалом  $R^{160}$ ; і
- л)  $CONR^{129}R^{130}$ , де  $R^{129}$  і  $R^{130}$  незалежно являють собою H,  $(C_{1-6})$ алкіл або  $(C_{3-7})$ циклоалкіл, або обидва  $R^{129}$  і  $R^{130}$  ковалентно зв'язані один з одним і з атомом азоту, до якого вони обидва приєднані, з утворенням при цьому 5-, 6- або 7-членного насиченого гетероциклу, причому вказані алкіл, циклоалкіл і гетероцикл необов'язково заміщені радикалом  $R^{160}$ ;
- де  $R^{160}$  визначають як 1 або 2 замісники, вибрані з галогену, CN,  $C_{1-6}$ алкілу, галогеналкілу,  $COOR^{161}$ ,  $OR^{161}$ ,  $N(R^{162})_2$ ,  $SO_2N(R^{162})_2$ ,  $NR^{162}COR^{162}$  або  $CON(R^{162})_2$ , де  $R^{161}$  і кожен  $R^{162}$  незалежно являють собою H,  $(C_{1-6})$ алкіл,  $(C_{3-7})$ циклоалкіл або  $(C_{1-6})$ алкіл- $(C_{3-7})$ циклоалкіл; або обидва  $R^{162}$  ковалентно зв'язані один з одним і з атомом азоту, до якого вони обидва приєднані, з утворенням при цьому 5-, 6- або 7-членного насиченого гетероциклу.

11. Сполука за п. 10, у якій  $R^2$  вибирають з арилу або Het, кожний з яких необов'язково монозаміщений або дизаміщений замісниками, вибраними з групи, яка складається з галогену, галогеналкілу,  $N_3$ , або

а)  $(C_{1-6})$ алкілу, необов'язково заміщеного групою OH або  $O(C_{1-6})$ алкіл;

б)  $(C_{1-6})$ алкокси;

д)  $NR^{111}R^{112}$ , де обидва  $R^{111}$  і  $R^{112}$  незалежно являють собою H,  $(C_{1-6})$ алкіл,  $(C_{3-7})$ циклоалкіл, або  $R^{112}$  являє собою 6- або 10-членний арил, Het,  $(C_{1-6})$ алкіларил або  $(C_{1-6})$ алкіл-Het; або обидва  $R^{111}$  і  $R^{112}$  ковалентно зв'язані один з одним і з атомом азоту, до якого вони обидва

приєднані, з утворенням при цьому азотовмісного гетероциклу, причому кожний із вказаних алкілу, циклоалкілу, арилу, Het, алкіларилу або алкіл-Het необов'язково заміщені галогеном або:

OR<sup>161</sup> або N(R<sup>162</sup>)<sub>2</sub>, де R<sup>161</sup> і кожен R<sup>162</sup> незалежно являє собою H, (C<sub>1-6</sub>)алкіл, або обидва R<sup>162</sup> ковалентно зв'язані один з одним і з атомом азоту, до якого вони обидва приєднані, з утворенням при цьому азотовмісного гетероциклу;

е) NHCOR<sup>117</sup>, де R<sup>117</sup> являє собою (C<sub>1-6</sub>)алкіл;

і) CO-арил; і

л) CONH<sub>2</sub>, CONH(C<sub>1-6</sub>алкіл), CON(C<sub>1-6</sub>алкіл)<sub>2</sub>, CONH-арил або CONHC<sub>1-6</sub>алкіларил.

12. Сполука за п. 11, де R<sup>2</sup> являє собою арил або Het, кожний з яких необов'язково монозаміщений або дизаміщений замісниками, вибраними з групи, яка складається з галогену, галогеналкілу, або

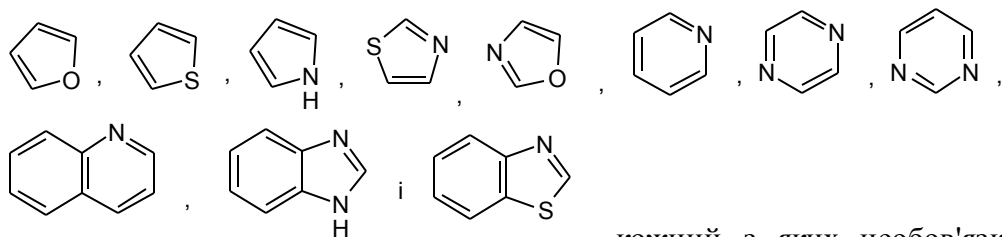
а) (C<sub>1-6</sub>)алкілу, необов'язково заміщеного групою OH або O(C<sub>1-6</sub>)алкіл;

б) (C<sub>1-6</sub>)алкокси; і

д) NR<sup>111</sup>R<sup>112</sup>, де обидва R<sup>111</sup> і R<sup>112</sup> незалежно являють собою H, (C<sub>1-6</sub>)алкіл, (C<sub>3-7</sub>)циклоалкіл, або R<sup>112</sup> являє собою 6- або 10-членний арил, Het, (C<sub>1-6</sub>)алкіларил або (C<sub>1-6</sub>)алкіл-Het; або обидва R<sup>111</sup> і R<sup>112</sup> ковалентно зв'язані один з одним і з атомом азоту, до якого вони обидва приєднані, з утворенням при цьому азотовмісного гетероциклу, причому кожний із вказаних алкілу, циклоалкілу, арилу, Het, алкіларилу або алкіл-Het необов'язково заміщений галогеном або:

OR<sup>161</sup> або N(R<sup>162</sup>)<sub>2</sub> де R<sup>161</sup> і кожен R<sup>162</sup> незалежно являють собою H, (C<sub>1-6</sub>)алкіл, або обидва R<sup>162</sup> ковалентно зв'язані один з одним і з атомом азоту, до якого вони обидва приєднані, з утворенням при цьому азотовмісного гетероциклу.

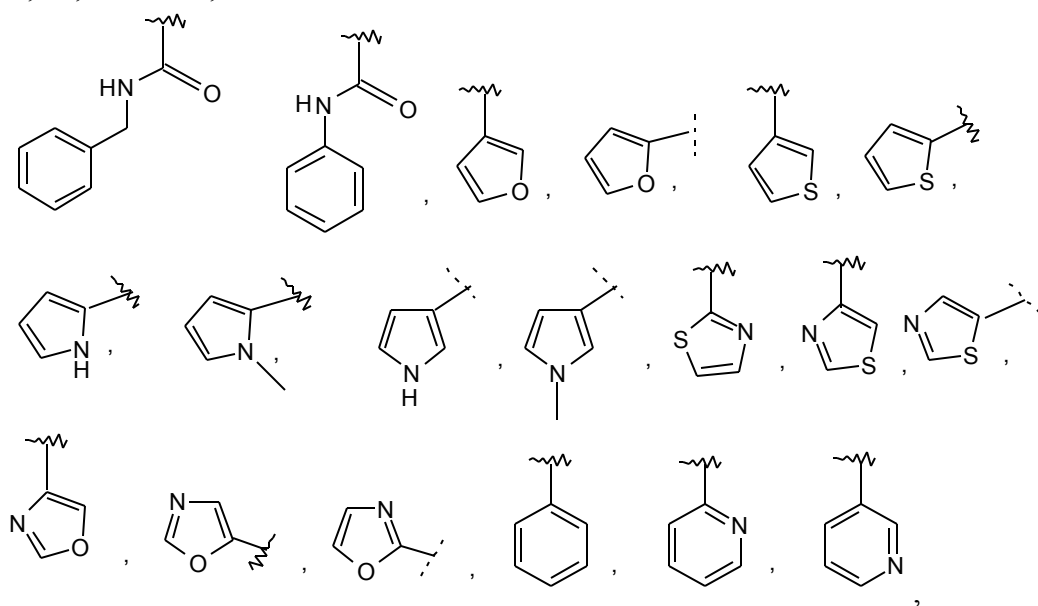
13. Сполука за п. 12, де R<sup>2</sup> означає феніл або гетероцикл, вибраний з:

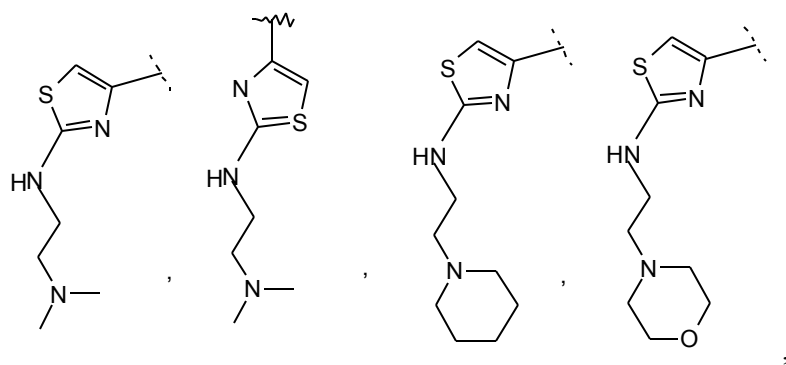
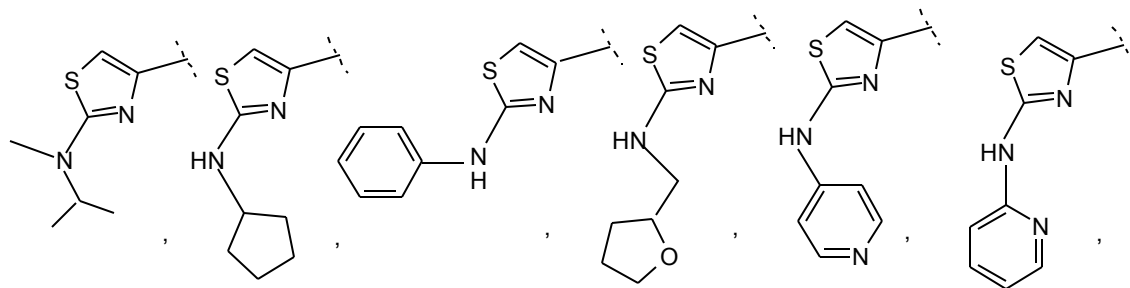
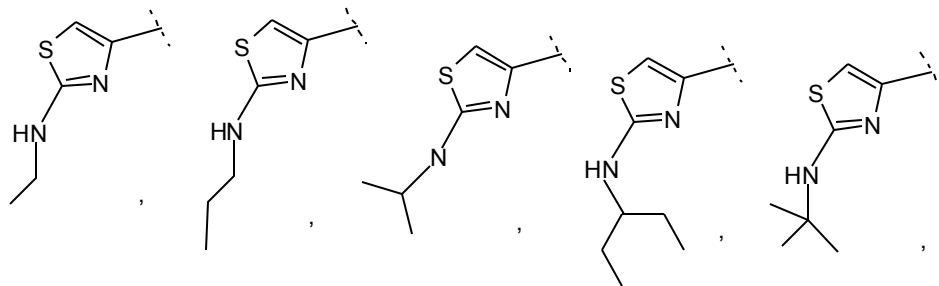
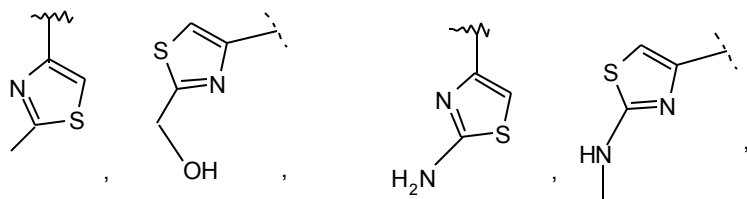
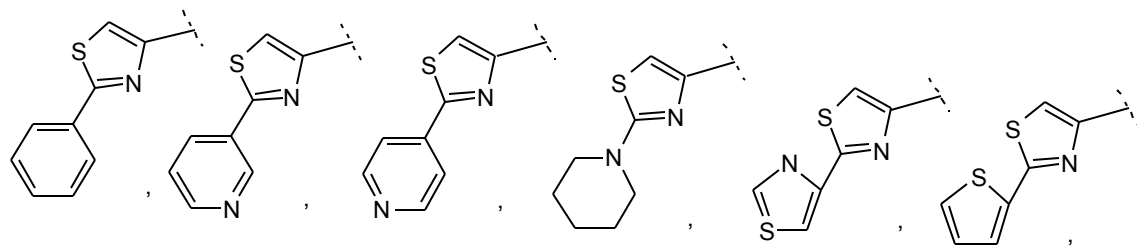
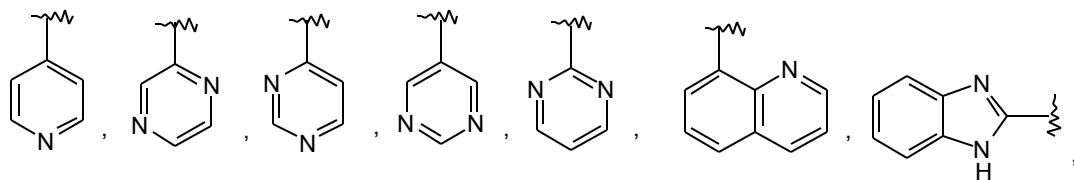


визначено в п. 12.

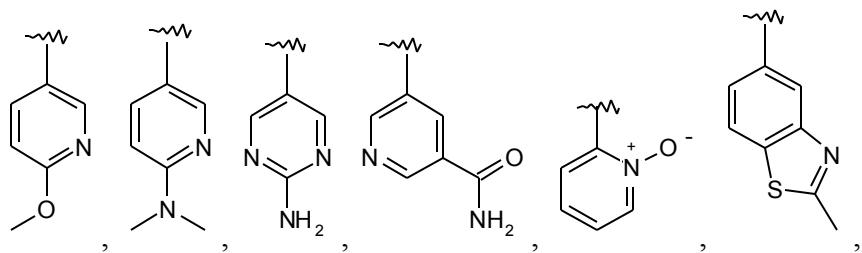
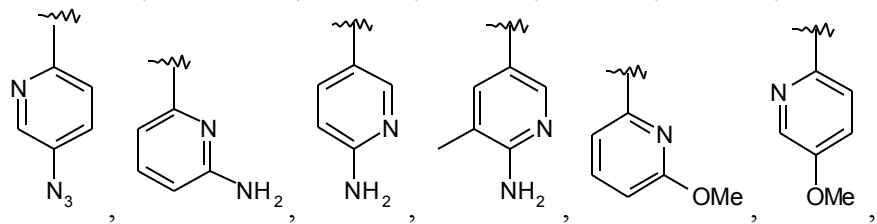
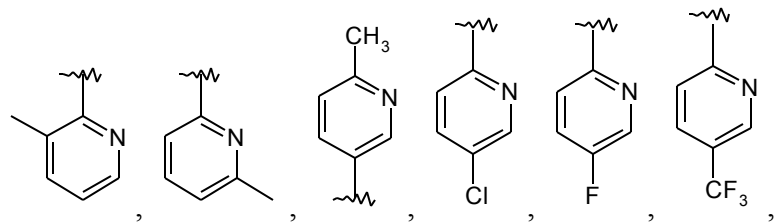
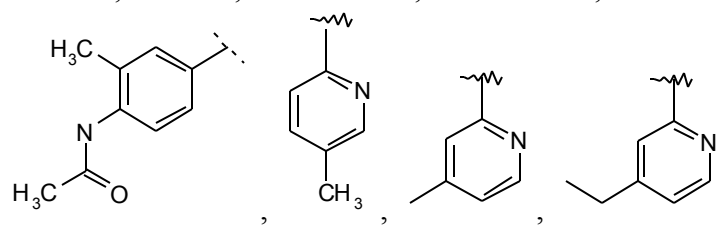
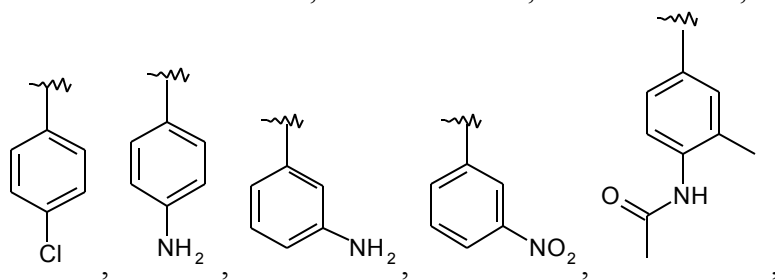
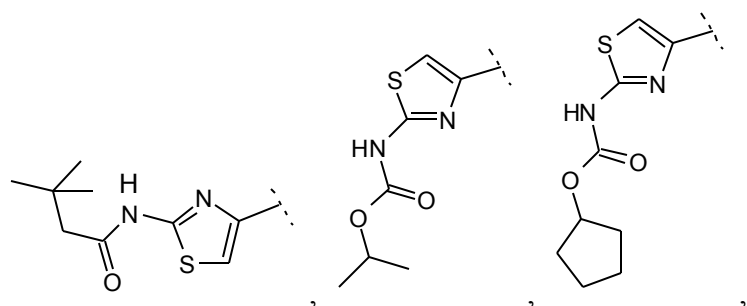
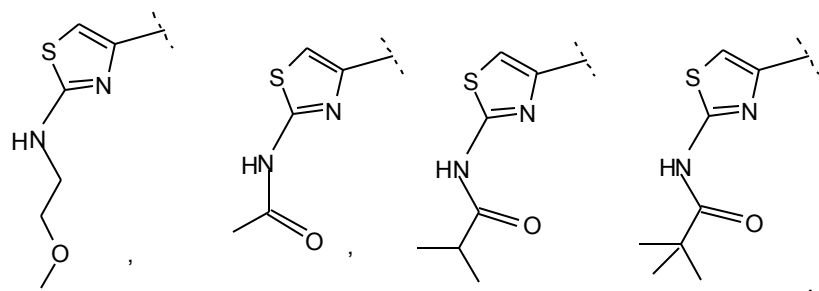
14. Сполука за п. 1, у якій R<sup>2</sup> вибирають з

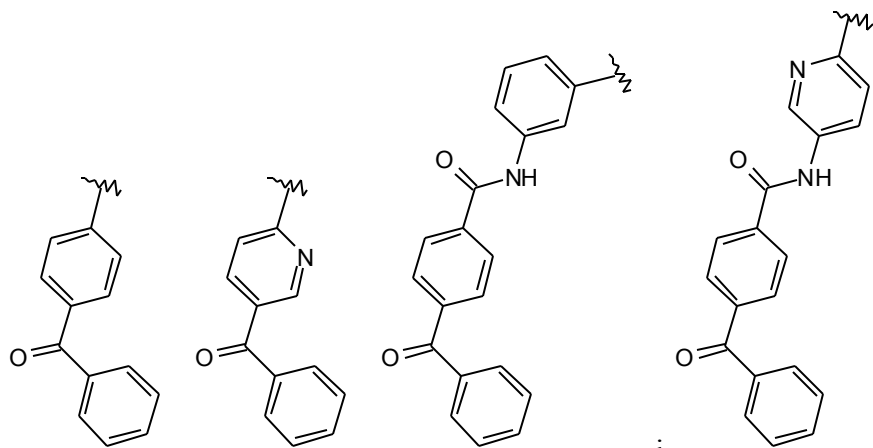
H, Br, CH=CH<sub>2</sub>,





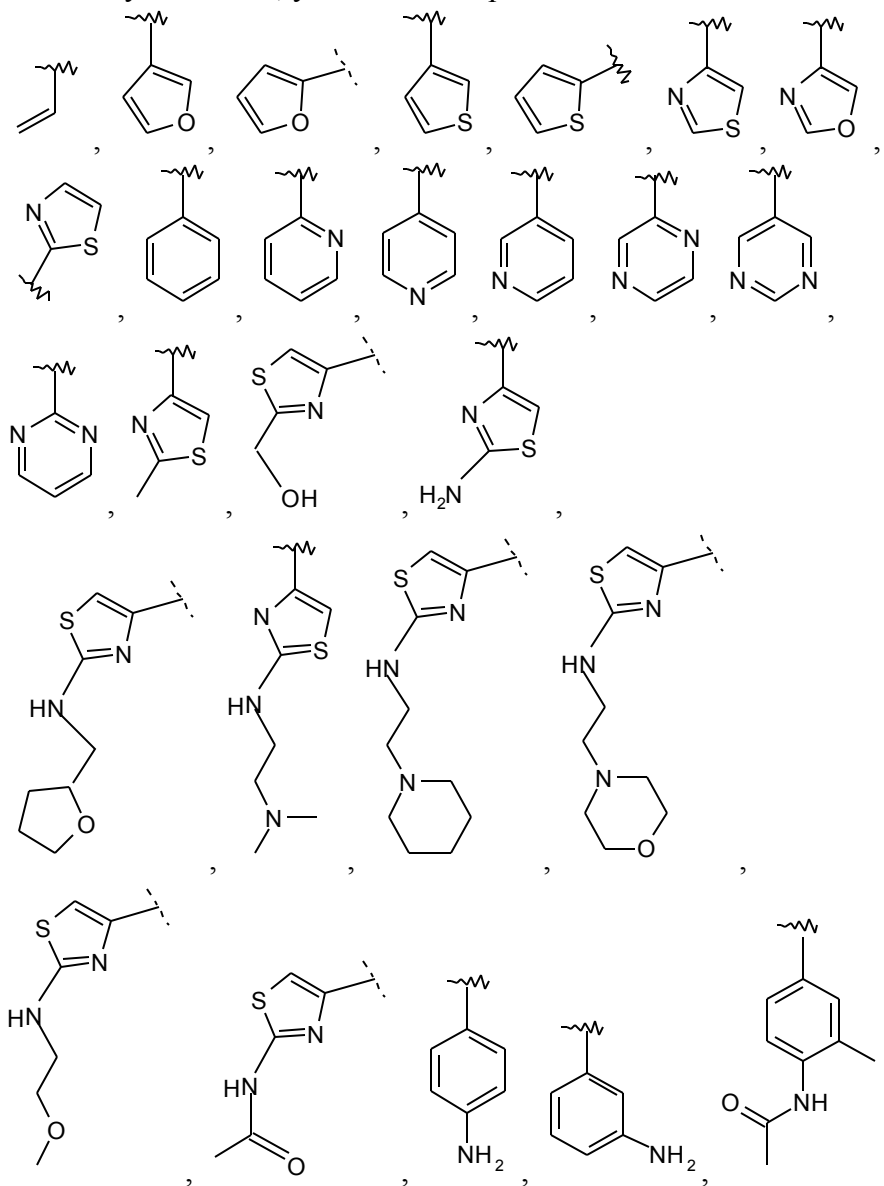


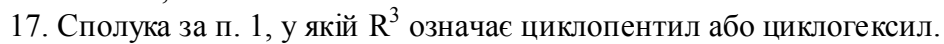
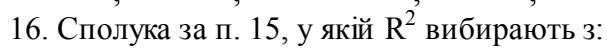




i

15. Сполука за п. 14, у якій  $R^2$  вибирають з :



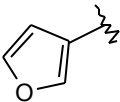
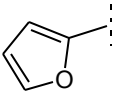
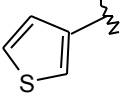
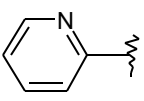
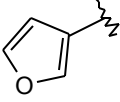
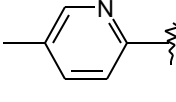
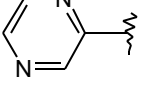
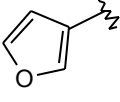
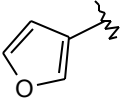
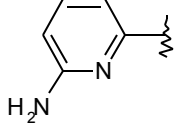
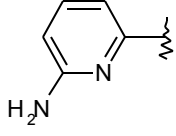
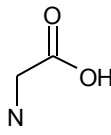
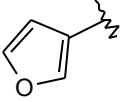
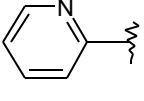
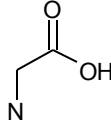
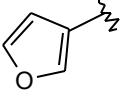
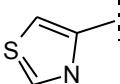


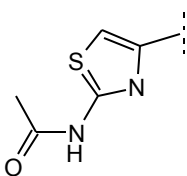
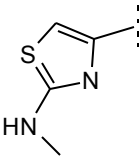
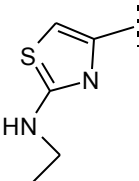
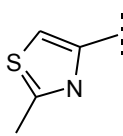
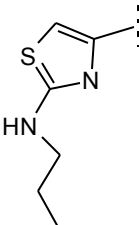
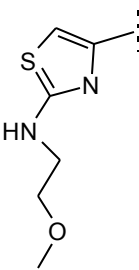
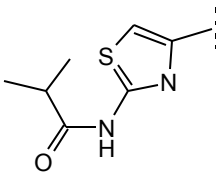
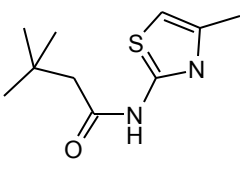
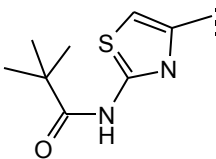
18. Сполука за п. 1, у якій Z означає ОН.

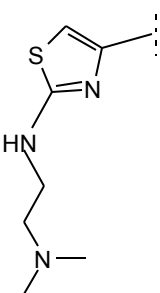
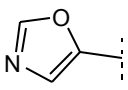
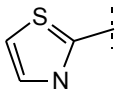
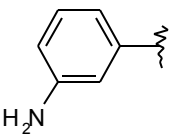
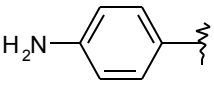
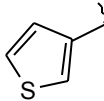
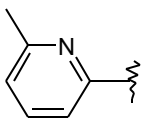
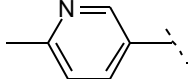
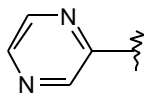
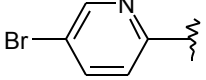
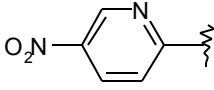
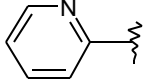
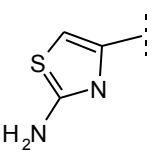
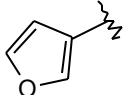
19. Сполука за п. 1, вибрана із сполук формули:

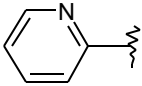
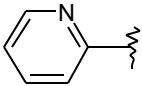
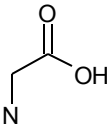
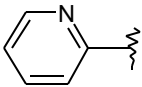
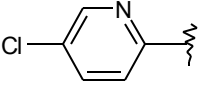
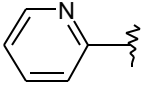
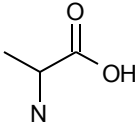
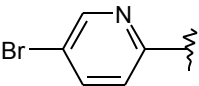
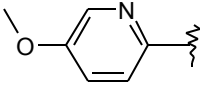
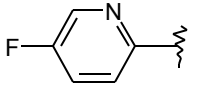
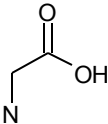
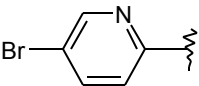
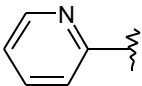
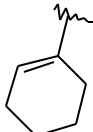


Спол. №	A	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	Z
101	N-Me	феніл	циклогексил	ОН

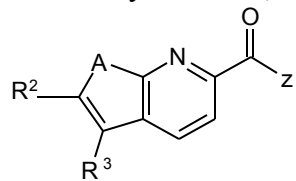
102	NH		циклогексил	ОН
103	NH		циклогексил	ОН
104	NH		циклогексил	ОН
105	NH	Br	циклогексил	ОН
106	N-Me		циклогексил	ОН
107	N-Me		циклогексил	ОН
108	N-Me		циклогексил	ОН
109	N-Me		циклогексил	ОН
110	NH		циклопентил	ОН
111	N-Me		циклопентил	ОН
112	N-Me		циклогексил	ОН
113	N-Me		циклопентил	ОН
114			циклогексил	OMe
115	N-Me		циклопентил	ОН
116			циклогексил	ОН
117	N-Me		циклопентил	ОН

118	N-Me		циклопентил	ОН
119	N-Me		циклопентил	ОН
120	N-Me		циклопентил	ОН
121	N-Me		циклопентил	ОН
122	N-Me		циклопентил	ОН
123	N-Me		циклопентил	ОН
124	N-Me		циклопентил	ОН
125	N-Me		циклопентил	ОН
126	N-Me		циклопентил	ОН

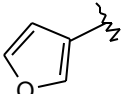
127	N-Me		циклопентил	ОН
128	N-Me		циклопентил	ОН
129	N-Me		циклопентил	ОН
130	N-Me		циклопентил	ОН
131	N-Me		циклопентил	ОН
132	N-Me		циклопентил	ОН
133	N-Me		циклопентил	ОН
134	N-Me		циклопентил	ОН
135	N-Me		циклопентил	ОН
136	N-Me		циклопентил	ОН
137	N-Me		циклопентил	ОН
138	S		циклопентил	ОН
139	N-Me		циклогексил	ОН
140	S		циклопентил	ОН

141	O		циклопентил	ОН
142	NH		циклогексил	ОН
143			циклогексил	ОН
144	N-Me		циклопентил	ОН
145	NH		циклопентил	ОН
146			циклогексил	ОН
147	N-Me		циклопентил	ОН
148	N-Me		циклопентил	ОН
149			циклогексил	ОН
150	N-Me			ОН

20. Сполука за п. 1, вибрана із сполук формули:



у якій А, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> і Z є такими, як визначено нижче:

Спол. №	А	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	Z
201	N-Me	феніл	циклогексил	ОН
202	N-Me		циклогексил	ОН

21. Сполука формули II згідно із п. 1, або її фармацевтично прийнятна сіль, як інгібітор реплікації вірусу гепатиту С (HCV).