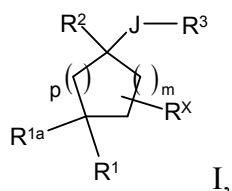


1. Сполука за формулою I

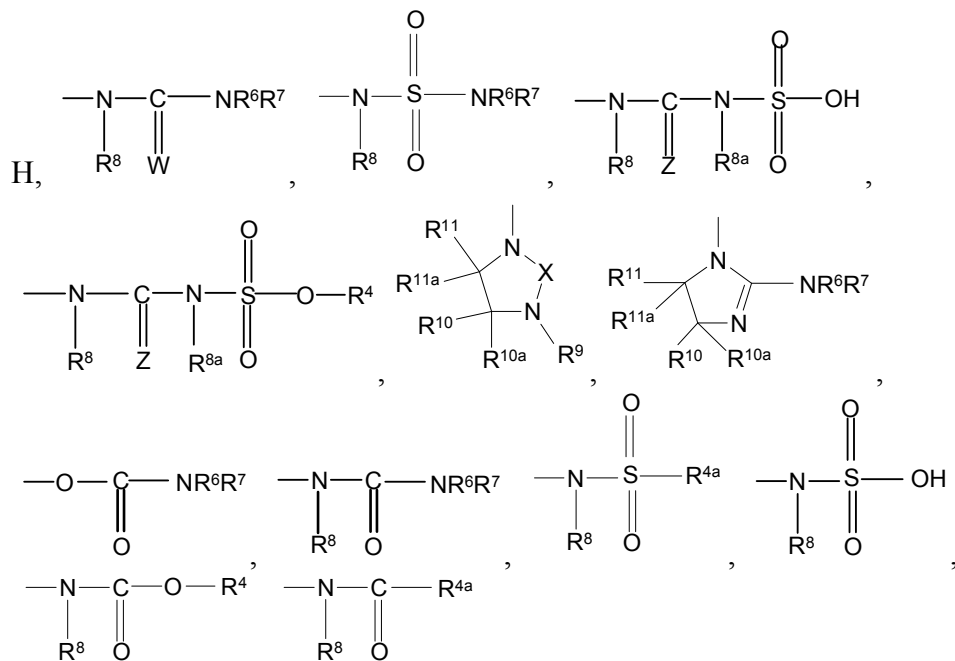


її енантіомери, діастереомери або солі, де

m являє собою 1;

p являє собою 1;

R<sup>1</sup> являє собою



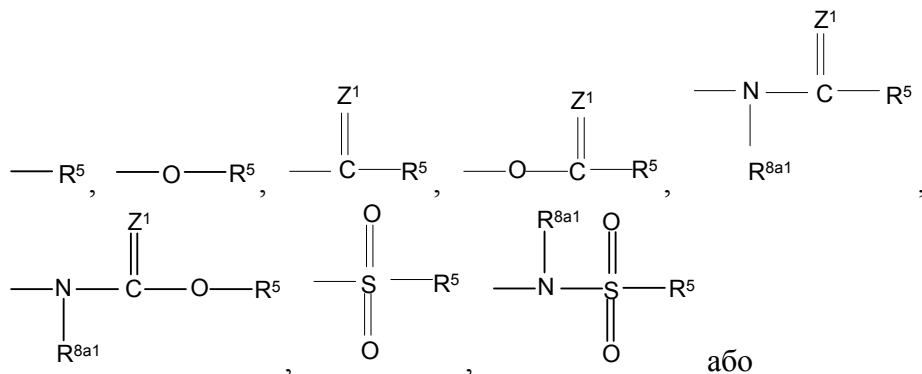
-N(R<sup>8</sup>)R<sup>14</sup>, -N(R<sup>8</sup>)C(O)R<sup>14</sup>, -SO<sub>2</sub>R<sup>8c</sup>, -CO<sub>2</sub>H, -C(O)R<sup>8c</sup>, -NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>, необов'язково заміщений арил, необов'язково заміщений гетероарил, необов'язково заміщений гетероцикло, гало, перфторалкіл, ціано, нітро, гідрокси, необов'язково заміщений алкокси, необов'язково заміщений арилокси, необов'язково заміщений гетероарилокси, необов'язково заміщений алкіл, необов'язково заміщений алкеніл або необов'язково заміщений алкініл;

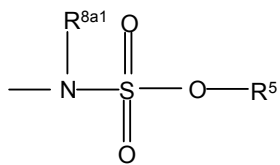
R<sup>1a</sup> являє собою H;

R<sup>2</sup> являє собою арил, який, у разі потреби, є незалежно заміщеним однією чи більше групами T<sup>1</sup>, T<sup>2</sup> або T<sup>3</sup>;

J являє собою зв'язок, C<sub>1-4</sub> алкілен, у разі потреби, незалежно заміщений однією чи більше групами T<sup>1a</sup>, T<sup>2a</sup> або T<sup>3a</sup>;

R<sup>3</sup> являє собою





$\text{R}^4$  являє собою алкіл, галоалкіл, алкеніл, циклоалкіл, гетероцикло, арил або гетероарил, будь-який із котрих, у разі потреби, є незалежно заміщеним однією чи більше такими групами  $\text{T}^{1b}$ ,  $\text{T}^{2b}$  або  $\text{T}^{3b}$ ;

$\text{R}^{4a}$  являє собою  $\text{R}^4$  або  $\text{OR}^4$ ;

$\text{R}^5$  являє собою  $\text{-NR}^{6a}\text{R}^{7a}$  або гетероарил, (гетероарил)алкіл, арил, (арил)алкіл, алкіл, циклоалкіл, (циклоалкіл)алкіл, гетероцикло або (гетероцикло)алкіл, із яких будь-який, у разі потреби, є незалежно заміщеним однією чи більше такими групами:  $\text{T}^{1c}$ ,  $\text{T}^{2c}$  або  $\text{T}^{3c}$ ;

$\text{R}^6$ ,  $\text{R}^7$ ,  $\text{R}^8$ ,  $\text{R}^{8a}$ ,  $\text{R}^{8a1}$ ,  $\text{R}^{8a2}$ ,  $\text{R}^{8a3}$ ,  $\text{R}^{8a4}$ ,  $\text{R}^{8a5}$  і  $\text{R}^9$  являють собою незалежно Н, алкіл, гідрокси, алкокси, арилокси, гетероциклоокси, гетероарилокси, (гідроксі)алкіл, (алкоксі)алкіл, (арилоксі)алкіл, (гетероциклооксі)алкіл, (гетероарилоксі)алкіл, (ціано)алкіл, (алкеніл)алкіл, (алкініл)алкіл, циклоалкіл, (циклоалкіл)алкіл, арил, (арил)алкіл, гетероарил, (гетероарил)алкіл, гетероцикло, (гетероцикло)алкіл,  $\text{-C(O)R}^{12}$ ,  $\text{-CO}_2\text{R}^{12}$  або  $\text{-C(O)-NR}^{12}\text{R}^{13}$ , із яких будь-який, у разі потреби, є незалежно заміщеним однією чи більше такими групами:  $\text{T}^{1d}$ ,  $\text{T}^{2d}$  або  $\text{T}^{3d}$ ;

або  $\text{R}^6$  і  $\text{R}^7$  разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, необов'язково утворюють насичений або ненасичений 4-8-членний цикл, в разі потреби, незалежно заміщений однією чи більше такими групами:  $\text{T}^{1d}$ ,  $\text{T}^{2d}$  або  $\text{T}^{3d}$ ;

або один із  $\text{R}^6$ ,  $\text{R}^7$  необов'язково сполучається з одним із  $\text{R}^8$ ,  $\text{R}^{8a}$  або  $\text{R}^9$  з утворенням насиченого або ненасиченого 5-8-членного кільця, в разі потреби, незалежно заміщеного однією чи більше такими групами:  $\text{T}^{1d}$ ,  $\text{T}^{2d}$  або  $\text{T}^{3d}$ ;

$\text{R}^{6a}$  являє собою Н;

$\text{R}^{7a}$  являє собою гетероарил, який, у разі потреби, є незалежно заміщеним однією чи більше групами:  $\text{T}^{1d}$ ,  $\text{T}^{2d}$  або  $\text{T}^{3d}$ ;

$\text{R}^{8b}$  являє собою незалежно Н, алкіл, арил, ціано, нітро, ацил або  $\text{-SO}_2$ (алкіл);

$\text{R}^{8c}$  являє собою незалежно алкіл, циклоалкіл, алкеніл, алкініл, арил, арилалкіл, циклогетероалкіл, гетероарил, аміно або алкокси;

$\text{R}^{8d}$  являє собою  $\text{R}^4$ ,  $\text{COR}^4$ ,  $\text{CO}_2\text{R}^4$ ,  $\text{SO}_2\text{R}^4$ ,  $\text{CONR}^6\text{R}^7$  або  $\text{SO}_2\text{-NR}^6\text{R}^7$ ;

$\text{R}^{10}$ ,  $\text{R}^{10a}$ ,  $\text{R}^{11}$  і  $\text{R}^{11a}$  являють собою незалежно Н, алкіл, арил, (арил)алкіл, алкокси, (алкоксі)алкіл, гало, гідрокси, (гідроксі)алкіл, аміно, амідо, гетероарил, (гетероарил)алкіл, гетероцикло, (гетероцикло)алкіл, сульфонамідо, циклоалкіл, (циклоалкіл)алкіл або ціано, із яких будь-який, у разі потреби, є незалежно заміщеним на доступних атомах однією чи більше такими групами:  $\text{T}^{1e}$ ,  $\text{T}^{2e}$  або  $\text{T}^{3e}$ ;

або  $\text{R}^{10}$  і  $\text{R}^{10a}$ , або  $\text{R}^{11}$  і  $\text{R}^{11a}$  необов'язково утворюють оксогрупу;

або  $\text{R}^{10a}$  необов'язково сполучається з  $\text{R}^{11a}$  з утворенням зв'язку;

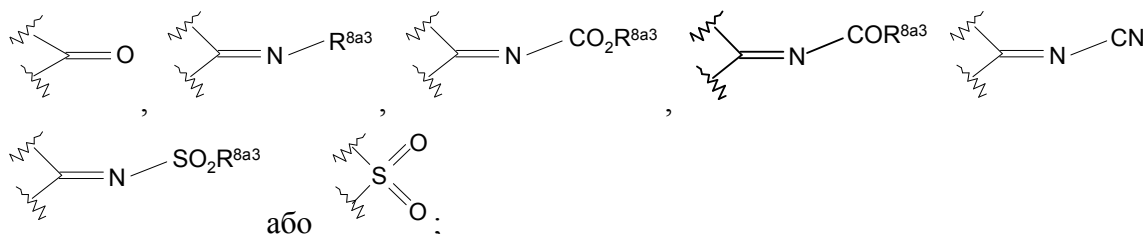
або  $\text{R}^{10}$  необов'язково сполучається з  $\text{R}^9$  з утворенням насиченого або ненасиченого циклу;

$\text{R}^{12}$  і  $\text{R}^{13}$  являють собою незалежно Н, алкіл, гідрокси, алкокси, арилокси, гетероциклоокси, гетероарил окси, (гідроксі)алкіл, (алкоксі)алкіл, (арилоксі)алкіл, (гетероциклооксі)алкіл, (гетероарилоксі)алкіл, циклоалкіл, (циклоалкіл)алкіл, арил, (арил)алкіл, гетероарил, (гетероарил)алкіл, гетероцикло або (гетероцикло)алкіл, із яких будь-який, у разі потреби, є незалежно заміщеним однією чи більше такими групами:  $\text{T}^{1f}$ ,  $\text{T}^{2f}$  або  $\text{T}^{3f}$ ;

або  $\text{R}^{12}$  і  $\text{R}^{13}$  разом з атомом азоту, з котрим вони зв'язані, необов'язково утворюють насичений або ненасичений цикл, котрий, у разі потреби, є незалежно заміщеним однією чи більше такими групами:  $\text{T}^{1f}$ ,  $\text{T}^{2f}$  або  $\text{T}^{3f}$ ;

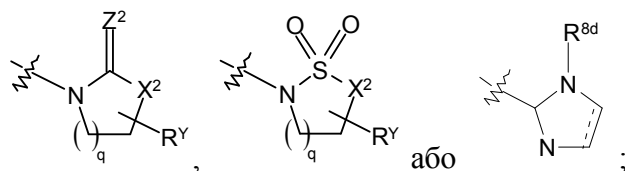
W являє собою  $=\text{NR}^{8a2}$ ,  $=\text{N-CO}_2\text{R}^{8a2}$ ,  $=\text{N-COR}^{8a2}$ ,  $=\text{N-CN}$  або  $=\text{N-SO}_2\text{R}^{8a2}$ ;

X являє собою



$Z, Z^1$  і  $Z^2$  являють собою незалежно  $=O, =S, =NR^{8a4}$  або  $=N-CN$ ;

$R^{14}$  являє собою незалежно



де  $q$  приймає значення 1, 2 або 3;

$R^Y$  являє собою необов'язковий оксозамісник, зв'язаний з будь-яким доступним атомом вуглецю в циклі;

$X^1$  являє собою  $O, S, NR^{8a5}$  або  $CH_2$ ; і

$X^2$  являє собою  $NR^{8a5}$  або  $CH_2$ ;

$R^X$  являє собою один або більше необов'язкових замісників, зв'язаних з будь-яким доступним атомом вуглецю в циклі, незалежно вибраних з:  $T^{1g}, T^{2g}$  або  $T^{3g}$ ;

$T^{1-1g}, T^{2-2g}$  і  $T^{3-3g}$  кожний являє собою незалежно

(1) водень або  $T^6$ , де  $T^6$  являє собою

(i) алкіл, (гідроксі)алкіл, (алкоксі)алкіл, алкеніл, алкініл, циклоалкіл, (циклоалкіл)алкіл, циклоалкеніл, (циклоалкеніл)алкіл, арил, (арил)алкіл, гетероцикло, (гетероцикло)алкіл, гетероарил або (гетероарил)алкіл;

(ii) групу (i), котра сама є заміщеною однією чи більше однаковими або різними групами (i); або

(iii) групу (i) або (ii), котра незалежно є заміщеною однією чи більше такими групами: (2)-(13) із визначення  $T^{1-1g}, T^{2-2g}$  і  $T^{3-3g}$ ,

(2)  $-OH$  або  $-OT^6$ ,

(3)  $-SH$  або  $-ST^6$ ,

(4)  $-C(O)_tH$ ,  $-C(O)_tT^6$  або  $-O-C(O)T^6$ , де  $t$  приймає значення 1 або 2;

(5)  $-SO_3H$ ,  $-S(O)_tT^6$  або  $S(O)_tN(T^9)T^6$ ,

(6) гало,

(7) ціано,

(8) нітро,

(9)  $-T^4-NT^7T^8$ ,

(10)  $-T^4-N(T^9)-T^5-NT^7T^8$ ,

(11)  $-T^4-N(T^{10})-T^5-T^6$ ,

(12)  $-T^4-N(T^{10})-T^5-H$ ,

(13) оксо,

$T^4$  і  $T^5$  кожний являє собою незалежно

(1) одинарний зв'язок,

(2)  $-T^{11}-S(O)_t-T^{12}-$ ,

(3)  $-T^{11}-C(O)-T^{12}-$ ,

(4)  $-T^{11}-C(S)-T^{12}-$ ,

(5)  $-T^{11}-O-T^{12}-$ ,

(6)  $-T^{11}-S-T^{12}-$ ,

(7)  $-T^{11}-O-C(O)-T^{12}-$ ,

(8)  $-T^{11}-C(O)-O-T^{12}-$ ,

(9)  $-T^{11}-C(=NT^{9a})-T^{12}-$ , або

(10)  $-T^{11}-C(O)-C(O)-T^{12}-$ ;  
 $T^7, T^8, T^9, T^{9a}$  і  $T^{10}$

(1) кожний являє собою незалежно водень або групу за визначенням для  $T^6$ , або

(2)  $T^7$  і  $T^8$  необов'язково разом являють собою алкілен або алкенілен, які разом з атомами, з котрими вони зв'язані, утворюють 3-8-членний насичений або ненасичений цикл, причому цей цикл є незаміщеним або заміщеним однією чи більше групами, переліченими у визначенні  $T^{1-1g}$ ,  $T^{2-2g}$  і  $T^{3-3g}$ , або

(3)  $T^7$  або  $T^8$ , разом з  $T^9$ , необов'язково являють собою алкілен або алкенілен, які разом з атомами азоту, з котрими вони зв'язані, утворюють 3-8-членний насичений або ненасичений цикл, причому цей цикл є незаміщеним або заміщеним однією чи більше групами, переліченими у визначенні  $T^{1-1g}$ ,  $T^{2-2g}$  і  $T^{3-3g}$ , або

(4)  $T^7$  і  $T^8$  або  $T^9$  і  $T^{10}$ , разом з атомом азоту, з котрим вони зв'язані, необов'язково утворюють групу  $-N=CT^{13}T^{14}$ , де  $T^{13}$  і  $T^{14}$  кожний являє собою незалежно Н або групу за визначенням для  $T^6$ ;

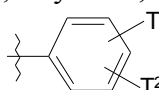
$T^{11}$  і  $T^{12}$  кожний являє собою незалежно

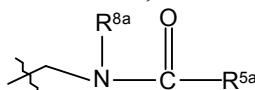
(1) одинарний зв'язок,

(2) алкілен,

(3) алкенілен, або

(4) алкінілен; за умови, що


(i)  $R^2$  є іншим, ніж , коли одночасно виконуються умови (a) і (b):

(a)  $-J-R^3$  являє собою ; і

(b)  $R^1$  являє собою Н, галоген, гідрокси, ціано, нітро, арил, алкокси, арилокси, гетероарилокси, необов'язково заміщений алкіл, необов'язково заміщений алкеніл, необов'язково заміщений алкініл,  $-OC(=O)CCl_3$ ,  $-SO_2$ (алкіл),  $-SO_2$ (арил),  $-SO_2$ (арилалкіл),  $-CO_2H$ ,  $-C(=O)$ (алкіл),  $-CO_2$ (алкіл),  $-C(=O)NR^{6*}R^{7*}$ ,  $-NR^{6*}R^{7*}$ ,  $-OC(=O)NR^{6*}R^{7*}$ ,  $-N_3$ ,  $-N(R^8)C(O)NR^{6*}R^{7*}$ ,  $-OC(=O)OR^4$ ,  $-OC(=O)R^4$  або  $-N(H)S(O_2)R^4$ ;

де

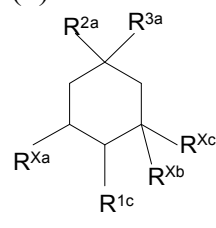
$R^{6*}$  і  $R^{7*}$  кожний являє собою незалежно Н, арил,  $-C(O)$ арил,  $-CO_2$ арил, алкіл,  $-C(O)$ алкіл,  $-CO_2$ алкіл,  $-S(O)_u$ алкіл,  $-C(O)S(O)_u$ алкіл,  $-S(O)_u$ арил,  $-C(O)S(O)_u$ арил або гетероцикло;

$R^{5a}$  являє собою ;

$R^{8a}$  являє собою Н або алкіл; і

и приймає значення 0, 1, 2 або 3;

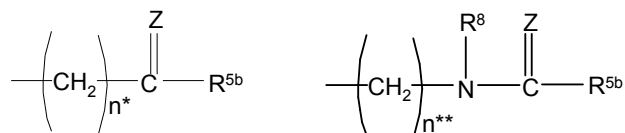
(ii) зазначена сполука є іншою, ніж сполука, виражена формулою



де

$R^{1c}$  являє собою  $-OC(O)NHR^{7c}$  або  $-O(CO)R^{4b}$ ;

$R^{2a}$  являє собою феніл;



$\text{R}^{3a}$  являє собою

$\text{R}^{4b}$  являє собою алкіл;

$\text{R}^{5b}$  являє собою  $-\text{NHR}^{7d}$  або бензил, заміщений однією-трьома групами, незалежно вибраними з гало, алкілу або алкокси;

$\text{R}^{7c}$  являє собою алкіл, феніл або бензил;

$\text{R}^{7d}$  являє собою феніл, заміщений однією-трьома групами, незалежно вибраними з гало, алкілу або алкокси;

$\text{R}^{Xa}$  являє собою гідрокси,  $-\text{OC}(\text{O})\text{NHR}^{7c}$  або  $-\text{OC}(\text{O})\text{R}^{4b}$ ;

$\text{R}^{Xb}$  і  $\text{R}^{Xc}$  являють собою незалежно Н або алкіл;

$n^*$  приймає значення 1-4;

$n^{**}$  приймає значення 0-3;

(iii)  $\text{R}^2$  є іншим, ніж феніл, коли одночасно виконуються обидві умови (e) і (f):

(e)  $\text{R}^1$  являє собою алкіл, алкокси або феніл; і

(f)  $-\text{J-R}^3$  являє собою N-арилзаміщену піперазинільну групу;

(iv)  $\text{R}^1$  є іншим, ніж гідрокси, алкокси, арилокси, алкіл або арил, коли одночасно виконуються обидві умови (g) і (h);

(g)  $\text{R}^2$  являє собою арил; і

(h)  $-\text{J-R}^3$  являє собою  $-\text{NR}^{6e}\text{R}^{7e}$  або  $-(\text{CHR}^{20})-\text{R}^{5c}$ ,

де

$\text{R}^{5c}$  являє собою необов'язково заміщений феніл;

$\text{R}^{6e}$  являє собою водень, гідрокси або алкокси;

$\text{R}^{7e}$  являє собою необов'язково заміщений феніл; і

$\text{R}^{20}$  являє собою водень, гідрокси або алкокси;

(v)  $\text{R}^2$  є іншим, ніж необов'язково заміщений феніл, коли одночасно виконуються обидві умови (j) і (k);

(j)  $\text{R}^{1a}$  являє собою Н, а  $\text{R}^1$  являє собою Н, гідрокси,  $-(\text{CH}_2)_{n^*}-\text{NR}^{6f}\text{R}^{7f}$ ,  $-(\text{CH}_2)_{n^*}-\text{CO}_2\text{R}^{8e}$ , циклоалкіл, гетероцикло або гетероарил,

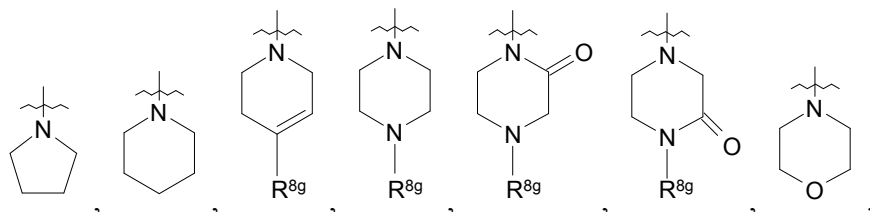
де

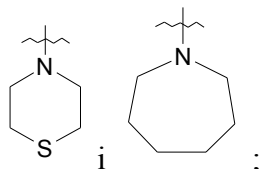
$n^*$  приймає значення 0-2;

$m^*$  приймає значення 1 або 2;

$\text{R}^{6f}$  і  $\text{R}^{7f}$  являють собою незалежно Н, алкіл, алкеніл, (гідроксі)алкіл, циклоалкіл, (циклоалкіл)алкіл, арил, (арил)алкіл, гетероцикло, (гетероцикло)алкіл, гетероарил, (гетероарил)алкіл,  $\text{CHO}$ ,  $-\text{C}(\text{O})$ -алкіл,  $-\text{C}(\text{O})$ циклоалкіл,  $-\text{C}(\text{O})$ (циклоалкіл)алкіл,  $-\text{C}(\text{O})$ -арил,  $-\text{C}(\text{O})$ (арил)алкіл,  $-\text{C}(\text{O})$ -гетероцикло,  $-\text{C}(\text{O})$ (гетероцикло)алкіл,  $-\text{C}(\text{O})$ -алкіл- $\text{NR}^{8e}\text{R}^{8f}$ ,  $-\text{C}(\text{O})$ - $\text{NR}^{8e}\text{R}^{8f}$ ,  $-\text{CO}_2$ -алкіл,  $-\text{алкіл}-\text{CO}_2$ -алкіл,  $-\text{CO}_2$ -циклоалкіл,  $-\text{CO}_2$ -(циклоалкіл)алкіл,  $-\text{CO}_2$ -арил,  $-\text{CO}_2$ -(арил)алкіл,  $-\text{CO}_2$ -гетероцикло,  $-\text{CO}_2$ -(гетероцикло)алкіл,  $-\text{CO}_2$ - $\text{NR}^{8e}\text{R}^{8f}$ ,  $-\text{CO}_2$ -алкіл- $\text{NR}^{8e}\text{R}^{8f}$ ,  $-\text{NR}^{8e}\text{COR}^{8f}$ ,  $-\text{алкіл}-\text{NR}^{8e}\text{COR}^{8f}$ ,  $-\text{NR}^{8e}\text{CO}_2\text{R}^{8f}$ ,  $-\text{алкіл}-\text{NR}^{8e}\text{CO}_2\text{R}^{8f}$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{8e})$ (арил),  $-\text{алкіл}-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{8e})$ (арил),  $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{8e})$ (гетероцикло),  $-\text{алкіл}-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{8e})$ (гетероцикло);

або  $\text{R}^{6f}$  і  $\text{R}^{7f}$ , разом з атомом азоту, з котрим вони зв'язані, утворюють необов'язково захищене гетероциклічне кільце, вибране з:



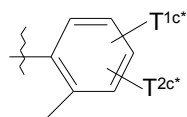


$R^{8e}$  і  $R^{8f}$  являють собою незалежно Н, алкіл, циклоалкіл, (фтор)алкіл або  $-CH_2CO_2-$  алкіл;

$R^{8g}$  являє собою Н, алкіл, циклоалкіл, (циклоалкіл)алкіл, арил, (арил)алкіл, гетероцикло, (гетероцикло)алкіл, гетероарил, (гетероарил)алкіл,  $CHO$ ,  $-C(O)-$ алкіл,  $-C(O)$ циклоалкіл,  $-C(O)$ (циклоалкіл)алкіл,  $-C(O)-$ арил,  $-C(O)$ (арил)алкіл,  $-C(O)-$ гетероцикло,  $-C(O)$ (гетероцикло)алкіл,  $-CO_2-$ алкіл,  $-CO_2-$ циклоалкіл,  $-CO_2-$ (циклоалкіл)алкіл,  $-CO_2-$ арил,  $-CO_2-$ (арил)алкіл,  $-CO_2-$ гетероцикло,  $-CO_2-$ (гетероцикло)алкіл,  $-CO_2-NR^{6f}R^{7f}$  або  $-CO_2-(алкіл)-NR^{6f}R^{7f}$ .

(k)  $-J-R^3$  являє собою групу  $-C(O)-NR^{8a1}-(CR^{15}R^{16})-R^{5*}$ ,  $-(CR^{15}R^{16})-NR^{8a1}-C(O)-R^{5*}$ ,  $-(CR^{15}R^{16})-NR^{8a1}-(CR^{17}R^{18})-R^{5*}$ ,  $-C(O)O-(CR^{15}R^{16})-R^{5*}$ ,  $-(CR^{15}R^{16})-OC(O)-R^{5*}$ ,  $-(CR^{15}R^{16})-O-(CR^{17}R^{18})-R^{5*}$ ,  $-C(R^{15})=C(R^{16})-R^{5*}$ ,  $-(CR^{15}R^{16})-C(R^{17})=C(R^{18})-R^{5*}$ ,  $-(CR^{15}R^{16})-C(R^{17}R^{18})-(CR^{19}R^{20})-R^{5*}$ ,  $-C(O)-(CR^{15}R^{16})-(CR^{17}R^{18})-R^{5*}$ ,  $-(CR^{15}R^{16})-C(O)-(CR^{17}R^{18})-R^{5*}$ ,  $-(CR^{15}R^{16})-(CR^{17}R^{18})-C(O)-R^{5*}$ ,  $-N(R^{8a1})-C(O)-(CR^{15}R^{16})-R^{5*}$ ,  $-N(R^{8a1})-(CR^{15}R^{16})-(CR^{17}R^{18})-R^{5*}$ ,  $-N(R^{8a1})-C(O)-C(O)-R^{5*}$ ,  $-OC(O)-(CR^{15}R^{16})-R^{5*}$  або  $-O-(CR^{15}R^{16})-(CR^{17}R^{18})-R^{5*}$ ,

де



$R^{5*}$  являє собою  $T^{3c*}$ , де

$T^{1c*}$  являє собою гідрокси, алкіл, фторалкіл, алкеніл, циклоалкіл, (циклоалкіл)алкіл, алкокси, фторалкокси, (алкокси)алкіл, (алкокси)алкокси, (фторалкокси)алкіл, алкенілокси, циклоалкілокси, (циклоалкіл)алкокси, фенокси, ціано, гало,  $-NT^7T^8$ , де  $T^7$  і  $T^8$  є такими, як визначено вище,  $-SH$ ,  $-ST^6$ , де  $T^6$  приймає значення згідно з визначенням вище,  $-S(O)_tT^6$ , де  $t$  приймає значення згідно з визначенням вище,  $-C(O)_tH$ ,  $-C(O)_tT^6$  або  $-C(O)-NT^7T^8$ ;

$T^{2c*}$  являє собою Н, галоген, алкіл або алкокси;

або, коли  $T^{1c*}$  є суміжним з  $T^{2c*}$ , вони необов'язково об'єднуються з утворенням 5- або 6-членного гетероцикло (гетероциклічного) або гетероарильного кільця, у разі потреби, заміщеного алкілом, фторалкілом,  $=O$  або  $=S$ ;

$T^{3c*}$  являє собою Н, галоген, алкіл, фторалкіл, алкокси, фторалкокси, циклоалкіл, (циклоалкіл)алкіл, ціано, гетероарил,  $-NT^7T^8$ ,  $-SH$ ,  $-ST^6$ ,  $-S(O)_tT^6$ ,  $-C(O)_tH$ ,  $-C(O)_tT^6$  або  $-C(O)-NT^7T^8$ , або алкіл, заміщений ціаногрупою,  $CO_2H$ ,  $CO_2T^6$  або  $-C(O)-NT^7T^8$ ;

і

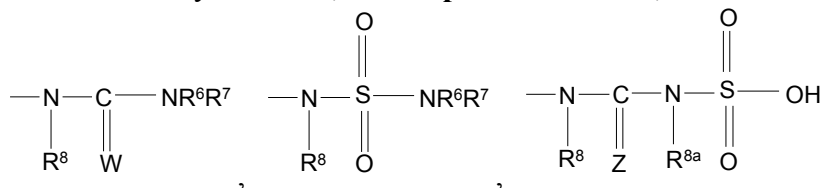
$R^{15}$ ,  $R^{16}$ ,  $R^{17}$ ,  $R^{18}$ ,  $R^{19}$  і  $R^{20}$  являють собою незалежно Н, гідрокси, алкіл, алкеніл, (гідрокси)алкіл, (алкокси)алкіл,  $-(CH_2)_{n*}-NR^{6f}R^{7f}$ ,  $-CHO$ ,  $-C(O)$ алкіл або  $-CO_2$ алкіл;

або  $R^{15}$  і  $R^{16}$  разом утворюють  $-CH_2CH_2-$ ;

або  $R^{17}$  і  $R^{18}$  разом утворюють  $-CH_2CH_2-$ ;

або  $R^{19}$  і  $R^{20}$  разом утворюють  $-CH_2CH_2-$ .

2. Сполука за п. 1, яка **відрізняється** тим, що  $R^1$  являє собою





Я є зв'язок або алкілен;

або гідрокси;

$R^2$  являє собою феніл, який необов'язково є заміщеним однією чи більше такими групами:  $T^1$ ,  $T^2$  або  $T^3$ ;

; Ta

$R^5$  являє собою необов'язково заміщений алкіл, необов'язково заміщений циклоалкіл, необов'язково заміщений арил, необов'язково заміщений гетероарил або  $-NR^{6a}R^{7a}$ .

$R^1$  являє собою:

(a)  $-N(R^8)-SO_2-NR^6R^7$  and  $-N(R^8)-C(W)-NR^6R^7$ ,

де

$R^6$  і  $R^7$  являють собою незалежно

(i) H, або

(ii) алкіл, циклоалкіл, алкеніл, алкініл, арил, гетероарил, гетероцикло, алкокси, (арил)алкіл, (циклоалкіл)алкіл, (гетероарил)алкіл, (гетероцикло)алкіл або (алкокси)алкіл, будь-який із котрих, у разі потреби, є незалежно заміщеним однією чи більше такими групами: OH, SH, OT<sup>6</sup>, ST<sup>6</sup>, C(O)<sub>t</sub>T<sup>6</sup>, NT<sup>7</sup>T<sup>8</sup>, ціано, гало, оксо, алкіл, галоалкіл, арил, гетероарил, гетероцикло, (OH)алкіл, (SH)алкіл, (OT<sup>6</sup>)алкіл, (ST<sup>6</sup>)алкіл, (C(O)<sub>t</sub>T<sup>6</sup>)алкіл, (NT<sup>7</sup>T<sup>8</sup>)алкіл, (ціано)алкіл, (арил)алкіл, (гетероарил)алкіл або (гетероцикло)алкіл,

або  $R^6$  і  $R^7$  об'єднуються між собою з утворенням гетероциклічного кільця, необов'язково заміщеного однією чи більше такими групами: OH, SH, OT<sup>6</sup>, ST<sup>6</sup>, C(O)<sub>t</sub>T<sup>6</sup>,

NT<sup>7</sup>T<sup>8</sup>, ціано, гало, оксо, алкіл, галоалкіл, арил, гетероарил, гетероцикло, (ОН)алкіл, (ЗН)алкіл, (OT<sup>6</sup>)алкіл, (ST<sup>6</sup>)алкіл, (C(O)<sub>t</sub>T<sup>6</sup>)алкіл, (NT<sup>7</sup>T<sup>8</sup>)алкіл, (ціано)алкіл, (арил)алкіл, (гетероарил)алкіл або (гетероцикло)алкіл; і

R<sup>8</sup> являє собою

(i) H, або

(ii) алкіл, циклоалкіл, арил, гетероарил, гетероцикло, (циклоалкіл)алкіл, (арил)алкіл, (гетероарил)алкіл або (гетероцикло)алкіл, будь-який із котрих, у разі потреби, є незалежно заміщеним однією чи більше такими групами: ОН, SH, OT<sup>6</sup>, ST<sup>6</sup>, C(O)<sub>t</sub>T<sup>6</sup>, NT<sup>7</sup>T<sup>8</sup>, ціано, гало, оксо, алкіл, галоалкіл, арил, гетероарил, гетероцикло, (ОН)алкіл, (SH)алкіл, (OT<sup>6</sup>)алкіл, (ST<sup>6</sup>)алкіл, (C(O)<sub>t</sub>T<sup>6</sup>)алкіл, (NT<sup>7</sup>T<sup>8</sup>)алкіл, (ціано)алкіл, (арил)алкіл, (гетероарил)алкіл або (гетероцикло)алкіл,

(b) -N(R<sup>8</sup>)-C(Z)-N(R<sup>8a</sup>)-SO<sub>2</sub>-ОН,

де

R<sup>4</sup> являє собою

(i) H, або

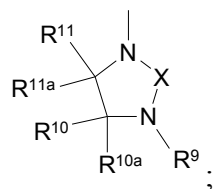
(ii) алкіл, циклоалкіл, алкеніл, алкініл, арил, гетероарил, гетероцикло, алкокси, (арил)алкіл, (циклоалкіл)алкіл, (гетероарил)алкіл або (гетероцикло)алкіл, або (алкокси)алкіл, будь-який із котрих, у разі потреби, є незалежно заміщеним однією чи більше такими групами: ОН, SH, OT<sup>6</sup>, ST<sup>6</sup>, C(O)<sub>t</sub>T<sup>6</sup>, NT<sup>7</sup>T<sup>8</sup>, ціано, гало, оксо, алкіл, галоалкіл, арил, гетероарил, гетероцикло, (ОН)алкіл, (SH)алкіл, (OT<sup>6</sup>)алкіл, (ST<sup>6</sup>)алкіл, (C(O)<sub>t</sub>T<sup>6</sup>)алкіл, (NT<sup>7</sup>T<sup>8</sup>)алкіл, (ціано)алкіл, (арил)алкіл, (гетероарил)алкіл або (гетероцикло)алкіл; і

R<sup>8</sup> і R<sup>8a</sup> являють собою незалежно

(i) H, або

(ii) алкіл, циклоалкіл, арил, гетероарил, гетероцикло, (циклоалкіл)алкіл, (арил)алкіл, (гетероарил)алкіл або (гетероцикло)алкіл, будь-який із котрих, у разі потреби, є незалежно заміщеним однією чи більше такими групами: ОН, SH, OT<sup>6</sup>, ST<sup>6</sup>, C(O)<sub>t</sub>T<sup>6</sup>, NT<sup>7</sup>T<sup>8</sup>, ціано, гало, оксо, алкіл, галоалкіл, арил, гетероарил, гетероцикло, (ОН)алкіл, (SH)алкіл, (OT<sup>6</sup>)алкіл, (ST<sup>6</sup>)алкіл, (C(O)<sub>t</sub>T<sup>6</sup>)алкіл, (NT<sup>7</sup>T<sup>8</sup>)алкіл, (ціано)алкіл, (арил)алкіл, (гетероарил)алкіл або (гетероцикло)алкіл; або

(c) групу



R<sup>1a</sup> являє собою H;

R<sup>2</sup> являє собою феніл, який, у разі потреби, є незалежно заміщеним однією чи більше такими групами: ОН, SH, OT<sup>6</sup>, ST<sup>6</sup>, C(O)<sub>t</sub>T<sup>6</sup>, NT<sup>7</sup>T<sup>8</sup>, ціано, гало, оксо, алкіл, галоалкіл, арил, гетероарил, гетероцикло, (ОН)алкіл, (SH)алкіл, (OT<sup>6</sup>)алкіл, (ST<sup>6</sup>)алкіл, (C(O)<sub>t</sub>T<sup>6</sup>)алкіл, (NT<sup>7</sup>T<sup>8</sup>)алкіл, (ціано)алкіл, (арил)алкіл, (гетероарил)алкіл або (гетероцикло)алкіл;

J являє собою зв'язок, метилен або етилен;

R<sup>3</sup> являє собою

(a) -R<sup>5</sup>, де R<sup>5</sup> являє собою гетероарил, гетероцикло або -NR<sup>6a</sup>R<sup>7a</sup>, будь-який із котрих, у разі потреби, є незалежно заміщеним однією чи більше такими групами: ОН, SH, OT<sup>6</sup>, ST<sup>6</sup>, C(O)<sub>t</sub>T<sup>6</sup>, NT<sup>7</sup>T<sup>8</sup>, ціано, гало, оксо, алкіл, галоалкіл, арил, гетероарил, гетероцикло, (ОН)алкіл, (SH)алкіл, (OT<sup>6</sup>)алкіл, (ST<sup>6</sup>)алкіл, (C(O)<sub>t</sub>T<sup>6</sup>)алкіл, (NT<sup>7</sup>T<sup>8</sup>)алкіл, (ціано)алкіл, (арил)алкіл, (гетероарил)алкіл або (гетероцикло)алкіл;

(b) -C(Z<sup>1</sup>)-R<sup>5</sup> або -O-C(Z<sup>1</sup>)-R<sup>5</sup>,

де

R<sup>5</sup> являє собою арил, (арил)алкіл, гетероарил, (гетероарил)алкіл або -NR<sup>6a</sup>R<sup>7a</sup>; і

R<sup>6a</sup> і R<sup>7a</sup> являють собою незалежно



(i) H, або

(ii) алкіл, циклоалкіл, арил, (арил)алкіл, гетероарил, (гетероарил)алкіл, гетероцикло, або (гетероцикло)алкіл, будь-який із котрих, у разі потреби, є незалежно заміщеним однією чи більше такими групами: OH, SH, OT<sup>6</sup>, ST<sup>6</sup>, C(O)<sub>t</sub>T<sup>6</sup>, NT<sup>7</sup>T<sup>8</sup>, ціано, гало, оксо, алкіл, галоалкіл, арил, гетероарил, гетероцикло, (OH)алкіл, (SH)алкіл, (OT<sup>6</sup>)алкіл, (ST<sup>6</sup>)алкіл, (C(O)<sub>t</sub>T<sup>6</sup>)алкіл, (NT<sup>7</sup>T<sup>8</sup>)алкіл, (ціано)алкіл, (арил)алкіл, (гетероарил)алкіл або (гетероцикло)алкіл; або

(с) -N(R<sup>8a1</sup>)-C(Z<sup>1</sup>)-R<sup>5</sup> або -N(R<sup>8a1</sup>)-SO<sub>2</sub>-R<sup>5</sup>,

де

R<sup>5</sup> являє собою арил, (арил)алкіл, гетероарил, (гетероарил)алкіл, гетероцикло, (гетероцикло)алкіл, алкіл, алкеніл, алкініл, циклоалкіл, (алкоксі)алкіл або (циклоалкоксі)алкіл, будь-який із котрих, у разі потреби, є незалежно заміщеним однією чи більше такими групами: OH, SH, OT<sup>6</sup>, ST<sup>6</sup>, C(O)<sub>t</sub>T<sup>6</sup>, NT<sup>7</sup>T<sup>8</sup>, ціано, гало, оксо, алкіл, галоалкіл, арил, гетероарил, гетероцикло, (OH)алкіл, (SH)алкіл, (OT<sup>6</sup>)алкіл, (ST<sup>6</sup>)алкіл, (C(O)<sub>t</sub>T<sup>6</sup>)алкіл, (NT<sup>7</sup>T<sup>8</sup>)алкіл, (ціано)алкіл, (арил)алкіл, (гетероарил)алкіл або (гетероцикло)алкіл; і

R<sup>8a1</sup> являє собою

(i) H, або

(ii) алкіл, циклоалкіл, арил, гетероарил, гетероцикло, (циклоалкіл)алкіл, (арил)алкіл, (гетероарил)алкіл або (гетероцикло)алкіл, будь-який із котрих, у разі потреби, є незалежно заміщеним однією чи більше такими групами: OH, SH, OT<sup>6</sup>, ST<sup>6</sup>, C(O)<sub>t</sub>T<sup>6</sup>, NT<sup>7</sup>T<sup>8</sup>, ціано, гало, оксо, алкіл, галоалкіл, арил, гетероарил, гетероцикло, (OH)алкіл, (SH)алкіл, (OT<sup>6</sup>)алкіл, (ST<sup>6</sup>)алкіл, (C(O)<sub>t</sub>T<sup>6</sup>)алкіл, (NT<sup>7</sup>T<sup>8</sup>)алкіл, (ціано)алкіл, (арил)алкіл, (гетероарил)алкіл або (гетероцикло)алкіл,

R<sup>5</sup> являє собою необов'язково заміщений алкіл, необов'язково заміщений циклоалкіл, необов'язково заміщений гетероарил, необов'язково заміщений арил або -NR<sup>6a</sup>R<sup>7a</sup>;

R<sup>6</sup> і R<sup>7</sup> являють собою незалежно H, необов'язково заміщений арил, необов'язково заміщений гетероарил, необов'язково заміщений циклоалкіл, необов'язково заміщений гетероцикло, необов'язково заміщений (арил)алкіл, необов'язково заміщений (гетероарил)алкіл, необов'язково заміщений (гетероцикло)алкіл, необов'язково заміщений алкіл або COR<sup>12</sup>;

або R<sup>6</sup> і R<sup>7</sup> разом з атомом азоту, з котрим вони зв'язані, утворюють необов'язково заміщений або незаміщений 5-8-членний цикл;

R<sup>6a</sup> являє собою H; і

R<sup>7a</sup> являє собою гетероарил, який, у разі потреби, є незалежно заміщеним однією чи більше групами T<sup>1d</sup>, T<sup>2d</sup> або T<sup>3d</sup>.

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

R<sup>1</sup> являє собою

(a) водень або гідрокси;

(b) -O-C(O)-NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>, -N(R<sup>8</sup>)-SO<sub>2</sub>-NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup> або -N(R<sup>8</sup>)-C(W)-NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>,

де

R<sup>6</sup> і R<sup>7</sup> являють собою незалежно

(i) H, або

(ii) алкіл, циклоалкіл, алкеніл, алкініл, арил, гетероарил, гетероцикло, алкокси, (арил)алкіл, (циклоалкіл)алкіл, (гетероарил)алкіл, (гетероцикло)алкіл або (алкоксі)алкіл, будь-який із котрих, у разі потреби, є незалежно заміщеним однією чи більше такими групами: OH, SH, OT<sup>6</sup>, ST<sup>6</sup>, C(O)<sub>t</sub>T<sup>6</sup>, NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>, ціано, гало, оксо, алкіл, галоалкіл, арил, гетероарил, гетероцикло, (OH)алкіл, (SH)алкіл, (OT<sup>6</sup>)алкіл, (ST<sup>6</sup>)алкіл, (C(O)<sub>t</sub>T<sup>6</sup>)алкіл, (NT<sup>7</sup>T<sup>8</sup>)алкіл, (ціано)алкіл, (арил)алкіл, (гетероарил)алкіл або (гетероцикло)алкіл,

або R<sup>6</sup> і R<sup>7</sup> об'єднуються між собою з утворенням гетероциклічного кільця, необов'язково заміщеного однією чи більше такими групами: OH, SH, OT<sup>6</sup>, ST<sup>6</sup>, C(O)<sub>t</sub>T<sup>6</sup>, NT<sup>7</sup>T<sup>8</sup>, ціано, гало, оксо, алкіл, галоалкіл, арил, гетероарил, гетероцикло, (OH)алкіл,

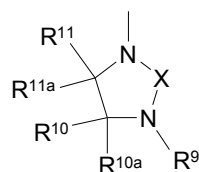
(SH)алкіл, (OT<sup>6</sup>)алкіл, (ST<sup>6</sup>)алкіл, (C(O)<sub>t</sub>T<sup>6</sup>)алкіл, (NT<sup>7</sup>T<sup>8</sup>)алкіл, (ціано)алкіл, (арил)алкіл, (гетероарил)алкіл або (гетероцикло)алкіл; і

R<sup>8</sup> являє собою

(i) H, або

(ii) алкіл, циклоалкіл, арил, гетероарил, гетероцикло, (циклоалкіл)алкіл, (арил)алкіл, (гетероарил)алкіл або (гетероцикло)алкіл, будь-який із котрих, у разі потреби, є незалежно заміщеним однією чи більше такими групами: OH, SH, OT<sup>6</sup>, ST<sup>6</sup>, C(O)<sub>t</sub>T<sup>6</sup>, NT<sup>7</sup>T<sup>8</sup>, ціано, гало, оксо, алкіл, галоалкіл, арил, гетероарил, гетероцикло, (OH)алкіл, (SH)алкіл, (OT<sup>6</sup>)алкіл, (ST<sup>6</sup>)алкіл, (C(O)<sub>t</sub>T<sup>6</sup>)алкіл, (NT<sup>7</sup>T<sup>8</sup>)алкіл, (ціано)алкіл, (арил)алкіл, (гетероарил)алкіл або (гетероцикло)алкіл; або

(с) групу



R<sup>1a</sup> являє собою H;

R<sup>2</sup> являє собою феніл, який, у разі потреби, є незалежно заміщеним однією чи більше такими групами: OH, SH, OT<sup>6</sup>, ST<sup>6</sup>, C(O)<sub>t</sub>T<sup>6</sup>, NT<sup>7</sup>T<sup>8</sup>, ціано, гало, оксо, алкіл, галоалкіл, арил, гетероарил, гетероцикло, (OH)алкіл, (SH)алкіл, (OT<sup>6</sup>)алкіл, (ST<sup>6</sup>)алкіл, (C(O)<sub>t</sub>T<sup>6</sup>)алкіл, (NT<sup>7</sup>T<sup>8</sup>)алкіл, (ціано)алкіл, (арил)алкіл, (гетероарил)алкіл або (гетероцикло)алкіл;

J являє собою зв'язок, метилен або етилен;

R<sup>3</sup> являє собою

(a) -R<sup>5</sup>, де R<sup>5</sup> являє собою гетероарил або гетероцикло, будь-який із котрих, у разі потреби, є незалежно заміщеним однією чи більше такими групами: OH, SH, OT<sup>6</sup>, ST<sup>6</sup>, C(O)<sub>t</sub>T<sup>6</sup>, NT<sup>7</sup>T<sup>8</sup>, ціано, гало, оксо, алкіл, галоалкіл, арил, гетероарил, гетероцикло, (OH)алкіл, (SH)алкіл, (OT<sup>6</sup>)алкіл, (ST<sup>6</sup>)алкіл, (C(O)<sub>t</sub>T<sup>6</sup>)алкіл, (NT<sup>7</sup>T<sup>8</sup>)алкіл, (ціано)алкіл, (арил)алкіл, (гетероарил)алкіл або (гетероцикло)алкіл;

(b) -C(Z<sup>1</sup>)-R<sup>5</sup> або -O-C(Z<sup>1</sup>)-R<sup>5</sup>, де

Z<sup>1</sup> являє собою =NR<sup>8a4</sup> або =N-CN;

R<sup>5</sup> являє собою арил, (арил)алкіл, гетероарил, (гетероарил)алкіл або -NR<sup>6a</sup>R<sup>7a</sup>; і

R<sup>6a</sup> і R<sup>7a</sup> являють собою незалежно

(i) H, або

(ii) алкіл, циклоалкіл, арил, (арил)алкіл, гетероарил, (гетероарил)алкіл, гетероцикло або (гетероцикло)алкіл, будь-який із котрих, у разі потреби, є незалежно заміщеним однією чи більше такими групами: OH, SH, OT<sup>6</sup>, ST<sup>6</sup>, C(O)<sub>t</sub>T<sup>6</sup>, NT<sup>7</sup>T<sup>8</sup>, ціано, гало, оксо, алкіл, галоалкіл, арил, гетероарил, гетероцикло, (OH)алкіл, (SH)алкіл, (OT<sup>6</sup>)алкіл, (ST<sup>6</sup>)алкіл, (C(O)<sub>t</sub>T<sup>6</sup>)алкіл, (NT<sup>7</sup>T<sup>8</sup>)алкіл, (ціано)алкіл, (арил)алкіл, (гетероарил)алкіл або (гетероцикло)алкіл; або

(с) -N(R<sup>8a1</sup>)-C(Z<sup>1</sup>)-R<sup>5</sup> або -N(R<sup>8a1</sup>)-SO<sub>2</sub>-R<sup>5</sup>,

де

Z<sup>1</sup> являє собою =NR<sup>8a4</sup> або =N-CN;

R<sup>5</sup> являє собою арил, (арил)алкіл, гетероарил, (гетероарил)алкіл, гетероцикло, (гетероцикло)алкіл, алкіл, алкеніл, алкініл, циклоалкіл, (алкокси)алкіл або (циклоалкокси)алкіл, будь-який із котрих, у разі потреби, є незалежно заміщеним однією чи більше такими групами: OH, SH, OT<sup>6</sup>, ST<sup>6</sup>, C(O)<sub>t</sub>T<sup>6</sup>, NT<sup>7</sup>T<sup>8</sup>, ціано, гало, оксо, алкіл, галоалкіл, арил, гетероарил, гетероцикло, (OH)алкіл, (SH)алкіл, (OT<sup>6</sup>)алкіл, (ST<sup>6</sup>)алкіл, (C(O)<sub>t</sub>T<sup>6</sup>)алкіл, (NT<sup>7</sup>T<sup>8</sup>)алкіл, (ціано)алкіл, (арил)алкіл, (гетероарил)алкіл або (гетероцикло)алкіл; і

R<sup>8a1</sup> являє собою

(i) H, або

(ii) алкіл, циклоалкіл, арил, гетероарил, гетероцикло, (циклоалкіл)алкіл, (арил)алкіл,

(гетероарил)алкіл або (гетероцикло)алкіл, будь-який із котрих, у разі потреби, є незалежно заміщеним однією чи більше такими групами: OH, SH, OT<sup>6</sup>, ST<sup>6</sup>, C(O)<sub>t</sub>T<sup>6</sup>, NT<sup>7</sup>T<sup>8</sup>, ціано, гало, оксо, алкіл, галоалкіл, арил, гетероарил, гетероцикло, (OH)алкіл, (SH)алкіл, (OT<sup>6</sup>)алкіл, (ST<sup>6</sup>)алкіл, (C(O)<sub>t</sub>T<sup>6</sup>)алкіл, (NT<sup>7</sup>T<sup>8</sup>)алкіл, (ціано)алкіл, (арил)алкіл, (гетероарил)алкіл або (гетероцикло)алкіл,

R<sup>5</sup> являє собою необов'язково заміщений алкіл, необов'язково заміщений циклоалкіл, необов'язково заміщений гетероарил, необов'язково заміщений арил або -NR<sup>6a</sup>R<sup>7a</sup>;

R<sup>6</sup> і R<sup>7</sup> являють собою незалежно H, необов'язково заміщений арил, необов'язково заміщений гетероарил, необов'язково заміщений циклоалкіл, необов'язково заміщений гетероцикло, необов'язково заміщений (арил)алкіл, необов'язково заміщений (гетероарил)алкіл, необов'язково заміщений (гетероцикло)алкіл, необов'язково заміщений алкіл або COR<sup>12</sup>;

або R<sup>6</sup> і R<sup>7</sup> разом з атомом азоту, з котрим вони зв'язані, утворюють необов'язково заміщений або незаміщений 5-8-членний цикл;

R<sup>6a</sup> являє собою H; і

R<sup>7a</sup> являє собою гетероарил, який, у разі потреби, є незалежно заміщеним однією чи більше групами T<sup>1d</sup>, T<sup>2d</sup> або T<sup>3d</sup>.

6. Фармацевтична композиція, що містить принаймні одну сполуку за п. 1 разом з придатним розріджувачем або носієм.

7. Фармацевтична композиція за п. 6, що містить, крім того, принаймні один додатковий терапевтичний засіб, вибраний з антиаритмічних засобів, блокаторів кальцевих каналів, антитромбоцитних засобів, антигіпертензивних засобів, антитромбоцитних/антитромболітичних засобів, антикоагулянтів, інгібіторів HMG-CoA редуктази, антидіабетичних засобів, міметиків тиреоїдних гормонів, антагоністів мінералокортикоїдних рецепторів або серцевих глікозидів.

8. Фармацевтична композиція за п. 7, яка **відрізняється** тим, що

(a) додатковий антиаритмічний засіб вибирають з соталолу, дофетиліду, дилтіазему і верапамілу;

(b) антитромбоцитний засіб вибирають з клопідогрелю, іфетробану й аспіріну;

(c) антигіпертензивний засіб вибирають з бета-адренергічних блокаторів, інгібіторів ACE, антагоністів А II, антагоністів ET, подвійних антагоністів ET/A II та інгібіторів вазопептидази;

(d) антитромбоцитний/антитромболітичний засіб вибирають з tPA, рекомбінантного tPA, TNK, nPA, інгібіторів фактора VIIa, інгібіторів фактора Ха і інгібіторів тромбіну;

(e) антикоагулянт вибирають з варфарину і гепаринів;

(f) інгібітор HMG-CoA редуктази вибирають з правастатину, ловастатину, аторвастатину, симвастатину, NK-104 і ZD-4522;

(g) антидіабетичний засіб вибирають з бігуанідів і комбінацій типу бігуанід/глібурид;

(h) антагоніст мінералокортикоїдних рецепторів вибирають з спіронолактону і еплерінону; і

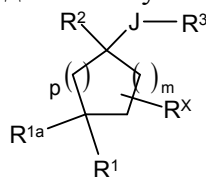
(i) серцевий глікозид вибирають з дигіталісу і убаїну.

9. Фармацевтична композиція за п. 8, яка **відрізняється** тим, що

(a) інгібітори ACE вибирають з каптоприлу, зофеноприлу, фозиноприлу, еналаприлу, цераноприлу, цилазоприлу, делаприлу, пентоприлу, квінаприлу, раміприлу і лізіноприлу; і

(b) інгібітори вазопептидази вибирають з омапатрилату і гемопатрилату.

10. Застосування щонайменше однієї сполуки за п. 1



для виготовлення засобів для лікування  $I_{Kur}$ -асоційованих розладів.

11. Застосування за п. 10, яке **відрізняється** тим, що  $I_{Kur}$ -асоційованим станом є аритмія, шлунково-кишковий розлад або запальне або імунологічне захворювання.

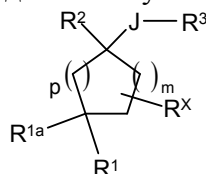
12. Застосування за п. 11, яке **відрізняється** тим, що аритмією є суправентрикулярна аритмія.

13. Застосування за п. 12, яке **відрізняється** тим, що суправентрикулярною аритмією є миготлива аритмія або тріпотіння передсердь.

14. Застосування за п. 11, яке **відрізняється** тим, що шлунково-кишковим розладом є шлунково-стравохідний рефлекс або розлад перистальтики.

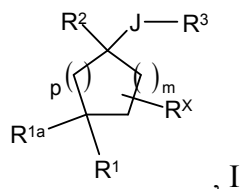
15. Застосування за п. 11, яке **відрізняється** тим, що запальним захворюванням є хронічна обструкція легень.

16. Застосування щонайменше однієї сполуки за п. 1



для виготовлення засобу для лікування діабету, когнітивних розладів або епілепсії.

17. Сполука за формулою I

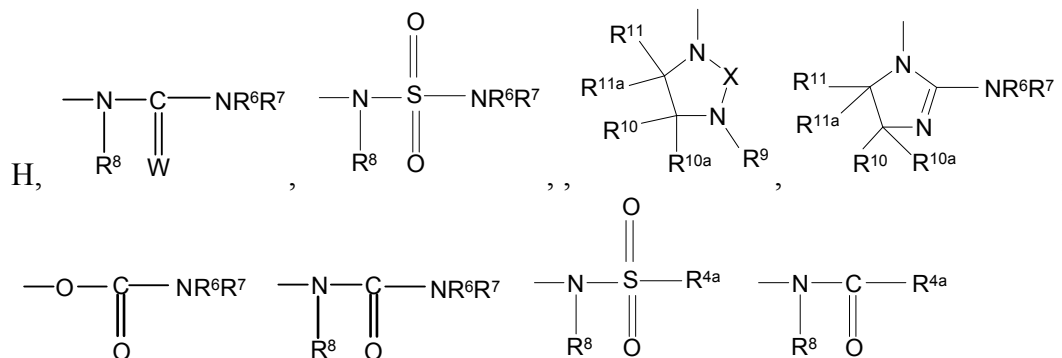


її енантіомери, діастереомери, сольвати або солі, де

m приймає значення 1;

p приймає значення 1;

$R^1$  являє собою



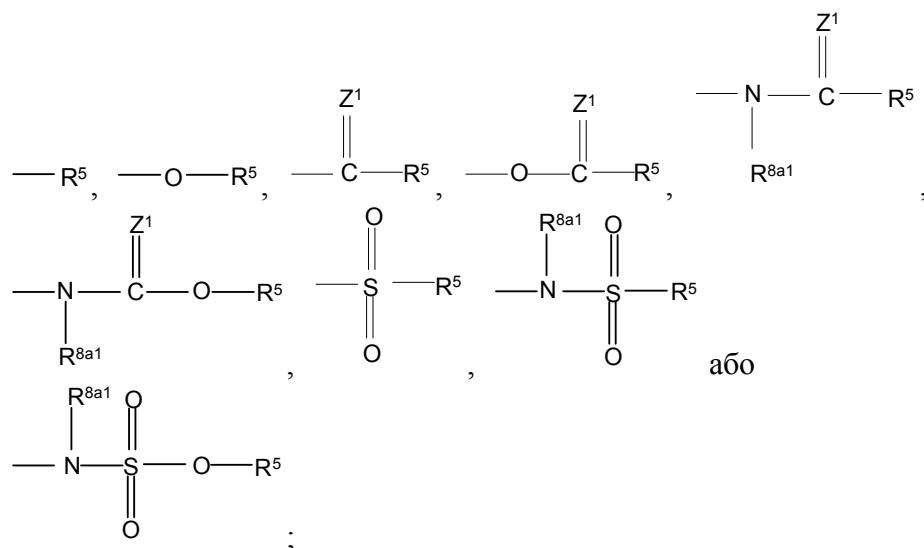
$-N(R^8)R^{14}$ ,  $-N(R^8)C(O)R^{14}$ ,  $-SO_2R^{8c}$ ,  $-CO_2H$ ,  $-C(O)R^{8c}$ ,  $-NR^6R^7$ , необов'язково заміщений арил, необов'язково заміщений гетероарил, необов'язково заміщений гетероцикло, гало, перфторалкіл, ціано, нітро, гідрокси, необов'язково заміщений алкокси, необов'язково заміщений арилокси, необов'язково заміщений гетероарилокси, необов'язково заміщений алкіл, необов'язково заміщений алкеніл або необов'язково заміщений алкініл;

$R^{1a}$  являє собою H,

$R^2$  являє собою арил, який, у разі потреби, є незалежно заміщеним однією чи більше такими групами:  $T^1$ ,  $T^2$  або  $T^3$ ;

J являє собою зв'язок або  $C_{1-4}$ алкілен, в разі потреби, незалежно заміщений однією чи більше такими групами:  $T^{1a}$ ,  $T^{2a}$  або  $T^{3a}$ ;

$R^3$  являє собою



$R^4$  являє собою алкіл, галоалкіл, алкеніл, циклоалкіл, гетероцикло, арил або гетероарил, із котрих будь-який, в разі потреби, є незалежно заміщеним однією чи більше такими групами:  $T^{1b}$ ,  $T^{2b}$  або  $T^{3b}$ ;

$R^{4a}$  являє собою  $R^4$  або  $OR^4$ ;

$R^5$  являє собою  $-NR^{6a}R^{7a}$  або гетероарил, (гетероарил)алкіл, арил, (арил)алкіл, алкіл, циклоалкіл, (циклоалкіл)алкіл, гетероцикло, (гетероцикло)алкіл або алкіл, із яких будь-який, у разі потреби, є незалежно заміщеним однією чи більше такими групами:  $T^{1c}$ ,  $T^{2c}$  або  $T^{3c}$ ;

$R^6$ ,  $R^7$ ,  $R^8$ ,  $R^{8a}$ ,  $R^{8a1}$ ,  $R^{8a2}$ ,  $R^{8a3}$ ,  $R^{8a4}$ ,  $R^{8a5}$  і  $R^9$  являють собою незалежно H, алкіл, гідрокси, алкокси, арилокси, гетероциклоокси, гетероарилокси, (гідроксі)алкіл, (алкокси)алкіл, (арилокси)алкіл, (гетероциклооксі)алкіл, (гетероарилокси)алкіл, (ціано)алкіл, (алкеніл)алкіл, (алкініл)алкіл, циклоалкіл, (циклоалкіл)алкіл, арил, (арил)алкіл, гетероарил, (гетероарил)алкіл, гетероцикло, (гетероцикло)алкіл,  $-C(O)R^{12}$ ,  $-CO_2R^{12}$  або  $-C(O)-NR^{12}R^{13}$ , із яких будь-який, у разі потреби, є незалежно заміщеним однією чи більше такими групами:  $T^{1d}$ ,  $T^{2d}$  або  $T^{3d}$ ;

або  $R^6$  і  $R^7$  разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, необов'язково утворюють насичений або ненасичений 4-8-членний цикл, в разі потреби, незалежно заміщений однією чи більше такими групами:  $T^{1d}$ ,  $T^{2d}$  або  $T^{3d}$ ;

або один із  $R^6$  або  $R^7$  необов'язково сполучається з одним із  $R^8$ ,  $R^{8a}$  або  $R^9$  з утворенням насиченого або ненасиченого 5-8-членного кільця, в разі потреби, незалежно заміщеного однією чи більше такими групами:  $T^{1d}$ ,  $T^{2d}$  або  $T^{3d}$ ;

$R^{6a}$  являє собою H; і

$R^{7a}$  являє собою гетероарил, який, у разі потреби, є незалежно заміщеним однією чи більше групами:  $T^{1d}$ ,  $T^{2d}$  або  $T^{3d}$ ;

$R^{8b}$  являє собою незалежно H, алкіл, арил, ціано, нітро, ацил або  $-SO_2$ (алкіл);

$R^{8c}$  являє собою незалежно H, алкіл, циклоалкіл, алкеніл, алкініл, арил, арилалкіл, циклогетероалкіл, гетероарил, аміно або алкокси;

$R^{8d}$  являє собою  $R^4$ ,  $COR^4$ ,  $CO_2R^4$ ,  $SO_2R^4$ ,  $CONR^6R^7$  або  $SO_2-NR^6R^7$ ;

$R^{10}$ ,  $R^{10a}$ ,  $R^{11}$  і  $R^{11a}$  являють собою незалежно H, алкіл, арил, (арил)алкіл, алкокси, (алкокси)алкіл, гало, гідрокси, (гідроксі)алкіл, аміно, амід, гетероарил, (гетероарил)алкіл, гетероцикло, (гетероцикло)алкіл, сульфонамід, циклоалкіл, (циклоалкіл)алкіл, ціано або оксо, із яких будь-який, у разі потреби, є незалежно заміщеним на доступних атомах однією чи більше такими групами:  $T^{1e}$ ,  $T^{2e}$  або  $T^{3e}$ ;

або  $R^{10a}$  необов'язково сполучається з  $R^{11a}$  з утворенням зв'язку;

або  $R^{10}$  необов'язково сполучається з  $R^9$  з утворенням насиченого або ненасиченого циклу;

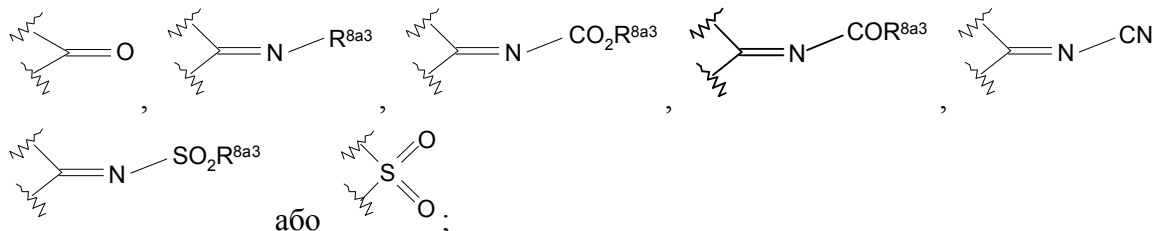
$R^{12}$  і  $R^{13}$  являють собою незалежно H, алкіл, гідрокси, алкокси, арилокси,

гетероциклоокси, гетероарилокси, (гідроксі)алкіл, (алкокси)алкіл, (арилокси)алкіл, (гетероциклоокси)алкіл, (гетероарилокси)алкіл, циклоалкіл, (циклоалкіл)алкіл, арил, (арил)алкіл, гетероарил, (гетероарил)алкіл, гетероцикло або (гетероцикло)алкіл, із яких будь-який, у разі потреби, є незалежно заміщеним однією чи більше такими групами:  $T^{1f}$ ,  $T^{2f}$  або  $T^{3f}$ ;

або  $R^{12}$  і  $R^{13}$  разом з атомом азоту, з котрим вони зв'язані, необов'язково утворюють насичений або ненасичений цикл, котрий, у разі потреби, є незалежно заміщеним однією чи більше такими групами:  $T^{1f}$ ,  $T^{2f}$  або  $T^{3f}$ ;

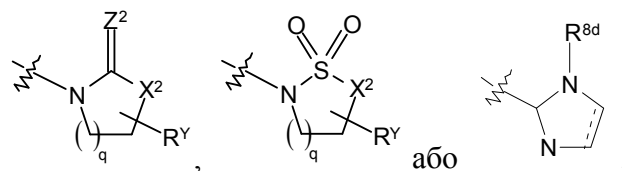
W являє собою  $=NR^{8a2}$ ,  $=N-CO_2R^{8a2}$ ,  $=N-COR^{8a2}$ ,  $=N-CN$  або  $=N-SO_2R^{8a2}$ ;

X являє собою



$Z$ ,  $Z^1$  і  $Z^2$  являють собою незалежно  $=O$ ,  $=S$ ,  $=NR^{8a4}$  або  $=N-CN$ ;

$R^{14}$  являє собою незалежно



де  $q$  приймає значення 1, 2 або 3;

$R^Y$  являє собою необов'язковий оксозамісник, зв'язаний з будь-яким доступним атомом вуглецю в циклі;

$X^1$  являє собою  $O$ ,  $S$ ,  $NR^{8a5}$  або  $CH_2$ ; і

$X^2$  являє собою  $NR^{8a5}$  або  $CH_2$ ;

$R^X$  являє собою один або більше необов'язкових замісників, зв'язаних з будь-яким доступним атомом вуглецю в циклі, незалежно вибраних з:  $T^{1g}$ ,  $T^{2g}$  або  $T^{3g}$ ;

$T^{1-1g}$ ,  $T^{2-2g}$  і  $T^{3-3g}$  кожний являє собою незалежно

(1) водень або  $T^6$ , де  $T^6$  являє собою

(i) алкіл, (гідроксі)алкіл, (алкокси)алкіл, алкеніл, алкініл, циклоалкіл, (циклоалкіл)алкіл, циклоалкеніл, (циклоалкеніл)алкіл, арил, (арил)алкіл, гетероцикло, (гетероцикло)алкіл, гетероарил або (гетероарил)алкіл;

(ii) групу (i), котра сама є заміщеною однією чи більше однаковими або різними групами (i); або

(iii) групу (i) або (ii), котра незалежно є заміщеною однією чи більше такими групами: (2)-

(13) за визначенням для  $T^{1-1g}$ ,  $T^{2-2g}$  і  $T^{3-3g}$ ,

(2)  $-OH$  або  $-OT^6$ ,

(3)  $-SH$  або  $-ST^6$ ,

(4)  $-C(O)_tH$ ,  $-C(O)_tT^6$  або  $-O-C(O)_tT^6$ , де  $t$  приймає значення 1 або 2;

(5)  $-SO_3H$ ,  $-S(O)_tT^6$  або  $S(O)_tN(T^9)T^6$ ,

(6) галоген,

(7) ціано,

(8) нітро,

(9)  $-T^4-NT^7T^8$ ,

(10)  $-T^4-N(T^9)-T^5-NT^7T^8$ ,

(11)  $-T^4-N(T^{10})-T^5-T^6$ ,

(12)  $-T^4-N(T^{10})-T^5-H$ ,

(13) оксо,

$T^4$  і  $T^5$  кожний являє собою незалежно

(1) одинарний зв'язок,

(2)  $-T^{11}-S(O)_t-T^{12}-$ ,

(3)  $-T^{11}-C(O)-T^{12}-$ ,

(4)  $-T^{11}-C(S)-T^{12}-$ ,

(5)  $-T^{11}-O-T^{12}-$ ,

(6)  $-T^{11}-S-T^{12}-$ ,

(7)  $-T^{11}-O-C(O)-T^{12}-$ ,

(8)  $-T^{11}-C(O)-O-T^{12}-$ ,

(9)  $-T^{11}-C(=NT^{9a})-T^{12}-$ , або

(10)  $-T^{11}-C(O)-C(O)-T^{12}-$ ;

$T^7$ ,  $T^8$ ,  $T^9$ ,  $T^{9a}$  і  $T^{10}$

(1) кожний являє собою незалежно водень або групу за визначенням для  $T^6$ , або

(2)  $T^7$  і  $T^8$  необов'язково разом являють собою алкілен або алкенілен, утворюючи, разом з атомами, з котрими вони зв'язані, 3-8-членний насичений або ненасичений цикл, причому цей цикл є незаміщеним або заміщеним однією чи більше такими групами, переліченими у визначенні  $T^{1-1g}$ ,  $T^{2-2g}$  і  $T^{3-3g}$ , або

(3)  $T^7$  або  $T^8$ , разом з  $T^9$  необов'язково являють собою алкілен або алкенілен, утворюючи разом з атомами азоту, з котрими вони зв'язані, 3-8-членний насичений або ненасичений цикл, причому цей цикл є незаміщеним або заміщеним однією чи більше такими групами, переліченими у визначенні  $T^{1-1g}$ ,  $T^{2-2g}$  і  $T^{3-3g}$ , або

(4)  $T^7$  і  $T^8$  або  $T^9$  і  $T^{10}$ , разом з атомом азоту, з котрим вони зв'язані, необов'язково утворюють групу  $-N=CT^{13}T^{14}$ , де  $T^{13}$  і  $T^{14}$  кожний являє собою незалежно Н або групу за визначенням для  $T^6$ ;

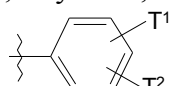
$T^{11}$  і  $T^{12}$  кожний являє собою незалежно

(1) одинарний зв'язок,

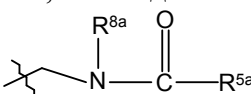
(2) алкілен,

(3) алкенілен, або

(4) алкінілен; за умови, що



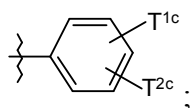
(i)  $R^2$  є іншим, ніж , коли одночасно виконуються обидві умови (a) і (b):

(a)  $-J-R^3$  являє собою  ; і

(b)  $R^1$  являє собою Н, галоген, гідрокси, ціано, нітро, арил, алкокси, арилокси, гетероарилокси, необов'язково заміщений алкіл, необов'язково заміщений алкеніл, необов'язково заміщений алкініл,  $-OC(=O)CCl_3$ ,  $-SO_2$ (алкіл),  $-SO_2$ (арил),  $-SO_2$ (арилалкіл),  $-CO_2H$ ,  $-C(=O)$ (алкіл),  $-CO_2$ (алкіл),  $-C(=O)NR^{6*}R^{7*}$ ,  $-NR^{6*}R^{7*}$ ,  $-OC(=O)NR^{6*}R^{7*}$ ,  $-N_3$ ,  $-N(R^8)C(O)NR^{6*}R^{7*}$ ,  $-OC(=O)OR^4$ ,  $-OC(=O)R^4$  або  $-N(H)S(O)_2R^4$ ;

де

$R^{6*}$  і  $R^{7*}$  кожний являє собою незалежно Н, арил,  $-C(O)$ арил,  $-CO_2$ арил, алкіл,  $-C(O)$ алкіл,  $-CO_2$ алкіл,  $-S(O)_u$ алкіл,  $-C(O)S(O)_u$ алкіл,  $-S(O)_u$ арил,  $-C(O)S(O)_u$ арил або гетероцикло;

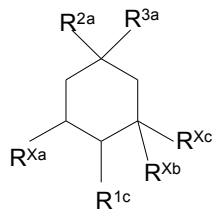


$R^{5a}$  являє собою

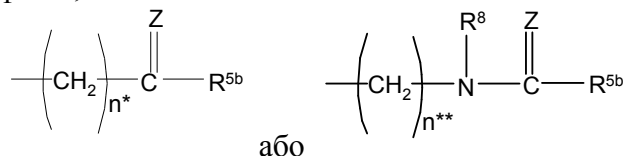
$R^{8a}$  являє собою Н або алкіл; і

и приймає значення 0, 1, 2 або 3;

(ii) зазначена сполука є відмінною від сполуки, вираженої формулою



де  
 $R^{1c}$  являє собою  $-\text{OC}(\text{O})\text{NHR}^{7c}$  або  $-\text{O}(\text{CO})\text{R}^{4b}$ ;  
 $R^{2a}$  являє собою феніл;



$R^{3a}$  являє собою ;

$R^{4b}$  являє собою алкіл;

$R^{5b}$  являє собою  $-\text{NHR}^{7d}$  або бензил, заміщений однією-трьома групами, незалежно вибраними з гало, алкілу або алкокси;

$R^{7c}$  являє собою алкіл, феніл або бензил;

$R^{7d}$  являє собою феніл, заміщений однією-трьома групами, незалежно вибраними з гало, алкілу або алкокси;

$R^{Xa}$  являє собою гідрокси,  $-\text{OC}(\text{O})\text{NHR}^{7c}$  або  $-\text{OC}(\text{O})\text{R}^{4b}$ ;

$R^{Xb}$  і  $R^{Xc}$  являють собою незалежно H або алкіл;

$n^*$  приймає значення 1-4;

$n^{**}$  приймає значення 0-3;

(iii)  $R^2$  є іншим, ніж феніл, коли одночасно виконуються обидві умови (e) і (f):

(e)  $R^1$  являє собою алкіл, алкокси або феніл; і

(f)  $-\text{J-R}^3$  являє собою N-арилзаміщену піперазинільну групу;

(iv)  $R^1$  є іншим, ніж гідрокси, алкокси, арилокси, алкіл або арил, коли одночасно виконуються обидві умови (g) і (h);

(g)  $R^2$  являє собою арил; і

(h)  $-\text{J-R}^3$  являє собою  $-\text{NR}^{6e}\text{R}^{7e}$  або  $-(\text{CHR}^{20})-\text{R}^{5c}$ ,

де

$R^{5c}$  являє собою необов'язково заміщений феніл;

$R^{6e}$  являє собою водень, гідрокси або алкокси;

$R^{7e}$  являє собою необов'язково заміщений феніл; і

$R^{20}$  являє собою водень, гідрокси або алкокси;

(v)  $R^2$  є іншим, ніж необов'язково заміщений феніл, коли одночасно виконуються обидві умови (j) і (k);

(j)  $R^{1a}$  являє собою H, а  $R^1$  являє собою H, гідрокси,  $-(\text{CH}_2)_{n^*}-\text{NR}^{6f}\text{R}^{7f}$ ,  $-(\text{CH}_2)_{n^*}-\text{CO}_2\text{R}^{8e}$ , циклоалкіл, гетероцикло або гетероарил;

де

$n^*$  приймає значення 0-2;

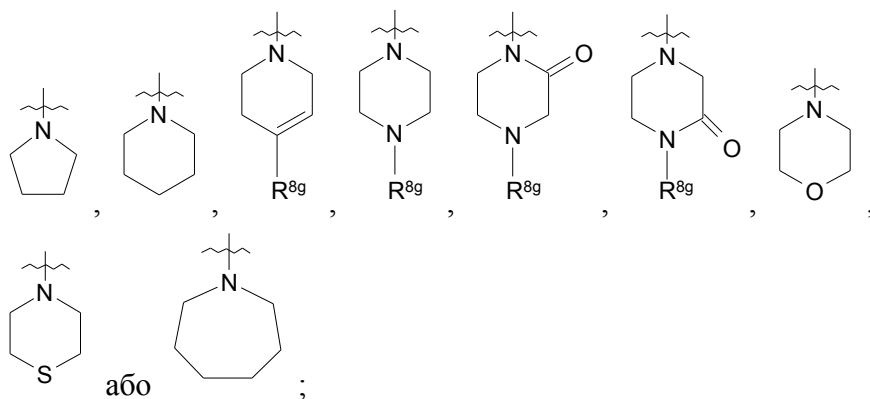
$m^*$  приймає значення 1 або 2;

$R^{6f}$  і  $R^{7f}$  являють собою незалежно H, алкіл, алкеніл, (гідроксі)алкіл, циклоалкіл, (циклоалкіл)алкіл, арил, (арил)алкіл, гетероцикло, (гетероцикло)алкіл, гетероарил, (гетероарил)алкіл,  $\text{CHO}$ ,  $-\text{C}(\text{O})$ -алкіл,  $-\text{C}(\text{O})$ циклоалкіл,  $-\text{C}(\text{O})$ (циклоалкіл)алкіл,  $-\text{C}(\text{O})$ -арил,  $-\text{C}(\text{O})$ (арил)алкіл,  $-\text{C}(\text{O})$ -гетероцикло,  $-\text{C}(\text{O})$ (гетероцикло)алкіл,  $-\text{C}(\text{O})$ -алкіл- $\text{NR}^{8e}\text{R}^{8f}$ ,  $-\text{C}(\text{O})$ - $\text{NR}^{8e}\text{R}^{8f}$ ,  $-\text{CO}_2$ -алкіл,  $-\text{алкіл}-\text{CO}_2$ -алкіл,  $-\text{CO}_2$ -циклоалкіл,  $-\text{CO}_2$ -(циклоалкіл)алкіл,  $-\text{CO}_2$ -арил,  $-\text{CO}_2$ -(арил)алкіл,  $-\text{CO}_2$ -гетероцикло,  $-\text{CO}_2$ -(гетероцикло)алкіл,  $-\text{CO}_2$ - $\text{NR}^{8e}\text{R}^{8f}$ ,  $-\text{CO}_2$ -алкіл- $\text{NR}^{8e}\text{R}^{8f}$ ,  $-\text{NR}^{8e}\text{COR}^{8f}$ ,  $-\text{алкіл}-\text{NR}^{8e}\text{COR}^{8f}$ ,  $-\text{NR}^{8e}\text{CO}_2\text{R}^{8f}$ ,  $-\text{алкіл}-\text{NR}^{8e}\text{CO}_2\text{R}^{8f}$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{8e})$ (арил),  $-\text{алкіл}-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{8e})$ (арил),  $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{8e})$ (гетероцикло),  $-\text{алкіл}-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{8e})$ (гетероцикло);

або  $R^{6f}$  і  $R^{7f}$ , разом з атомом азоту, з котрим вони зв'язані, утворюють необов'язково



захищене гетероциклічне кільце, вибране з:

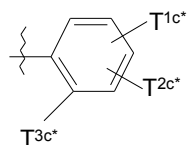


$R^{8e}$  і  $R^{8f}$  являють собою незалежно H, алкіл, циклоалкіл, (фтор)алкіл або  $-\text{CH}_2\text{CO}_2$ -алкіл;

$R^{8g}$  являє собою H, алкіл, циклоалкіл, (циклоалкіл)алкіл, арил, (арил)алкіл, гетероцикло, (гетероцикло)алкіл, гетероарил, (гетероарил)алкіл, CHO,  $-\text{C}(\text{O})$ -алкіл,  $-\text{C}(\text{O})$ -циклоалкіл,  $-\text{C}(\text{O})$ (циклоалкіл)алкіл,  $-\text{C}(\text{O})$ -арил,  $-\text{C}(\text{O})$ (арил)алкіл,  $-\text{C}(\text{O})$ -гетероцикло,  $-\text{C}(\text{O})$ (гетероцикло)алкіл,  $-\text{CO}_2$ -алкіл,  $-\text{CO}_2$ -циклоалкіл,  $-\text{CO}_2$ (циклоалкіл)алкіл,  $-\text{CO}_2$ -арил,  $-\text{CO}_2$ (арил)алкіл,  $-\text{CO}_2$ -гетероцикло,  $-\text{CO}_2$ (гетероцикло)алкіл,  $-\text{CO}_2$ -NR<sup>6f</sup>R<sup>7f</sup> або  $-\text{CO}_2$ -(алкіл)-NR<sup>6f</sup>R<sup>7f</sup>;

(k)  $-\text{J}-\text{R}^3$  являє собою групу  $-\text{C}(\text{O})-\text{NR}^{8a1}-(\text{CR}^{15}\text{R}^{16})-\text{R}^{5*}$ ,  $-(\text{CR}^{15}\text{R}^{16})-\text{NR}^{8a1}-\text{C}(\text{O})-\text{R}^{5*}$ ,  $-(\text{CR}^{15}\text{R}^{16})-\text{NR}^{8a1}-(\text{CR}^{17}\text{R}^{18})-\text{R}^{5*}$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{O}-(\text{CR}^{15}\text{R}^{16})-\text{R}^{5*}$ ,  $-(\text{CR}^{15}\text{R}^{16})-\text{OC}(\text{O})-\text{R}^{5*}$ ,  $-(\text{CR}^{15}\text{R}^{16})-\text{O}-(\text{CR}^{17}\text{R}^{18})-\text{R}^{5*}$ ,  $-\text{C}(\text{R}^{15})=\text{C}(\text{R}^{16})-\text{R}^{5*}$ ,  $-(\text{CR}^{15}\text{R}^{16})-\text{C}(\text{R}^{17})=\text{C}(\text{R}^{18})-\text{R}^{5*}$ ,  $-(\text{CR}^{15}\text{R}^{16})-\text{C}(\text{R}^{17}\text{R}^{18})-(\text{CR}^{19}\text{R}^{20})-\text{R}^{5*}$ ,  $-\text{C}(\text{O})-(\text{CR}^{15}\text{R}^{16})-(\text{CR}^{17}\text{R}^{18})-\text{R}^{5*}$ ,  $-(\text{CR}^{15}\text{R}^{16})-\text{C}(\text{O})-(\text{CR}^{17}\text{R}^{18})-\text{R}^{5*}$ ,  $-(\text{CR}^{15}\text{R}^{16})-(\text{CR}^{17}\text{R}^{18})-\text{C}(\text{O})-\text{R}^{5*}$ ,  $-\text{NR}^{8a1}-\text{C}(\text{O})-(\text{CR}^{15}\text{R}^{16})-\text{R}^{5*}$ ,  $-\text{NR}^{8a1}-(\text{CR}^{15}\text{R}^{16})-(\text{CR}^{17}\text{R}^{18})-\text{R}^{5*}$ ,  $-\text{N}(\text{R}^{8a1})-\text{C}(\text{O})-\text{C}(\text{O})-\text{R}^{5*}$ ,  $-\text{OC}(\text{O})(\text{CR}^{15}\text{R}^{16})-\text{R}^{5*}$  або  $-\text{O}-(\text{CR}^{15}\text{R}^{16})-(\text{CR}^{17}\text{R}^{18})-\text{R}^{5*}$ ,

де



$\text{R}^{5*}$  являє собою  $\text{T}^{3c*}$ , де

$\text{T}^{1c*}$  являє собою гідрокси, алкіл, фторалкіл, алкеніл, циклоалкіл, (циклоалкіл)алкіл, алкокси, фторалкокси, (алкокси)алкіл, (алкокси)алкокси, (фторалкокси)алкіл, алкенілокси, циклоалкілокси, (циклоалкіл)алкокси, фенокси, ціано, гало,  $-\text{NT}^7\text{T}^8$ , де  $\text{T}^7$  і  $\text{T}^8$  є такими, як визначено вище,  $-\text{SH}$ ,  $-\text{ST}^6$ , де  $\text{T}^6$  приймає значення згідно з визначеним вище,  $-\text{S}(\text{O})_t\text{T}^6$ , де  $t$  приймає значення згідно з визначеним вище,  $-\text{C}(\text{O})_t\text{H}$ ,  $-\text{C}(\text{O})_t\text{T}^6$  або  $-\text{C}(\text{O})-\text{NT}^7\text{T}^8$ ;

$\text{T}^{2c*}$  являє собою H, галоген, алкіл або алкокси;

або, коли  $\text{T}^{1c*}$  є суміжним з  $\text{T}^{2c*}$ , вони необов'язково сполучаються з утворенням 5- або 6-членного гетероциклічного або гетероарильного кільця, у разі потреби, заміщеного алкілом, фторалкілом,  $=\text{O}$  або  $=\text{S}$ ;

$\text{T}^{3c*}$  являє собою H, галоген, алкіл, фторалкіл, алкокси, фторалкокси, циклоалкіл, (циклоалкіл)алкіл, ціано, гетероарил,  $-\text{NT}^7\text{T}^8$ ,  $-\text{SH}$ ,  $-\text{ST}^6$ ,  $-\text{S}(\text{O})_t\text{T}^6$ ,  $-\text{C}(\text{O})_t\text{H}$ ,  $-\text{C}(\text{O})_t\text{T}^6$  або  $-\text{C}(\text{O})-\text{NT}^7\text{T}^8$ , або алкіл, заміщений ціаногрупою,  $\text{CO}_2\text{H}$ ,  $\text{CO}_2\text{T}^6$  або  $-\text{C}(\text{O})-\text{NT}^7\text{T}^8$ ;

і  $\text{R}^{15}$ ,  $\text{R}^{16}$ ,  $\text{R}^{17}$ ,  $\text{R}^{18}$ ,  $\text{R}^{19}$  і  $\text{R}^{20}$  являють собою незалежно H, гідрокси, алкіл, алкеніл, (гідрокси)алкіл, (алкокси)алкіл,  $-(\text{CH}_2)_n-\text{NR}^{6f}\text{R}^{7f}$ ,  $-\text{CHO}$ ,  $-\text{C}(\text{O})$ алкіл або  $-\text{CO}_2$ алкіл;

або  $\text{R}^{15}$  і  $\text{R}^{16}$  разом утворюють  $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ ;

або  $\text{R}^{17}$  і  $\text{R}^{18}$  разом утворюють  $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ ;

або  $\text{R}^{19}$  і  $\text{R}^{20}$  разом утворюють  $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ .