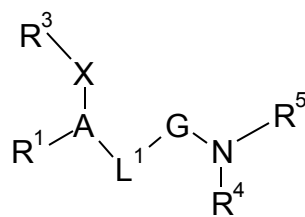


1. Сполука загальної формули (I)



(I)

де

G є -C(O)-,

A є >N-, і

X є прямим зв'язком, -O- або -N(R⁶)-, де

R⁶ є воднем або алкілом, який необов'язково може бути заміщеним одним або кількома замісниками R¹⁶, R¹⁷ та R¹⁸, і

L¹ є -(CH₂)_n-Y- або прямим зв'язком, де

n є цілим числом від 1 до 6, і

Y є прямим зв'язком, -O- або -N(R⁷)-, де

R⁷ є воднем або алкілом, який необов'язково може бути заміщеним одним або кількома замісниками R²², R²³ та R²⁴,

або

X є алкіленом, який необов'язково може бути заміщеним одним або кількома замісниками R²⁵, R²⁸ та R²⁷, або прямим зв'язком, і

L¹ є -O- або -N(R⁸)-, де

R⁸ є воднем або алкілом, який необов'язково може бути заміщеним одним або кількома замісниками R²⁸, R²⁹ та R³⁰,

або

A є >C(R²)-, де R² є воднем або алкілом, необов'язково заміщеним одним або кількома замісниками R³¹, R³² та R³³, і

X є -O-, -S- або -N(R⁶)-, де

R⁶ є таким, як визначено вище, і

L¹ є -(CH₂)_n-Y- або прямим зв'язком, де

n є цілим числом від 1 до 6, і

Y є прямим зв'язком, O або -N(R⁷)-, де

R⁷ є таким, як визначено вище,

або

X є алкіленом, який необов'язково може бути заміщеним одним або кількома замісниками R²⁵, R²⁶ та R²⁷, або прямим зв'язком, і

L^1 є -O- або -N(R⁸)-, де

R⁸ є таким, як визначено вище,

R¹ є вибраним з-поміж фенілу, нафтилу та бензодіоксили, необов'язково заміщеного одним або кількома замісниками R⁴⁴, R⁴⁵ та R⁴⁶, та R⁴⁷ або R¹ є циклоалкілом, необов'язково заміщеним одним або кількома замісниками R³⁴, R³⁵ та R³⁶;

R³ є вибраним з-поміж алкілу, алкенілу, алкінілу, циклоалкілу та гетероциклілу, необов'язково заміщеного одним або кількома замісниками R³⁴, R³⁵ та R³⁶, або з-поміж фенілу та фуранілу, необов'язково заміщеного одним або кількома замісниками R⁴⁴, R⁴⁵, R⁴⁶ та R⁴⁷,

або

R¹ та R³ можуть бути взяті разом з атомами, до яких вони є приєднаними, для утворення циклоалкільного або гетероциклільного кільця, необов'язково заміщеного одним або кількома замісниками R³⁴, R³⁵ та R³⁶,

або, якщо A є >C(R²)-, то

R¹ та R² можуть бути взяті разом з атомами, до яких вони є приєднаними, для утворення циклоалкільного або гетероциклільного кільця, необов'язково заміщеного одним або кількома замісниками R³⁴, R³⁵ та R³⁶,

або

R² та R³ можуть бути взяті разом з атомами, до яких вони є приєднаними, для утворення циклоалкільного або гетероциклільного кільця, необов'язково заміщеного одним або кількома замісниками R³⁴, R³⁵ та R³⁶,

R⁴ є воднем або алкілом, необов'язково заміщеним одним або кількома замісниками R³⁷, R³⁸ та R³⁹, і

R⁵ є гетероарилом, вибраним з групи, що включає фуран, тіофен, пірол, імідазол, піразол, триазол, тетразол, тіазол, оксазол, ізоксазол, оксадіазол, тадіазол, ізотіазол, піридазин, піразин, хінолін, ізохінолін, бензофуран, бензотіофен, індол, та індазол, необов'язково заміщеним одним або кількома замісниками R⁴⁸, R⁴⁹, R⁵⁰ та R⁵¹,

де

R¹⁶, R¹⁷, R¹⁸, R¹⁹, R²⁰, R²¹, R²², R²³, R²⁴, R²⁵, R²⁶, R²⁷, R²⁸, R²⁹, R³⁰, R³¹, R³², R³³, R³⁴, R³⁵, R³⁶, R³⁷, R³⁸ та R³⁹ незалежно один від одного є вибраними з-поміж

-CHF₂, -CF₃, -OCF₃, -OCHF₂, -OCH₂CF₃, -OCF₂CHF₂, -S(O)₂CF₃, -SCF₃, -OR⁵², -NR⁵²R⁵³, -SR⁵², -NR⁵²S(O)₂R⁵³, -S(O)₂NR⁵²R⁵³, -S(O)NR⁵²R⁵³, -S(O)R⁵², -S(O)₂R⁵², -C(O)NR⁵²R⁵³, -OC(O)NR⁵²R⁵³, -NR⁵²C(O)R⁵³, -CH₂C(O)NR⁵²R⁵³, -OCH₂C(O)NR⁵²R⁵³, -

CH₂OR⁵², -CH₂NR⁵²R⁵³, -OC(O)R⁵², -C(O)R⁵² та -C(O)OR⁵², C₂₋₆-алкенілу та C₂₋₆-алкінілу, який необов'язково може бути заміщеним одним або кількома замісниками, вибраними з-поміж -CN, -CF₃, -OCF₃, -OR⁵², -NR⁵²R⁵³ та C₁₋₆-алкілу, C₃₋₈-циклоалкілу, C₄₋₈-циклоалкенілу, гетероциклілу, C₃₋₈-циклоалкіл-C₁₋₆-алкілу, C₃₋₈-циклоалкіл-C₁₋₆-алкокси, C₃₋₈-циклоалкілокси, C₃₋₈-циклоалкіл-C₁₋₆-алкілтію, C₃₋₈-циклоалкілтію, C₃₋₈-циклоалкіл-C₂₋₆-алкенілу, C₃₋₈-циклоалкіл-C₂₋₆-алкінілу, C₄₋₈-циклоалкеніл-C₁₋₆-алкілу, C₄₋₈-циклоалкеніл-C₂₋₆-алкенілу, C₄₋₈-циклоалкеніл-C₂₋₆-алкінілу, гетероцикліл-C₁₋₆-алкілу, гетероцикліл-C₂₋₆-алкенілу, гетероцикліл-C₂₋₆-алкінілу, арилу, арилокси, арилоксикарбонілу, ароїлу, арил-C₁₋₆-алкокси, арил-C₁₋₆-алкілу, арил-C₂₋₆-алкенілу, арил-C₂₋₆-алкінілу, гетероарилу, гетероарил-C₁₋₆-алкілу, гетероарил-C₂₋₆-алкенілу та гетероарил-C₂₋₆-алкінілу, з яких арильний та гетероарильний компоненти необов'язково можуть бути заміщеними одним або кількома замісниками, вибраними з-поміж галогену, -C(O)OR⁵², -CN, -CF₃, -OCF₃, -NO₂, -OR⁵², -NR⁵²R⁵³ та C₁₋₆-алкілу, і

R⁴⁰, R⁴¹, R⁴², R⁴³, R⁴⁴, R⁴⁵, R⁴⁶ та R⁴⁷ незалежно один від одного є вибраними з-поміж галогену, -CN, -CH₂CN, -CHF₂, -CF₃, -OCF₃, -OCHF₂, -OCH₂CF₃, -OCF₂CHF₂, -S(O)₂CF₃, -SCF₃, -NO₂, -OR⁵², -NR⁵²R⁵³, -SR⁵², -NR⁵²S(O)₂R⁵³, -S(O)₂NR⁵²R⁵³, -S(O)NR⁵²R⁵³, -S(O)R⁵², -S(O)₂R⁵², -C(O)NR⁵²R⁵³, -OC(O)NR⁵²R⁵³, -NR⁵²C(O)R⁵³, -CH₂C(O)NR⁵²R⁵³, -OCH₂C(O)NR⁵²R⁵³, -CH₂OR⁵², -CH₂NR⁵²R⁵³, -OC(O)R⁵², -C(O)R⁵² та -C(O)OR⁵²;

C₁₋₆-алкілу, C₂₋₆-алкенілу та C₂₋₆-алкінілу, який необов'язково може бути заміщеним одним або кількома замісниками, вибраними з-поміж -CN, -CF₃, -OCF₃, -OR⁵², -NR⁵²R⁵³ та C₁₋₆-алкілу;

C₃₋₈-циклоалкілу, C₄₋₈-циклоалкенілу, гетероциклілу, C₃₋₈-циклоалкіл-C₁₋₆-алкілу, C₃₋₈-циклоалкіл-C₁₋₆-алкокси, C₃₋₈-циклоалкілокси, C₃₋₈-циклоалкіл-C₁₋₆-алкілтію, C₃₋₈-циклоалкілтію, C₃₋₈-циклоалкіл-C₂₋₆-алкенілу, C₃₋₈-циклоалкіл-C₂₋₆-алкінілу, C₄₋₈-циклоалкеніл-C₁₋₆-алкілу, C₄₋₈-циклоалкеніл-C₂₋₆-алкенілу, C₄₋₈-циклоалкеніл-C₂₋₆-алкінілу, гетероцикліл-C₁₋₆-алкілу, гетероцикліл-C₂₋₆-алкенілу, гетероцикліл-C₂₋₆-алкінілу, арилу, арилокси, арилоксикарбонілу, ароїлу, арил-C₁₋₆-алкокси, арил-C₁₋₆-алкілу, арил-C₂₋₆-алкенілу, арил-C₂₋₆-алкінілу, гетероарилу, гетероарил-C₁₋₆-алкілу, гетероарил-C₂₋₆-алкенілу та гетероарил-C₂₋₆-алкінілу, з яких арил та гетероарил необов'язково може бути заміщеним одним або кількома замісниками, вибраними з-поміж галогену, -C(O)OR⁵², -CN, -CF₃, -OCF₃, -NO₂, -OR⁵², -NR⁵²R⁵³ та C₁₋₆-алкілу;

два з R^{40} , R^{41} , R^{42} та R^{43} , або два з R^{44} , R^{45} , R^{46} та R^{47} на суміжних атомах вуглецю можуть бути незалежно взяті разом для утворення $-O-CH_2-O-$,

де

R^{52} та R^{53} незалежно один від одного є воднем, C_{1-6} -алкілом, арил- C_{1-6} -алкілом або арилом,

або

R^{52} та R^{53} , якщо приєднані до одного атома азоту, разом з вищезгаданим атомом азоту можуть утворювати 3-8-членне гетероциклічне кільце, яке необов'язково містить один або два додаткових гетероатоми вибрані з-поміж азоту, кисню та сірки, і необов'язково містить один або два подвійні зв'язки, і

R^{48} , R^{49} , R^{50} та R^{51} незалежно один від одного є вибраними з-поміж галогену, перфтороалкілу, ціано, алкіл-Z-, арил-Z-, арил-алкілен-Z-, $N(R^{63})(R^{64})$ -алкілен-Z- та R^{65} -W-алкілен-Z-, де

Z та W незалежно один від одного є вибраними з-поміж прямого зв'язку, алкілену, $-O-$, $-N(R^{66})-$, $-S-$, $-SO_2-$, $-C(O)N(R^{66})-$, $-N(R^{66})C(O)-$, $-N(R^{66})C(O)N(R^{67})-$, $-N(R^{66})SO_2-$, $-SO_2N(R^{66})-$, $-C(O)C-$, $-OC(O)-$ та $-N(R^{66})O_2N(R^{67})-$, де

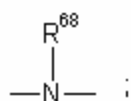
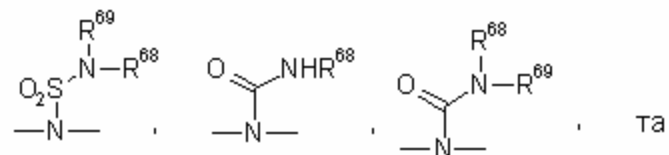
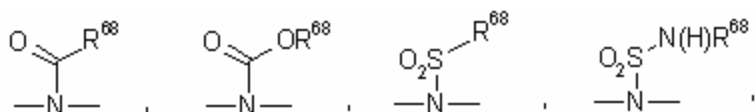
R^{66} та R^{67} незалежно один від одного є воднем або алкілом, R^{63} , R^{64} та R^{65} є вибраними з групи, яка складається з водню, арилу, алкілу та арил-алкілену, або

R^{63} та R^{64} можуть бути взяті разом для утворення кільця, що має формулу $-(CH_2)_j-E-(CH_2)_k-$ зв'язаного з атомом азоту, до якого приєднані R^{63} та R^{64} , де

j є цілим числом від 1 до 4,

k є цілим числом від 1 до 4, і

E є прямим зв'язком, $-CH_2-$, $-O-$, $-S-$, $-S(O_2)-$, $-C(O)-$, $-C(O)N(H)-$, $-NHC(O)-$, $-NHC(O)N(H)-$, $-NHSO_2-$, $-SO_2NH-$, $-C(O)O-$, $-OC(O)-$, $-NHSO_2NH-$,



де

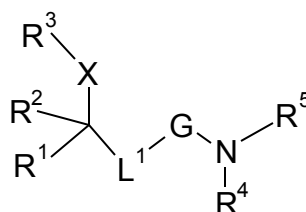
R^{68} та R^{69} є вибраними з групи, яка складається з водню, арилу, алкілу та

арил-алкілену,

або її фармацевтично прийнятна сіль, сольват або проліки.

2. Сполука за п. 1, **яка відрізняється тим, що** R^3 є вибраним з-поміж арилу та гетероарилу, необов'язково заміщеного одним або кількома замісниками R^{44} , R^{45} , R^{46} та R^{47} .

3. Сполука за п. 1, **яка відрізняється тим, що** є сполукою загальної формули (II)



(II)

де

$G \in -C(O)-$,

R^2 є воднем або алкілом, який необов'язково може бути заміщеним одним або кількома замісниками R^{31} , R^{32} та R^{33} ,

$X \in -O-$, $-S-$ або $-N(R^6)-$, де

R^6 є таким, як визначено у п. 1,

$L^1 \in -(CH_2)_n-Y$ або прямим зв'язком, де

n є цілим числом від 1 до 6,

$Y \in$ прямим зв'язком, O або $-N(R^7)-$, де

R^7 є таким, як визначено у п. 1,

або її фармацевтично прийнятна сіль, сольват або проліки.

4. Сполука за п. 3, **яка відрізняється тим, що**

$X \in -S-$, $-O-$ або $-N(R^6)-$, де R^6 є таким, як визначено у п. 3.

5. Сполука за п. 4, **яка відрізняється тим, що**

$X \in -S-$, $-O-$, або $-N(R^6)-$, де

R^6 є воднем або алкілом.

6. Сполука за п. 5, **яка відрізняється тим, що**

$X \in -S-$, $-O-$, або $-N(R^6)-$, де

R^6 є воднем або C_{1-6} -алкілом.

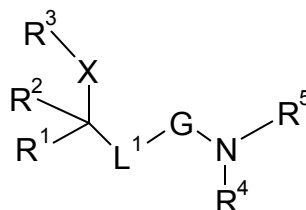
7. Сполука за п. 6, **яка відрізняється тим, що**

$X \in -S-$.

8. Сполука за п. 6, **яка відрізняється тим, що**

$X \in -O-$.

9. Сполука за п. 6, **яка відрізняється тим, що**
 $X \in -NH-$.
10. Сполука за п. 1, **яка відрізняється тим, що є сполукою загальної формули**
 (II)



(II)

де

$G \in -C(O)-$,

R^2 є воднем або алкілом, який необов'язково може бути заміщеним одним або кількома замісниками R^{31} , R^{32} та R^{33} ,

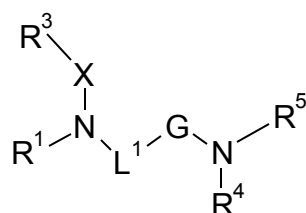
X є алкіленом, який необов'язково може бути заміщеним одним або кількома замісниками R^{25} , R^{26} та R^{27} , або прямим зв'язком,

L^1 is $-O-$, або $-N(R^8)-$, де

R^8 є таким, як визначено у п. 1,

або її фармацевтично прийнятна сіль, сольват або проліки.

11. Сполука за п. 10, **яка відрізняється тим, що**
 R^2 є воднем або алкілом, який необов'язково може бути заміщеним одним або кількома замісниками R^{31} , R^{32} та R^{33} .
12. Сполука за п. 10 або п. 11, **яка відрізняється тим, що**
 X є метиленом.
13. Сполука за п. 10 або п. 11, **яка відрізняється тим, що**
 X є прямим зв'язком.
14. Сполука за будь-яким з пп. з 10 по 13, **яка відрізняється тим, що**
 $L^1 \in -O-$.
15. Сполука за п. 1, **яка відрізняється тим, що є сполукою загальної формули**
 (III),



(III)

де

G є -C(O)-, і

X є прямим зв'язком, -O-, -S- або -N(R⁶)-, де

R⁶ є таким, як визначено у п. 1, і

L¹ є -(CH₂)_n-Y- або прямим зв'язком, де

n є цілим числом від 1 до 6, і

Y є прямим зв'язком, -O- або -N(R⁷)-, де

R⁷ є таким, як визначено у п. 1,

або

X є алкіленом, який необов'язково може бути заміщеним одним або кількома замісниками R²⁵, R²⁶ та R²⁷, або прямим зв'язком, і

L¹ є -O- або -N(R⁸)-, де

R⁸ є таким, як визначено у п. 1, або

її фармацевтично прийнятна сіль, сольват або проліки.

16. Сполука за будь-яким з пп. з 1 по 15, **яка відрізняється тим, що**

R² є воднем або C₁₋₆-алкілом, який необов'язково може бути заміщеним одним або кількома замісниками R³¹, R³² та R³³, де

R³¹, R³² та R³³ є такими, як визначено у п. 1.

17. Сполука за п. 16, **яка відрізняється тим, що**

R² є воднем.

18. Сполука за будь-яким з пп. з 1 по 17, **яка відрізняється тим, що**

R³ є вибраним з-поміж C₁₋₈-алкілу, C₂₋₈-алкенілу та C₂₋₈-алкінілу, необов'язково заміщеного одним або кількома замісниками R³⁴, R³⁵ та R³⁶, де

R³⁴, R³⁵ та R³⁶ є такими, як визначено у п. 1.

19. Сполука за п. 18, **яка відрізняється тим, що**

R³ є вибраним з-поміж C₁₋₈-алкілу, C₂₋₈-алкенілу та C₂₋₈-алкінілу, заміщеного одним або кількома замісниками R³⁴, R³⁵ та R³⁶, де

R³⁴, R³⁵ та R³⁶ є такими, як визначено у п. 1.

20. Сполука за п. 18, **яка відрізняється тим, що**

R³ є C₁₋₈-алкілом, необов'язково заміщеним одним або кількома замісниками R³⁴, R³⁵ та R³⁶, де

R³⁴, R³⁵ та R³⁶ є такими, як визначено у п. 1.

21. Сполука за п. 20, **яка відрізняється тим, що**

R³ є C₁₋₈-алкілом, заміщеним одним або кількома замісниками R³⁴, R³⁵ та R³⁶,

- де R^{34} , R^{35} та R^{36} є такими, як визначено у п. 1.
22. Сполука за п. 20, **яка відрізняється тим, що**
 R^3 є C_{1-8} -алкілом, необов'язково заміщеним одним замісником R^{34} ,
де R^{34} є таким, як визначено у п. 1.
23. Сполука за п. 22, **яка відрізняється тим, що**
 R^3 є C_{1-8} -алкілом, заміщеним одним замісником R^{34} ,
де R^{34} є таким, як визначено у п. 1.
24. Сполука за п. 22, **яка відрізняється тим, що**
 R^3 є C_{1-3} -алкілом, необов'язково заміщеним одним замісником R^{34} ,
де R^{34} є таким, як визначено у п. 1.
25. Сполука за п. 24, **яка відрізняється тим, що**
 R^3 є C_{1-3} -алкілом, заміщеним одним замісником R^{34} ,
де R^{34} є таким, як визначено у п. 1.
26. Сполука за будь-яким з пп. з 18 по 25, **яка відрізняється тим, що**
 R^{34} , R^{35} та R^{36} незалежно один від одного є вибраними з-поміж $-\text{CHF}_2$, $-\text{CF}_3$, $-\text{OCF}_3$, $-\text{OCHF}_2$, $-\text{OCH}_2\text{CF}_3$, $-\text{OCF}_2\text{CHF}_2$, $-\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$, $-\text{SCF}_3$, $-\text{OR}^{52}$, $-\text{NR}^{52}\text{R}^{53}$, $-\text{SR}^{52}$, $-\text{NR}^{52}\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{53}$, $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}^{52}\text{R}^{53}$, $-\text{S}(\text{O})\text{NR}^{52}\text{R}^{53}$, $-\text{S}(\text{O})\text{R}^{52}$, $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{52}$, $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^{52}\text{R}^{53}$, $-\text{OC}(\text{O})\text{NR}^{52}\text{R}^{53}$, $-\text{NR}^{52}\text{C}(\text{O})\text{R}^{53}$, $-\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{NR}^{52}\text{R}^{53}$, $-\text{OCH}_2\text{C}(\text{O})\text{NR}^{52}\text{R}^{53}$, $-\text{CH}_2\text{OR}^{52}$, $-\text{CH}_2\text{NR}^{52}\text{R}^{53}$, $-\text{OC}(\text{O})\text{R}^{52}$, $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{52}$ та $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{52}$,
- C_{2-6} -алкенілу та C_{2-6} -алкінілу, який необов'язково може бути заміщеним одним або кількома замісниками, вибраними з-поміж $-\text{CN}$, $-\text{CF}_3$, $-\text{OCF}_3$, $-\text{OR}^{52}$, $-\text{NR}^{52}\text{R}^{53}$ та C_{1-6} -алкілу, C_{3-8} -циклоалкілу, C_{4-8} -циклоалкенілу, C_{3-8} -гетероциклілу, C_{3-8} -циклоалкіл- C_{1-6} -алкілу, C_{3-8} -циклоалкіл- C_{1-6} -алкокси, C_{3-8} -циклоалкілокси, C_{3-8} -циклоалкіл- C_{1-6} -алкілтіо, C_{3-8} -циклоалкілтіо, C_{3-8} -циклоалкіл- C_{2-6} -алкенілу, C_{3-8} -циклоалкіл- C_{2-6} -алкінілу, C_{4-8} -циклоалкеніл- C_{1-6} -алкілу, C_{4-8} -циклоалкеніл- C_{2-6} -алкенілу, C_{4-8} -циклоалкеніл- C_{2-6} -алкінілу, C_{3-8} -гетероцикліл- C_{1-6} -алкілу, C_{3-8} -гетероцикліл- C_{2-6} -алкенілу, C_{3-8} -гетероцикліл- C_{2-6} -алкінілу, C_{6-18} -арилу, C_{6-18} -арилокси, C_{6-18} -арилоксикарбонілу, C_{6-18} -ароїлу, C_{6-18} -арил- C_{1-6} -алкокси, C_{6-18} -арил- C_{1-6} -алкілу, C_{6-18} -арил- C_{2-6} -алкенілу, C_{6-18} -арил- C_{2-6} -алкінілу, C_{5-18} -гетероарилу, C_{5-18} -гетероарил- C_{1-6} -алкілу, C_{5-18} -гетероарил- C_{2-6} -алкенілу та C_{5-18} -гетероарил- C_{2-6} -алкінілу, з яких C_{6-18} -арильний та C_{5-18} -гетероарильний компонент необов'язково може бути заміщеним одним або кількома замісниками, вибраними з-поміж галогену, $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{52}$, $-\text{CN}$, $-\text{CF}_3$, $-\text{OCF}_3$, $-\text{NO}_2$, $-\text{OR}^{52}$, $-\text{NR}^{52}\text{R}^{53}$ та C_{1-6} -алкілу, де
 R^{52} та R^{53} незалежно один від одного є воднем, C_{1-6} -алкілом, C_{6-18} -арил- C_{1-6} -алкілом або C_{6-18} -арилом,

або

R^{52} та R^{53} , якщо приєднані до одного атома азоту, разом з вищезгаданим атомом азоту можуть утворювати 3-8-членне гетероциклічне кільце, яке необов'язково містить один або два додаткових гетероатоми, вибрані з-поміж азоту, кисню та сірки, і необов'язково містить один або два подвійні зв'язки.

27. Сполука за п. 26, яка відрізняється тим, що

R^{34} , R^{35} та R^{36} незалежно один від одного є вибраними з-поміж C_{3-8} -циклоалкілу, C_{4-8} -циклоалкенілу, C_{3-8} -гетероциклілу, C_{3-8} -циклоалкіл- C_{1-6} -алкілу, C_{3-8} -циклоалкіл- C_{1-6} -алкокси, C_{3-8} -циклоалкілокси, C_{3-8} -циклоалкіл- C_{1-6} -алкілтію, C_{3-8} -циклоалкілтію, C_{3-8} -циклоалкіл- C_{2-6} -алкенілу, C_{3-8} -циклоалкіл- C_{2-6} -алкінілу, C_{4-8} -циклоалкеніл- C_{1-6} -алкілу, C_{4-8} -циклоалкеніл- C_{2-6} -алкенілу, C_{4-8} -циклоалкеніл- C_{2-6} -алкінілу, C_{3-8} -гетероцикліл- C_{1-6} -алкілу, C_{3-8} -гетероцикліл- C_{2-6} -алкенілу, C_{2-6} -гетероцикліл- C_{2-6} -алкінілу, C_{6-18} -арилу, C_{6-18} -арилокси, C_{6-18} -арилоксикарбонілу, C_{6-18} -ароїлу, C_{6-18} -арил- C_{1-6} -алкокси, C_{6-18} -арил- C_{1-6} -алкілу, C_{6-18} -арил- C_{2-6} -алкенілу, C_{6-18} -арил- C_{2-6} -алкінілу, C_{5-18} -гетероарилу, C_{5-18} -гетероарил- C_{1-6} -алкілу, C_{5-18} -гетероарил- C_{2-6} -алкенілу та C_{5-18} -гетероарил- C_{2-6} -алкінілу, з яких C_{6-18} -арильний та C_{5-18} -гетероарильний компонент необов'язково може бути заміщеним одним або кількома замісниками, вибраними з-поміж галогену, $-C(O)OR^{52}$, $-CN$, $-CF_3$, $-OCF_3$, $-NO_2$, $-OR^{52}$, $-NR^{52}R^{53}$ та C_{1-6} -алкілу, де

R^{52} та R^{53} незалежно один від одного є воднем, C_{1-6} -алкілом, C_{6-18} -арил- C_{1-6} -алкілом або C_{6-18} -арилом,

або

R^{52} та R^{53} , якщо приєднані до одного атома азоту, разом з вищезгаданим атомом азоту можуть утворювати 3-8-членне гетероциклічне кільце, яке необов'язково містить один або два додаткових гетероатоми, вибрані з-поміж азоту, кисню та сірки, і необов'язково містить один або два подвійні зв'язки.

28. Сполука за п. 27, яка відрізняється тим, що

R^{34} , R^{35} та R^{36} незалежно один від одного є вибраними з-поміж C_{3-8} -циклоалкілу, C_{6-18} -арилу або C_{5-18} -гетероарилу, з яких C_{6-18} -арил та C_{5-18} -гетероарил необов'язково може бути заміщеним одним або кількома замісниками, вибраними з-поміж галогену, $-C(O)OR^{52}$, $-CN$, $-CF_3$, $-OCF_3$, $-NO_2$, $-OR^{52}$, $-NR^{52}R^{53}$ та C_{1-6} -алкілу, де

R^{52} та R^{53} незалежно один від одного є воднем, C_{1-6} -алкілом, C_{6-18} -арил- C_{1-6} -алкілом або C_{6-18} -арилом,

або

R^{52} та R^{53} , якщо приєднані до одного атома азоту, разом з вищезгаданим атомом азоту можуть утворювати 3-8-членне гетероциклічне кільце, яке необов'язково містить один або два додаткових гетероатоми, вибрані з-поміж азоту, кисню та сірки, і необов'язково містить один або два подвійні зв'язки.

29. Сполука за п. 28, **яка відрізняється тим, що**

R^{34} , R^{35} та R^{36} незалежно один від одного є вибраними з-поміж C_{3-6} -циклоалкілу, C_{6-10} -арилу або C_{5-7} -гетероарилу, з яких C_{6-10} -арил та C_{5-7} -гетероарил необов'язково можуть бути заміщеним одним або кількома замісниками, вибраними з-поміж галогену, $-C(O)OR^{52}$, $-CN$, $-CF_3$, $-OCF_3$, $-NO_2$, $-OR^{52}$, $-NR^{52}R^{53}$ та C_{1-6} -алкілу, де

R^{52} та R^{53} незалежно один від одного є воднем, C_{1-6} -алкілом або C_{6-10} -арилом,

або

R^{52} та R^{53} , якщо приєднані до одного атома азоту, разом з вищезгаданим атомом азоту можуть утворювати 3-8-членне гетероциклічне кільце, яке необов'язково містить один або два додаткових гетероатоми, вибрані з-поміж азоту, кисню та сірки, і необов'язково містить один або два подвійні зв'язки.

30. Сполука за будь-яким з пп. з 26 по 29, **яка відрізняється тим, що**

R^{52} та R^{53} є воднем.

31. Сполука за п. 22, **яка відрізняється тим, що**

R^3 є C_{4-8} -алкілом.

32. Сполука за п. 31, **яка відрізняється тим, що**

R^3 є C_4 -алкілом.

33. Сполука за будь-яким з пп. з 1 по 17, **яка відрізняється тим, що**

R^3 є вибраним з-поміж C_{3-8} -циклоалкілу та C_{3-8} -гетероциклілу, необов'язково заміщеного одним або кількома замісниками R^{34} , R^{35} та R^{36} , де

R^{34} , R^{35} та R^{36} є такими, як визначено у п. 1.

34. Сполука за п. 33, **яка відрізняється тим, що**

R^3 є вибраним з-поміж C_{3-8} -циклоалкілу та C_{3-8} -гетероциклілу, заміщеного одним або кількома замісниками R^{34} , R^{35} та R^{36} , де

R^{34} , R^{35} та R^{36} є такими, як визначено у п. 1.

35. Сполука за п. 33, **яка відрізняється тим, що**

R^3 є вибраним з-поміж C_{5-6} -циклоалкілу та C_{5-6} -гетероциклілу, необов'язково заміщеного одним або кількома замісниками R^{34} , R^{35} та R^{36} , де

R^{34} , R^{35} та R^{36} є такими, як визначено у п. 1.

36. Сполука за п. 35, **яка відрізняється тим, що**

R^3 є вибраним з-поміж C_{5-6} -циклоалкілу та C_{5-6} -гетероциклілу, заміщеного одним або кількома замісниками R^{34} , R^{35} та R^{36} , де

R^{34} , R^{35} та R^{36} є такими, як визначено у п. 1.

37. Сполука за п. 35, **яка відрізняється тим, що**

R^3 є цикlopентилом, циклогексилом, тетрагідропіранілом або тетрагідротіопіранілом, необов'язково заміщеним одним або кількома замісниками R^{34} , R^{35} та R^{36} , де

R^{34} , R^{35} та R^{36} є такими, як визначено у п. 1.

38. Сполука за п. 37, **яка відрізняється тим, що**

R^3 є цикlopентилом, циклогексилом, тетрагідропіранілом або тетрагідротіопіранілом, заміщеним одним або кількома замісниками R^{34} , R^{35} та R^{36} , де

R^{34} , R^{35} та R^{36} є такими, як визначено у п. 1.

39. Сполука за будь-яким з пп. з 33 по 38, **яка відрізняється тим, що**

R^{34} , R^{35} та R^{36} незалежно один від одного є вибраними з-поміж $-CHF_2$, $-CF_3$, $-OCF_3$, $-OCHF_2$, $-OCH_2CF_3$, $-OCF_2CHF_2$, $-S(O)_2CF_3$, $-SCF_3$, $-OR^{52}$, $-NR^{52}R^{53}$, $-SR^{52}$, $-NR^{52}S(O)_2R^{53}$, $-S(O)_2NR^{52}R^{53}$, $-S(O)NR^{52}R^{53}$, $-S(O)R^{52}$, $-S(O)_2R^{52}$, $-C(O)NR^{52}R^{53}$, $-OC(O)NR^{52}R^{53}$, $-NR^{52}C(O)R^{53}$, $-CH_2C(O)NR^{52}R^{53}$, $-OCH_2C(O)NR^{52}R^{53}$, $-CH_2OR^{52}$, $-CH_2NR^{52}R^{53}$, $-OC(O)R^{52}$, $-C(O)R^{52}$ та $-C(O)OR^{52}$,

C_{2-6} -алкенілу та C_{2-6} -алкінілу, який необов'язково може бути заміщеним одним або кількома замісниками, вибраними з-поміж $-CN$, $-CF_3$, $-OCF_3$, $-OR^{52}$, $-NR^{52}R^{53}$ та C_{1-6} -алкілу, C_{3-8} -циклоалкілу, C_{4-8} -циклоалкенілу, C_{3-8} -гетероциклілу, C_{3-8} -циклоалкіл- C_{1-6} -алкілу, C_{3-8} -циклоалкіл- C_{1-6} -алкокси, C_{3-8} -циклоалкілокси, C_{3-8} -циклоалкіл- C_{1-6} -алкілтіо, C_{3-8} -циклоалкілтіо, C_{3-8} -циклоалкіл- C_{2-6} -алкенілу, C_{3-8} -циклоалкіл- C_{2-6} -алкінілу, C_{4-8} -циклоалкеніл- C_{1-6} -алкілу, C_{4-8} -циклоалкеніл- C_{2-6} -алкенілу, C_{4-8} -циклоалкеніл- C_{2-6} -алкінілу, C_{3-8} -гетероцикліл- C_{1-6} -алкілу, C_{3-8} -гетероцикліл- C_{2-6} -алкенілу, C_{3-8} -гетероцикліл- C_{2-6} -алкінілу, C_{6-18} -арилу, C_{6-18} -арилокси, C_{6-18} -арилоксикарбонілу, C_{6-18} -ароїлу, C_{6-18} -арил- C_{1-6} -алкокси, C_{6-18} -арил- C_{1-6} -алкілу, C_{6-18} -арил- C_{2-6} -алкенілу, C_{6-18} -арил- C_{2-6} -алкінілу, C_{5-18} -гетероарилу, C_{5-18} -гетероарил- C_{1-6} -алкілу, C_{5-18} -гетероарил- C_{2-6} -алкенілу та C_{5-18} -гетероарил- C_{2-6} -алкінілу, з яких C_{6-18} -арильний та C_{5-18} -гетероарильний компонент необов'язково може бути заміщеним одним або кількома замісниками, вибраними з-поміж галогену, $-C(O)OR^{52}$, $-CN$, $-CF_3$, $-OCF_3$, $-NO_2$, $-OR^{52}$, $-NR^{52}R^{53}$ та C_{1-6} -алкілу, де

R^{52} та R^{53} незалежно один від одного є воднем, C_{1-6} -алкілом, C_{6-18} -арил- C_{1-6} -

алкілом або C₆₋₁₈-арилом,

або

R⁵² та R⁵³, якщо приєднані до одного атома азоту, разом з вищезгаданим атомом азоту можуть утворювати 3-8-членне гетероциклічне кільце, яке необов'язково містить один або два додаткових гетероатоми, вибрані з-поміж азоту, кисню та сірки, і необов'язково містить один або два подвійні зв'язки.

40. Сполука за п. 39, **яка відрізняється тим, що**

R³⁴, R³⁵ та R³⁶ незалежно один від одного є вибраними з-поміж -CHF₂, -CF₃, -OCF₃, -OCHF₂, -OCH₂CF₃, -OCF₂CHF₂, -S(O)₂CF₃, -SCF₃, -OR⁵², -NR⁵²R⁵³, -SR⁵², -NR⁵²S(O)₂R⁵³, -S(O)₂NR⁵²R⁵³, -S(O)NR⁵²R⁵³, -S(O)R⁵², -S(O)₂R⁵², -C(O)NR⁵²R⁵³, -OC(O)NR⁵²R⁵³, -NR⁵²C(O)R⁵³, -CH₂C(O)NR⁵²R⁵³, -OCH₂C(O)NR⁵²R⁵³, -CH₂OR⁵², -CH₂NR⁵²R⁵³, -OC(O)R⁵², -C(O)R⁵² та -C(O)OR⁵²,

C₂₋₆-алкенілу та C₂₋₆-алкінілу, який необов'язково може бути заміщеним одним або кількома замісниками, вибраними з-поміж -CN, -CF₃, -OCF₃, -OR⁵², -NR⁵²R⁵³ та C₁₋₆-алкілу, C₅₋₆-циклоалкілу, C₅₋₆-циклоалкенілу, C₅₋₆-гетероциклілу, C₅₋₆-циклоалкілокси, C₅₋₆-циклоалкілтію, C₆₋₁₀-арилу, C₆₋₁₀-арилокси, C₆₋₁₀-арилоксикарбонілу, C₆₋₁₀-ароїлу, C₅₋₇-гетероарилу, з яких C₆₋₁₀-арильний та C₅₋₇-гетероарильний компонент необов'язково може бути заміщеним одним або кількома замісниками, вибраними з-поміж галогену, -C(O)OR⁵², -CN, -CF₃, -OCF₃, -NO₂, -OR⁵², -NR⁵²R⁵³ та C₁₋₆-алкілу, де

R⁵² та R⁵³ незалежно один від одного є воднем, C₁₋₆-алкілом, C₆₋₁₀-арил-C₁₋₆-алкілом або C₆₋₁₀-арилом,

або

R⁵² та R⁵³, якщо приєднані до одного атома азоту, разом з вищезгаданим атомом азоту можуть утворювати 3-8-членне гетероциклічне кільце, яке необов'язково містить один або два додаткових гетероатоми, вибрані з-поміж азоту, кисню та сірки, і необов'язково містить один або два подвійні зв'язки.

41. Сполука за п. 40, **яка відрізняється тим, що**

R³⁴, R³⁵ та R³⁶ незалежно один від одного є вибраними з-поміж -CHF₂, -CF₃, -OCF₃, -OCHF₂, -OCH₂CF₃, -OCF₂CHF₂, -S(O)₂CF₃, -SCF₃, -OR⁵², -NR⁵²R⁵³, -SR⁵², -NR⁵²S(O)₂R⁵³, -S(O)₂NR⁵²R⁵³, -S(O)NR⁵²R⁵³, -S(O)R⁵², -S(O)₂R⁵², -C(O)NR⁵²R⁵³, -OC(O)NR⁵²R⁵³, -NR⁵²C(O)R⁵³, -CH₂C(O)NR⁵²R⁵³, -OCH₂C(O)NR⁵²R⁵³, -CH₂OR⁵², -CH₂NR⁵²R⁵³, -OC(O)R⁵², -C(O)R⁵² та -C(O)OR⁵²,

C₂₋₆-алкенілу та C₂₋₆-алкінілу, який необов'язково може бути заміщеним одним або кількома замісниками, вибраними з-поміж -CN, -CF₃, -OCF₃, -OR⁵², -

$\text{NR}^{52}\text{R}^{53}$ та C_{1-6} -алкілу, де

R^{52} та R^{53} незалежно один від одного є воднем, C_{1-6} -алкілом, C_{6-10} -арил- C_{1-6} -алкілом або C_{6-10} -арилом,

або

R^{52} та R^{52} , якщо приєднані до одного атома азоту, разом з вищезгаданим атомом азоту можуть утворювати 3-8-членне гетероциклічне кільце, яке необов'язково містить один або два додаткових гетероатоми, вибрані з-поміж азоту, кисню та сірки, і необов'язково містить один або два подвійні зв'язки.

42. Сполука за будь-яким з пп. з 39 по 41, **яка відрізняється тим, що**

R^{52} та R^{53} є воднем.

43. Сполука за п. 37, **яка відрізняється тим, що**

R^3 є цикlopентилом, циклогексилом, тетрагідропіранілом або тетрагідротіопіранілом.

44. Сполука за будь-яким з пп. з 1 по 17, **яка відрізняється тим, що**

R^3 є фенілом необов'язково заміщеним одним або кількома замісниками R^{44} , R^{45} , R^{46} та R^{47} , де

R^{44} , R^{45} , R^{46} та R^{47} є такими, як визначено у п. 1.

45. Сполука за п. 44, **яка відрізняється тим, що**

R^{44} , R^{45} , R^{46} та R^{47} незалежно один від одного є вибраними з-поміж галогену, $-\text{CN}$, $-\text{CH}_2\text{CN}$, $-\text{CHF}_2$, $-\text{CF}_3$, $-\text{OCF}_3$, $-\text{OCHF}_2$, $-\text{OCH}_2\text{CF}_3$, $-\text{OCF}_2\text{CHF}_2$, $-\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$, $-\text{SCF}_3$, $-\text{NO}_2$, $-\text{OR}^{52}$, $-\text{NR}^{52}\text{R}^{53}$, $-\text{SR}^{52}$, $-\text{NR}^{52}\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{53}$, $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}^{52}\text{R}^{53}$, $-\text{S}(\text{O})\text{NR}^{52}\text{R}^{53}$, $-\text{S}(\text{O})\text{R}^{52}$, $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{52}$, $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^{52}\text{R}^{53}$, $-\text{OC}(\text{O})\text{NR}^{52}\text{R}^{53}$, $-\text{NR}^{52}\text{C}(\text{O})\text{R}^{53}$, $-\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{NR}^{52}\text{R}^{53}$, $-\text{OCH}_2\text{C}(\text{O})\text{NR}^{52}\text{R}^{53}$, $-\text{CH}_2\text{OR}^{52}$, $-\text{CH}_2\text{NR}^{52}\text{R}^{53}$, $-\text{OC}(\text{O})\text{R}^{52}$, $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{52}$ та $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{52}$,

C_{1-6} -алкілу, C_{2-6} -алкенілу та C_{2-6} -алкінілу, який необов'язково може бути заміщеним одним або кількома замісниками, вибраними з-поміж $-\text{CN}$, $-\text{CF}_3$, $-\text{OCF}_3$, $-\text{OR}^{52}$, $-\text{NR}^{52}\text{R}^{53}$ та C_{1-6} -алкілу,

C_{3-8} -циклоалкілу, C_{4-8} -циклоалкенілу, C_{3-8} -гетероциклілу, C_{3-8} -циклоалкіл- C_{1-6} -алкілу, C_{3-8} -циклоалкіл- C_{1-6} -алкокси, C_{3-8} -циклоалкілокси, C_{3-8} -циклоалкіл- C_{1-6} -алкілію, C_{3-8} -циклоалкілію, C_{3-8} -циклоалкіл- C_{2-6} -алкенілу, C_{3-8} -циклоалкіл- C_{2-6} -алкінілу, C_{4-8} -циклоалкеніл- C_{1-6} -алкілу, C_{4-8} -циклоалкеніл- C_{2-6} -алкенілу, C_{4-8} -циклоалкеніл- C_{2-6} -алкінілу, C_{3-8} -гетероцикліл- C_{1-6} -алкілу, C_{3-8} -гетероцикліл- C_{2-6} -алкенілу, C_{3-8} -гетероцикліл- C_{2-6} -алкінілу, C_{6-18} -арилу, C_{6-18} -арилокси, C_{6-18} -арилоксикарбонілу, C_{6-18} -ароїлу, C_{6-18} -арил- C_{1-6} -алкокси, C_{6-18} -арил- C_{1-6} -алкілу, C_{6-18} -арил- C_{2-6} -алкенілу, C_{6-18} -арил- C_{2-6} -алкінілу, C_{5-18} -гетероарилу, C_{5-18} -гетероарил- C_{1-6} -алкілу, C_{5-18} -гетероарил- C_{2-6} -алкенілу та C_{5-18} -гетероарил- C_{2-6} -алкінілу, з яких

C₆₋₁₈-арил та C₅₋₁₈-гетероарил необов'язково може бути заміщеним одним або кількома замісниками, вибраними з-поміж галогену, -C(O)OR⁵², -CN, -CF₃, -OCF₃, -NO₂, -OR⁵², -NR⁵²R⁵³ та C₁₋₆-алкілу,

або

два з R⁴⁴, R⁴⁵, R⁴⁶ та R⁴⁷ на суміжних атомах вуглецю можуть бути незалежно взяті разом для утворення -O-CH₂-O-, де

R⁵² та R⁵³ незалежно один від одного є воднем, C₁₋₆-алкілом, C₆₋₁₈-арил- C₁₋₆-алкілом або C₆₋₁₈-арилом,

або

R⁵² та R⁵³, якщо приєднані до одного атома азоту, разом з вищезгаданим атомом азоту можуть утворювати 3-8-членне гетероциклічне кільце, яке необов'язково містить один або два додаткових гетероатоми, вибрані з-поміж азоту, кисню та сірки, і необов'язково містить один або два подвійні зв'язки.

46. Сполука за п. 45, **яка відрізняється тим, що**

R⁴⁴, R⁴⁵, R⁴⁶ та R⁴⁷ незалежно один від одного є вибраними з-поміж галогену, -CN, -CH₂CN, -CHF₂, -CF₃, -OCF₃, -OCHF₂, -OCH₂CF₃, -OCF₂CHF₂, -S(O)₂CF₃, -SCF₃, -NO₂, -OR⁵², -NR⁵²R⁵³, -SR⁵², -NR⁵²S(O)₂R⁵³, -S(O)₂NR⁵²R⁵³, -S(O)NR⁵²R⁵³, -S(O)R⁵², -S(O)₂R⁵², -C(O)NR⁵²R⁵³, -OC(O)NR⁵²R⁵³, -NR⁵²C(O)R⁵³, -CH₂C(O)NR⁵²R⁵³, -OCH₂C(O)NR⁵²R⁵³, -CH₂OR⁵², -CH₂NR⁵²R⁵³, -OC(O)R⁵², -C(O)R⁵² та -C(O)OR⁵²,

C₁₋₆-алкілу, C₂₋₆-алкенілу та C₂₋₆-алкінілу, який необов'язково може бути заміщеним одним або кількома замісниками, вибраними з-поміж -CN, -CF₃, -OCF₃, -OR⁵², -NR⁵²R⁵³ та C₁₋₆-алкілу,

C₅₋₆-циклоалкілу, C₅₋₆-гетероциклілу, C₅₋₆-циклоалкілокси, C₅₋₆-циклоалкілтію, C₆₋₁₀-арилу, C₆₋₁₀-арилокси, C₆₋₁₀-арилоксикарбонілу, C₆₋₁₀-ароїлу, C₅₋₇-гетероарилу, з яких C₆₋₁₀-арильний та C₅₋₇-гетероарильний компоненти необов'язково можуть бути заміщеними одним або кількома замісниками, вибраними з-поміж галогену, -C(O)OR⁵², -CN, -CF₃, -OCF₃, -NO₂, -OR⁵², -NR⁵²R⁵³ та C₁₋₆-алкілу,

або

два з R⁴⁴, R⁴⁵, R⁴⁶ та R⁴⁷ на суміжних атомах вуглецю можуть бути незалежно взяті разом для утворення -O-CH₂-O-,

де

R⁵² та R⁵³ незалежно один від одного є воднем, C₁₋₆-алкілом, C₆₋₁₈-арил- C₁₋₆-алкілом або C₆₋₁₈-арилом,

або

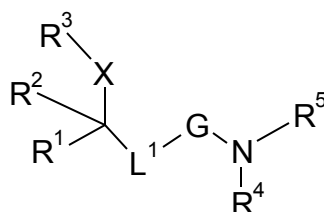
R⁵² та R⁵³, якщо приєднані до одного атома азоту, разом з вищезгаданим

атомом азоту можуть утворювати 3-8-членне гетероциклічне кільце, яке необов'язково містить один або два додаткових гетероатоми, вибрані з-поміж азоту, кисню та сірки, і необов'язково містить один або два подвійні зв'язки.

47. Сполука за п. 45 або п. 46, **яка відрізняється тим, що**

R^{52} та R^{53} є воднем.

48. Сполука за п. 1, **яка відрізняється тим, що є сполукою загальної формули (II)**



(II)

де

G є -C(O)-, і

X є -O-, -S-, або -N(R^6)-, де

R^6 є таким, як визначено у п. 1, і

L^1 є -(CH₂)_n-Y- або прямим зв'язком, де

n є цілим числом від 1 до 6, і

Y є прямим зв'язком, O або -N(R^7)-, де

R^7 є таким, як визначено у п. 1,

або

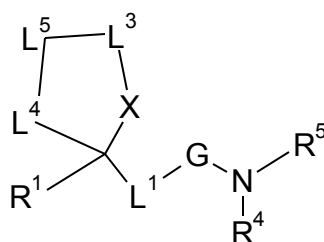
X є алкіленом, який необов'язково може бути заміщеним одним або кількома замісниками R^{25} , R^{26} та R^{27} , або прямим зв'язком, і

L^1 є -O- або -N(R^8)-, де

R^8 є таким, як визначено у п. 1, або

її фармацевтично прийнятна сіль, сольват або проліки.

49. Сполука за п. 48 загальної формули (IIa)



(IIa)

де

G, X, L^1 , R^4 та R^5 є такими, як визначено у п. 48,

$L^3 \in -(C(R^{11})(R^{12}))_p-$,

$L^4 \in -(C(R^{13})(R^{14}))_q-$, де

R^{11} , R^{12} , R^{13} та R^{14} незалежно один від одного є воднем або алкілом, необов'язково заміщеним нижчим алкілом, фенілом або гідрокси,

p є цілим числом від 0 до 3, і

q є цілим числом від 0 до 3, і

L^5 є прямим зв'язком, алкеніленом, алкініленом, ариленом, гетероариленом, -O-, -C(O)-, -S-, -S(O)-, -S(O₂)- або -N(R¹⁵)-, де

R^{15} є воднем або алкілом, який необов'язково може бути заміщеним одним або кількома замісниками R^{54} , R^{55} та R^{56} , де

R^{54} , R^{55} та R^{56} незалежно є вибраними з-поміж

-CHF₂, -CF₃, -OCF₃, -OCHF₂, -OCH₂CF₃, -OCF₂CHF₂, -S(O)₂CF₃, -SCF₃, -OR⁵⁷, -NR⁵⁷R⁵⁸, -SR⁵⁷, -NR⁵⁷S(O)₂R⁵⁸, -S(O)₂NR⁵⁷R⁵⁸, -S(O)NR⁵⁷R⁵⁸, -S(O)R⁵⁷, -S(O)₂R⁵⁷, -C(O)NR⁵⁷R⁵⁸, -OC(O)NR⁵⁷R⁵⁸, -NR⁵⁷C(O)R⁵⁸, -CH₂C(O)NR⁵⁷R⁵⁸, -OCH₂C(O)NR⁵⁷R⁵⁸, -CH₂OR⁵⁷, -CH₂NR⁵⁷R⁵⁸, -OC(O)R⁵⁷, -C(O)R⁵⁷ та -C(O)OR⁵⁷,

C₂₋₆-алкенілу та C₂₋₆-алкінілу, який необов'язково може бути заміщеним одним або кількома замісниками, вибраними з-поміж -CN, -CF₃, -OCF₃, -OR⁵⁷, -NR⁵⁷R⁵⁸ та C₁₋₆-алкілу,

C₃₋₈-циклоалкілу, C₄₋₈-циклоалкенілу, гетероциклілу, C₃₋₈-циклоалкіл-C₁₋₆-алкілу, C₃₋₈-циклоалкіл-C₁₋₆-алкокси, C₃₋₈-циклоалкілокси, C₃₋₈-циклоалкіл-C₁₋₆-алкілтіо, C₃₋₈-циклоалкілтіо, C₃₋₈-циклоалкіл-C₂₋₆-алкенілу, C₃₋₈-циклоалкіл-C₂₋₆-алкінілу, C₄₋₈-циклоалкеніл-C₁₋₆-алкілу, C₄₋₈-циклоалкеніл-C₂₋₆-алкенілу, C₄₋₈-циклоалкеніл-C₂₋₆-алкінілу, гетероцикліл-C₁₋₆-алкілу, гетероцикліл-C₂₋₆-алкенілу, гетероцикліл-C₂₋₆-алкінілу, арилу, арилокси, арилоксикарбонілу, ароїлу, арил-C₁₋₆-алкокси, арил-C₁₋₆-алкілу, арил-C₂₋₆-алкенілу, арил-C₂₋₆-алкінілу, гетероарилу, гетероарил-C₁₋₆-алкілу, гетероарил-C₂₋₆-алкенілу та гетероарил-C₂₋₆-алкінілу, з яких арильний та гетероарильний компоненти необов'язково можуть бути заміщеними одним або кількома замісниками, вибраними з-поміж галогену, -C(O)OR⁵⁷, -CN, -CF₃, -OCF₃, -NO₂, -OR⁵⁷, -NR⁵⁷R⁵⁸ та C₁₋₆-алкілу,

де

R^{57} та R^{58} незалежно один від одного є воднем, C₁₋₆-алкілом, арил-C₁₋₆-алкілом або арилом,

або

R^{57} та R^{58} , якщо приєднані до одного атома азоту, разом з вищезгаданим атомом азоту можуть утворювати 3-8-членне гетероциклічне кільце, яке

необов'язково містить один або два додаткових гетероатоми, вибрані з-поміж азоту, кисню та сірки, і необов'язково містить один або два подвійні зв'язки.

50. Сполука за п. 49, **яка відрізняється тим, що**

R^{11} , R^{12} , R^{13} та R^{14} незалежно один від одного є вибраними з-поміж водню та алкілу.

51. Сполука за п. 50, **яка відрізняється тим, що**

R^{11} , R^{12} , R^{13} та R^{14} незалежно один від одного є вибраними з-поміж водню та C_{1-6} -алкілу.

52. Сполука за будь-яким з пп. з 49 по 51, **яка відрізняється тим, що**

R^{11} , R^{12} , R^{13} та R^{14} є воднем.

53. Сполука за будь-яким з пп. з 49 по 52, **яка відрізняється тим, що**

r є цілим числом від 2 до 3, і q є цілим числом від 2 до 3.

54. Сполука за будь-яким з пп. з 49 по 53, **яка відрізняється тим, що**

L^5 є прямим зв'язком.

55. Сполука за будь-яким з пп. з 49 по 54, **яка відрізняється тим, що**

$-L_3-L_4-L_5-$ є $-(CH_2)_4-$, $-(CH_2)_5-$ або $-(CH_2)_6-$.

56. Сполука за будь-яким з пп. з 49 по 53, **яка відрізняється тим, що** L^5 є ариленом або гетероариленом.

57. Сполука за п. 56, **яка відрізняється тим, що** L^5 є C_{6-18} -ариленом або C_{5-18} -гетероариленом.

58. Сполука за п. 57, **яка відрізняється тим, що** L^5 є C_{6-10} -ариленом або C_{5-7} -гетероариленом.

59. Сполука за будь-яким з пп. з 49 по 53, **яка відрізняється тим, що** L^5 є -O-.

60. Сполука за будь-яким з пп. з 48 по 59, **яка відрізняється тим, що**

X є прямим зв'язком, і

L^1 є прямим зв'язком.

61. Сполука за будь-яким з пп. 48 по 59, **яка відрізняється тим, що**

X є прямим зв'язком, і

L^1 є -O- або $-N(R^8)-$, де

R^8 є таким, як визначено у п. 48.

62. Сполука за будь-яким з пп. 48 по 59, **яка відрізняється тим, що**

X є алкіленом, який необов'язково може бути заміщеним одним або кількома замісниками R^{25} , R^{26} та R^{27} або прямим зв'язком, і

L^1 є $-N(R^8)-$, де

R^8 є таким, як визначено у п. 48.

63. Сполука за п. 61 або 62, **яка відрізняється тим, що** L^1 є $-N(R^8)$ -, де R^8 є воднем або алкілом.
64. Сполука за п. 63, **яка відрізняється тим, що** L^1 є $-N(R^8)$ -, де R^8 є воднем або C_{1-8} -алкілом.
65. Сполука за п. 64, **яка відрізняється тим, що** L^1 є $-N(R^8)$ -, де R^8 є воднем.
66. Сполука за будь-яким з пп. 1 по 65, **яка відрізняється тим, що** R^1 є C_{3-8} -циклоалкілом, необов'язково заміщеним одним або кількома замісниками R^{34} , R^{35} та R^{36} , де R^{34} , R^{35} та R^{36} є такими, як визначено у п. 1.
67. Сполука за п. 66, **яка відрізняється тим, що** R^1 є C_{5-6} -циклоалкілом, необов'язково заміщеним одним або кількома замісниками R^{34} , R^{35} та R^{36} , де R^{34} , R^{35} та R^{36} є такими, як визначено у п. 1.
68. Сполука за п. 67, **яка відрізняється тим, що** R^1 є цикlopентилом, циклогексилем, необов'язково заміщеним одним або кількома замісниками R^{34} , R^{35} та R^{36} , де R^{34} , R^{35} та R^{36} є такими, як визначено у п. 1.
69. Сполука за будь-яким з пп. з 66 по 68, де R^{34} , R^{35} та R^{36} незалежно один від одного є вибраними з-поміж $-CHF_2$, $-CF_3$, $-OCF_3$, $-OCHF_2$, $-OCH_2CF_3$, $-OCF_2CHF_2$, $-S(O)_2CF_3$, $-SCF_3$, $-OR^{52}$, $-NR^{52}R^{53}$, $-SR^{52}$, $-NR^{52}S(O)_2R^{53}$, $-S(O)_2NR^{52}R^{53}$, $-S(O)NR^{52}R^{53}$, $-S(O)R^{52}$, $-S(O)_2R^{52}$, $-C(O)NR^{52}R^{53}$, $-OC(O)NR^{52}R^{53}$, $-NR^{52}C(O)R^{53}$, $-CH_2C(O)NR^{52}R^{53}$, $-OCH_2C(O)NR^{52}R^{53}$, $-CH_2OR^{52}$, $-CH_2NR^{52}R^{53}$, $-OC(O)R^{52}$, $-C(O)R^{52}$ та $-C(O)OR^{52}$,
 C_{2-6} -алкенілу та C_{2-6} -алкінілу, який необов'язково може бути заміщеним одним або кількома замісниками, вибраними з-поміж $-CN$, $-CF_3$, $-OCF_3$, $-OR^{52}$, $-NR^{52}R^{53}$ та C_{1-6} -алкілу, C_{3-8} -циклоалкілу, C_{4-8} -циклоалкенілу, C_{3-8} -гетероциклілу, C_{3-8} -циклоалкіл- C_{1-6} -алкілу, C_{3-8} -циклоалкіл- C_{1-6} -алкокси, C_{3-8} -циклоалкілокси, C_{3-8} -циклоалкіл- C_{1-6} -алкілтіо, C_{3-8} -циклоалкілтіо, C_{3-8} -циклоалкіл- C_{2-6} -алкенілу, C_{3-8} -циклоалкіл- C_{2-6} -алкінілу, C_{4-8} -циклоалкеніл- C_{1-6} -алкілу, C_{4-8} -циклоалкеніл- C_{2-6} -алкенілу, C_{4-8} -циклоалкеніл- C_{2-6} -алкінілу, C_{3-8} -гетероцикліл- C_{1-6} -алкілу, C_{3-8} -гетероцикліл- C_{2-6} -алкенілу, C_{3-8} -гетероцикліл- C_{2-6} -алкінілу, C_{6-18} -арилу, C_{6-18} -арилокси, C_{6-18} -арилоксикарбонілу, C_{6-18} -ароїлу, C_{6-18} -арил- C_{1-6} -алкокси, C_{6-18} -арил- C_{1-6} -алкілу, C_{6-18} -арил- C_{2-6} -алкенілу, C_{6-18} -арил- C_{2-6} -алкінілу, C_{5-18} -гетероарилу, C_{5-18} -гетероарил- C_{1-6} -алкілу, C_{5-18} -гетероарил- C_{2-6} -алкенілу та C_{5-18} -гетероарил- C_{2-6} -

алкінілу, з яких C₆₋₁₈-арильний та C₅₋₁₈-гетероарильний компонент необов'язково може бути заміщеним одним або кількома замісниками, вибраними з-поміж галогену, -C(O)OR⁵², -CN, -CF₃, -OCF₃, -NO₂, -OR⁵², -NR⁵²R⁵³ та C₁₋₆-алкілу, де

R⁵² та R⁵³ незалежно один від одного є воднем, C₁₋₆-алкілом, C₆₋₁₈-арил- C₁₋₆-алкілом або C₆₋₁₈-арилом,

або

R⁵² та R⁵³, якщо приєднані до одного атома азоту, разом з вищезгаданим атомом азоту можуть утворювати 3-8-членне гетероциклічне кільце, яке необов'язково містить один або два додаткових гетероатоми, вибрані з-поміж азоту, кисню та сірки, і необов'язково містить один або два подвійні зв'язки.

70. Сполука за п. 69, **яка відрізняється тим, що**

R³⁴, R³⁵ та R³⁶ незалежно один від одного є вибраними з-поміж -CHF₂, -CF₃, -OCF₃, -OCHF₂, -OCH₂CF₃, -OCF₂CHF₂, -S(O)₂CF₃, -SCF₃, -OR⁵², -NR⁵²R⁵³, -SR⁵², -NR⁵²S(O)₂R⁵³, -S(O)₂NR⁵²R⁵³, -S(O)NR⁵²R⁵³, -S(O)R⁵², -S(O)₂R⁵², -C(O)NR⁵²R⁵³, -OC(O)NR⁵²R⁵³, -NR⁵²C(O)R⁵³, -CH₂C(O)NR⁵²R⁵³, -OCH₂C(O)NR⁵²R⁵³, -CH₂OR⁵², -CH₂NR⁵²R⁵³, -OC(O)R⁵², -C(O)R⁵² та -C(O)OR⁵²,

C₂₋₆-алкенілу та C₂₋₆-алкініл, який необов'язково може бути заміщеним одним або кількома замісниками, вибраними з-поміж -CN, -CF₃, -OCF₃, -OR⁵², -NR⁵²R⁵³ та C₁₋₆-алкілу, C₅₋₆-циклоалкілу, C₅₋₆-циклоалкенілу, C₅₋₆-гетероциклілу, C₅₋₆-циклоалкілокси, C₅₋₆-циклоалкілтію, C₆₋₁₀-арилу, C₆₋₁₀-арилокси, C₆₋₁₀-арилоксикарбонілу, C₆₋₁₀-ароїлу, C₅₋₇-гетероарилу, з яких C₆₋₁₀-арильний та C₅₋₇-гетероарильний компонент необов'язково може бути заміщеним одним або кількома замісниками, вибраними з-поміж галогену, -C(O)OR⁵², -CN, -CF₃, -OCF₃, -NO₂, -OR⁵², -NR⁵²R⁵³ та C₁₋₆-алкілу, де

R⁵² та R⁵³ незалежно один від одного є воднем, C₁₋₆-алкілом, C₆₋₁₀-арил- C₁₋₆-алкілом або C₆₋₁₀-арилом,

або

R⁵² та R⁵³, якщо приєднані до одного атома азоту, разом з вищезгаданим атомом азоту можуть утворювати 3-8-членне гетероциклічне кільце, яке необов'язково містить один або два додаткових гетероатоми, вибрані з-поміж азоту, кисню та сірки, і необов'язково містить один або два подвійні зв'язки.

71. Сполука за п. 70, **яка відрізняється тим, що**

R³⁴, R³⁵ та R³⁶ незалежно один від одного є вибраними з-поміж -CHF₂, -CF₃, -OCF₃, -OCHF₂, -OCH₂CF₃, -OCF₂CHF₂, -S(O)₂CF₃, -SCF₃, -OR⁵², -NR⁵²R⁵³, -SR⁵², -NR⁵²S(O)₂R⁵³, -S(O)₂NR⁵²R⁵³, -S(O)NR⁵²R⁵³, -S(O)R⁵², -S(O)₂R⁵², -C(O)NR⁵²R⁵³, -

$\text{OC(O)NR}^{52}\text{R}^{53}$, $-\text{NR}^{52}\text{C(O)R}^{53}$, $-\text{CH}_2\text{C(O)NR}^{52}\text{R}^{53}$, $-\text{OCH}_2\text{C(O)NR}^{52}\text{R}^{53}$, $-\text{CH}_2\text{OR}^{52}$, $-\text{CH}_2\text{NR}^{52}\text{R}^{53}$, $-\text{OC(O)R}^{52}$, $-\text{C(O)R}^{52}$ та $-\text{C(O)OR}^{52}$,

C_{2-6} -алкенілу та C_{2-6} -алкінілу, який необов'язково може бути заміщеним одним або кількома замісниками, вибраними з-поміж $-\text{CN}$, $-\text{CF}_3$, $-\text{OCF}_3$, $-\text{OR}^{52}$, $-\text{NR}^{52}\text{R}^{53}$ та C_{1-6} -алкілу, де

R^{52} та R^{53} незалежно один від одного є воднем, C_{1-6} -алкілом, C_{6-10} -арил- C_{1-6} -алкілом або C_{6-10} -арилом,

або

R^{52} та R^{53} , якщо приєднані до одного атома азоту, разом з вищезгаданим атомом азоту можуть утворювати 3-8-членне гетероциклічне кільце, яке необов'язково містить один або два додаткових гетероатоми, вибрані з-поміж азоту, кисню та сірки, і необов'язково містить один або два подвійні зв'язки.

72. Сполука за будь-яким з пп. з 69 по 71, **яка відрізняється тим, що**

R^{52} та R^{53} є воднем.

73. Сполука за п. 1, **яка відрізняється тим, що**

R^1 є фенілом, необов'язково заміщеним одним або кількома замісниками R^{44} , R^{45} , R^{46} та R^{47} , де

R^{44} , R^{45} , R^{46} та R^{47} є такими, як визначено у п. 1.

74. Сполука за п. 73, **яка відрізняється тим, що**

R^{44} , R^{45} , R^{46} та R^{47} незалежно один від одного є вибраними з-поміж галогену, $-\text{CN}$, $-\text{CH}_2\text{CN}$, $-\text{CHF}_2$, $-\text{CF}_3$, $-\text{OCF}_3$, $-\text{OCHF}_2$, $-\text{OCH}_2\text{CF}_3$, $-\text{OCF}_2\text{CHF}_2$, $-\text{S(O)}_2\text{CF}_3$, $-\text{SCF}_3$, $-\text{NO}_2$, $-\text{OR}^{52}$, $-\text{NR}^{52}\text{R}^{53}$, $-\text{SR}^{52}$, $-\text{NR}^{52}\text{S(O)}_2\text{R}^{53}$, $-\text{S(O)}_2\text{NR}^{52}\text{R}^{53}$, $-\text{S(O)NR}^{52}\text{R}^{53}$, $-\text{S(O)R}^{52}$, $-\text{S(O)}_2\text{R}^{52}$, $-\text{C(O)NR}^{52}\text{R}^{53}$, $-\text{OC(O)NR}^{52}\text{R}^{53}$, $-\text{NR}^{52}\text{C(O)R}^{53}$, $-\text{CH}_2\text{C(O)NR}^{52}\text{R}^{53}$, $-\text{OCH}_2\text{C(O)NR}^{52}\text{R}^{53}$, $-\text{CH}_2\text{OR}^{52}$, $-\text{CH}_2\text{NR}^{52}\text{R}^{53}$, $-\text{OC(O)R}^{52}$, $-\text{C(O)R}^{52}$ та $-\text{C(O)OR}^{52}$,

C_{1-6} -алкілу, C_{2-6} -алкенілу та C_{2-6} -алкінілу, який необов'язково може бути заміщеним одним або кількома замісниками, вибраними з-поміж $-\text{CN}$, $-\text{CF}_3$, $-\text{OCF}_3$, $-\text{OR}^{52}$, $-\text{NR}^{52}\text{R}^{53}$ та C_{1-6} -алкілу,

C_{3-8} -циклоалкілу, C_{4-8} -циклоалкенілу, C_{3-8} -гетероциклілу, C_{3-8} -циклоалкіл- C_{1-6} -алкілу, C_{3-8} -циклоалкіл- C_{1-6} -алкокси, C_{3-8} -циклоалкілокси, C_{3-8} -циклоалкіл- C_{1-6} -алкілтію, C_{3-8} -циклоалкілтію, C_{3-8} -циклоалкіл- C_{2-6} -алкенілу, C_{3-8} -циклоалкіл- C_{2-6} -алкінілу, C_{4-8} -циклоалкеніл- C_{1-6} -алкілу, C_{4-8} -циклоалкеніл- C_{2-6} -алкенілу, C_{4-8} -циклоалкеніл- C_{2-6} -алкінілу, C_{3-8} -гетероцикліл- C_{1-6} -алкілу, C_{3-8} -гетероцикліл- C_{2-6} -алкенілу, C_{3-8} -гетероцикліл- C_{2-6} -алкінілу, C_{6-18} -арилу, C_{6-18} -арилокси, C_{6-18} -арилоксикарбонілу, C_{6-18} -ароїлу, C_{6-18} -арил- C_{1-6} -алкокси, C_{6-18} -арил- C_{1-6} -алкілу, C_{6-18} -арил- C_{2-6} -алкенілу, C_{6-18} -арил- C_{2-6} -алкінілу, C_{5-18} -гетероарилу, C_{5-18} -гетероарил-

C₁₋₆-алкілу, C₅₋₁₈-гетероарил-C₂₋₆-алкенілу та C₅₋₁₈-гетероарил-C₂₋₆-алкінілу, з яких C₆₋₁₈-арил та C₅₋₁₈-гетероарил необов'язково може бути заміщеним одним або кількома замісниками, вибраними з-поміж галогену, -C(O)OR⁵², -CN, -CF₃, -OCF₃, -NO₂, -OR⁵², -NR⁵²R⁵³ та C₁₋₆-алкілу,

або

два з R⁴⁴, R⁴⁵, R⁴⁶ та R⁴⁷ на суміжних атомах вуглецю можуть бути незалежно взяті разом для утворення -O-CH₂-O-, де

R⁵² та R⁵³ незалежно один від одного є воднем, C₁₋₆-алкілом, C₆₋₁₈-арил- C₁₋₆-алкілом або C₆₋₁₈-арилом,

або

R⁵² та R⁵³, якщо приєднані до одного атома азоту, разом з вищезгаданим атомом азоту можуть утворювати 3-8-членне гетероциклічне кільце, яке необов'язково містить один або два додаткових гетероатоми, вибрані з-поміж азоту, кисню та сірки, і необов'язково містить один або два подвійні зв'язки.

75. Сполука за п. 74, **яка відрізняється тим, що**

R⁴⁴, R⁴⁵, R⁴⁶ та R⁴⁷ незалежно один від одного є вибраними з-поміж галогену, -CN, -CH₂CN, -CHF₂, -CF₃, -OCF₃, -OCHF₂, -OCH₂CF₃, -OCF₂CHF₂, -S(O)₂CF₃, -SCF₃, -NO₂, -OR⁵², -NR⁵²R⁵³, -SR⁵², -NR⁵²S(O)₂R⁵³, -S(O)₂NR⁵²R⁵³, -S(O)NR⁵²R⁵³, -S(O)R⁵², -S(O)₂R⁵², -C(O)NR⁵²R⁵³, -OC(O)NR⁵²R⁵³, -NR⁵²C(O)R⁵³, -CH₂C(O)NR⁵²R⁵³, -OCH₂C(O)NR⁵²R⁵³, -CH₂OR⁵², -CH₂NR⁵²R⁵³, -OC(O)R⁵², -C(O)R⁵² та -C(O)OR⁵²,

C₁₋₆-алкілу, C₂₋₆-алкенілу та C₂₋₆-алкінілу, який необов'язково може бути заміщеним одним або кількома замісниками, вибраними з-поміж -CN, -CF₃, -OCF₃, -OR⁵², -NR⁵²R⁵³ та C₁₋₆-алкілу,

C₅₋₆-циклоалкілу, C₅₋₆-гетероциклілу, C₅₋₆-циклоалкілокси, C₅₋₆-циклоалкілтію, C₆₋₁₀-арилу, C₆₋₁₀-арилокси, C₆₋₁₀-арилоксикарбонілу, C₆₋₁₀-ароїлу, C₅₋₇-гетероарилу, з яких C₆₋₁₀-арильний та C₅₋₇-гетероарильний компоненти необов'язково можуть бути заміщеним одним або кількома замісниками, вибраними з-поміж галогену, -C(O)OR⁵², -CN, -CF₃, -OCF₃, -NO₂, -OR⁵², -NR⁵²R⁵³ та C₁₋₆-алкілу,

або

два з R⁴⁴, R⁴⁵, R⁴⁶ та R⁴⁷ на суміжних атомах вуглецю можуть бути незалежно взяті разом для утворення -O-CH₂-O-,

де

R⁵² та R⁵³ незалежно один від одного є воднем, C₁₋₆-алкілом, C₆₋₁₈-арил- C₁₋₆-алкілом або C₆₋₁₈-арилом,

або

R^{52} та R^{53} , якщо приєднані до одного атома азоту, разом з вищезгаданим атомом азоту можуть утворювати 3-8-членне гетероциклічне кільце, яке необов'язково містить один або два додаткових гетероатоми, вибрані з-поміж азоту, кисню та сірки, і необов'язково містить один або два подвійні зв'язки.

76. Сполука за п. 74 або п. 75, **яка відрізняється тим, що**

R^{52} та R^{53} є воднем.

77. Сполука за будь-яким з пп. з 1 по 76, **яка відрізняється тим, що**

R^4 є воднем або алкілом.

78. Сполука за п. 77, **яка відрізняється тим, що**

R^4 є воднем або C_{1-8} -алкілом.

79. Сполука за п. 78, **яка відрізняється тим, що**

R^4 є воднем.

80. Сполука за п. 1, **яка відрізняється тим, що**

R^5 є п'яти- або шестичленним гетероарилом, необов'язково заміщеним одним або кількома замісниками R^{48} , R^{49} , R^{50} та R^{51} , де

R^{48} , R^{49} , R^{50} та R^{51} є такими, як визначено у п. 1.

81. Сполука за п. 80, **яка відрізняється тим, що**

R^5 є вибраним з групи, яка складається з фурану, тіофену, піролу, імідазолу, піразолу, триазолу, тетразолу, тіазолу, оксазолу, ізоксазолу, оксадіазолу, тіадіазолу, ізотіазолу, піридину, піридазину, піразину, піримідину, хіноліну, ізохіноліну, бензофурану, бензотіофену, індолу та індазолу, необов'язково заміщеного одним або кількома замісниками R^{48} , R^{49} , R^{50} та R^{51} , де

R^{48} , R^{49} , R^{50} та R^{51} є такими, як визначено у п. 1.

82. Сполука за будь-яким з пп. з 80 по 81, **яка відрізняється тим, що**

R^{48} , R^{49} , R^{50} та R^{51} незалежно один від одного є вибраними з-поміж галогену, перфтороалкілу, ціано, алкіл-Z-, арил-алкілен-Z- та R^{65} -W-алкілен-Z-, де

Z та W незалежно один від одного є вибраними з-поміж прямого зв'язку, -O-, -N(R^{66})-, -N(R^{66})C(O)- та -OC(O)-, де

R^{66} є воднем або алкілом, і

R^{65} є воднем або алкілом.

83. Сполука за п. 82, **яка відрізняється тим, що**

R^{48} , R^{49} , R^{50} та R^{51} незалежно один від одного є вибраними з групи, яка складається з галогену, перфтороалкілу, ціано, алкіл-OC(O)-алкілену, алкіл-NHC(O)-алкілену, N(алкіл)₂-C(O)-алкілену, алкіл-OC(O)-, NH(алкіл)-C(O)-, N(алкіл)₂C(O)-, арил-алкілен-O- та арил-алкілен-NH-.

84. Сполука за п. 83, **яка відрізняється тим, що**

R^{48} , R^{49} , R^{50} та R^{51} незалежно один від одного є вибраними з групи, яка складається з галогену, перфторо- C_{1-8} -алкілу, ціано, C_{1-8} -алкіл- $OC(O)-C_{1-8}$ -алкілену, C_{1-8} -алкіл- $NHC(O)-C_{1-8}$ -алкілену, $N(C_{1-8}\text{-алкіл})_2C(O)-C_{1-8}$ -алкілену, C_{1-8} -алкіл- $OC(O)-$, $NH(C_{1-8}\text{-алкіл})-C(O)-$, $N(C_{1-8}\text{-алкіл})_2-C(O)-$, C_{6-18} -арил- C_{1-8} -алкілен- $O-$ та C_{6-18} -арил- C_{1-8} -алкілен- $NH-$.

85. Сполука за п. 81, **яка відрізняється тим, що**

R^5 є вибраним з групи, яка складається з тіазолу, тіадіазолу, ізотіазолу, піридину та піримідину, необов'язково заміщеного одним або кількома замісниками R^{48} , R^{49} , R^{50} та R^{51} , де

R^{48} , R^{49} , R^{50} та R^{51} є такими, як визначено у п. 1.

86. Сполука за п. 85, **яка відрізняється тим, що**

R^{48} , R^{49} , R^{50} та R^{51} незалежно один від одного є вибраними з-поміж галогену, перфтороалкілу, ціано, алкіл- $Z-$, арил-алкілен- $Z-$ та R^{65} - W -алкілен- $Z-$, де

Z та W незалежно один від одного є вибраними з-поміж прямого зв'язку, $-O-$, $-N(R^{66})-$, $-N(R^{66})C(O)-$ та $-OC(O)-$, де

R^{66} є воднем або алкілом, і

R^{65} є воднем або алкілом.

87. Сполука за п. 86, **яка відрізняється тим, що**

R^{48} , R^{49} , R^{50} та R^{51} незалежно один від одного є вибраними з групи, яка складається з галогену, перфтороалкілу, ціано, алкіл- $OC(O)$ -алкілену, алкіл- $NHC(O)$ -алкілену, $N(\text{алкіл})_2C(O)$ -алкілену, алкіл- $OC(O)-$, $NH(\text{алкіл})-C(O)-$, $N(\text{алкіл})_2C(O)-$, арил-алкілен- $O-$ та арил-алкілен- $NH-$.

88. Сполука за п. 87, **яка відрізняється тим, що**

R^{48} , R^{49} , R^{50} та R^{51} незалежно один від одного є вибраними з групи, яка складається з галогену, перфторо- C_{1-8} -алкілу, ціано, C_{1-8} -алкіл- $OC(O)-C_{1-8}$ -алкілену, C_{1-8} -алкіл- $NHC(O)-C_{1-8}$ -алкілену, $N(C_{1-8}\text{-алкіл})_2C(O)-C_{1-8}$ -алкілену, C_{1-8} -алкіл- $OC(O)-$, $NH(C_{1-8}\text{-алкіл})-C(O)-$, $N(C_{1-8}\text{-алкіл})_2-C(O)-$, C_{6-18} -арил- C_{1-8} -алкілен- $O-$ та C_{6-18} -арил- C_{1-8} -алкілен- $NH-$.

89. Сполука за будь-яким з пп. з 1 по 88, **яка відрізняється тим, що є** активатором глюкокінази, як визначено в Glucokinase Activation Assay (I) в даному описі.

90. Сполука за будь-яким з пп. з 1 по 88, **яка відрізняється тим, що ця сполука** у концентрації 30 мкМ є здатною забезпечувати принаймні 1,3-разову активацію глюкокінази, як визначено в Glucokinase Activation Assay (I) в даному описі.

91. Карбоксамідна сполука, яка має гетероатом в альфа-, бета- або гамма-позиції відносно карбоксаміду, відповідно, яка у концентрації 30 мкМ є здатною забезпечувати підвищену принаймні в 1,3-раз активацію глюкокінази, як визначено в Glucokinase Activation Assay (I) в даному описі.

92. Сполука за п. 90 або п. 91, **яка відрізняється тим, що** ця сполука у концентрації 30 мкМ є здатною забезпечувати підвищену принаймні в 1,5-, наприклад, принаймні в 1,7-, наприклад, принаймні в 2,0-раз активацію глюкокінази, як визначено в Glucokinase Activation Assay (I) в даному описі.

93. Сполука за будь-яким з пп. з 1 по 88, **яка відрізняється тим, що** ця сполука у концентрації 5 мкМ є здатною забезпечувати підвищену принаймні в 1,3-раз активацію глюкокінази, як визначено в Glucokinase Activation Assay (I) в даному описі.

94. Карбоксамідна сполука, яка має гетероатом в альфа-, бета- або гамма-позиції відносно карбоксаміду, відповідно, яка у концентрації 5 мкМ є здатною забезпечувати підвищену принаймні в 1,3-раз активацію глюкокінази, як визначено в Glucokinase Activation Assay (I) в даному описі.

95. Сполука за п. 93 або п. 94, **яка відрізняється тим, що** ця сполука у концентрації 5 мкМ є здатною забезпечувати підвищену в принаймні 1,5-, наприклад, принаймні в 1,7-, наприклад, принаймні в 2,0-раз активацію глюкокінази, як визначено в Glucokinase Activation Assay (I) в даному описі.

96. Сполука за будь-яким з пп. з 1 по 95, **яка відрізняється тим, що** є засобом, корисним для лікування показань, вибраних із групи, яка складається з гіперглікемії, IGT, діабету 2 типу, діабету 1 типу, дисліпідемії, гіпертонії та ожиріння.

97. Сполука за п. 1, яка являє собою

тіазол-2-іл амід 2-(3,4-дихлоро-фенокси)-гексанової кислоти,
2-(4-фторофенокси)-N-1,3-тіазол-2-ілгексанагід,
2-(4-метоксифенокси)-N-1,3-тіазол-2-ілгексанагід,
2-(4-метоксифенокси)-N-піридин-2-ілгексанагід,
2-(3,4-дихлорофенокси)-4-метил-N-1,3-тіазол-2-ілпентанагід,
2-(1,1'-біфеніл-4-ілокси)-N-1,3-тіазол-2-ілгексанагід,
2-(4-ізопропілфенокси)-N-1,3-тіазол-2-ілгексанагід,
2-(3-метоксифенокси)-N-1,3-тіазол-2-ілгексанагід,
2-(2,3-диметоксифенокси)-N-1,3-тіазол-2-ілгексанагід,
2-(3,4-диметоксифенокси)-N-1,3-тіазол-2-ілгексанагід,

2-(3,5-диметоксифенокси)-N-1,3-тіазол-2-ілгексанагід,
 2-(2-нафтилокси)-N-1,3-тіазол-2-ілгексанагід,
 2-(2,4-дифторофенокси)-N-1,3-тіазол-2-ілгексанагід,
 2-(3,4-дифторофенокси)-N-1,3-тіазол-2-ілгексанагід,
 2-(1,3-бензодіоксол-5-ілокси)-N-1,3-тіазол-2-ілгексанагід,
 2-(4-метилсульфонілфенокси)-N-1,3-тіазол-2-ілгексанагід,
 2-(2,4,6-трихлорофенокси)-N-1,3-тіазол-2-ілгексанагід,
 2-(2,4-дихлорофенокси)-N-1,3-тіазол-2-ілгексанагід,
 2-(4-феноксифенокси)-N-1,3-тіазол-2-ілгексанагід,
 2-(4-ціанофенокси)-N-1,3-тіазол-2-ілгексанагід,
 2-(4-хлоро-3-трифторометилфенокси)-N-1,3-тіазол-2-ілгексанагід,
 2-(4-метоксифенокси)-N-1,3-тіазол-2-ілгептанагід,
 2-(4-фторофенокси)-N-1,3-тіазол-2-ілгептанагід,
 2-(3,4-дихлорофенокси)-3-циклопентил-N-1,3-тіазол-2-ілпропіонагід,
 2-(4-метоксифенокси)-3-циклопентил-N-1,3-тіазол-2-ілпропіонагід,
 2-(4-хлоро-фенілсульфаніл)-гексанова кислота тіазол-2-ілагід,
 2-(4-хлоро-фенілсульфаніл)-гексанова кислота піридин-2-ілагід,
 2-(індолін-1-yl)-N-(1,3-тіазол-2-іл)гексанагід,
 3-(4-хлорофеніл)-N-піридин-2-іл-3-(тетрагідро-2H-тіопіран-4-іламіно)пропанагід,
 3-(4-хлорофеніл)-3-(тетрагідро-2H-тіопіран-4-іламіно)-N-1,3-тіазол-2-ілпропанагід,
 2-(3,4-дихлоробензилокси)-2-(4-хлорофеніл)-N-піридин-2-ілацетагід,
 2-(3,4-дихлоробензилокси)-2-(4-хлорофеніл)-N-1,3-тіазол-2-ілацетагід,
 2-(4-хлорофеніл)-2-(4-метилфенокси)-N-піридин-2-ілацетагід,
 2-(4-хлорофеніл)-2-(4-метилфенокси)-N-1,3-тіазол-2-ілацетагід,
 2-(4-бромфенокси)-2-(4-хлорофеніл)-N-піридин-2-ілацетагід,
 2-(4-бромфенокси)-2-(4-хлорофеніл)-N-1,3-тіазол-2-ілацетагід,
 2-(4-хлорофеніл)-2-(4-фторофенокси)-N-1,3-тіазол-2-ілацетагід,
 2-(4-хлорофеніл)-2-(3,4-дихлорофенокси)-N-піридин-2-ілацетагід,
 2-(4-бромфенокси)-2-(4-бромфеніл)-N-піридин-2-ілацетагід,
 2-(4-бромфенокси)-2-(4-бромфеніл)-N-1,3-тіазол-2-ілацетагід,
 2-(4-бромфеніл)-2-(4-метилфенокси)-N-піридин-2-ілацетагід,
 2-(4-бромфеніл)-2-(4-фторофенокси)-N-1,3-тіазол-2-ілацетагід,
 2-(4-бромфеніл)-2-фенокси-N-1,3-тіазол-2-ілацетагід,

2-(4-фторофенокси)-2-(4-фторофеніл)-N-піридин-2-ілацетамід,
 2-(4-фторофенокси)-2-(4-фторофеніл)-N-1,3-тіазол-2-ілацетамід,
 2-(4-фторофеніл)-2-(4-метилфенокси)-N-1,3-тіазол-2-ілацетамід,
 2-(4-фторофеніл)-2-фенокси-N-1,3-тіазол-2-ілацетамід,
 2-(4-бромофенокси)-2-(4-фторофеніл)-N-піридин-2-ілацетамід,
 2-(4-фторофенокси)-N-1,3-тіазол-2-іл-2-[4-(трифторометил)феніл] ацетамід,
 2-(4-бромофенокси)-N-піридин-2-іл-2-[4-(трифторометил)феніл]ацетамід,
 2-(3,4-дихлорофенокси)-2-(3,4-дихлорофеніл)-N-1,3-тіазол-2-ілацетамід,
 2-циклопентилсульфаніл-2-феніл-N-1,3-тіазол-2-іл-ацетамід,
 2-циклопентилсульфаніл-2-феніл-N-піридин-2-іл-ацетамід,
 2-циклопентилсульфаніл-2-(4-фторофеніл)-N-1,3-тіазол-2-іл-ацетамід,
 2-циклопентилсульфаніл-2-(4-фторофеніл)-N-піридин-2-іл-acetannide,
 2-циклопентилсульфаніл-2-(3-хлорофеніл)-N-1,3-тіазол-2-іл-ацетамід,
 2-циклопентилсульфаніл-2-(3-хлорофеніл)-N-піридин-2-іл-ацетамід,
 2-циклопентилсульфаніл-2-(4-хлоро)феніл-N-піридин-2-іл-ацетамід,
 2-циклопентилсульфаніл-2-(4-бромофеніл)-N-1,3-тіазол-2-іл-ацетамід,
 2-циклопентилсульфаніл-2-(4-бромофеніл)-N-піридин-2-іл-ацетамід,
 2-циклопентилсульфаніл-2-(4-метоксифеніл)-N-1,3-тіазол-2-іл-ацетамід,
 2-циклопентилсульфаніл-2-(4-метоксифеніл)-N-піридин-2-іл-ацетамід,
 2-циклопентилсульфаніл-2-(3-ціанофеніл)-N-1,3-тіазол-2-іл-ацетамід,
 2-циклопентилсульфаніл-2-(3-ціанофеніл)-N-піридин-2-іл-ацетамід,
 2-циклопентилсульфаніл-2-(4-ціанофеніл)-N-1,3-тіазол-2-іл-ацетамід,
 2-циклопентилсульфаніл-2-(4-ціанофеніл)-N-піридин-2-іл-ацетамід,
 2-циклопентилсульфаніл-2-(4-нітрофеніл)-N-1,3-тіазол-2-іл-ацетамід,
 2-циклопентилсульфаніл-2-(4-нітрофеніл)-N-піридин-2-іл-ацетамід,
 2-циклопентилсульфаніл-2-(4-метилсульфоніл)феніл-N-1,3-тіазол-2-іл-ацетамід,
 2-циклопентилсульфаніл-2-(4-метилсульфоніл)феніл-N-піридин-2-іл-ацетамід,
 2-циклопентилсульфаніл-2-(4-трифторометил)феніл-N-1,3-тіазол-2-іл-ацетамід,
 2-циклопентилсульфаніл-2-(4-трифторометил)феніл-N-піридин-2-іл-ацетамід,
 2-циклопентилсульфаніл-2-(3-трифторометоксифеніл)-N-1,3-тіазол-2-іл-ацетамід,

2-циклопентилсульфаніл-2-(3-трифторометоксифеніл)-N-піридин-2-іл-ацетамід,

2-циклопентилсульфаніл-2-(4-трифторометоксифеніл)-N-1,3-тіазол-2-іл-ацетамід,

2-циклопентилсульфаніл-2-(4-трифторометоксифеніл)-N-піридин-2-іл-ацетамід,

2-циклопентилсульфаніл-2-(4-феніл)феніл-N-1, 3-тіазол-2-іл-ацетамід,

2-циклопентилсульфаніл-2-(4-феніл)феніл-N-піридин-2-іл-ацетамід,

2-циклопентилсульфаніл-2-(4-феноксифеніл)-N-1,3-тіазол-2-іл-ацетамід,

2-циклопентилсульфаніл-2-(4-феноксифеніл)-N-піридин-2-іл-ацетамід,

2-циклопентилсульфаніл-2-(3,4-дифторофеніл)-N-1,3-тіазол-2-іл-ацетамід,

2-циклопентилсульфаніл-2-(3, 4-дифторофеніл)-N-піридин-2-іл-ацетамід,

2-циклопентилсульфаніл-2-(3,5-дифторофеніл)-N-1,3-тіазол-2-іл-ацетамід,

2-циклопентилсульфаніл-2-(3,5-дифторофеніл)-N-піридин-2-іл-ацетамід,

2-циклопентилсульфаніл-2-{3,4-(метилендіокси)феніл}-N-1,3-тіазол-2-іл-ацетамід,

2-циклопентилсульфаніл-2-{3,4-(метилендіокси)феніл}-N-піридин-2-іл-ацетамід,

2-циклопентилсульфаніл-2-[3,5-біс(трифторометил)феніл]-N-1,3-тіазол-2-іл-ацетамід,

2-циклопентилсульфаніл-2-[3,5-біс(трифторометил)феніл]-N-піридин-2-іл-ацетамід,

2-циклопентилсульфаніл-2-(3-хлоро-4-метокси)феніл-N-1,3-тіазол-2-іл-ацетамід,

2-циклопентилсульфаніл-2-(3,4-дихлоро-феніл)-N-тіазол-2-іл-ацетамід,

N-(5-бромо-1,3-тіазол-2-іл)-2-(циклопентилтіо)-2-(3,4-дихлорофеніл) ацетамід,

2-циклопентилсульфаніл-2-(3,4-дихлорофеніл)-N-[(4-метоксикарбонілметил)-1,3-тіазол-2-іл]-ацетамід,

2-циклопентилсульфаніл-2-(3,4-дихлорофеніл)-N-[(4-метиламінокарбонілметил)-1,3-тіазол-2-іл]-ацетамід,

2-(циклопентилтіо)-2-(3,4-дихлорофеніл)-N-1,3,4-тіадіазол-2-ілацетамід,

2-циклопентилсульфаніл-2-(3,4-дихлоро-феніл)-N-піридиніл-2-ілацетамід,

2-циклопентилсульфаніл-2-(3,4-дихлоро-феніл)-N-піримідин-2-ілацетамід,

2-циклогексилсульфаніл-2-(3,4-дихлорофеніл)-N-1,3-тіазол-2-ілацетамід,

2-циклогексилсульфаніл-2-(3,4-дихлорофеніл)-N-піридин-2-ілацетамід,
2-ізопропілсульфаніл-2-(3,4-дихлорофеніл)-N-1, 3-тіазол-2-ілацетамід,
2-ізопропілсульфаніл-2-(3,4-дихлорофеніл)-N-піридин-2-ілацетамід,
2-алілсульфаніл-2-(3,4-дихлорофеніл)-N-1,3-тіазол-2-ілацетамід,
2-(3,4-дихлорофеніл)-2-(ізобутилтіо)-N-піридин-2-ілацетамід,
2-(3,4-дихлорофеніл)-2-(ізобутилтіо)-N-1,3-тіазол-2-ілацетамід,
2-(3,4-дихлорофеніл)-2-[(2-фурилметил)тіо]-N-піридин-2-ілацетамід,
2-(3,4-дихлорофеніл)-2-[(2-фурилметил)тіо]-N-1,3-тіазол-2-ілацетамід,
2-(4-метилтіо)-2-феніл-N-піридин-2-ілацетамід,
2-(3,4-дихлорофеніл)-2-[(2-фурилметил)тіо]-N-піридин-2-ілацетамід,
2-[(4-фторофеніл)тіо]-N-піридин-2-іл-2-[4-(трифторометил)феніл]ацетамід,
2-[(4-фторофеніл)тіо]-N-1,3-тіазол-2-іл-2-[4-(трифторометил)феніл]

ацетамід,

2-[(4-метилфеніл)тіо]-N-1,3-тіазол-2-іл-2-[4-(трифторометил)феніл] ацетамід,
2-(4-фторофеніл)-2-[(4-фторофеніл)тіо]-N-піридин-2-ілацетамід,
2-(4-бромфеніл)-2-[(4-фторофеніл)тіо]-N-піридин-2-ілацетамід,
2-(4-бромфеніл)-2-[(4-метилфеніл)тіо]-N-піридин-2-ілацетамід,
N-[1-(4-хлорофеніл)циклопентил]-N'-1,3-тіазол-2-ілсечовину,
N-[1-(4-хлорофеніл)циклопентил]-N'-піридин-2-ілсечовину,
N-[1-(4-хлорофеніл)циклогексил]-N'-1,3-тіазол-2-ілсечовину,
N-[1-(4-хлорофеніл)циклогексил]-N'-піридин-2-ілсечовину,
1-(3-бензилоксифеніл)-1-*i*-бутил-3-(тіазол-2-іл)сечовину,
1-(3,4-дихлорофеніл)-1-*i*-бутил-3-(тіазол-2-іл)сечовину,
1-(4-фторофеніл)-1-*n*-пентил-3-(тіазол-2-іл)сечовину,
1-(3,4-метилendioксибензил)-1-(3,4-дихлоробензил)-3-(тіазол-2-іл)сечовину,
1-(4-фторофеніл)-1-циклопентил-3-(тіазол-2-іл)сечовину,
1-(3,4-дихлоробензил)-1-[етил-(2-тіофен)]-3-(тіазол-2-іл)сечовину,
1-(3,4-дихлоробензил)-1-*i*-бутил-3-(тіазол-2-іл)сечовину,
1-(4-фторофеніл)-1-циклогексилметил-3-(тіазол-2-іл)сечовину,
1-(3-хлорофенетил)-1-*i*-бутил-3-(тіазол-2-іл)сечовину,
1-(2-етоксибензил)-1-*i*-бутил-3-(тіазол-2-іл)сечовину,
1-(4-фторофеніл)-1-(4-тетрагідротіопіраніл)-3-(тіазол-2-іл)сечовину,
1-(3,4-дихлоробензил)-1-циклогексилметил-3-(тіазол-2-іл)сечовину,
1-(3-метилпіридин)-1-(циклогексилметил)-3-(тіазол-2-іл)сечовину,
1-(2-етоксибензил)-1-циклогексилметил-3-(тіазол-2-іл)сечовину,

- 1-(3,4-дихлоробензил)-1-циклопентил-3-(тіазол-2-іл)сечовину,
 1-(2-етоксибензил)-1-циклопентил-3-(тіазол-2-іл)сечовину,
 1-(3,4-дихлоробензил)-1-(4-тетрагідропіраніл)-3-(тіазол-2-іл)сечовину,
 1-(3,4-дихлоробензил)-1-(4-тетрагідротіапіраніл)-3-(тіазол-2-іл)сечовину,
 1-(3-хлорофенетил)-1-(4-тетрагідротіапіраніл)-3-(тіазол-2-іл)сечовину,
 1-(4-фторофеніл)-1-*i*-бутил-3-(тіазол-2-іл)сечовину,
 2-циклопентил-1-(3,4-дихлорофеніл)етил піридин-2-ілкарбамат,
 2-циклопентил-1-(3,4-дихлорофеніл)етил 1,3-тіазол-2-ілкарбамат,
 (2-[3-циклогексил-2-(4-метоксифеноксипропіоніламіно)]тіазол-4-іл) оцтову кислоту,
 1-циклопентилметил-1-(3,4-дихлоро-феніл)-3-тіазол-2-іл-сечовину,
 1-циклопентил-1-(3,4-дихлоро-феніл)-3-тіазол-2-іл-сечовину або
 1-(3,4-дихлоро-феніл)-1-пропіл-3-тіазол-2-іл-сечовину.
98. Сполука за будь-яким з пп. з 1 по 97 для застосування як медикамент.
99. Сполука за будь-яким з пп. з 1 по 97 для лікування гіперглікемії, для лікування IGT, для лікування синдрому X, для лікування діабету 2 типу, для лікування діабету 1 типу, для лікування дисліпідемії або гіперліпідемії, для лікування гіпертонії, для лікування або профілактики ожиріння, для зниження споживання їжі, для регулювання апетиту, для регулювання харчової поведінки, для підвищення секреції ентероінкретинів, таких як GLP-1.
100. Фармацевтична композиція, яка включає як активний інгредієнт принаймні одну сполуку за будь-яким з пп. з 1 по 99 разом з одним або кількома фармацевтично прийнятними носіями або наповнювачами.
101. Фармацевтична композиція за п. 100 у порційній формі, яка містить від приблизно 0,05 мг до приблизно 1000 мг, краще — від приблизно 0,1 мг до приблизно 500 мг, найкраще — від приблизно 0,5 мг до приблизно 200 мг сполуки за будь-яким з пп. з 1 по 99.
102. Фармацевтична композиція за п. 100 або п. 101, яка включає додатковий антидіабетичний засіб.
103. Фармацевтична композиція за п. 102, **яка відрізняється тим, що** вищезгаданий додатковий антидіабетичний засіб є інсуліном або аналогом інсуліну, сульфонілсечовини, бігуаніду, меглітиніду, сенсibilізатора інсуліну, тіазолідиндіонового сенсibilізатора інсуліну, інгібітора α -глюкозидази, інгібітора глікогенфосфорилази, або засобу, який діє на АТР-залежний калієвий канал β -клітин підшлункової залози.

104. Фармацевтична композиція за будь-яким з пп. з 100 по 103, яка включає додатковий антигіперліпідемічний засіб.
105. Фармацевтична композиція за п. 104, **яка відрізняється тим, що** вищезгаданим ще одним антигіперліпідемічним засобом є холестирамін, колестипол, клофібрат, гемфіброзил, ловастатин, правастатин, симвастатин, пробукола або декстротироксин.
106. Фармацевтична композиція за будь-яким з пп. з 100 по 104, яка включає додатковий засіб проти ожиріння або для регулювання апетиту.
107. Фармацевтична композиція за будь-яким з пп. з 100 по 106, яка включає додатковий антигіпертонічний засіб.
108. Застосування сполуки за будь-яким з пп. з 1 по 99 для підвищення активності глюकोкінази.
109. Застосування сполуки за будь-яким з пп. з 1 по 99 для лікування гіперглікемії, IGT, синдрому X, діабету 2 типу, діабету 1 типу, дисліпідемії, гіперліпідемії, гіпертонії.
110. Застосування сполуки за будь-яким з пп. з 1 по 99 для зниження споживання їжі.
111. Застосування сполуки за будь-яким з пп. з 1 по 99 для регулювання апетиту.
112. Застосування сполуки за будь-яким з пп. з 1 по 99 для лікування або профілактики ожиріння.