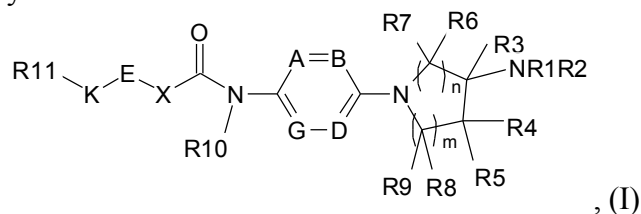


## 1. Сполука формули I



де

R1, R2, незалежно один від одного, являють собою H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)алкіл, -(CR<sup>7</sup>CR<sup>9</sup>)<sub>o</sub>-R<sup>12</sup>, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкіл, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)алкеніл, CO-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)алкіл, -CO-(CH<sub>2</sub>)<sub>o</sub>-R<sup>12</sup>, CO-арилокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкіл, COCH=H(R<sup>13</sup>), COCC(R<sup>14</sup>), CO(C(R<sup>15</sup>)(R<sup>16</sup>))<sub>q</sub>N(R<sup>17</sup>)(R<sup>18</sup>), CO(C(R<sup>19</sup>)(R<sup>20</sup>))<sub>t</sub>CON(R<sup>21</sup>)(R<sup>22</sup>), CO(C(R<sup>23</sup>)(R<sup>24</sup>))<sub>s</sub>O(R<sup>25</sup>);

або R1 і R2 утворюють разом з атомом азоту, з яким вони зв'язані, 4-10-членне моно-, бі- або спіроциклічне кільце, яке, крім атома азоту, може містити 0-2 додаткових гетероатомів, вибраних з групи, що включає кисень, азот і сірку, де гетероциклічна кільцева система може бути додатково заміщена F, Cl, Br, CF<sub>3</sub>, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкілом, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкілом, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкілом, гідрокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкілом, (C<sub>0</sub>-C<sub>2</sub>)алкіленарилом, оксо, CO(R<sup>26</sup>), CON(R<sup>27</sup>)(R<sup>28</sup>), гідрокси, COO(R<sup>29</sup>), N(R<sup>30</sup>)CO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкілом, N(R<sup>31</sup>)(R<sup>32</sup>) або SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>;

o має значення 0, 1, 2, 3, 4, 5, 6;

q, r, незалежно один від одного, мають значення 1, 2, 3;

s має значення 0, 1, 2, 3, 4;

R<sup>13</sup>, R<sup>14</sup>, незалежно один від одного, являють собою інше фенільне кільце, яке може містити 0-1 атом азоту;

R<sup>15</sup>, R<sup>16</sup>, R<sup>17</sup>, R<sup>19</sup>, R<sup>20</sup>, R<sup>21</sup>, R<sup>22</sup>, R<sup>23</sup>, R<sup>24</sup>, R<sup>25</sup>, R<sup>26</sup>, R<sup>27</sup>, R<sup>28</sup>, R<sup>29</sup>, R<sup>30</sup>, R<sup>31</sup>, R<sup>32</sup>, незалежно один від одного, являють собою H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл;

R<sup>18</sup> являє собою H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл, CO(R<sup>33</sup>);

або

R<sup>17</sup> і R<sup>18</sup>, R<sup>21</sup> і R<sup>22</sup>, R<sup>27</sup> і R<sup>28</sup>, R<sup>31</sup> і R<sup>32</sup>, незалежно один від одного, необов'язково разом з атомом азоту, з яким вони зв'язані, утворюють 5-6-членне кільце, яке, крім атома азоту, може також містити 0-1 додатковий гетероатом, вибраний з групи, що включає N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл, кисень і сірку;

R<sup>33</sup> являє собою 5-10-членну ароматичну кільцеву систему, яка може містити додатковий гетероатом, вибраний з групи, що включає азот, кисень і сірку, і може бути заміщена F, Cl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкілом, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)алкілом;

R<sup>12</sup> являє собою OH, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл, O(C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)алкіленарил, CN, S-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл, COO(R<sup>80</sup>), CON(R<sup>81</sup>)(R<sup>82</sup>), 3-12-членне моно-, бі- або спіроциклічне кільце, яке може містити один або декілька гетероатомів, вибраних з групи, що включає N, O і S, і вказане 3-12-членне кільце може містити додаткові замісники, такі як F, Cl, Br, OH, CF<sub>3</sub>, CN, оксо, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкіл, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл, O-(C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)алкіленарил, (C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)алкіленарил, N(R<sup>34</sup>)(R<sup>35</sup>), COCH=CH(R<sup>36</sup>), (C(R<sup>37</sup>)(R<sup>38</sup>))<sub>t</sub>(R<sup>39</sup>), CO(C(R<sup>37</sup>)(R<sup>38</sup>))<sub>t</sub>(R<sup>39</sup>), CO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл, COCOO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл, COO(R<sup>40</sup>), S(O)<sub>u</sub>(R<sup>41</sup>);

t має значення 0, 1, 2, 3, 4, 5, 6;

u має значення 0, 1, 2;

R<sup>34</sup>, R<sup>35</sup>, R<sup>37</sup>, R<sup>38</sup>, незалежно один від одного, являють собою H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)алкіл;

або

R<sup>34</sup> і R<sup>35</sup>, необов'язково разом з атомом азоту, з яким вони зв'язані, утворюють 5-6-членне кільце, яке, крім атома азоту, може також містити 0-1 додатковий гетероатом, вибраний з групи, що включає N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл, кисень і сірку, і може необов'язково бути заміщеним 1-2 оксогрупами;

R<sup>36</sup>, R<sup>39</sup>, незалежно один від одного, являють собою (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)циклоалкіл, 5-10-членну ароматичну кільцеву систему, яка може містити 0-2 додаткових гетероатомів, вибраних з групи, що включає азот, кисень і сірку, і може бути заміщена F, Cl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкілом, O-(C<sub>1</sub>-

C<sub>8</sub>)алкілом;

R40 являє собою H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)алкіл, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)алкеніл, (C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)алкіленарил;

R41 являє собою (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл, 5-10-членну ароматичну кільцеву систему, яка може містити 0-2 додаткових гетероатомів, вибраних з групи, що включає азот, кисень і сірку, і може бути заміщена F, Cl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкілом, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)алкілом;

R78, R79, незалежно один від одного, являють собою H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)алкіл, гідроксі-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкіл, OH, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкіл;

R80, R81, незалежно один від одного, являють собою H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)алкіл;

R3 являє собою H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл;

R4, R5, незалежно один від одного, являють собою H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл, OH, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл, O-CO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл, S-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл;

R6, R7, R8, R9 являють собою H;

або

R6 і R7, R8 і R9, незалежно один від одного, необов'язково, являють собою оксо;

n має значення 1;

m має значення 1;

A, B, D, G, незалежно один від одного, являє собою N, C(R42);

або

групи A і B або групи D і G, кожна, являють собою C(R42) і разом утворюють ортофеніленову ланку, загалом утворюючи 1,4-бізаміщену нафталінову систему;

R42 являє собою H, F, Cl, Br, CF<sub>3</sub>, CN, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкіл, S-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл, (C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)алкіленарил, O-(C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)алкіленарил, N(R43)(R44), SO<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, CON(R45)(R46), N(R47)CO(R48), CO(R51), -(CR<sub>84</sub>R<sub>85</sub>)<sub>x</sub>-O(R86);

R43, R44, R45, R46, R47, незалежно один від одного, являють собою H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)алкіл;

або

R43 і R44, R45 і R46, незалежно один від одного, необов'язково разом з атомом азоту, з яким вони зв'язані, утворюють 5-6-членне кільце, яке, крім атома азоту, може також містити 0-1 додатковий гетероатом, вибраний з групи, що включає N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл, кисень і сірку;

R48, R50, R51, незалежно один від одного, являють собою H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) алкіл, арил;

R84, R85 являють собою H;

R86 являє собою H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл;

x має значення 0, 1, 2;

R10 являє собою H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)алкіл;

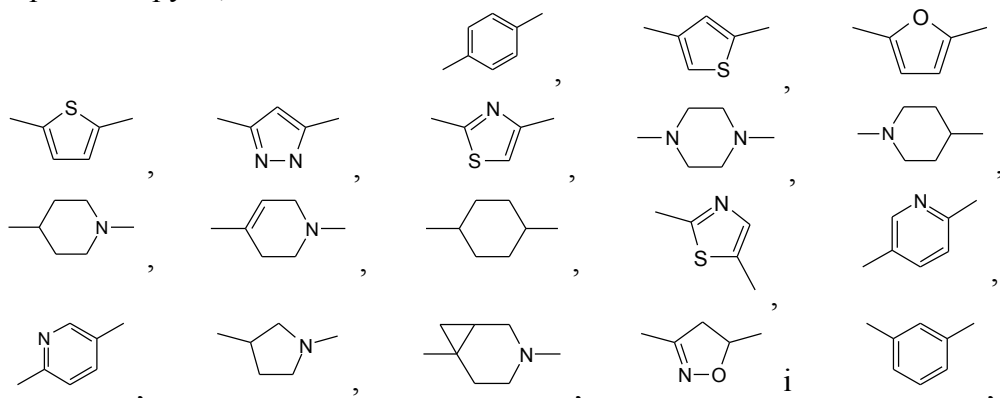
X являє собою N(R52), зв'язок, C=C, C(R53)(R54), CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>;

Y являє собою O, S, N(R89);

R89 являє собою H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)алкіл;

R52, R53, R54, незалежно один від одного, являють собою H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)алкіл;

E вибраний з групи, що включає:



які можуть необов'язково містити замісники, вибрані з групи, що включає H, F, Cl, Br,

ОН, CF<sub>3</sub>, NO<sub>2</sub>, OCF<sub>3</sub>, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)алкеніл, N(R57)(R58), SO<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, CO(R65);

R57, R58, незалежно один від одного, являють собою H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)алкіл;

R65, незалежно один від одного, являють собою H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)алкіл, арил;

K являє собою зв'язок, O, OCH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>O, S, SO, SO<sub>2</sub>, N(R66), N(R67)CO, CON(R68), (C(R69)(R70))<sub>v</sub>, CO, C=C, C≡C, SCH<sub>2</sub>, SO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>;

v має значення 1, 2, 3, 4;

R66, R67, R68, R69, R70, незалежно один від одного, являють собою H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)алкіл;

R11 являє собою H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)алкіл, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкіл, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)алкеніл, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)алкініл, 3-10-членне моно-, бі-, три- або спіроциклічне кільце, яке може містити 0-4 гетероатоми, вибраних з групи, що включає кисень, азот і сірку, де вказана кільцева система може бути додатково заміщена F, Cl, Br, CF<sub>3</sub>, CN, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкілом, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)алкілом, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкілом, гідрокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкілом, -(C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)алкіленарилом, оксо, CO(R71), CON(R72)(R73), гідрокси, COO(R74), N(R75)CO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкілом, N(R76)(R77) або SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>;

R71, R72, R73, R74, R75, R76, R77, незалежно один від одного, являють собою H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)алкіл;

або

R72 і R73, R76 і R77, незалежно один від одного, необов'язково разом з атомом азоту, з яким вони зв'язані, утворюють 5-6-членне кільце, яке, крім атома азоту, може також містити 0-1 додатковий гетероатом, вибраний з групи, що включає N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл, кисень і сірку; або

її N-оксиди і фізіологічно прийнятні солі.

2. Сполука формули I за п. 1,

де

R1, R2, незалежно один від одного, являють собою H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)алкіл, -(CR78R79)<sub>o</sub>-R12, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкіл, CO-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)алкіл, -CO-(CH<sub>2</sub>)<sub>o</sub>-R12, COCH=CH(R13), COCC(R14), CO(C(R15)(R16))<sub>q</sub>N(R17)(R18), CO(C(R23)(R24))<sub>s</sub>O(R25);

або R1 і R2 утворюють разом з атомом азоту, з яким вони зв'язані, 4-10-членне моно- або біциклічне кільце, яке, крім атома азоту, може містити 0-2 додаткових гетероатомів, вибраних з групи, що включає кисень, азот і сірку, де гетероциклічна кільцева система може бути додатково заміщена F, Cl, CF<sub>3</sub>, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкілом, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкілом, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкілом, (C<sub>0</sub>-C<sub>2</sub>)алкіленарилом, оксо, CO(R26), гідрокси, N(R31)(R32) або SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>;

o має значення 0, 1, 2, 3, 4;

q має значення 1 або 2;

s має значення 0, 1, 2, 3;

R13, R14, незалежно один від одного, являють собою інше фенільне кільце, яке може містити 0-1 атом азоту;

R15, R16, R17, R23, R24, R26, R31, R32, незалежно один від одного, являють собою H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл;

R18 являє собою H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл, CO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл;

або

R17 і R18, R31 і R32, незалежно один від одного, необов'язково разом з атомом азоту, з яким вони зв'язані, утворюють 5-6-членне кільце, вибране з піролідину, піперидину, N-метилпіперазину, морфоліну;

R12 являє собою ОН, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл, O(C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)алкіленарил, CN, 3-10-членне моно- або біциклічне кільце, яке може містити 1-3 гетероатоми, вибраних з групи, що включає N, O і S, і вказане 3-10 членне кільце може містити додаткові замісники, такі як F, Cl, Br, ОН, CF<sub>3</sub>, CN, оксо, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкіл, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл, (C<sub>0</sub>-C<sub>2</sub>)алкіленарил, N(R34)(R35), CO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл;

t має значення 0, 1, 2, 3, 4, 5, 6;

u має значення 0 або 2;

R34, R35, незалежно один від одного, являють собою H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)алкіл;

або

R34 і R35, необов'язково разом з атомом азоту, з яким вони зв'язані, утворюють 5-6-членне кільце, яке, крім атома азоту, може також містити 0-1 додатковий гетероатом, вибраний з групи, що включає N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл, кисень і сірку, і може бути заміщеним 1-2 оксогрупами;

R78, R79, незалежно один від одного, являють собою H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)алкіл, гідроксі-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкіл, OH, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкіл;

R3 являє собою H;

R4, R5, незалежно один від одного, являють собою H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл, OH, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл, O-CO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл;

R6, R7, R8, R9 являють собою H;

n має значення 1;

m має значення 1;

A, B, D, G: B являє собою N, C(R42); і A, D, G являють собою C(R42);

R42 являє собою H, F, Cl, Br, CF<sub>3</sub>, CN, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл, SO<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, CON(R45)(R46), N(R47)CO(R48), CO(R51), -(CR<sub>84</sub>R<sub>85</sub>)<sub>x</sub>-O(R86);

R45, R46, R47, незалежно один від одного, являють собою H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)алкіл;

або

R45 і R46, незалежно один від одного, необов'язково разом з атомом азоту, з яким вони зв'язані, утворюють 5-6-членне кільце, яке, крім атома азоту, може також містити 0-1 додатковий гетероатом, вибраний з групи, що включає N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл, кисень і сірку;

R48, R51, незалежно один від одного, являють собою H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)алкіл;

R84, R85 являють собою H;

R86 являє собою H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл;

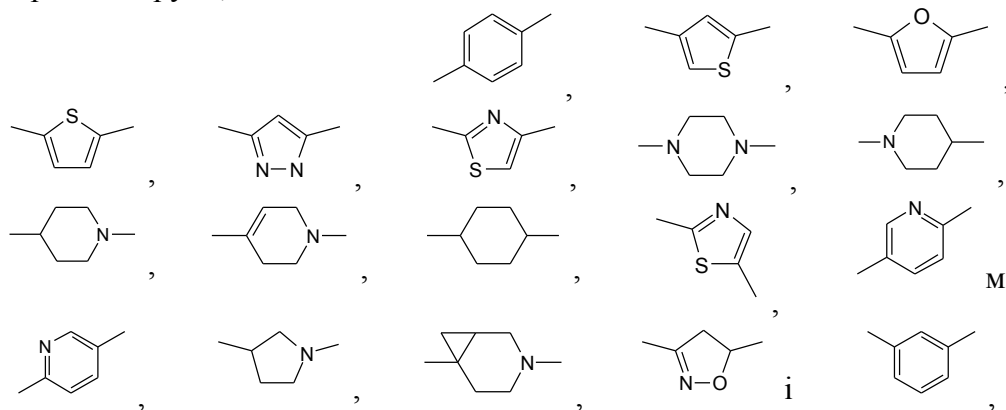
x має значення 0, 1;

R10 являє собою H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)алкіл;

X являє собою N(R52), зв'язок, C=C, C(R53)(R54), CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>;

R52, R53, R54, незалежно один від одного, являють собою H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)алкіл;

E вибраний з групи, що включає:



які можуть необов'язково містити замісники, вибрані з групи, що включає H, F, Cl, Br, OH, CF<sub>3</sub>, NO<sub>2</sub>, OCF<sub>3</sub>, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)алкеніл, N(R57)(R58), SO<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, CO(R65);

R57, R58, незалежно один від одного, являють собою H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)алкіл;

R65, незалежно один від одного, являють собою H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)алкіл;

K являє собою зв'язок, O, OCH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>O, N(R66), CON(R68), (C(R69)(R70))<sub>v</sub>, CO, C≡C, SCH<sub>2</sub>;

v має значення 1, 2, 3;

R66, R68, R69, R70, незалежно один від одного, являють собою H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)алкіл;

R11 являє собою (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)алкіл, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкіл, 3-10-членне моно-, бі-, три-

або спіроциклічне кільце, яке може містити 0-3 гетероатоми, вибраних з групи, що включає кисень, азот і сірку, де вказана кільцева система може бути додатково заміщена F, Cl, Br, CF<sub>3</sub>, CN, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкілом, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)алкілом, -(C<sub>0</sub>-C<sub>2</sub>)алкіленарилом, оксо, CO(R71), CON(R72)(R73), гідрокси, N(R75)CO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкілом, N(R76)(R77) або SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>;

R71, R72, R73, R75, R76, R77, незалежно один від одного, являють собою H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)алкіл;

або

R72 і R73, R76 і R77, незалежно один від одного, необов'язково разом з атомом азоту, з яким вони зв'язані, утворюють 5-6-членне кільце, яке, крім атома азоту, може також містити 0-1 додатковий гетероатом, вибраний з групи, що включає N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл, кисень і сірку; або

її N-оксиди і фізіологічно прийнятні солі.

3. Сполука формули I за п. 1,

де

R1, R2, незалежно один від одного, являють собою H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)алкіл, -(CR78R79)<sub>o</sub>-R12, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкіл, CO-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)алкіл, -CO-(CH<sub>2</sub>)<sub>o</sub>-R12, O(C(R15)(R16))<sub>q</sub>N(R17)(R18);

або R1 і R2 утворюють разом з атомом азоту, з яким вони зв'язані, 4-10-членне моно- або біциклічне кільце, яке, крім атома азоту, може містити 0-2 додаткових гетероатомів, вибраних з групи, що включає кисень і азот, де гетероциклічна кільцева система може бути додатково заміщена F, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкілом, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкілом, оксо, CO(R26), гідрокси, N(R31)(R32);

о має значення 0, 1, 2, 3;

q має значення 1 або 2;

R15, R16, R17, R26, R31, R32, незалежно один від одного, являють собою H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл;

R18 являє собою H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл;

або

R17 і R18, R21 і R22, R27 і R28, R31 і R32, незалежно один від одного, необов'язково разом з атомом азоту, з яким вони зв'язані, утворюють 5-6-членне кільце, вибране з піролідину, піперидину, N-метилпіперазину, морфоліну;

R12 являє собою OH, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл, 3-10-членне моно- або біциклічне кільце, яке може містити 1-2 гетероатоми, вибраних з групи, що включає N, O і S, і вказане 3-10-членне кільце може містити додаткові замісники, такі як F, OH, оксо, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл, CO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл;

R78, R79, незалежно один від одного, являють собою H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)алкіл, гідрокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкіл, OH, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкіл;

R3 являє собою H;

R4, R5, незалежно один від одного, являють собою H, OH, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл;

R6, R7, R8, R9, являють собою H;

n має значення 1;

m має значення 1;

A, B, D, G являють собою C(R42);

R42 являє собою H, F, Cl, CF<sub>3</sub>, CN, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл, -(CR84R85)<sub>x</sub>-O(R86);

R84, R85 являють собою H;

R86 являє собою H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл;

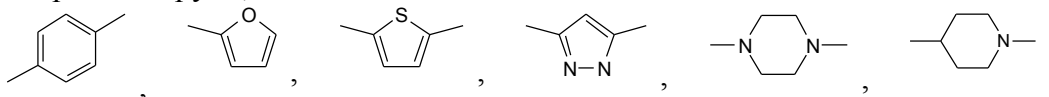
x має значення 0, 1, 2; переважно, 0, 1; особливо переважно 1;

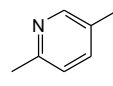
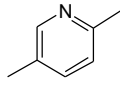
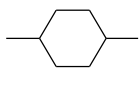
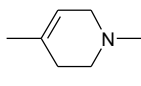
R10 являє собою H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)алкіл;

X являє собою зв'язок, C=C, C(R53)(R54), CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>;

R53, R54, незалежно один від одного, являють собою H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)алкіл;

E вибраний з групи, що включає:





які можуть необов'язково містити замісники, вибрані з групи, що включає H, F, Cl, Br, OH, CF<sub>3</sub>, NO<sub>2</sub>, OCF<sub>3</sub>, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)алкеніл, N(R57)(R58), SO<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, CO(R65);

R57, R58, незалежно один від одного, являють собою H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)алкіл;

R65, незалежно один від одного, являють собою H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)алкіл;

K являє собою зв'язок, O, OCH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>O, CON(R68), (C(R69)(R70))<sub>v</sub>, C≡C;

v має значення 1, 2;

R68, R69, R70, незалежно один від одного, являють собою H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)алкіл;

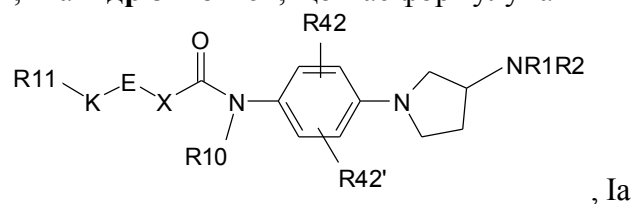
R11 являє собою (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)алкіл, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкіл, 3-10-членне моно- або біциклічне кільце, яке може містити 0-2 гетероатоми, вибраних з групи, що включає кисень, азот і сірку, де вказана кільцева система може бути додатково заміщена F, Cl, Br, CF<sub>3</sub>, CN, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкілом, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)алкілом, оксо, CO(R71), CON(R72)(R73), N(R75)CO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкілом або SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>;

R71, R72, R75, незалежно один від одного, являють собою H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)алкіл;

або

R72 і R73, незалежно один від одного, необов'язково разом з атомом азоту, з яким вони зв'язані, утворюють 5-6-членне кільце, яке, крім атома азоту, може також містити 0-1 додатковий гетероатом, вибраний з групи, що включає N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл, кисень і сірку; або її N-оксиди і фізіологічно прийнятні солі.

4. Сполука за п. 1, яка **відрізняється**, що має формулу Ia



, Ia

R1, R2, незалежно один від одного, являють собою H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)алкіл, -(CR78R79)<sub>o</sub>-R12, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкіл, або R1 і R2 утворюють разом з атомом азоту, з яким вони зв'язані, 4-10-членне моно-, бі- або спіроциклічне кільце, яке, крім атома азоту, може містити 0-2 додаткових гетероатоми, вибраних з групи, що включає кисень, азот і сірку, де гетероциклічна кільцева система може бути додатково заміщена F, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкілом, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкілом, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкілом, гідрокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкілом, (C<sub>0</sub>-C<sub>2</sub>)алкіленарилом, оксо, CO(R26), CON(R27)(R28), гідрокси, N(R31)(R32) або SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>;

де R1 і R2 обидва не є CO(R26);

o має значення 0, 1, 2, 3, 4;

q має значення 1, 2, 3;

s має значення 0, 1, 2;

R15, R16, R17, R18, R23, R24, R25, R26, R27, R28, R31, R32, незалежно один від одного, являють собою H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл;

або

R17 і R18, R27 і R28, R31 і R32, незалежно один від одного, необов'язково разом з атомом азоту, з яким вони зв'язані, утворюють 5-6-членне кільце, яке, крім атома азоту, може також містити 0-1 додатковий гетероатом, вибраний з групи, що включає N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл, кисень і сірку;

R12 являє собою OH, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл, O(C<sub>0</sub>-C<sub>2</sub>)алкіленарил, CN, S-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл, 3-12-членне моно-, бі- або спіроциклічне кільце, яке може містити 1-3 гетероатоми, вибраних з групи, що включає N, O і S, і вказане 3-12-членне кільце може містити додаткові замісники, такі як F, OH, CF<sub>3</sub>, CN, оксо, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл, (C<sub>0</sub>-C<sub>2</sub>)алкіленарил, N(R34)(R35), COO(R40), CO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл;

R34, R35, незалежно один від одного, являють собою H, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкіл;

R40 являє собою H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл, (C<sub>0</sub>-C<sub>2</sub>)алкіленарил;

R78, R79, незалежно один від одного, являють собою H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)алкіл, гідроксі-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкіл, OH, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкіл;

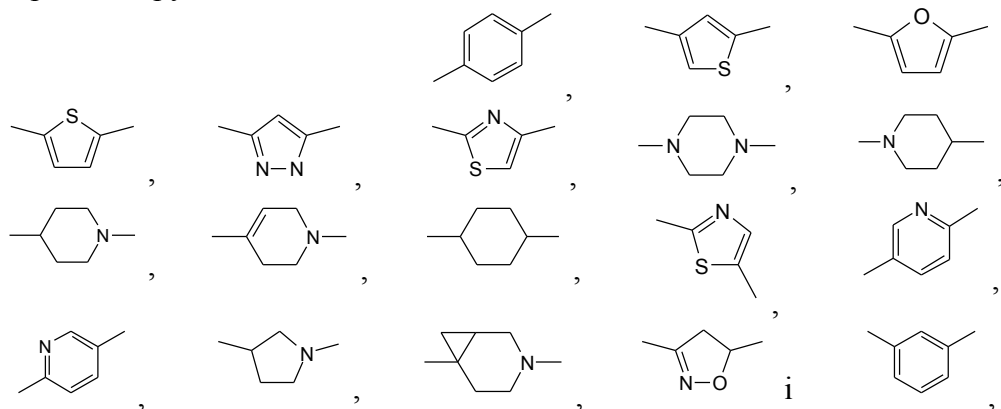
R42, R42', незалежно один від одного, являють собою H, F, Cl, Br, CF<sub>3</sub>, CN, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл;

R10 являє собою H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)алкіл;

X являє собою N(R52), зв'язок, C-C, C(R53)(R54), CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>;

R52, R53, R54, незалежно один від одного, являють собою H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)алкіл;

E вибраний з групи, що включає:



які можуть необов'язково містити замісники, вибрані з групи, що включає H, F, Cl, Br, OH, CF<sub>3</sub>, NO<sub>2</sub>, OCF<sub>3</sub>, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)алкеніл, N(R57)(R58), SO<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, CO(R65);

R57, R58, незалежно один від одного, являють собою H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)алкіл;

R65 являють собою H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)алкіл;

K являє собою зв'язок, O, OCH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>O, S, SO<sub>2</sub>, N(R66), N(R67)CO, CON(R68), (C(R69)(R70))<sub>v</sub>, CO, C≡C, SCH<sub>2</sub>, SO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>;

v має значення 1, 2, 3;

R66, R67, R68, R69, R70, незалежно один від одного, являють собою H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)алкіл;

R11 являє собою (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)алкіл, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкіл, 3-10-членне моно-, бі-, три- або спіроциклічне кільце, яке може містити 0-4 гетероатоми, вибраних з групи, що включає кисень, азот і сірку, де вказана кільцева система може бути додатково заміщена F, Cl, Br, CF<sub>3</sub>, CN, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкілом, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)алкілом, оксо, CO(R71), гідрокси, N(P75)CO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкілом або SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>;

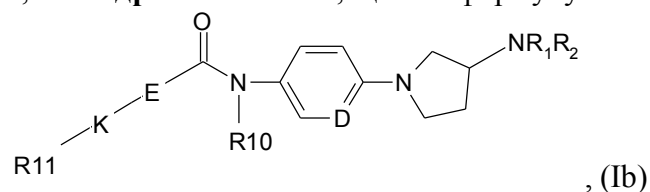
R71, R72, R73, R74, R75, R76, R77, незалежно один від одного, являють собою H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)алкіл;

або

R72 і R73, R76 і R77, незалежно один від одного, необов'язково разом з атомом азоту, з яким вони зв'язані, утворюють 5-6-членне кільце, яке, крім атома азоту, може також містити 0-1 додатковий гетероатом, вибраний з групи, що включає N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл, кисень і сірку; або

її N-оксиди і фізіологічно прийнятні солі.

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



де

R1, R2, незалежно один від одного, являють собою H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)алкіл, -(CR78R79)<sub>o</sub>-R12,

(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкіл, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)алкеніл, CO-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)алкіл, -CO-(CH<sub>2</sub>)<sub>o</sub>-R12, CO-арилокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкіл, COCH-CH(R13), COCC(R14), CO(C(R15)(R16))<sub>q</sub>N(R17)(R18), CO(C(R19)(R20))<sub>t</sub>CON(R21)(R22), CO(C(R23)(R24))<sub>s</sub>O(R25);

або R1 і R2 утворюють разом з атомом азоту, з яким вони зв'язані, 4-10-членне моно-, бі- або спіроциклічне кільце, яке, крім атома азоту, може містити 0-2 додаткових гетероатомів, вибраних з групи, що включає кисень, азот і сірку, де гетероциклічна кільцева система може бути додатково заміщена F, C, CF<sub>3</sub>, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкілом, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкілом, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) алкілом, гідрокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкілом, (C<sub>0</sub>-C<sub>2</sub>)алкіленарилом, оксо, CO(R26), CON(R27)(R28), гідрокси, COO(R29), N(R30)CO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкілом, N(R31)(R32) або SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, де R1 і R2 обидва не є CO(R26);

o має значення 0, 1, 2, 3, 4, 5, 6;

q, г, незалежно один від одного, мають значення 1, 2, 3;

s має значення 0, 1, 2, 3, 4;

R13, R14, незалежно один від одного, являють собою інше фенільне кільце, яке може містити 0-1 атом азоту;

R15, R16, R17, R19, R20, R21, R22, R23, R24, R25, R26, R27, R28, R29, R30, R31, R32, незалежно один від одного, являють собою H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл;

R18 являє собою H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл, CO-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл, CO(R33);

або

R17 і R18, R21 і R22, R27 і R28, R31 і R32, незалежно один від одного, необов'язково разом з атомом азоту, з яким вони зв'язані, утворюють 5-6-членне кільце, яке, крім атома азоту, може також містити 0-1 додатковий гетероатом, вибраний з групи, що включає H-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл, кисень і сірку;

R33 являє собою 5-10-членну ароматичну кільцеву систему, яка може містити додатковий гетероатом, вибраний з групи, що включає азот, кисень і сірку, і може бути заміщена F, Cl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкілом, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)алкілом;

R12 являє собою OH, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл, O(C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)алкіленарил, CN, S-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл, COO(R80), CON(R81)(R82), 3-12-членне моно-, бі- або спіроциклічне кільце, яке може містити один або декілька гетероатомів, вибраних з групи, що включає N, O і S, і вказане 3-12-членне кільце може містити додаткові замісники, такі як F, Cl, Br, OH, CF<sub>3</sub>, CN, оксо, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкіл, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл, O-(C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)алкіленарил, (C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)алкіленарил, N(R34)(R35), COCH=CH(R36), (C(R37)(R38))<sub>t</sub>(R39), CO(C(R37)(R38))<sub>t</sub>(R39), CO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл, COCOO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл, COO(R40), S(O)<sub>u</sub>(R41);

t має значення 0, 1, 2, 3, 4, 5, 6;

u має значення 0, 1, 2;

R34, R35, R37, R38, незалежно один від одного, являють собою H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)алкіл;

або

R34 і R35 необов'язково разом з атомом азоту, з яким вони зв'язані, утворюють 5-6-членне кільце, яке, крім атома азоту, може також містити 0-1 додатковий гетероатом, вибраний з групи, що включає N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл, кисень і сірку, і може необов'язково бути заміщеним 1-2 оксогрупами;

R36, R39, незалежно один від одного, являє собою (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)циклоалкіл, 5-10-членну ароматичну кільцеву систему, яка може містити 0-2 додаткових гетероатомів, вибраних з групи, що включає азот, кисень і сірку, і може бути заміщена F, Cl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкілом, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)алкілом;

R40 являє собою H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)алкіл, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)алкеніл, (C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)алкіленарил;

R41 являє собою (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл, 5-10-членну ароматичну кільцеву систему, яка може містити 0-2 додаткових гетероатомів, вибраних з групи, що включає азот, кисень і сірку, і може бути заміщена F, Cl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкілом, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)алкілом;

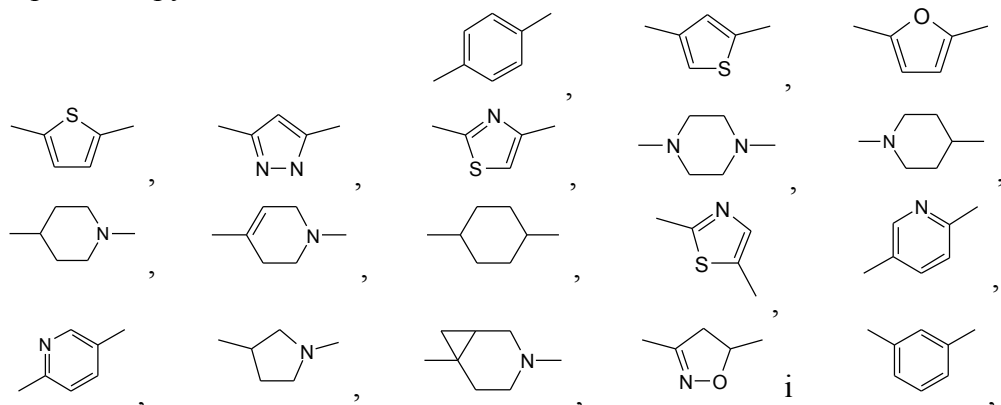
R78, R79, незалежно один від одного, являють собою H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)алкіл, гідрокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкіл, OH, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкіл;



R80, R81, незалежно один від одного, являють собою H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)алкіл;

R10 являє собою H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)алкіл;

E вибраний з групи, що включає:



які можуть необов'язково містити замісники, вибрані з групи, що включає H, F, Cl, Br, OH, CF<sub>3</sub>, NO<sub>2</sub>, OCF<sub>3</sub>, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)алкеніл, N(R57)(R58), SO<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, CO(R65);

R57, R58, незалежно один від одного, являють собою H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)алкіл;

R65, незалежно один від одного, являють собою H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)алкіл, арил;

K являє собою зв'язок, O, OCH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>O, S, SO, SO<sub>2</sub>, N(R66), N(R67)CO, CON(R68), (C(R69)(R70))<sub>v</sub>, CO, OC, C≡C, SCH<sub>2</sub>, SO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>;

v має значення 1, 2, 3, 4;

R66, R67, R68, R69, R70, незалежно один від одного, являють собою H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)алкіл;

R11 являє собою (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)алкіл, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкіл, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)алкеніл, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)алкініл, 3-10-членне моно-, бі-, три- або спіроциклічне кільце, яке може містити 0-4 гетероатоми, вибраних з групи, що включає кисень, азот і сірку, де вказана кільцева система може бути додатково заміщена F, Cl, Br, CF<sub>3</sub>, CN, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкілом, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)алкілом, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкілом, гідрокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкілом, (C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)алкіленарилом, оксо, CO(R71), CON(R73)(R73), гідрокси, COO(R74), N(R75)CO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкілом, N(R76)(R77) або SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>;

R71, R72, R73, R74, R75, R76, R77, незалежно один від одного, являють собою H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)алкіл;

або

R72 і R73, R76 і R77, незалежно один від одного, необов'язково разом з атомом азоту, з яким вони зв'язані, утворюють 5-6-членне кільце, яке, крім атома азоту, може також містити 0-1 додатковий гетероатом, вибраний з групи, що включає N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл, кисень і сірку; або

її N-оксиди і фізіологічно прийнятні солі.

6. Лікарський засіб, що містить одну або декілька сполук за будь-яким з пп. 1-5.

7. Лікарський засіб, що містить одну або декілька сполук за будь-яким з пп. 1-5 і один або декілька анорексично активних інгредієнтів.

8. Сполука формули I за будь-яким з пп. 1-5 для застосування як лікарського засобу для профілактики і лікування ожиріння.

9. Сполука формули I за будь-яким з пп. 1-5 для застосування як лікарського засобу для профілактики і лікування діабету типу II.

10. Сполука формули I за будь-яким з пп. 1-5 в поєднанні з щонайменше одним додатковим анорексично активним інгредієнтом для застосування як лікарського засобу для профілактики і лікування ожиріння.

11. Сполука формули I за будь-яким з пп. 1-5 в поєднанні з щонайменше одним додатковим анорексично активним інгредієнтом для застосування як лікарського засобу для профілактики і лікування діабету типу II.

12. Спосіб одержання лікарського засобу, що включає одну або декілька сполук

формули I за будь-яким з пп. 1-5, який включає змішування активного інгредієнта з фармацевтично прийнятним носієм і перетворення одержаної суміші у форму, придатну для введення.

13. Застосування сполуки формули I за будь-яким з пп. 1-5 для одержання лікарського засобу для зниження маси у ссавців.

14. Застосування сполуки формули I за будь-яким з пп. 1-5 для одержання лікарського засобу для профілактики і лікування ожиріння.

15. Застосування сполуки формули I за будь-яким з пп. 1-5 для одержання лікарського засобу для профілактики і лікування діабету типу II.

16. Застосування сполуки формули I за будь-яким з пп. 1-5 для одержання лікарського засобу для лікування тривожності та інших психіатричних показань, для лікування розладів, пов'язаних з циркадним ритмом, і для лікування зловживання лікарськими засобами.

17. Застосування сполуки формули I за будь-яким з пп. 1-5 для одержання лікарського засобу, що має активність антагоніста МСН-рецептора.