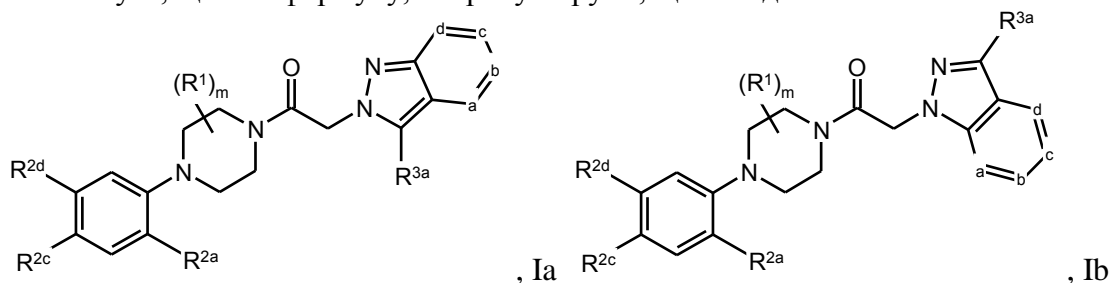


1. Сполука, що має формулу, вибрану з групи, що складається з



або її фармацевтично прийнятна сіль, гідрат або N-оксид,

де

m є цілим числом від 0 до 2 ;

R<sup>1</sup> є C<sub>1-8</sub>-алкіл;

кожен R<sup>2a</sup>, R<sup>2c</sup> і R<sup>2d</sup> незалежно вибирають з групи, що складається з водню, галогену, ціано, -NO<sub>2</sub>, -CO<sub>2</sub>R<sup>c</sup>, -CONR<sup>c</sup>R<sup>d</sup>, -C(O)R<sup>c</sup>, -S(O)R<sup>e</sup>, -S(O)<sub>2</sub>R<sup>e</sup>, -S(O)<sub>3</sub>R<sup>c</sup>, -R<sup>e</sup>, -OR<sup>c</sup>, -SR<sup>c</sup>, -NR<sup>d</sup>C(O)R<sup>c</sup>, -NR<sup>d</sup>C(O)<sub>2</sub>R<sup>c</sup>, -S(O)<sub>2</sub>NR<sup>c</sup>R<sup>d</sup>, -NR<sup>c</sup>-C(O)NR<sup>c</sup>R<sup>d</sup>, -NH-C(NH<sub>2</sub>)=NH, -NR<sup>c</sup>C(NH<sub>2</sub>)=NH, NH-C(CH<sub>2</sub>)=NR<sup>e</sup>, -NH-C(NHR<sup>e</sup>)=NH, -NR<sup>c</sup>C(NHR<sup>e</sup>)=NH, -NR<sup>c</sup>C(NH<sub>2</sub>)=NR<sup>e</sup>, -NH-C(NHR<sup>c</sup>)=NR<sup>e</sup>, -NH-C(NR<sup>e</sup>R<sup>c</sup>)=NH, -NR<sup>c</sup>S(O)<sub>2</sub>R<sup>e</sup>, -OC(O)R<sup>c</sup> і -NR<sup>c</sup>R<sup>d</sup>, де

у кожному з R<sup>2a</sup>, R<sup>2c</sup> і R<sup>2d</sup> кожен R<sup>c</sup> і R<sup>d</sup> незалежно вибирають з водню, C<sub>1-8</sub>-алкілу, C<sub>1-8</sub>-галогеналкілу і C<sub>3-6</sub>-циклоалкілу; і кожен R<sup>e</sup> незалежно вибирають з групи, що складається з C<sub>1-8</sub>-алкілу, C<sub>1-8</sub>-галогеналкілу, C<sub>3-6</sub>-циклоалкілу;

кожну з вершин кільця a, b, c і d у формулах Ia і Ib незалежно вибирають з N і C(R<sup>3a</sup>), і одна-дві вершини кільця є N;

R<sup>3a</sup> незалежно вибирають з групи, що складається з водню, галогену, -OR<sup>f</sup>, -OC(O)R<sup>f</sup>, -NR<sup>f</sup>R<sup>g</sup>, -SR<sup>f</sup>, -R<sup>h</sup>, -CN, -NO<sub>2</sub>, -CO<sub>2</sub>R<sup>f</sup>, -CONR<sup>f</sup>R<sup>g</sup>, -C(O)R<sup>f</sup>, -OC(O)NR<sup>f</sup>R<sup>g</sup>, -NR<sup>g</sup>C(O)R<sup>f</sup>, -NR<sup>g</sup>C(O)<sub>2</sub>R<sup>h</sup>, -NR<sup>f</sup>-C(O)NR<sup>f</sup>R<sup>g</sup>, -NH-C(NH<sub>2</sub>)=NH, -NR<sup>h</sup>C(NH<sub>2</sub>)=NH, -NH-C(NH<sub>2</sub>)=NR<sup>h</sup>, -NH-C(NHR<sup>h</sup>)=NH, -C(=NR<sup>f</sup>)NR<sup>g</sup>R<sup>h</sup>, -S(O)<sub>3</sub>R<sup>f</sup>, -S(O)R<sup>h</sup>, -S(O)<sub>2</sub>R<sup>h</sup>, -S(O)<sub>3</sub>R<sup>h</sup>, -NR<sup>f</sup>S(O)<sub>2</sub>R<sup>h</sup>, -S(O)<sub>2</sub>NR<sup>f</sup>R<sup>g</sup>, -NR<sup>f</sup>S(O)<sub>2</sub>R<sup>h</sup>, -NR<sup>f</sup>S(O)<sub>2</sub>NR<sup>f</sup>R<sup>g</sup>, -N<sub>3</sub>, -C(C=NOR<sup>f</sup>)NR<sup>f</sup>R<sup>g</sup>, -X<sub>3</sub>SO<sub>3</sub>R<sup>f</sup>, -X<sub>3</sub>OR<sup>f</sup>, -X<sub>3</sub>NR<sup>f</sup>R<sup>g</sup>, -Y, -X<sup>3</sup>N<sub>3</sub>, де Y вибирають з групи, що складається з гомопіперидинілу, морфолінілу, тіоморфолінілу, піролідинілу, піперидинілу, азетидинілу, піранілу, тетрагідрофуранілу, піперазинілу, фенілу, тієнілу, фуранілу, піридинілу, піримідинілу, піразинілу, піролілу, піридазинілу, піразолілу, імідазинілу, тіазолілу, оксазолілу, ізоксазолілу, ізотіазолілу, триазолілу, тетразолілу і оксадіазолілу, які необов'язково заміщені 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з галогену, -OR<sup>f</sup>, -NR<sup>f</sup>R<sup>g</sup>, -COR<sup>f</sup>, -CO<sub>2</sub>R<sup>f</sup>, -CONR<sup>f</sup>R<sup>g</sup>, -NO<sub>2</sub>, -R<sup>h</sup> і -CN, де

кожен R і R<sup>g</sup> незалежно вибирають з групи, що складається з водню, C<sub>1-8</sub>-алкілу, C<sub>1-8</sub>-галогеналкілу і C<sub>3-6</sub>-циклоалкілу; і кожен R<sup>h</sup> незалежно вибирають з групи, що складається з C<sub>1-8</sub>-алкілу, C<sub>1-8</sub>-галогеналкілу і C<sub>3-6</sub>-циклоалкілу і де X<sup>3</sup> є C<sub>1-4</sub>-алкілен.

2. Сполука за п. 1, яка **відрізняється** тим, що у формулі Ib, коли R<sup>2a</sup> є H, R<sup>2c</sup> є хлором, R<sup>2d</sup> є метокси, m дорівнює 0, a є N, c є CH або N та b і d є CH, тоді R<sup>3a</sup> не є воднем, метилом, незаміщеним 2-піридилом, незаміщеним 2-піримідинілом або незаміщеним 2-оксазолілом.

3. Сполука за п. 1, яка **відрізняється** тим, що анельоване шестичленне кільце, яке має вершини a, b, c і d, є анельоване кільце піридину, анельоване кільце піримідину або його N-оксид.

4. Сполука за п. 1, яка **відрізняється** тим, що анельоване шестичленне кільце, яке має вершини a, b, c і d, є анельоване кільце піридину або його N-оксид.

5. Сполука за п. 1, яка **відрізняється** тим, що анельоване шестичленне кільце, яке має вершини a, b, c і d, є анельоване піримідинове кільце або його N-оксид.

6. Сполука за п. 1, яка **відрізняється** тим, що анельоване шестичленне кільце, яке має вершини a, b, c і d, є анельоване піразинове кільце або його N-оксид.

7. Сполука за п. 1, яка **відрізняється** тим, що анельоване шестичленне кільце, яке має вершини a, b, c і d, є анельоване піридазинове кільце або його N-оксид.

8. Сполука за п. 1 або 3-7, яка **відрізняється** тим, що кожен замісник  $R^{3a}$  незалежно вибирають з групи, що складається з водню, галогену,  $-OR^f$ ,  $-NR^fR^g$ ,  $-C(O)R^f$ ,  $-C(O)OR^f$ ,  $-S(O)R^f$ ,  $-S(O)_2R^f$ ,  $-S(O)_3R^f$ ,  $-S(O)_3R^h$ ,  $-X^3C(O)_2R^f$ ,  $X^3S(O)_3R^f$ ,  $-S(O)_2NR^fR^g$ ,  $-X^3S(O)_2NR^fR^g$ ,  $-R^h$ ,  $-CN$ ,  $X^3NR^fR^g$ ,  $NR^gC(O)R^f$ ,  $X^3N_3$  і  $Y$ , де  $Y$  є п'яти-шестичлене арильне, п'яти-шестичлене гетероарильне кільце або три-восьмичленне гетероциклоалкільне кільце, вибрані з групи, що складається з гомопіперидинілу, морфолінілу, тіоморфолінілу, піролідинілу, піперидинілу, азетидинілу, піранілу, тетрагідрофуранілу, піперазинілу, фенілу, піридилу, оксазолілу, піримідинілу, оксадіазолілу, імідазолілу, піразолілу, триазолілу і тiazолілу, необов'язково, заміщеного одним-трьома замісниками, вибраними з групи, що складається з галогену,  $-OR^f$ ,  $-NR^fR^g$ ,  $-R^h$ ,  $-CN$ , де кожен  $R^f$  і  $R^g$  незалежно вибирають з водню,  $C_{1-6}$ -алкілу,  $C_{1-6}$ -галогеналкілу і  $C_{3-6}$ -циклоалкілу, і кожен  $R^h$  незалежно вибирають з групи, що складається з  $C_{1-6}$ -алкілу,  $C_{1-6}$ -галогеналкілу і  $C_{3-6}$ -циклоалкілу.

9. Сполука за п. 1, яка **відрізняється** тим, що  $a \in N$ , кожен  $b, c$  і  $d \in C(R^{3a})$ .

10. Сполука за п. 1, яка **відрізняється** тим, що  $a$  і  $c \in N$ , кожен  $b$  і  $d \in C(R^{3a})$ .

11. Сполука за будь-яким з пп. 1, 9 або 10, яка **відрізняється** тим, що  $m$  дорівнює 0-1.

12. Сполука за п. 9, яка **відрізняється** тим, що має формулу Ib.

13. Сполука за п. 10, яка **відрізняється** тим, що має формулу Ib.

14. Сполука за будь-яким з пп. 1, 10 або 11, яка **відрізняється** тим, що одна з вказаних груп  $R^{3a}$  є  $Y$ , де  $Y$  вибраний з групи, що складається з фенілу, піридинілу, піримідинілу, тiazолілу, оксазолілу і оксадіазолілу, кожен з яких, необов'язково, заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з галогену,  $-OR^f$ ,  $-NR^fR^g$ ,  $-COR^f$ ,  $-CO_2R^f$ ,  $-CONR^fR^g$ ,  $-NO_2$ ,  $-R^h$  і  $-CN$ , де кожен  $R^f$  і  $R^g$  незалежно вибирають з групи, що складається з  $H$ ,  $C_{1-8}$ -алкілу,  $C_{3-6}$ -циклоалкілу і  $C_{1-8}$ -галогеналкілу, і кожен  $R^h$  незалежно вибирають з групи, що складається з  $C_{1-8}$ -алкілу,  $C_{3-6}$ -циклоалкілу і  $C_{1-8}$ -галогеналкілу.

15. Сполука за п. 1, яка **відрізняється** тим, що  $m$  дорівнює 0 або 1;  $R^{2a}$  є воднем.

16. Сполука за п. 1, яка **відрізняється** тим, що  $R^{2a}$  вибирають з групи, що складається з водню,  $F$ ,  $Cl$ ,  $Br$  і  $I$ .

17. Сполука за п. 1, яка **відрізняється** тим, що групою  $R^{3a}$  фрагмента біля піразольного кільця є водень, галоген, хлор, фтор, бром, оксазоліл, піридиніл, піримідиніл, оксадіазоліл, тiazоліл,  $-R^h$  або ціано.

18. Сполука за п. 1, яка **відрізняється** тим, що  $R^1$  є метилом; і  $m$  дорівнює 0-2.

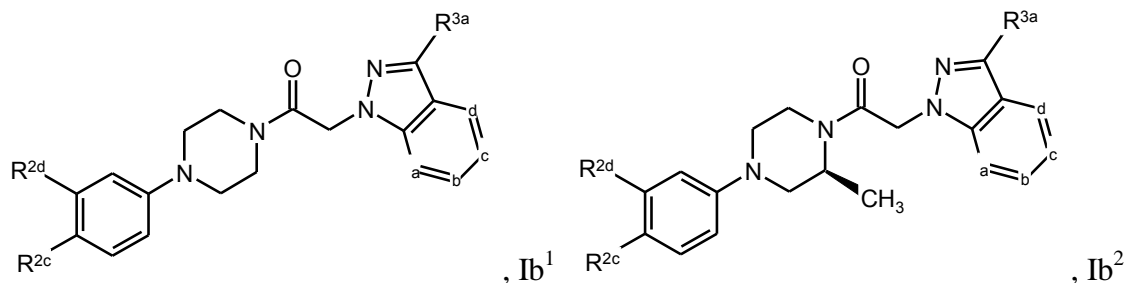
19. Сполука за будь-яким з пп. 1 або 15, яка **відрізняється** тим, що щонайменше один з вказаних замісників  $R^{3a}$  вибирають з групи, що складається з галогену,  $C_{1-4}$ -алкілу і  $C_{1-4}$ -галогеналкілу, де аліфатичні частини, необов'язково, заміщені 1-3 замісниками, вибраними з групи, що складається з  $-OH$ ,  $-OR^o$ ,  $-OC(O)NHR^o$ ,  $-OC(O)N(RO)_2$ ,  $-SH$ ,  $-SR^o$ ,  $-S(O)R^o$ ,  $-S(O)_2R^o$ ,  $-SO_2NH_2$ ,  $-S(O)_2NHR^o$ ,  $-S(O)_2N(RO)_2$ ,  $-NHS(O)_2R^o$ ,  $-NR^oS(O)_2R^o$ ,  $-C(O)NH_2$ ,  $-C(O)NHR^o$ ,  $-C(O)N(R^o)_2$ ,  $-C(O)R^o$ ,  $-NHC(O)R^o$ ,  $-NR^oC(O)R^o$ ,  $-NHC(O)NH_2$ ,  $-NR^oC(O)NH_2$ ,  $-NR^oC(O)NHR^o$ ,  $-NHC(O)NHR^o$ ,  $-NR^oC(O)N(R^o)_2$ ,  $-NHC(O)N(R^o)_2$ ,  $-CO_2H$ ,  $-CO_2R^o$ ,  $-NHCO_2R^o$ ,  $-NR^oCO_2R^o$ ,  $-CN$ ,  $-NO_2$ ,  $-NH_2$ ,  $-NHR^o$ ,  $-N(R^o)_2$ ,  $-NR^oS(O)NH_2$  і  $-NR^oS(O)_2NHR^o$ , де кожен  $R^o$  є, незалежно, незаміщений  $C_{1-6}$ -алкіл.

20. Сполука за будь-яким з пп. 1 або 19, яка **відрізняється** тим, що  $R^{2c}$  вибирають з групи, що складається з  $F$ ,  $Cl$ ,  $Br$ ,  $CN$ ,  $NO_2$ ,  $-CO_2CH_3$ ,  $-C(O)CH_3$  і  $-S(O)_2CH_3$ .

21. Сполука за будь-яким з пп. 1 або 20, яка **відрізняється** тим, що  $R^{2d}$  вибирають з групи, що складається з  $-SR^c-O-X^2-OR^c$ ,  $-X^2-OR^c$ ,  $-OC(O)R^c$ ,  $-NR^cR^d$ ,  $-R^e$  і  $-OR^c$ .

22. Сполука за п. 1, яка **відрізняється** тим, що кожен  $R^{2c}$  і  $R^{2d}$  незалежно вибирають з групи, що складається з водню, галогену  $F$ ,  $Cl$ ,  $Br$ ,  $I$  і  $OR^c$ .

23. Сполука за п. 13, яка **відрізняється** тим, що має формулу, вибрану з групи, що складається з



або її N-оксид, де у вказаних формулах  $R^{2c}$  є галогеном, ціано- або нітрогрупою;  $R^{2d}$  вибирають з числа  $-SR^c$ ,  $-OX^2-OR^c$ ,  $-X^2-OR^c$ ,  $-R^e$ ,  $-OR^c$  і  $-NR^dC(O)R^c$ ; кожну з вершин кільця a, b, c і d незалежно вибирають з числа N і  $C(R^{3a})$ , і одна-дві з вказаних вершин кільця є N; і кожен  $R^{3a}$  незалежно вибирають з групи, що складається з водню, галогену,  $C_{3-6}$ -гетероциклоалкілу,  $-S(O)_2R^h$ ,  $C_{1-6}$ -алкілу,  $C_{1-6}$ -галогеналкілу,  $C_{3-6}$ -циклоалкілу, аміно, морфолінілу, фенілу, піридинілу, піримідинілу, оксазолілу, оксадіазолілу, ізоксазолілу і тіазолілу.

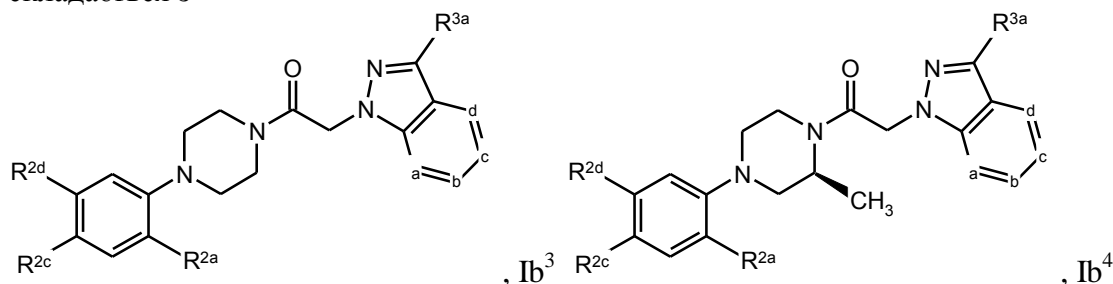
24. Сполука за п. 23, яка **відрізняється** тим, що вершина кільця a є N.

25. Сполука за п. 23, яка **відрізняється** тим, що вершина кільця b є N.

26. Сполука за п. 23, яка **відрізняється** тим, що вершина кільця c є N.

27. Сполука за п. 23, яка **відрізняється** тим, що вершина кільця d є N.

28. Сполука за п. 13, яка **відрізняється** тим, що має формулу, вибрану з групи, що складається з



або її N-оксид; де  $R^{2c}$  є галогеном, ціано- або нітрогрупою;  $R^{2d}$  вибирають з числа  $-SR^c$ ,  $-OX^2-OR^c$ ,  $-X^2-OR^c$ ,  $-R^e$ ,  $-OR^c$ ,  $-NR^dR^d$ ,  $-NR^cS(O)_2R^e$  і  $-NR^dC(O)R^c$ ;  $R^{2a}$  вибирають з групи, що складається з F, Cl, Br, I,  $-CO_2Me$ ,  $-CONH_2$ , CN, оксазолілу,  $-CH_2NH_2$ ,  $-CH_2NHMe$ ,  $-CH_2NMe_2$  і  $-CH=N-OH$ ; кожну з вершин кільця a, b, c і d незалежно вибирають з числа N і  $C(R^{3a})$ , і одна-дві з вказаних вершин кільця є N; і кожен  $R^{3a}$  незалежно вибирають з групи, що складається з водню, галогену,  $C_{1-6}$ -алкілу,  $C_{1-6}$ -галогеналкілу,  $C_{3-6}$ -циклоалкілу,  $-S(O)_2R^h$ , аміно, морфолінілу, фенілу, піридинілу, піримідинілу, оксадіазолілу, оксазолілу, ізоксазолілу і тіазолілу.

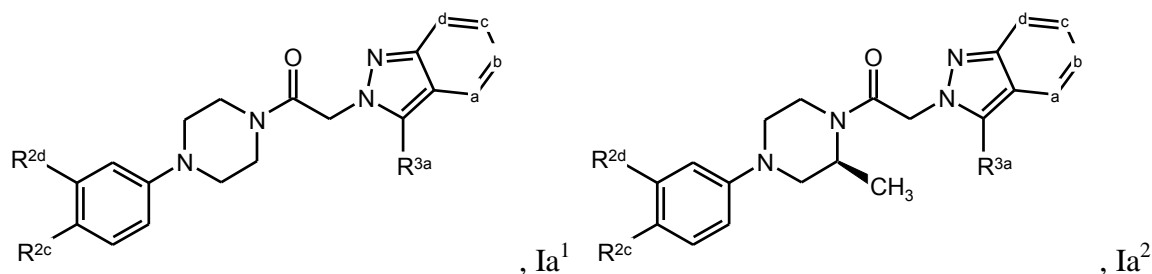
29. Сполука за п. 28, яка **відрізняється** тим, що вершина кільця a є N.

30. Сполука за п. 28, яка **відрізняється** тим, що вершина кільця b є N.

31. Сполука за п. 28, яка **відрізняється** тим, що вершина кільця c є N.

32. Сполука за п. 28, яка **відрізняється** тим, що вершина кільця d є N.

33. Сполука за п. 12, яка **відрізняється** тим, що має формулу, вибрану з групи, що складається з



або її N-оксид; де у вказаних формулах  $R^{2c}$  є галогеном, ціано- або нітрогрупою;  $R^{2d}$

піримідинілу, оксазолілу, оксодіазолілу, ізоксазолілу і тіазолілу.

- складається з



тіазолілу.

42. Сполука за п. 38, яка **відрізняється** тим, що вершина кільця d є N.

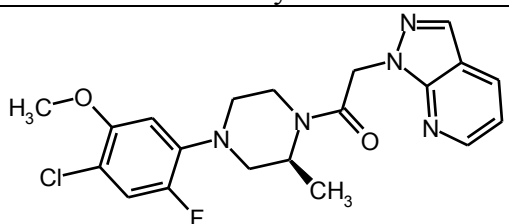
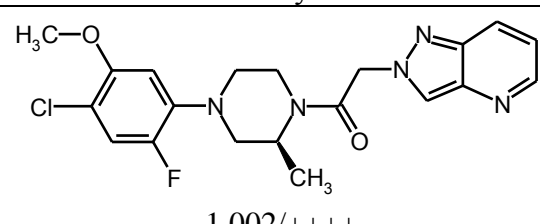
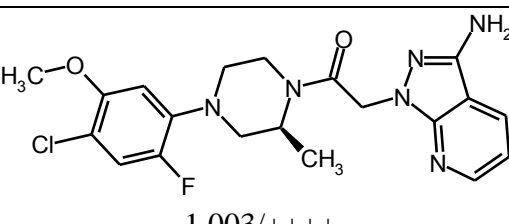
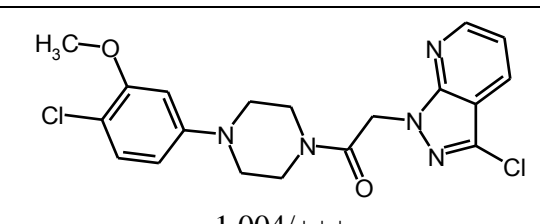
СПОЛУК, ЩО ВКЛЮЧАЄ:

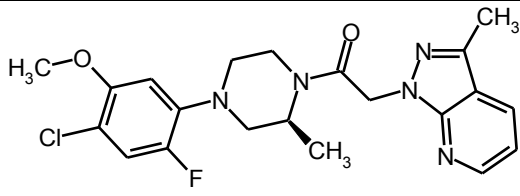
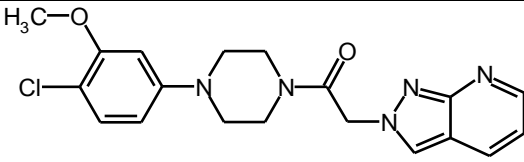
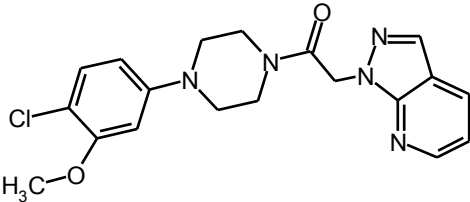
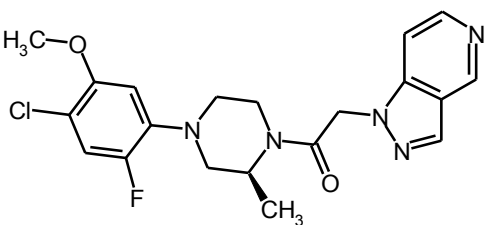
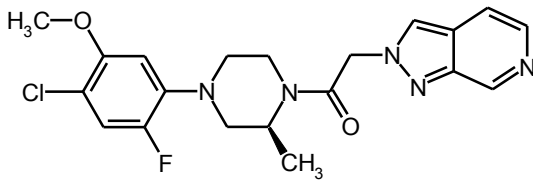
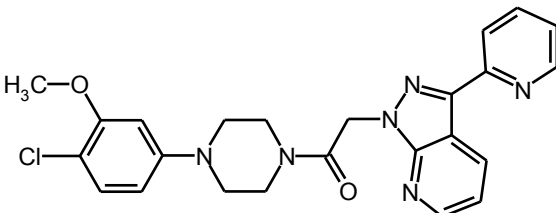
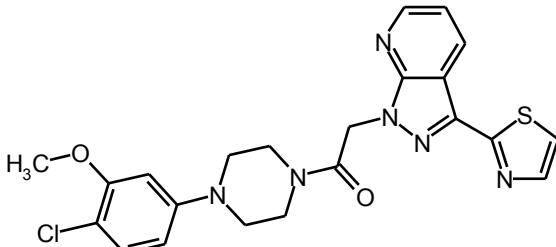
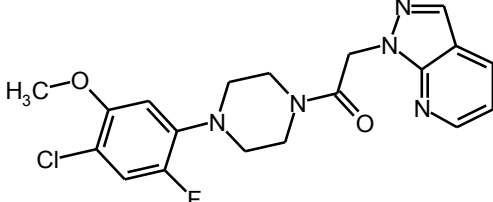
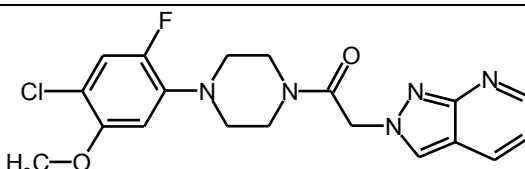
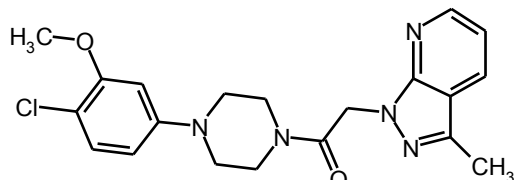
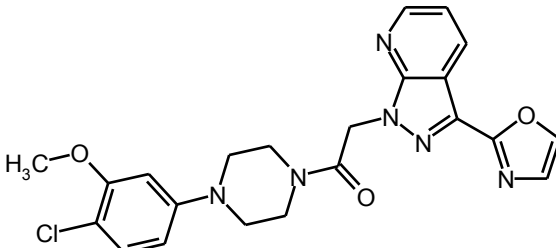
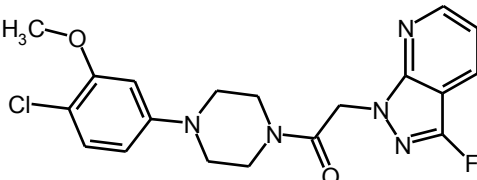
- 1-[4-(4-хлор-2-фтор-5-метоксифеніл)-2-метилпіперазин-1-іл]-2-піразоло[3,4-с]піридин-2-

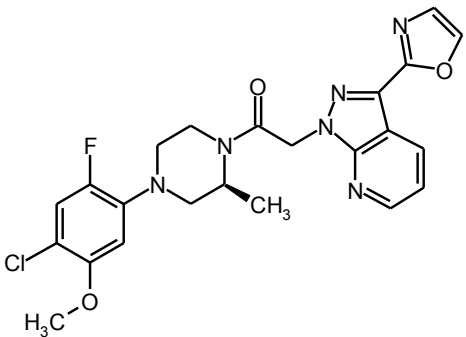
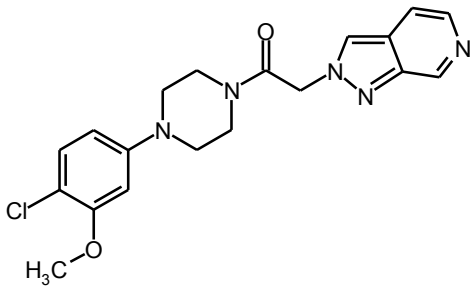
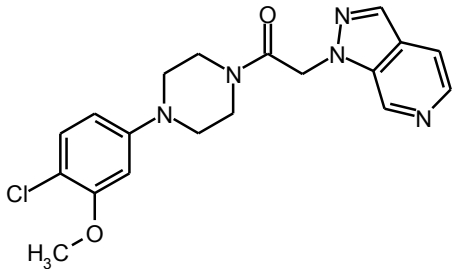
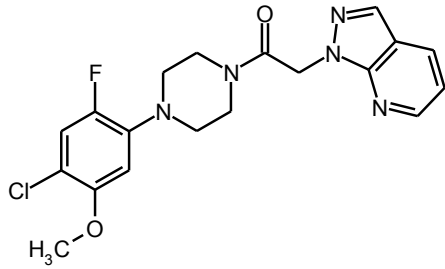
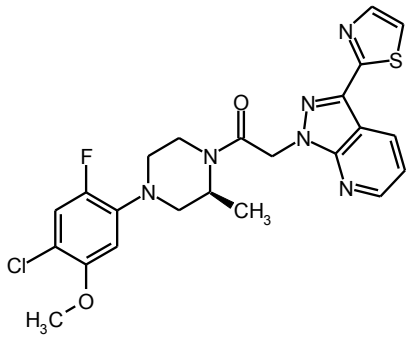
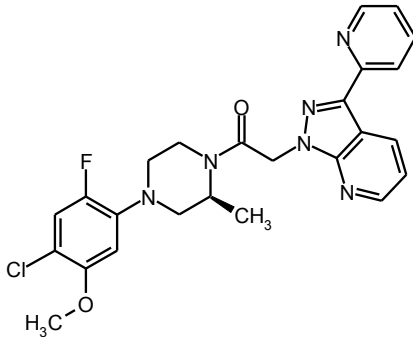
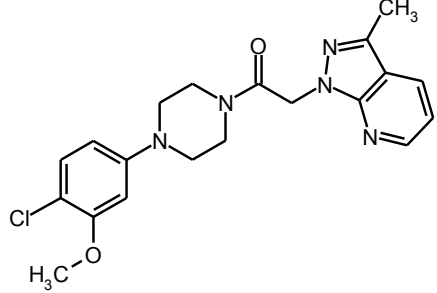
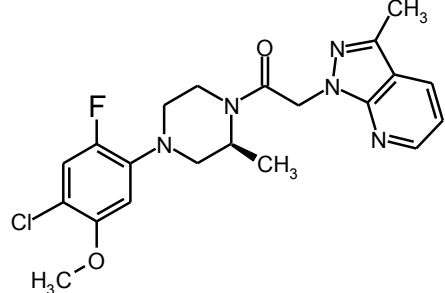
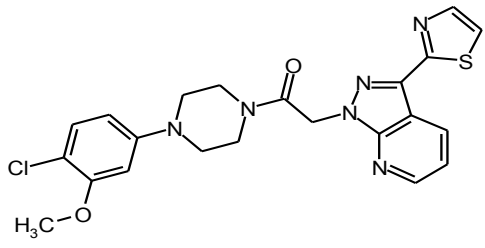
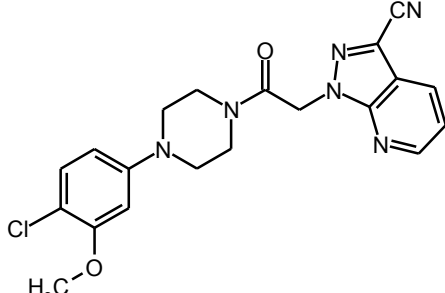


2-(6-азидопіразоло[3,4-b]піридин-1-іл)-1-[4-(4-хлор-3-метоксифеніл)піперазин-1-іл]етанон;  
 2-(6-амінопіразоло[3,4-b]піридин-1-іл)-1-[4-(4-хлор-3-метоксифеніл)піперазин-1-іл]етанон;  
 2-(7-азидопіразоло[3,4-c]піридин-1-іл)-1-[4-(4-хлор-3-метоксифеніл)піперазин-1-іл]етанон;  
 2-(7-амінопіразоло[3,4-c]піридин-1-іл)-1-[4-(4-хлор-3-метоксифеніл)піперазин-1-іл]етанон;  
 1-[4-(4-хлор-3-метоксифеніл)піперазин-1-іл]-2-(3-оксазол-2-ілпіразоло[3,4-b]піридин-2-іл)етанон;  
 2-(5-аміно-3-метилпіразоло[3,4-b]піридин-1-іл)-1-[4-(4-хлор-3-метоксифеніл)піперазин-1-іл]етанон;  
 1-[4-(4-хлор-3-метоксифеніл)піперазин-1-іл]-2-(3-метил-5-нітропіразоло[3,4-b]піридин-1-іл)етанон;  
 2-(3-аміно-6-метилпіразоло[3,4-b]піридин-1-іл)-1-[4-(4-хлор-3-метоксифеніл)піперазин-1-іл]етанон;  
 1-[4-(4-хлор-2-фтор-5-метоксифеніл)-2-метилпіперазин-1-іл]-2-(3-[1,2,4]оксадіазол-3-ілпіразоло[3,4-b]піридин-1-іл)етанон;  
 1-{2-[4-(4-хлоро-3-метоксифеніл)піперазин-1-іл]-2-оксоетил}-N-гідрокси-1H-піразоло[3,4-b]піридин-3-карбоксамідин;  
 1-[4-(4-хлор-3-метоксифеніл)піперазин-1-іл]-2-(3-[1,2,4]оксадіазол-3-ілпіразоло[3,4-b]піридин-1-іл)етанон;  
 1-[4-(4-хлор-3-метоксифеніл)піперазин-1-іл]-2-[3-(5-метил[1,2,4]оксадіазол-3-іл)піразоло[3,4-b]піридин-1-іл]етанон;  
 N-(1-{2-[4-(4-хлор-3-метоксифеніл)піперазин-1-іл]-2-оксоетил}-1H-піразоло[3,4-b]піридин-6-іл)ацетамід;  
 1-[4-(4-хлор-3-метоксифеніл)піперазин-1-іл]-2-(3-метансульфонілпіразоло[3,4-b]піридин-1-іл)етанон;  
 2-(3-амінометилпіразоло[3,4-b]піридин-1-іл)-1-[4-(4-хлор-3-метоксифеніл)піперазин-1-іл]етанон;  
 1-[4-(4-хлор-3-метоксифеніл)піперазин-1-іл]-2-(3-йодпіразоло[3,4-b]піридин-1-іл)етанон;  
 1-[4-(4-хлор-2-фтор-5-метоксифеніл)-2-метилпіперазин-1-іл]-2-(3-йодпіразоло[3,4-b]піридин-1-іл)етанон;  
 1-[4-(4-хлор-2-фтор-5-метоксифеніл)піперазин-1-іл]-2-(3-оксазол-2-ілпіразоло[3,4-b]піридин-1-іл)етанон;  
 або її фармацевтично прийнятна сіль, або N-оксид.

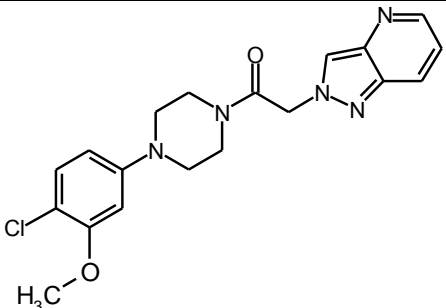
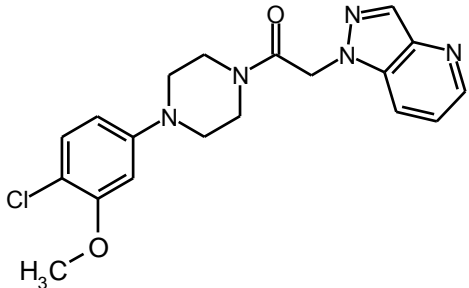
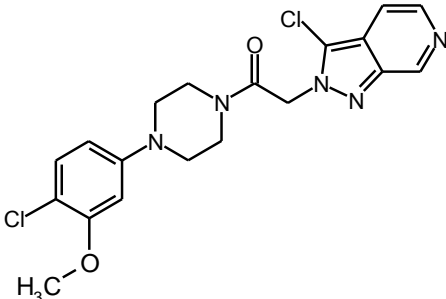
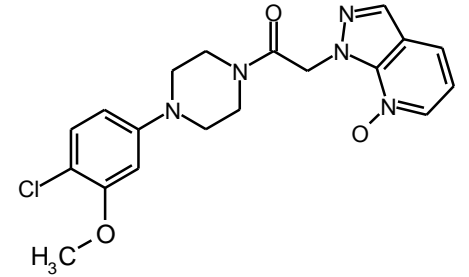
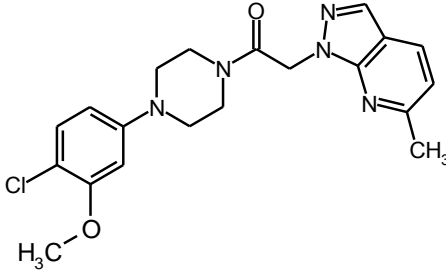
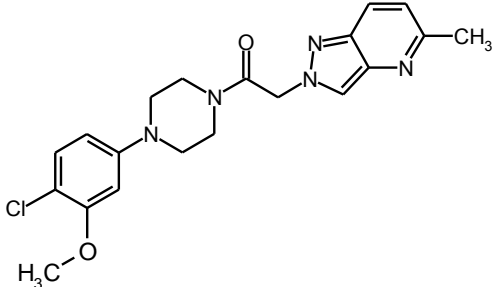
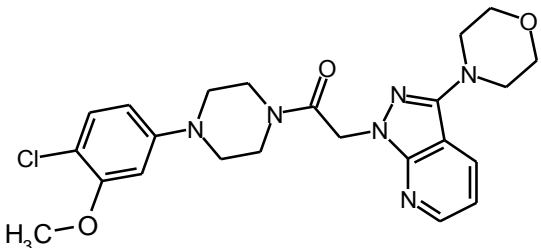
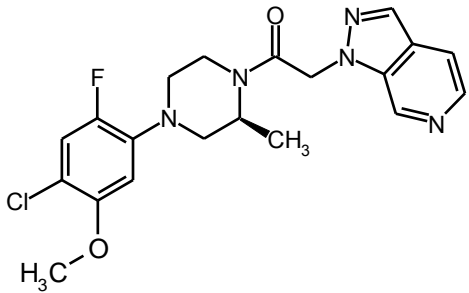
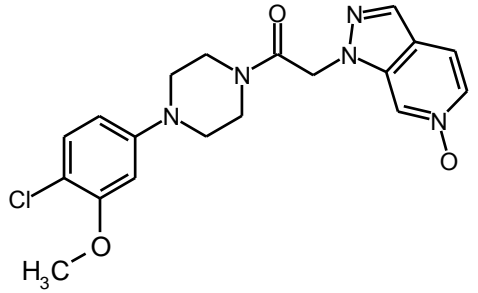
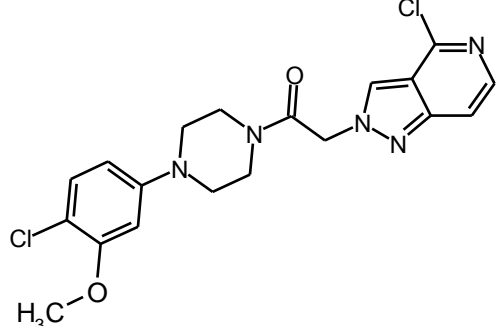
44. Сполука за п. 1, яка **відрізняється** тим, що вказану сполуку вибирають з групи сполук, що включає

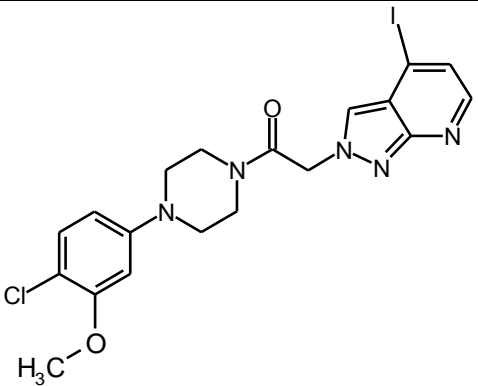
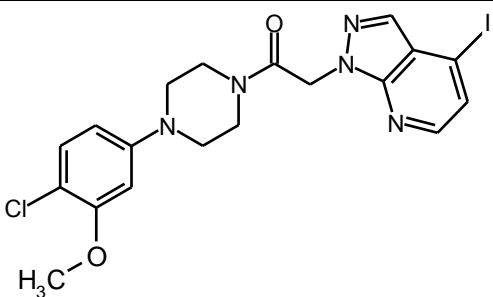
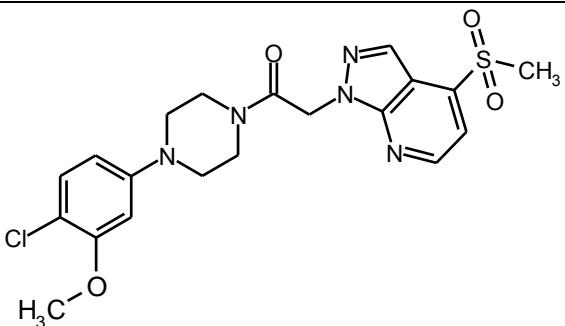
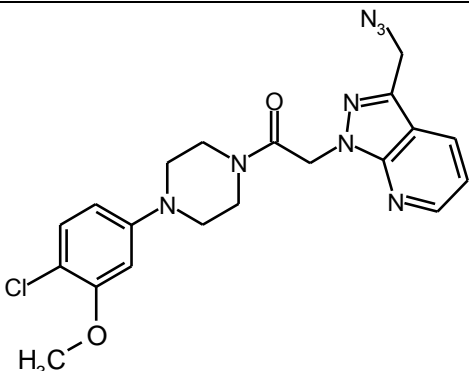
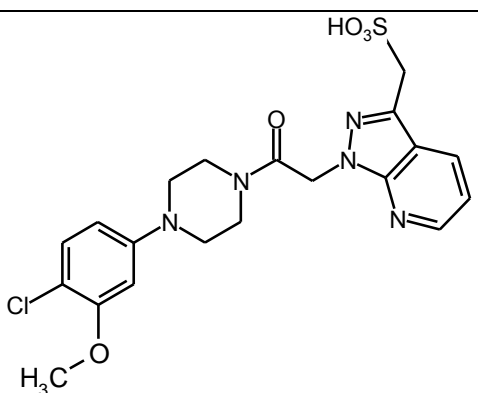
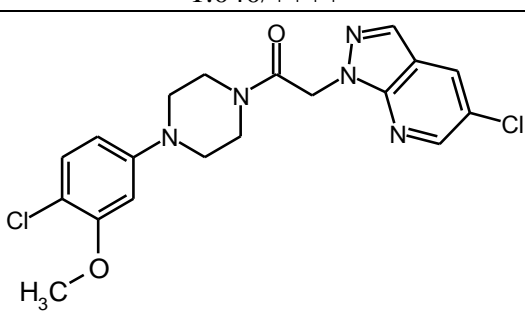
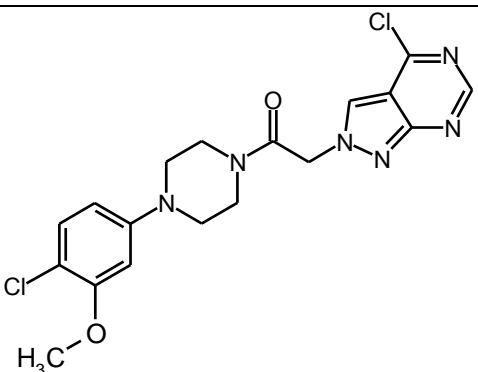
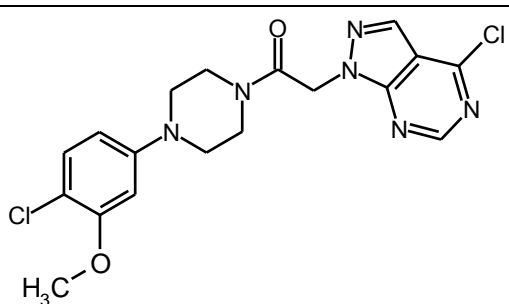
Сполука	Сполука
 <p>1.001/++++</p>	 <p>1.002/++++</p>
 <p>1.003/++++</p>	 <p>1.004/+++</p>

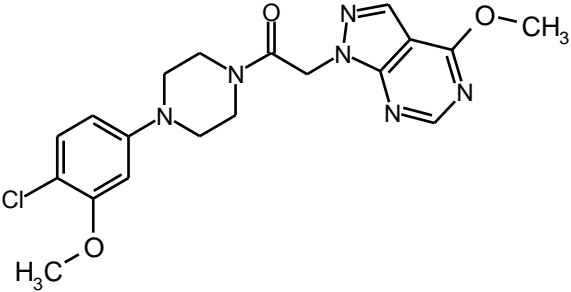
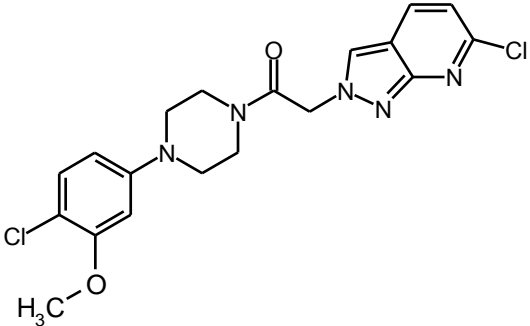
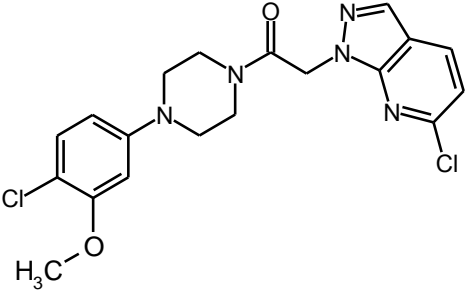
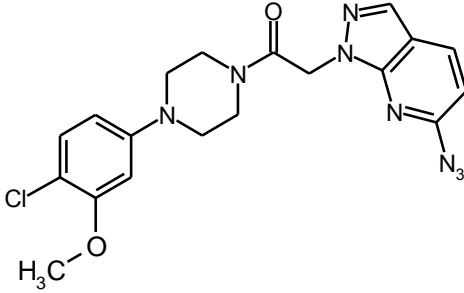
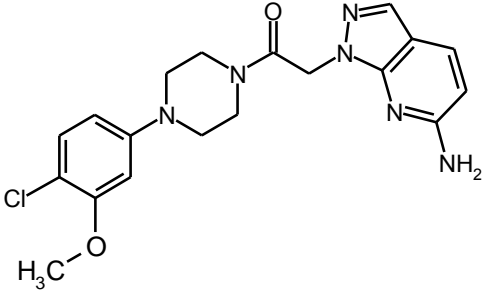
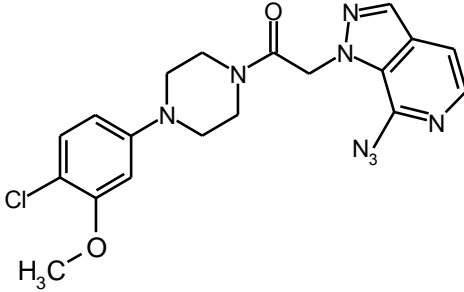
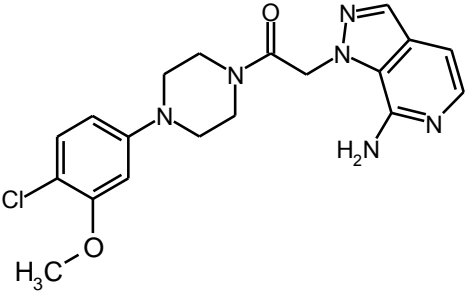
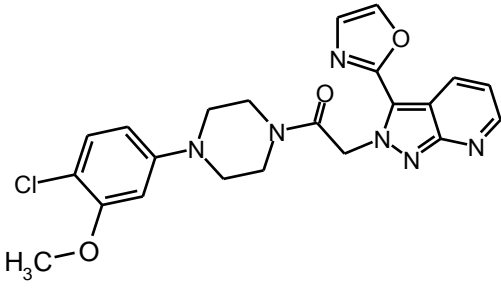
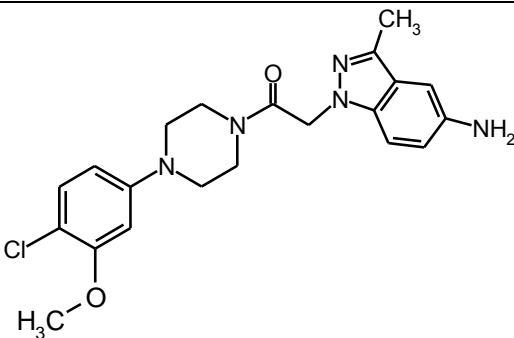
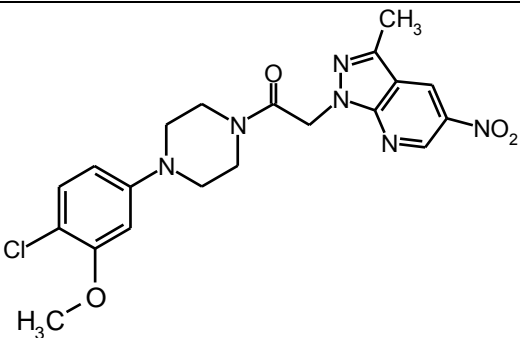
Сполука	Сполука
 <p>1.005/++++</p>	 <p>1.006/++++</p>
 <p>1.007/++++</p>	 <p>1.008/++++</p>
 <p>1.009/++++</p>	 <p>1.010/++++</p>
 <p>1.011/++</p>	 <p>1.012/++++</p>
 <p>1.013/++++</p>	 <p>1.014/+++</p>
 <p>1.015/++++</p>	 <p>1.016/++++</p>

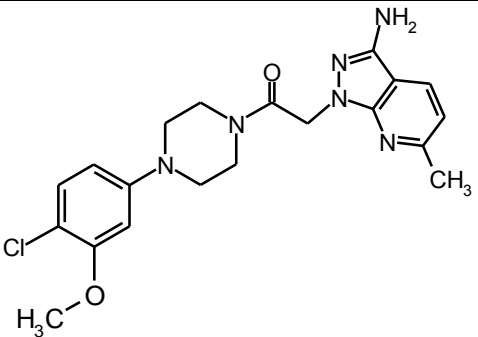
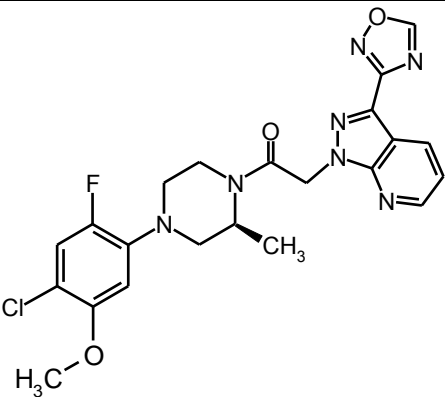
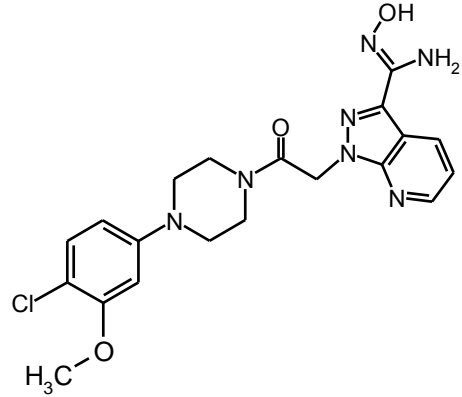
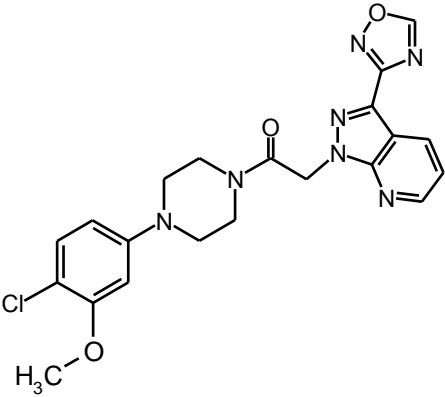
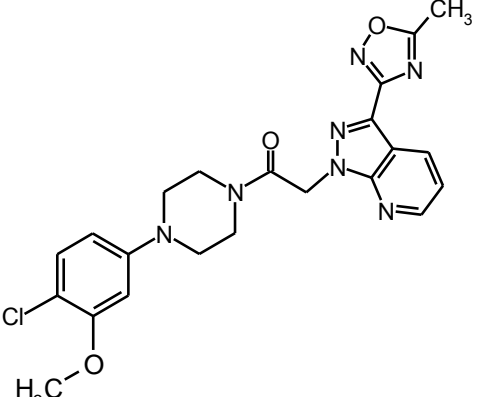
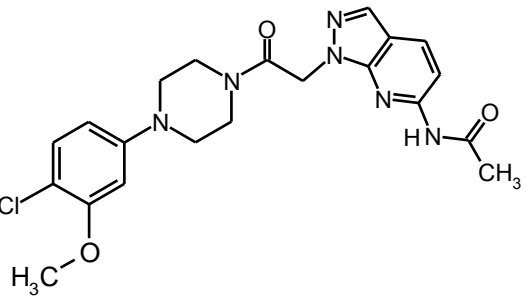
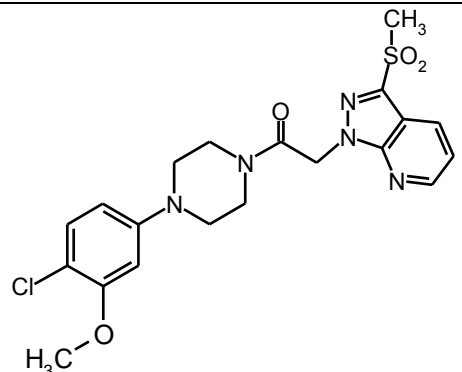
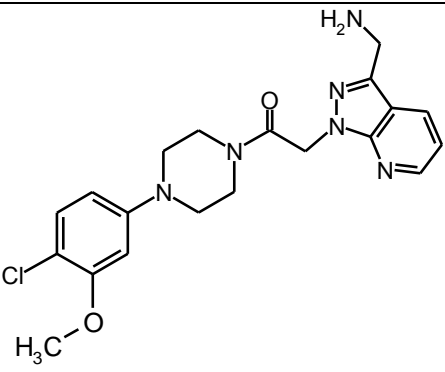
Сполука	Сполука
 <p>1.017/++++</p>	 <p>1.018/++++</p>
 <p>1.019/++++</p>	 <p>1.020/++++</p>
 <p>1.021/++++</p>	 <p>1.022/++++</p>
 <p>1.023/++++</p>	 <p>1.024/++++</p>
 <p>1.025/++++</p>	 <p>1.026/++++</p>

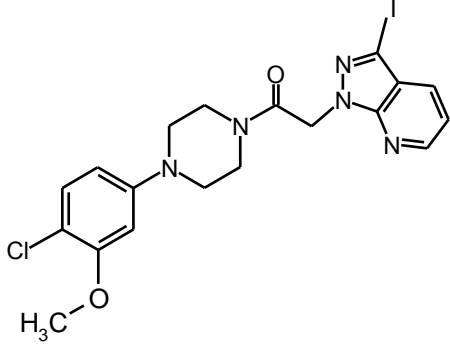
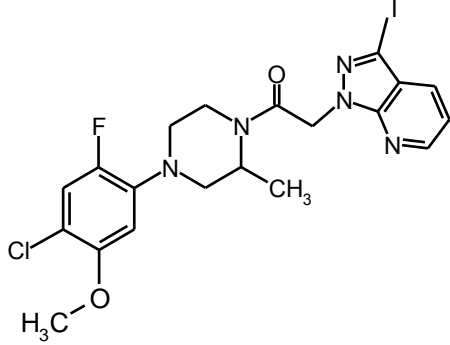


Сполука	Сполука
 <p>1.027/++++</p>	 <p>1.028/++++</p>
 <p>1.029/++++</p>	 <p>1.030/++++</p>
 <p>1.031/++++</p>	 <p>1.032/++++</p>
 <p>1.033/++++</p>	 <p>1.034/++++</p>
 <p>1.035/++++</p>	 <p>1.036/++++</p>

Сполука	Сполука
 <p>1.037/++++</p>	 <p>1.038/++++</p>
 <p>1.039/++++</p>	 <p>1.040/++++</p>
 <p>1.041/+++</p>	 <p>1.042/++++</p>
 <p>1.043/++++</p>	 <p>1.044/++++</p>

Сполука	Сполука
 <p>1.045/++++</p>	 <p>1.046/++++</p>
 <p>1.047/++++</p>	 <p>1.048/++++</p>
 <p>1.049/++++</p>	 <p>1.050/++++</p>
 <p>1.051/++++</p>	 <p>1.052/++++</p>
 <p>1.053/++++</p>	 <p>1.54/++++</p>

Сполука	Сполука
 <p>1.055/++++</p>	 <p>1.056/++++</p>
 <p>1.057/++++</p>	 <p>1.058/++++</p>
 <p>1.059/++++</p>	 <p>1.060/++++</p>
 <p>1.061/++++</p>	 <p>1.062/++++</p>

Сполука	Сполука
 <p>1.063/++++</p>	 <p>1.064/++++</p>

або її фармацевтично прийнятна сіль або N-оксид.

45. Сполука за п. 1, яка **відрізняється** тим, що  $R^{3a}$  вибирають з групи, що складається з водню, галогену,  $OR^f$ ,  $-NR^fR^g$ ,  $-RH$ ,  $-Y$ ,  $-CN$ ,  $X^3N_3$ ,  $SO_2R^h$ ,  $X^3NR^fR^g$ ,  $X^3Y$ ,  $-S(O)_3R^f$ ,  $-C(C=NOR^f)NR^fR^g$ ,  $-NO_2$  і  $NR^gC(O)R^f$ , де  $Y$  є необов'язково заміщеною групою, вибраною з групи, що складається з фенілу, піридинілу, піримідинілу, оксазолілу, тiazолілу, оксадіазолілу і морфолінілу, і  $R^h$  є необов'язково заміщеною групою, вибраною з групи, що складається з  $C_{1-8}$ -алкілу,  $C_{1-8}$ -галогеналкілу і  $C_{3-8}$ -циклоалкілу, і кожен  $R^f$  і  $R^g$  незалежно є необов'язково заміщеною групою, вибраною з групи, що складається з водню,  $C_{1-8}$ -алкілу,  $C_{1-8}$ -галогеналкілу і  $C_{3-8}$ -циклоалкілу.

46. Сполука за п. 45, яка **відрізняється** тим, що  $R^{3a}$  вибирають з групи, що складається з водню, фтору, хлору, бром, йоду, аміно- $CH_3$ , оксазолілу, тiazолілу, піридинілу, піримідинілу, морфолінілу, оксадіазолілу,  $-NHC(O)CH_3$ ,  $-CN$ ,  $-CH_2N_3$ ,  $-CH_2SO_3H$ ,  $-NO_2$ ,  $-(C=NOH)NH_2$ ,  $-S(O)_2CH_3$  і  $CH_2NH_2$ .

47. Сполука за п. 1, яка **відрізняється** тим, що  $R^{2a}$  вибирають з групи, що складається з водню, F, Cl, Br і I.

48. Сполука за п. 1, яка **відрізняється** тим, що кожен  $R^{2c}$  і  $R^{2d}$  незалежно вибирають з групи, що складається з водню, галогену, а саме F, Cl, Br, I і  $OR^c$ .

49. Фармацевтична композиція, яка містить фармацевтично прийнятний ексципієнт або носій і сполуку за п. 1.

50. Фармацевтична композиція за п. 49, яка **відрізняється** тим, що вказану композицію формують у вигляді стента або стентового трансплантаційного пристрою.

51. Спосіб лікування CCR1 опосередкованих захворювань або станів, що включає введення суб'єктові, що потребує цього, терапевтично ефективної кількості сполуки за будь-яким з пп. 1-48 або фармацевтичної композиції за пп. 49, 50.

52. Спосіб за п. 51, який **відрізняється** тим, що вказаним CCR1 опосередкованим захворюванням або станом є запальний стан.

53. Спосіб за п. 51, який **відрізняється** тим, що вказаним CCR1 опосередкованим захворюванням або станом є імунорегуляторне порушення.

54. Спосіб за п. 51, який **відрізняється** тим, що вказане CCR1 опосередковане захворювання або стан вибирають з групи, що складається з ревматоїдного артриту, розсіяного склерозу, відторгнення трансплантата, рестенозу, дерматиту, екземи, кропив'яної лихоманки, васкуліту, запального кишкового захворювання, харчової алергії, астми, хвороби Альцгеймера, хвороби Паркінсона, псоріазу, червоного вовчаку, остеоартриту, інсульту і енцефаломієліту.

55. Спосіб за п. 51, який **відрізняється** тим, що вказаний спосіб введення є пероральним, парентеральним, ректальним, трансдермальним, сублінгвальним, назальним або місцевим.

56. Спосіб за п. 51, який **відрізняється** тим, що вказану сполуку вводять в комбінації з протизапальним агентом, анагетиком, антипроліферативним агентом, інгібітором

метаболізму, інгібітором міграції лейкоцитів або імуномодулятором.