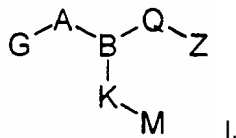


1. Сполука формули I



її проліки та фармацевтично прийнятні солі згаданих сполук та згаданих проліків, де

A є SO₂ або CO;

G - Ar, Ar¹-V-Ar², Ar-(C₁-C₂)алкілен, Ar-CONH-(C₁-C₆)алкілен, R¹R²N, оксі(C₁-C₆)алкілен, аміно, заміщений Ar, або аміно, заміщений Ar(C₁-C₄)алкіленом та R¹¹, де R¹¹ є H або (C₁-C₈)алкіл, R¹ та R² можуть бути взяті окремо і незалежно вибрані з H та (C₁-C₈)алкілу, або R¹ та R², взяті разом з атомом азоту аміногрупи, утворюють п'ятишестичленний азациклоалкіл, причому згаданий азациклоалкіл необов'язково містить атом кисню і необов'язково моно-, ди- або тризаміщений, незалежно, оксо, гідрокси, (C₁-C₄)алкілом, фтором або хлором в кількості до двох;

B є N або CH;

Q - -(C₂-C₆)алкілен-W-(C₁-C₃)алкілен-, де кожний з алкіленів необов'язково має до чотирьох замісників, що незалежно вибрані з фтору або (C₁-C₄)алкілу,

-(C₄-C₈)алкілен-, де згаданий алкілен необов'язково має до чотирьох замісників, що незалежно вибрані з фтору або (C₁-C₄)алкілу,

-X-(C₁-C₅)алкілен-, де згаданий алкілен необов'язково має до чотирьох замісників, що незалежно вибрані з фтору або (C₁-C₄)алкілу,

-(C₁-C₅)алкілен-X-, де згаданий алкілен необов'язково має до чотирьох замісників, що незалежно вибрані з фтору або (C₁-C₄)алкілу,

-(C₁-C₃)алкілен-X-(C₁-C₃)алкілен, де кожний згаданий алкілен необов'язково має до чотирьох замісників, що незалежно вибрані з фтору або (C₁-C₄)алкілу,

-(C₂-C₄)алкілен-W-X-(C₀-C₃)алкілен, де кожний згаданий алкілен необов'язково має до чотирьох замісників, що незалежно вибрані з фтору або (C₁-C₄)алкілу,

-(C₀-C₄)алкілен-X-W-(C₁-C₃)алкілен, де кожний згаданий алкілен необов'язково має до чотирьох замісників, що незалежно вибрані з фтору або (C₁-C₄)алкілу,

-(C₂-C₅)алкілен-W-X-W-(C₁-C₃)алкілен, в якому наявність одного з W не залежить від наявності іншого W, причому згадані алкілени необов'язково мають до чотирьох замісників, що незалежно вибрані з фтору або (C₁-C₄)алкілу,

-(C₁-C₄)алкілен-етенілен(C₁-C₄)алкілен, де кожний згаданий алкілен і згаданий етенілен необов'язково мають до чотирьох замісників, що незалежно вибрані з фтору або (C₁-C₄)алкілу,

-(C₁-C₄)алкілен-етенілен(C₀-C₂)алкілен-X-(C₀-C₅)алкілен, де кожний згаданий алкілен і згаданий етенілен необов'язково мають до чотирьох замісників, що незалежно вибрані з фтору або (C₁-C₄)алкілу,

-(C₁-C₄)алкілен-етенілен(C₀-C₂)алкілен-X-W-(C₁-C₃)алкілен, де кожний згаданий алкілен і згаданий етенілен необов'язково мають до чотирьох замісників, що незалежно вибрані з фтору або (C₁-C₄)алкілу,

-(C₁-C₄)алкілен-етинілен(C₁-C₄)алкілен, де кожний згаданий алкілен і згаданий етинілен необов'язково мають до чотирьох замісників, що незалежно вибрані з фтору або (C₁-C₄)алкілу,

-(C₁-C₄)алкілен-етинілен-X-(C₀-C₃)алкілен, де кожний згаданий алкілен і згаданий етинілен необов'язково мають до чотирьох замісників, що незалежно вибрані з фтору або (C₁-C₄)алкілу;

Z - карбосил, (C₁-C₄)алкоксикарбоніл, тетразоліл, 1,2,4-оксадіазоліл, 5-оксо-1,2,4-оксадіазоліл, (C₁-C₄)алкілсульфонілкарбамоїл або фенілсульфонілкарбамоїл;

K - зв'язок, (C₁-C₉)алкілен, тіо(C₁-C₄)алкілен, (C₁-C₄)алкілентіо(C₁-C₄)алкілен, (C₁-C₄)алкіленоксі(C₁-C₄)алкілен або оксі(C₁-C₄)алкілен, де згаданий (C₁-C₉)алкілен є необов'язково мононенасиченим і де, коли K не є зв'язком, то K необов'язково моно-, ди- або тризаміщений хлором, фтором, гідрокси або метилом;

M є -Ar³, -Ar⁴-V¹-Ar⁵, -Ar⁴-S-Ar⁵, -Ar⁴-SO-Ar⁵, -Ar⁴-SO₂-Ar⁵ або -Ar⁴-O-Ar⁵;

Ar є частково насиченим або повністю ненасиченим п'яти-восьмичленним кільцем, що необов'язково має від одного до чотирьох гетероатомів, незалежно вибраних з кисню, сірки та азоту, або біциклічною кільцевою системою, що складається з двох сконденсованих, незалежно частково насичених, повністю насичених або повністю ненасичених п'яти-шестичленних кілець, взятих незалежно, що необов'язково мають від одного до чотирьох гетероатомів, вибраних незалежно з азоту, сірки та кисню, або трициклічною кільцевою системою, яка складається з трьох сконденсованих, незалежно частково насичених, повністю насичених або повністю ненасичених п'яти- або шестичленних кілець, взятих незалежно, які необов'язково мають від одного до чотирьох гетероатомів, вибраних незалежно з азоту, сірки та кисню, причому згадані частково або повністю насичене кільце, біциклічна кільцева система або трициклічна кільцева система необов'язково мають одну або дві оксогрупи, що заміщені на атомі вуглецю, або одну або дві оксогрупи, що заміщені на сірці; або Ar є повністю насиченим п'яти-семихленним кільцем, що має один або два гетероатоми, незалежно вибрані з кисню, сірки та азоту;

Ar¹ та Ar² є кожний незалежно частково насиченим, повністю насиченим або повністю ненасиченим п'яти-восьмичленним кільцем, що необов'язково має від одного до чотирьох гетероатомів, які незалежно вибрані з кисню, сірки та азоту, або біциклічною кільцевою системою, яка складається з двох сконденсованих, незалежно частково насичених, повністю насичених або повністю ненасичених п'яти-шестичленних кілець, взятих незалежно, які необов'язково мають від одного до чотирьох гетероатомів, вибраних незалежно з азоту, сірки та кисню, або трициклічною кільцевою системою, яка складається з трьох сконденсованих, незалежно частково насичених, повністю насичених або повністю ненасичених п'яти-шестичленних кілець, які необов'язково мають від одного до чотирьох гетероатомів, вибраних незалежно з азоту, сірки та кисню,

причому згадані частково або повністю насичене кільце, біциклічна кільцева система або трициклічна кільцева система необов'язково мають одну або дві оксогрупи, що заміщені на вуглецї, або одну або дві оксогрупи, що заміщені на сірці;

згадані Ar^1 та Ar^2 залишки необов'язково заміщені на вуглецї або азоті на одному кільці, якщо залишок є моноциклічним, на одному або на двох кільцях, якщо залишок є біциклічним, або на одному, двох або трьох кільцях, якщо залишок є трициклічним, замісниками в кількості до трьох на залишок, які незалежно вибрані з R^3 , R^4 та R^5 , де R^3 , R^4 та R^5 є незалежно гідрокси, нітро, гало, карбокси, (C_1-C_7) алкокси, (C_1-C_4) алкоксі (C_1-C_4) алкіл, (C_1-C_4) алкоксикарбоніл, (C_1-C_7) алкіл, (C_2-C_7) алкеніл, (C_2-C_7) алкініл, (C_3-C_7) циклоалкіл, (C_3-C_7) циклоалкіл (C_1-C_4) алкіл, (C_3-C_7) циклоалкіл (C_1-C_4) алканойл, форміл, (C_1-C_8) алканойл, (C_1-C_6) алканойл (C_1-C_6) алкіл, (C_1-C_4) алканойламіно, (C_1-C_4) алкоксикарбоніламіно, гідроксисульфоніл, амінокарбоніламіно або моно-N-, ди-N,N-, ди-N,N'- або три-N,N,N' (C_1-C_4) алкілзаміщений амінокарбоніламіно, сульфонамід, (C_1-C_4) алкілсульфонамід, аміно, моно-N- або ді-N,N- (C_1-C_4) алкіламіно, карбамоїл, моно-N- або ді-N,N- (C_1-C_4) алкілкарбамоїл, ціано, тіол, (C_1-C_6) алкілтіо, (C_1-C_6) алкілсульфініл, (C_1-C_4) алкілсульфоніл або моно-N- або ді-N,N- (C_1-C_4) алкіламіносульфініл;

Ar^3 , Ar^4 та Ar^5 є кожний незалежно частково насиченим, повністю насиченим або повністю ненасиченим п'яти-восьмичленним кільцем, що необов'язково має від одного до чотирьох гетероатомів, які незалежно вибрані з кисню, сірки та азоту, або біциклічною кільцевою системою, яка складається з двох сконденсованих, незалежно частково насичених, повністю насичених або повністю ненасичених п'яти-шестичленних кілець, взятих незалежно, що необов'язково мають від одного до чотирьох гетероатомів, вибраних незалежно з азоту, сірки та кисню, або трициклічною кільцевою системою, яка складається з трьох сконденсованих, незалежно частково насичених, повністю насичених або повністю ненасичених п'яти-шестичленних кілець, які необов'язково мають від одного до чотирьох гетероатомів, вибраних незалежно з азоту, сірки та кисню, причому згадані частково або повністю насичене кільце, біциклічна кільцева система або трициклічна кільцева система необов'язково мають одну або дві оксогрупи, що заміщені на атомі вуглецю, або одну або дві оксогрупи, що заміщені на сірці;

згадані Ar^3 , Ar^4 та Ar^5 залишки необов'язково заміщені на вуглецї або азоті, на одному кільці, якщо залишок є моноциклічним, на одному або на двох кільцях, якщо залишок є біциклічним, або на одному, двох або трьох кільцях, якщо залишок є трициклічним, замісниками, в кількості до трьох на залишок, які вибрані незалежно з R^{31} , R^{41} та R^{51} , де R^{31} , R^{41} та R^{51} - незалежно гідрокси, нітро, гало, карбокси, (C_1-C_7) алкокси, (C_1-C_4) алкоксі (C_1-C_4) алкіл, (C_1-C_4) алкоксикарбоніл, (C_1-C_7) алкіл, (C_2-C_7) алкеніл, (C_2-C_7) алкініл, (C_3-C_7) циклоалкіл, (C_3-C_7) циклоалкіл (C_1-C_4) алкіл, (C_3-C_7) циклоалкіл (C_1-C_4) алканойл, форміл, (C_1-C_8) алканойл, (C_1-C_6) алканойл (C_1-C_6) алкіл, (C_1-C_4) алканойламіно, (C_1-C_4) алкоксикарбоніламіно, гідроксисульфоніл, амінокарбоніламіно або моно-N-, ди-N,N-, ди-N,N'- або три-N,N,N' (C_1-C_4) алкілзаміщений амінокарбоніламіно, сульфонамід, (C_1-C_4) алкілсульфонамід, аміно, моно-N- або ді-N,N- (C_1-C_4) алкіламіно, карбамоїл, моно-N- або ди-N,N- (C_1-C_4) алкілкарбамоїл, ціано, тіол, (C_1-C_6) алкілтіо, (C_1-C_6) алкілсульфініл, (C_1-C_4) алкілсульфоніл або моно-N- або ді-N,N- (C_1-C_4) алкіламіносульфініл;

W - окси, тіо, сульфїно, сульфоніл, аміносульфоніл, моно-N- (C_1-C_4) алкіленаміносульфоніл, сульфоніламіно, -N- (C_1-C_4) алкіленсульфоніламіно, карбоксаїдо, -N- (C_1-C_4) алкіленкарбоксаїдо, карбоксаїдоокси, -N- (C_1-C_4) алкіленкарбоксаїдоокси, карбамоїл, моно-N- (C_1-C_4) алкіленкарбамоїл, карбамоїлокси або -моно-N- (C_1-C_4) алкіленкарбамоїлокси, де згадані W алкільні групи необов'язково заміщені на вуглецї одним-трьома атомами фтору;

X - п'яти- або шестичленне ароматичне кільце, що необов'язково має один або два гетероатоми, вибрані незалежно з кисню, азоту та сірки, згадане кільце необов'язково моно-, ди- або тризаміщене незалежно гало, (C_1-C_3) алкілом, трифторметилом, трифторметилокси, дифторметилокси, гідроксилом, (C_1-C_4) алкокси або карбамоїлом;

якщо R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^{11} , R^{31} , R^{41} та R^{51} містять алкільний, алкіленовий, алкеніленовий або алкініленовий залишки, то вони необов'язково моно-, ди- або тризаміщені на вуглецї незалежно гало або гідрокси; та

V та V^1 кожний незалежно - зв'язок, тіо (C_1-C_4) алкілен, (C_1-C_4) алкілентіо, (C_1-C_4) алкіленокси, оксі (C_1-C_4) алкілен або (C_1-C_3) алкілен, що необов'язково моно- або дизаміщені незалежно гідрокси або фтором;

за умови:

a) якщо K - (C_2-C_4) алкілен, а M - Ar^3 і Ar^3 - циклопент-1-ил, циклогекс-1-ил, циклогепт-1-ил або циклоокт-1-ил, то згадані (C_5-C_8) циклоалкільні замісники не заміщені в першому положенні гідроксигрупою; та

b) якщо K - зв'язок; G - феніл, фенілметил, заміщений феніл або заміщений фенілметил; Q - (C_3-C_8) алкілен; а M є Ar^3 або Ar^4 - Ar^5 , то A - сульфоніл.

2. Сполука згідно з пунктом 1, її пролікарська форма або фармацевтично прийнятна сіль згаданої сполуки або згаданої пролікарської форми, де B є N; Z - карбоксил, (C_1-C_6) алкоксикарбоніл або тетразоліл; Ar - феніл, фурил, тієніл, піроліл, оксазоліл, тіазоліл, імідазоліл, піразоліл, ізоксазоліл, ізотіазоліл, піридил, піридазиніл, піримідиніл, піразиніл, 2H-піроліл, 3H-піроліл, піроліл, 2-піролініл, 3-піролініл, піролідиніл, 1,3-діоксоланіл, 2H-імідазоліл, 2-імідазолініл, імідазолідиніл, 2-піразолініл, піразолідиніл, 1,2,3-оксадіазоліл, 1,2,4-оксадіазоліл, 1,2,5-оксадіазоліл, 1,3,4-оксадіазоліл, 1,2,3-тріазоліл, 1,2,4-тріазоліл, 2H-піраніл, 4H-піраніл, піридил, піперидиніл, 1,4-діоксаніл, морфолініл, 1,4-дитаніл, тіоморфолініл, піперазиніл, 1,3,5-тріазиніл, 1,2,4-тріазиніл, азепініл, оксепініл, тіспініл, циклопентеніл, циклогексеніл, бензо[b]тієніл, бензоксазоліл, бензімідазоліл, бензтіазоліл, хінолініл, ізохінолініл, фталазиніл, хіназолініл, хіноксалініл, нафтил, тетралініл, декалініл, 2H-1-бензопіраніл та 1,4-бензодіоксан; Ar^1 , Ar^2 , Ar^3 , Ar^4 та Ar^5 - кожний незалежно циклопентил, циклогексил, циклогептил, циклооктил, феніл, фурил, тієніл, піроліл, оксазоліл, тіазоліл, імідазоліл, піразоліл, ізоксазоліл, ізотіазоліл, піридил, піридазиніл, піримідиніл, піразиніл, 2H-піроліл, 3H-піроліл, піроліл, 2-піролініл, 3-піролініл, піролідиніл, 1,3-діоксоланіл, 2H-імідазоліл, 2-імідазолініл, імідазолідиніл, 2-піразолініл, піразолідиніл, 1,2,3-оксадіазоліл, 1,2,4-оксадіазоліл, 1,2,5-оксадіазоліл, 1,3,4-оксадіазоліл, 1,2,3-тріазоліл, 1,2,4-тріазоліл, 2H-піраніл, 4H-піраніл, піридил, піперидиніл, 1,4-діоксаніл, морфолініл, 1,4-дитаніл,

тіоморфолініл, піперазиніл, 1,3,5-триазиніл, 1,2,4-триазиніл, азецініл, оксепініл, тісепініл, 1,2,4-діазепініл, циклопентеніл, циклогексеніл, циклогептеніл, циклооктеніл, циклооктадієніл, індолізиніл, індоліл, ізоіндоліл, 3H-індоліл, 1H-ізоіндоліл, індолініл, циклопента(b)піридиніл, пірано(3,4-b)піроліл, бензофурил, ізобензофурил, бензо(b)тієніл, бензо(c)тієніл, 1H-індазоліл, індоксазиніл, бензоксазоліл, антраніліл, бензімідазоліл, бензтіазоліл, пуриніл, 4H-хінолізиніл, хінолініл, ізохінолініл, цинолініл, фталазиніл, хіназолініл, хіноксалініл, 1,8-нафтиридиніл, птеридиніл, інденіл, ізоінденіл, нафтил, тетралініл, декалініл, 2H-1-бензопіраніл, 1,4-бензодіоксаніл, піридо(3,4-b)-піридиніл, піридо(3,2-b)-піридиніл, піридо(4,3-b)-піридиніл, 2H-1,3-бензоксазиніл, 2H-1,4-бензоксазиніл, 1H-2,3-бензоксазиніл, 4H-3,1-бензоксазиніл, 2H-1,2-бензоксазиніл та 4H-1,4-бензоксазиніл; та X - тетрагідрофураніл, феніл, тіазоліл, тієніл, піридил, піразоліл, фураніл або піримідил, де X необов'язково моно-, ди- або тризаміщений незалежно хлором, фтором, метокси, дифторметокси, трифторметокси, трифторметилом або метилом; та де кожна зі згаданих Ag, Ag¹ та Ag² груп необов'язково заміщена на вуглеці або азоті незалежно замісниками, в кількості до трьох, що незалежно вибрані з R³, R⁴ та R⁵; кожна зі згаданих Ag, Ag¹ та Ag² груп необов'язково заміщена незалежно на вуглеці або сірці однією або двома оксогрупами; кожна зі згаданих Ag³, Ag⁴ та Ag⁵ груп необов'язково заміщена на вуглеці або азоті незалежно R³¹, R⁴¹ та R⁵¹ групами, в кількості до трьох, і кожна зі згаданих Ag³, Ag⁴ та Ag⁵ груп необов'язково заміщена незалежно на вуглеці або сірці однією або двома оксогрупами.

3. Сполука згідно з пунктом 2, її пролікарська форма або фармацевтично прийнятна сіль згаданої сполуки або згаданої пролікарської форми, де A є CO; G - оксі(C₁-C₆) алкілен; Q -

(C₂-C₆)алкілен-O-(C₁-C₃)алкілен-,

(C₄-C₈)алкілен-, де згаданий (C₄-C₈)алкілен- необов'язково заміщений замісниками, в кількості до чотирьох, що незалежно вибрані з фтору або (C₁-C₄)алкілу,

-X-(C₂-C₅)алкілен-,

-(C₁-C₅)алкілен-X-,

-(C₁-C₃)алкілен-X-(C₁-C₃)алкілен-,

-(C₂-C₄)алкілен-O-X-(C₀-C₃)алкілен- або

-(C₀-C₄)алкілен-X-O-(C₁-C₃)алкілен-; та X - феніл, тієніл, фураніл або тіазоліл, де X необов'язково моно-, ди- або тризаміщений хлором, фтором, метокси, дифторметокси, трифторметокси, трифторметилом або метилом.

4. Сполука згідно з пунктом 2, її пролікарська форма або фармацевтично прийнятна сіль згаданої сполуки або згаданої пролікарської форми, де A є CO; G є Ag; Q -

(C₂-C₆)алкілен-O-(C₁-C₃)алкілен-,

(C₄-C₈)алкілен-, де згаданий (C₄-C₈)алкілен- необов'язково заміщений замісниками в кількості до чотирьох, що незалежно вибрані з фтору або (C₁-C₄)алкілу,

-X-(C₂-C₅)алкілен-,

-(C₁-C₅)алкілен-X-,

-(C₁-C₃)алкілен-X-(C₁-C₃)алкілен-,

-(C₂-C₄)алкілен-O-X-(C₀-C₃)алкілен- або

-(C₀-C₄)алкілен-X-O-(C₁-C₃)алкілен-; та X - феніл, тієніл, фураніл або тіазоліл, де X необов'язково моно-, ди- або тризаміщений хлором, фтором, метокси, дифторметокси, трифторметокси, трифторметилом або метилом.

5. Сполука згідно з пунктом 2, її пролікарська форма або фармацевтично прийнятна сіль згаданої сполуки або згаданої пролікарської форми, де A є CO; G - R¹R²N або аміно, заміщений Ag, або аміно, заміщений Ag(C₁-C₄)алкіленом та R¹¹, де R¹¹ є H; Q -

(C₂-C₆)алкілен-O-(C₁-C₃)алкілен-,

(C₄-C₈)алкілен-, де згаданий (C₄-C₈)алкілен- необов'язково заміщений замісниками, в кількості до чотирьох, що незалежно вибрані з фтору або (C₁-C₄)алкілу,

-X-(C₂-C₅)алкілен-,

-(C₁-C₅)алкілен-X-,

-(C₁-C₃)алкілен-X-(C₁-C₃)алкілен-,

-(C₂-C₄)алкілен-O-X-(C₀-C₃)алкілен- або

-(C₀-C₄)алкілен-X-O-(C₁-C₃)алкілен-; та X - феніл, тієніл, фураніл або тіазоліл, де X необов'язково моно-, ди- або тризаміщений хлором, фтором, метокси, дифторметокси, трифторметокси, трифторметилом та метилом; і де R¹ та R² можуть бути взяті окремо і незалежно вибрані з H та (C₁-C₈)алкілу, або R¹ та R², взяті разом, утворюють п'яти- або шестичленний азіациклоалкіл, причому згаданий азіациклоалкіл необов'язково містить атом кисню.

6. Сполука згідно з пунктом 2, її пролікарська форма або фармацевтично прийнятна сіль згаданої сполуки або згаданої пролікарської форми, де A є SO₂; G - R¹R²N або аміно, заміщений Ag та R¹¹; Q -

(C₂-C₆)алкілен-O-(C₁-C₃)алкілен-,

(C₄-C₈)алкілен-, де згаданий (C₄-C₈)алкілен- необов'язково заміщений замісниками, в кількості до чотирьох, що незалежно вибрані з фтору або (C₁-C₄)алкілу,

-X-(C₂-C₅)алкілен-,

-(C₁-C₅)алкілен-X-,

-(C₁-C₃)алкілен-X-(C₁-C₃)алкілен-,

-(C₂-C₄)алкілен-O-X-(C₀-C₃)алкілен- або

-(C₀-C₄)алкілен-X-O-(C₁-C₃)алкілен-; та X - феніл, тієніл, фураніл або тіазоліл, де X необов'язково моно-, ди- або тризаміщений хлором, фтором, метокси, дифторметокси, трифторметокси, трифторметилом або метилом; і

де R^1 та R^2 можуть бути взяті окремо і незалежно вибрані з H та (C_1-C_8) алкілу, або R^1 та R^2 , взяті разом, утворюють п'яти- або шестичленний азациклоалкіл, причому згаданий азациклоалкіл необов'язково містить атом кисню.

7. Сполука згідно з пунктом 2, її пролікарська форма або фармацевтично прийнятна сіль згаданої сполуки або згаданої пролікарської форми, де A є SO_2 ; G - Ar, Ar (C_1-C_2) алкілен або Ar 1 -V-Ar 2 ; Q -

(C_2-C_6) алкілен-O- (C_1-C_3) алкілен-,

(C_4-C_8) алкілен-, де згаданий (C_4-C_8) алкілен- необов'язково заміщений замісниками в кількості до чотирьох, що незалежно вибрані з фтору або (C_1-C_4) алкілу,

-X- (C_2-C_5) алкілен-,

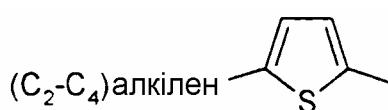
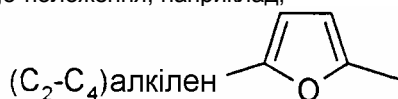
-(C $_1$ -C $_5$)алкілен-X-,

-(C $_1$ -C $_3$)алкілен-X-(C $_1$ -C $_3$)алкілен-,

-(C $_2$ -C $_4$)алкілен-O-X-(C $_1$ -C $_3$)алкілен- або

-(C $_1$ -C $_4$)алкілен-X-O-(C $_1$ -C $_3$)алкілен-; та X - феніл, піримідил, піридил, тієніл, тетрагідрофураніл, фураніл або тіазоліл, де X необов'язково моно-, ди- або тризаміщений хлором, фтором, метокси, дифторметокси, трифторметокси, трифторметилом та метилом.

8. Сполука згідно з пунктом 7, її пролікарська форма або фармацевтично прийнятна сіль згаданої сполуки або згаданої пролікарської форми, де G - Ar або Ar (C_1-C_2) алкілен; Ar - феніл, фурил, тієніл, піроліл, оксазоліл, тіазоліл, імідазоліл, піразоліл, ізоксазоліл, піридил, піридазиніл, піримідиніл, піразиніл, ізотіазоліл, 1,2,3-триазоліл, 1,2,4-триазоліл або 1,3,4-тіадіазоліл, де кожна з згаданих Ar-груп необов'язково заміщена на вуглеці або азоті R^1 , R^2 або R^3 , Ar 4 - цикlopентил, циклогексил, циклогептил, циклооктил, феніл, фурил, тієніл, піроліл, оксазоліл, тіазоліл, імідазоліл, піразоліл, ізоксазоліл, ізотіазоліл, піридил, піридазиніл, піримідиніл, піразиніл, піролідиніл, 1,2,3-триазоліл, 1,2,4-триазоліл, піраніл, тіоморфолініл, піперазиніл, 1,3,5-триазиніл, 1,2,4-триазиніл, 1,2,3-триазиніл, азепініл, оксепініл або тієпініл, де кожна зі згаданих Ar 4 груп необов'язково моно-, ди- або тризаміщена на вуглеці або азоті R^1 , R^4 або R^{51} , Ar 5 - цикlopентил, циклогексил, циклогептил, циклооктил, феніл, фурил, тієніл, піроліл, оксазоліл, тіазоліл, імідазоліл, піразоліл, ізоксазоліл, ізотіазоліл, піридил, піридазиніл, піримідиніл, піразиніл, піролідиніл, 1,2,3-триазоліл, 1,2,4-триазоліл, піраніл, 1,4-діоксаніл, тіоморфолініл, піперазиніл, 1,3,5-триазиніл, 1,2,4-триазиніл, 1,2,3-триазиніл, азепініл, оксепініл або тієпініл, де кожна зі згаданих Ar 5 груп необов'язково моно-, ди- або тризаміщена на вуглеці або азоті R^1 , R^4 або R^{51} ; Q - (C_5-C_7) алкілен, (C_1-C_2) алкілен-X- (C_1-C_2) алкілен, (C_1-C_2) -X-O- (C_1-C_2) алкілен-, (C_2-C_4) алкілентієніл-, (C_2-C_4) алкіленфураніл або (C_2-C_4) алкілентіазоліл; X є феніл, піридил, піримідил або тієніл, а згадані X-групи необов'язково моно-, ди- або тризаміщені хлором, фтором, метокси, дифторметокси, трифторметокси, трифторметилом або метилом; згадані (C_2-C_4) алкіленфураніл- та (C_2-C_4) алкілентієніл мають модель заміщення 2,5-положення, наприклад,



9. Сполука згідно з пунктом 8, її пролікарська форма або фармацевтично прийнятна сіль згаданої сполуки або згаданої пролікарської форми, де K - метилен, M є Ar 4 -Ar 5 , Ar 4 -O-Ar 5 або Ar 4 -S-Ar 5 , а Ar - феніл, піридил, піразоліл, імідазоліл, піримідиніл, тієніл або тіазоліл, де Ar необов'язково моно-, ди- або тризаміщений на вуглеці або азоті R^3 , R^4 або R^5 .

10. Сполука згідно з пунктом 9, її пролікарська форма або фармацевтично прийнятна сіль згаданої сполуки або згаданої пролікарської форми, де M є Ar 4 -Ar 5 ; Ar - феніл, піридил або імідазоліл; Ar 5 - феніл, фураніл або піридил; і Ar 5 - цикlopентил, циклогексил, циклогептил, феніл, піридил, імідазоліл, піримідиніл, тієніл, піридазиніл, піразиніл, імідазоліл, піразоліл або тіазоліл, де Ar, Ar 4 та Ar 5 необов'язково моно-, ди- або тризаміщені на вуглеці або азоті незалежно хлором, фтором, метилом, метокси, дифторметокси, трифторметилом або трифторметокси.

11. Сполука згідно з пунктом 10, її пролікарська форма або фармацевтично прийнятна сіль згаданої сполуки або згаданої пролікарської форми де Q - (C_5-C_7) алкілен.

12. Сполука згідно з пунктом 10, її пролікарська форма або фармацевтично прийнятна сіль згаданої сполуки або згаданої пролікарської форми, де Q є CH_2 -X- CH_2 , а X - метафенілен, що необов'язково моно- або дизаміщений хлором, фтором, метокси, дифторметокси, трифторметокси, трифторметилом або метилом.

13. Сполука згідно з пунктом 12, вибрана з (3-(((піридин-3-сульфоніл)-(4-піримідин-5-ілбензил)аміно)метил)феніл)оцтової кислоти; (3-(((5-фенілфуран-2-ілметил)-(піридин-3-сульфоніл)аміно)метил)феніл)оцтової кислоти; (3-(((піридин-3-сульфоніл)-(4-піримідин-2-ілбензил)аміно)метил)феніл)оцтової кислоти; (3-(((піридин-3-сульфоніл)-(4-тіазол-2-ілбензил)аміно)метил)феніл)оцтової кислоти, та (3-(((4-піразин-2-ілбензил)-(піридин-3-сульфоніл)аміно)метил)феніл)оцтової кислоти.

14. Сполука згідно з пунктом 12, в якій Ar - пірид-3-ил; Z є карбокси; M є Ar 4 -Ar 5 , де Ar 4 - фуранілове кільце, а Ar 5 - феніл, де згаданий фенільний залишок заміщений у п'ятому положенні згаданого фуранільного кільця; та Q - CH_2 -X- CH_2 , де X є метафенілен.

15. Сполука згідно з пунктом 12, в якій Ar - пірид-3-ил; Z є карбокси; M є Ar 4 -Ar 5 , де Ar 4 - феніл, а Ar 5 - піримід-2-ил, а згаданий піримід-2-іловий залишок заміщений у четвертому положенні згаданого фенільного кільця; та Q є CH_2 -X- CH_2 , де X - метафенілен.

16. Сполука згідно з пунктом 12, в якій Ar - пірид-3-ил; Z є карбокси; M є Ar 4 -Ar 5 , де Ar 4 - феніл, а Ar 5 - тіазол-2-іл, а згаданий тіазол-2-іловий залишок заміщений у четвертому положенні згаданого фенільного кільця; та Q є CH_2 -X- CH_2 , де X - метафенілен.

17. Сполука згідно з пунктом 12, в якій Ar - пірид-3-ил; Z є карбокси; M є Ar⁴-Ar⁵, де Ar⁴ - феніл, а Ar⁵ - піримід-5-ил, а згаданий піримід-5-иловий залишок заміщений у четвертому положенні згаданого фенільного кільця; та Q є CH₂-X-CH₂, де X - метафенілен.
18. Сполука згідно з пунктом 12, в якій Ar - пірид-3-ил; Z є карбокси; M - Ar⁴ -Ar⁵, де Ar⁴ - феніл, а Ar⁵ - піразин-2-іл, а згаданий піразин-2-іловий залишок заміщений у четвертому положенні згаданого фенільного кільця; та Q є CH₂-X-CH₂, де X - метафенілен.
19. Сполука згідно з пунктом 10, її пролікарська форма або фармацевтично прийнятна сіль згаданої сполуки або згаданої пролікарської форми, де Q - -(C₂-C₄)алкілентієніл-, -(C₂-C₄)алкіленфураніл- або -(C₂-C₄)алкілентіазоліл.
20. Сполука згідно з пунктом 19, якою є 5-(3-((піридин-3-сульфоніл)-(4-тіазол-2-ілбензил)аміно)пропіл)тіофен-2-карбонова кислота.
21. Сполука згідно з пунктом 19, в якій Q - н-пропіленіл; X - тієніл; Z є карбокси; Ar - 3-піридил; Ar⁴ - феніл; Ar⁵ - 2-тіазоліл; згаданий 2-тіазоліл заміщений у четвертому положенні згаданого фенілу.
22. Сполука згідно з пунктом 10, її пролікарська форма або фармацевтично прийнятна сіль згаданої сполуки або згаданої пролікарської форми, де Q є CH₂-X-O CH₂; Ar⁴ - феніл або піридил; згадані феніл та піридил необов'язково заміщені хлором, фтором, метокси, дифторметокси, трифторметокси, трифторметилом та метилом; та X - метафенілен.
23. Сполука згідно з пунктом 22, яка вибрана з (3-(((4-циклогексилбензил)-(піридин-3-сульфоніл)аміно)метил)фенокси)оцтової кислоти; (3-(((піридин-3-сульфоніл)-(4-піридин-2-ілбензил)аміно)метил)фенокси)оцтової кислоти; (3-(((піридин-3-сульфоніл)-(4-піридин-3-ілбензил)аміно)метил)фенокси)оцтової кислоти; (3-(((піридин-3-сульфоніл)-(4-піридин-4-ілбензил)аміно)метил)фенокси)оцтової кислоти; (3-(((піридин-3-сульфоніл)-(4-тіазол-2-ілбензил)аміно)метил)фенокси)оцтової кислоти.
24. Сполука згідно з пунктом 22, де Ar - пірид-3-ил; Z є карбокси; Ar⁴ - феніл; Ar⁵ - циклогексил; а згаданий циклогексильний залишок заміщений у четвертому положенні згаданого фенільного кільця.
25. Сполука згідно з пунктом 22, де Ar - пірид-3-ил; Z є карбокси; Ar⁴ - феніл; Ar⁵ - тіазол-2-іл; а згаданий залишок тіазол-2-ілу заміщений у четвертому положенні згаданого фенільного кільця.
26. Сполука згідно з пунктом 22, в якій Ar - пірид-3-ил; Z є карбокси; Ar⁴ - феніл; Ar⁵ - 2-піридил; а згаданий залишок 2-піридилу заміщений у четвертому положенні згаданого фенільного кільця.
27. Сполука згідно з пунктом 22, в якій Ar - пірид-3-ил; Z є карбокси; Ar⁴ - феніл; Ar⁵ - 3-піридил; а згаданий залишок 3-піридилу заміщений у четвертому положенні згаданого фенільного кільця.
28. Сполука згідно з пунктом 19, в якій Ar - пірид-3-ил; Z є карбокси; Ar⁴ - феніл; Ar⁵ - 4-піридил; а згаданий 4-піридинський залишок заміщений у четвертому положенні згаданого фенільного кільця.
29. Сполука згідно з пунктом 8, її пролікарська форма або фармацевтично прийнятна сіль згаданої сполуки або згаданої пролікарської форми, де K - метилен, G є Ar; Ar - феніл, піридазиніл, піразоліл, піразиніл, піридил, імідазоліл, піримідил, тієніл та тіазоліл, Ar необов'язково моно-, ди- або тризаміщений R³, R⁴ або R⁵, M є Ar³, де згаданий Ar³ - циклопентил, циклогексил, феніл, тієніл, піридазиніл, піримідиніл, піразиніл, індоліл, бензофурил, бензо(b)тієніл, бензоксазоліл, бензтіазоліл, хінолініл, ізохінолініл, нафтил, тетралініл, 2H-1-бензопіраніл або 1,4-бензодіоксаніл та необов'язково моно-, ди- або тризаміщений R³¹, хлором, фтором, метилом, метокси, дифторметокси, трифторметилом або трифторметокси.
30. Сполука згідно з пунктом 29, яка вибрана з (3-(((2,3-дігідробензо[1,4]діоксин-6-ілметил)-(піридин-3-сульфоніл)аміно)метил)феніл)оцтової кислоти та (3-((бензофуран-2-ілметил(піридин-3-сульфоніл)аміно)метил)феніл)оцтової кислоти.
31. Сполука згідно з пунктом 29, в якій Ar - пірид-3-ил; Z є карбокси; M - 6-(1,4-бензодіоксан); а Q є CH₂-X-CH₂, де X - метафенілен.
32. Сполука згідно з пунктом 29, в якій Ar - пірид-3-ил; Z є карбокси; M - 2-бензофурил; а Q є CH₂-X-CH₂, де X - метафенілен.
33. Сполука згідно з пунктом 29, її пролікарська форма або фармацевтично прийнятна сіль згаданої сполуки або згаданої пролікарської форми, де Ar - феніл, піридил або імідазоліл, згадані феніл, піридил та імідазоліл необов'язково заміщені незалежно хлором, фтором, метилом, метокси, дифторметокси, трифторметилом або трифторметокси; Ar³ - феніл, заміщений R³¹, де R³¹ - (C₁-C₇)алкіл, моно-N- або ді-N,N-(C₁-C₄)алкіламін або (C₁-C₅)алкокси, де згадані (C₁-C₇)алкіл або (C₁-C₅)алкокси необов'язково моно-, ди- або тризаміщені незалежно гідрокси або фтором; а Ar³ необов'язково моно- або дизаміщений хлором, фтором, метилом, метокси, дифторметокси, трифторметокси або трифторметилом.
34. Сполука згідно з пунктом 33, її пролікарська форма або фармацевтично прийнятна сіль згаданої сполуки або згаданої пролікарської форми, де Q - -(C₅-C₇)алкілен.
35. Сполука згідно з пунктом 33, її пролікарська форма або фармацевтично прийнятна сіль згаданої сполуки або згаданої пролікарської форми, де Q є CH₂-X-CH₂, а X - феніл, необов'язково моно-, ди- або тризаміщений хлором, фтором, метокси, дифторметокси, трифторметокси, трифторметилом або метилом.
36. Сполука згідно з пунктом 35, вибрана з (3-(((4-бутилбензил)-(піридин-3-сульфоніл)аміно)метил)феніл)оцтової кислоти; (3-((бензолсульфоніл)-(4-бутилбензил)-аміно)метил)феніл)оцтової кислоти; (3-(((4-бутилбензил)-(1-метил-1H-імідазол-4-сульфоніл)аміно)метил)феніл)оцтової кислоти та (3-(((4-диметиламінобензил)-(піридин-3-сульфоніл)аміно)метил)феніл)оцтової кислоти.
37. Сполука згідно з пунктом 35, в якій Ar - пірид-3-ил; Z є карбокси; M - феніл, заміщений у четвертому положенні н-бутилом; а Q є CH₂-X-CH₂, де X - метафенілен.
38. Сполука згідно з пунктом 35, в якій Ar - феніл; Z є карбокси; M - феніл, заміщений у четвертому положенні н-бутилом; а Q є CH₂-X-CH₂, де X - метафенілен.

39. Сполука згідно з пунктом 35, в якій Ar - 4-(1-метилімідазоліл); Z є карбокси; M - феніл, заміщений у четвертому положенні n -бутилом; а Q є CH_2-X-CH_2 , де X - метафенілен.
40. Сполука згідно з пунктом 35, в якій Ar - пірид-3-ил; Z є карбокси; M - феніл, заміщений у четвертому положенні диметиламіно; а Q є CH_2-X-CH_2 , де X - метафенілен.
41. Сполука згідно з пунктом 33, її пролікарська форма або фармацевтично прийнятна сіль згаданої сполуки або згаданої пролікарської форми, де Q - $-(C_2-C_4)$ алкілентієніл, $-(C_2-C_4)$ алкіленфураніл або $-(C_2-C_4)$ алкілентіазоліл.
42. Сполука згідно з пунктом 33, її пролікарська форма або фармацевтично прийнятна сіль згаданої сполуки або згаданої пролікарської форми, де Q - $-(C_1-C_2)-X-O-(C_1-C_2)$ алкілен-, а X - метафенілен, причому згаданий X необов'язково моно-, ди- або тризаміщений хлором, фтором, метокси, дифторметокси, трифторметокси, трифторметилом або метилом.
43. Сполука згідно з пунктом 42, вибрана з (3-(((4-диметиламінобензил)-(піридин-3-сульфоніл)аміно)метил)фенокси)оцтової кислоти та (3-(((4-трет-бутилбензил)-(піридин-3-сульфоніл)аміно)метил)фенокси)оцтової кислоти.
44. Сполука згідно з пунктом 42, в якій Ar - пірид-3-ил; Z є карбокси; M - феніл, заміщений у четвертому положенні диметиламіно; а Q є $CH_2-X-O-CH_2$, де X - метафенілен.
45. Сполука згідно з пунктом 42, в якій Ar - пірид-3-ил; Z є карбокси; M - феніл, заміщений у четвертому положенні трет-бутилом; а Q є $CH_2-X-O-CH_2$, де X - метафенілен.
46. Сполука згідно з пунктом 8, її пролікарська форма або фармацевтично прийнятна сіль згаданої сполуки або згаданої пролікарської форми, де G є Ar ; K - (C_2-C_4) алкілен або n -пропенілен; Ar - феніл, піразоліл, піридазиніл, піразиніл, піридил, імідазоліл, піримідил, тієніл або тіазоліл, де Ar необов'язково моно-, ди- або тризаміщений R^3 , R^4 або R^5 ; а M є Ar^3 , що необов'язково моно-, ди- або тризаміщений хлором, фтором, метилом, метокси, дифторметокси, трифторметокси або трифторметилом.
47. Сполука згідно з пунктом 46, яка є транс-3-(((3-(3,5-дихлорфеніл)аліл)-(піридин-3-сульфоніл)аміно)метил)феніл)оцтовою кислотою.
48. Сполука згідно з пунктом 46, де K - транс- n -пропенілен, причому згадана M -група приєднана до 1 положення n -пропенілену, а згаданий N -атом приєднаний до 3 положення n -пропенілену; Ar - пірид-3-ил; M - феніл, що 3,5-дизаміщений хлором; Z є карбокси; а Q є CH_2-X-CH_2 , де X - метафенілен.
49. Сполука згідно з пунктом 46, її пролікарська форма або фармацевтично прийнятна сіль згаданої сполуки або згаданої пролікарської форми, де Ar^3 - феніл, необов'язково заміщений хлором, фтором, метилом, метокси, дифторметокси, трифторметокси або трифторметилом.
50. Сполука згідно з пунктом 49, її пролікарська форма або фармацевтично прийнятна сіль згаданої сполуки або згаданої пролікарської форми, де Q - $-(C_5-C_7)$ алкілен-.
51. Сполука згідно з пунктом 49, де Q є CH_2-X-CH_2 , а X - метафенілен.
52. Сполука згідно з пунктом 49, її пролікарська форма або фармацевтично прийнятна сіль згаданої сполуки або згаданої пролікарської форми, де Q - $-(C_2-C_4)$ алкілен- X -, а X - фураніл, тієніл або тіазоліл.
53. Сполука згідно з пунктом 49, її пролікарська форма або фармацевтично прийнятна сіль згаданої сполуки або згаданої пролікарської форми, де Q - $-(C_1-C_2)-X-O-(C_1-C_2)$ -алкілен та X - метафенілен.
54. Сполука згідно з пунктом 8, її пролікарська форма або фармацевтично прийнятна сіль згаданої сполуки або згаданої пролікарської форми, де G є Ar ; K - тіетилен або оксіетилен; Ar - феніл, піразоліл, піридазиніл, піразиніл, піридил, імідазоліл, піримідил, тієніл або тіазоліл, де Ar необов'язково заміщений R^3 , R^4 або R^5 в кількості до трьох; а M є Ar^3 , що необов'язково моно-, ди- або тризаміщений хлором, фтором, метилом, дифторметокси, трифторметилом або трифторметокси.
55. Сполука згідно з пунктом 54, її пролікарська форма або фармацевтично прийнятна сіль згаданої сполуки або згаданої пролікарської форми, де Ar^3 - феніл.
56. Сполука згідно з пунктом 55, її пролікарська форма або фармацевтично прийнятна сіль згаданої сполуки або згаданої пролікарської форми, де Q - $-(C_5-C_7)$ алкілен.
57. Сполука згідно з пунктом 55, її пролікарська форма або фармацевтично прийнятна сіль згаданої сполуки або згаданої пролікарської форми, де Q - CH_2-X-CH_2 , де X - метафенілен.
58. Сполука згідно з пунктом 55, її пролікарська форма або фармацевтично прийнятна сіль згаданої сполуки або згаданої пролікарської форми, де Q - $-(C_2-C_4)$ алкілен- X -, а X - фураніл, тієніл або тіазоліл.
59. Сполука згідно з пунктом 55, її пролікарська форма або фармацевтично прийнятна сіль згаданої сполуки або згаданої пролікарської форми, де Q - $-(C_1-C_2)-X-O-(C_1-C_2)$ алкілен-, а X - метафенілен.
60. Сполука згідно з пунктом 59, яка є (3-(((2-(3,5-дихлорофенокси)етил)-(піридин-3-сульфоніл)аміно)метил)феніл)оцтовою кислотою.
61. Сполука згідно з пунктом 59, де K є етиленілокси; згадана M -група приєднана до атома кисню етиленілоксигрупи, і згаданий N -атом приєднаний до 2 положення етиленілоксигрупи; Ar - пірид-3-ил; M - феніл, що 3,5-дизаміщений хлором; Z є карбокси; а Q є $CH_2-X-O-CH_2$, де X є другим фенільним кільцем, а згадані CH_2 та OCH_2 замісники розташовані по схемі мета-заміщення на згаданому другому фенільному кільці.
62. Сполука згідно з пунктом 1, її пролікарська форма або фармацевтично прийнятна сіль згаданої сполуки або згаданої пролікарської форми, де B є CN .
63. Сполука згідно з пунктом 62, її пролікарська форма або фармацевтично прийнятна сіль згаданої сполуки або згаданої пролікарської форми, де A є CO ; G є Ar , K - метиленіл, пропіленіл, пропеніленіл або оксіетиленіл; M є Ar^3 або Ar^4-Ar^5 ; Ar^3 - феніл або піридил; Ar^4 - феніл, тієніл, піридил або фураніл; Ar^5 - (C_5-C_7) циклоалкіл, феніл, піридил, імідазоліл, піримідил, тієніл, піридазиніл, піразиніл, імідазоліл, піразоліл або тіазоліл; Ar - феніл, піразоліл, піридазиніл, піразиніл, піридил, імідазоліл, піримідил, тієніл або тіазоліл, де Ar , Ar^3 , Ar^4 та Ar^5 необов'язково мають до трьох замісників, незалежно вибраних з хлору, фтору, метилу, дифторметокси, трифторметокси або трифторметилу.

а) певну кількість сполуки згідно з пунктом 1, її пролікарської форми або фармацевтично прийнятної солі згаданої сполуки або згаданої пролікарської форми;

б) певну кількість антирезорбтивного агента, його пролікарської форми або фармацевтично прийнятної солі згаданого агента або згаданої пролікарської форми.

81. Спосіб згідно з пунктом 80, в якому антирезорбтивним агентом є дролоксифен, ралоксифен, тамоксифен; 4-гідрокситамоксифен; тореміфен; центхроман; левормелоксифен; ідоксифен; 6-(4-гідроксифеніл)-5-(4-(2-піперидин-1-ілетокси)бензил)-нафталін-2-ол; (4-(2-(2-азабіцикло[2.2.1]гепт-2-ил)етокси)феніл)-(6-гідрокси-2-(4-гідроксифеніл)бензо[*b*]тіофен-3-іл)метанон;

3-(4-(1,2-дифенілбут-1-еніл)феніл)акрилова кислота;

2-(4-метоксифеніл)-3-[4-(2-піперидин-1-ілетокси)фенокси]бензо[*b*]тіофен-6-ол;

цис-6-(4-фторфеніл)-5-(4-(2-піперидин-1-ілетокси)феніл)-5,6,7,8-тетрагідронафталін-2-ол;

(-)-цис-6-феніл-5-(4-(2-піролідин-1-ілетокси)феніл)-5,6,7,8-тетрагідронафталін-2-ол;

цис-6-феніл-5-(4-(2-піролідин-1-ілетокси)феніл)-5,6,7,8-тетрагідронафталін-2-ол;

цис-1-(6'-піролодинетокси-3'-піридил)-2-феніл-6-гідрокси-1,2,3,4-тетрагідронафталін;

1-(4'-піролодинетоксифеніл)-2-(4''-фторфеніл)-6-гідрокси-1,2,3,4-тетрагідроізохінолін;

цис-6-(4-гідроксифеніл)-5-(4-(2-піперидин-1-ілетокси)феніл)-5,6,7,8-тетрагідронафталін-2-ол або

1-(4'-піролодинолетоксифеніл)-2-феніл-6-гідрокси-1,2,3,4-тетрагідроізохінолін,

його пролікарська форма або фармацевтично прийнятна сіль згаданого агента або згаданої пролікарської форми.

82. Спосіб згідно з пунктом 80, де антирезорбтивним агентом є тілудронова кислота, алендренова кислота, золедренова кислота, ібандронова кислота, ризедронова кислота, етидренова кислота, клодронова кислота і памідренова кислота, її пролікарська форма або фармацевтично прийнятна сіль згаданого агента або згаданої пролікарської форми.

83. Набір, який містить:

а) певну кількість сполуки за п. 1, її пролікарської форми або фармацевтично прийнятної солі згаданої сполуки або згаданої пролікарської форми в першій одиничній дозованій формі;

б) певну кількість антирезорбтивного агента, його пролікарської форми або фармацевтично прийнятної солі згаданого агента або згаданої пролікарської форми та фармацевтично прийнятний носій або розріджувач в другій одиничній дозованій формі;

в) засоби зберігання для розміщення згаданих першої і другої дозованих форм.

84. Набір згідно з пунктом 83, в якому антирезорбтивним агентом є дролоксифен, ралоксифен, тамоксифен; 4-гідрокситамоксифен; тореміфен; центхроман; левормелоксифен; ідоксифен; 6-(4-гідроксифеніл)-5-(4-(2-піперидин-1-ілетокси)бензил)-нафталін-2-ол; (4-(2-(2-азабіцикло[2.2.1]гепт-2-ил)етокси)феніл)-(6-гідрокси-2-(4-гідроксифеніл)бензол[*b*]тіофен-3-іл)метанон;

3-(4-(1,2-дифенілбут-1-еніл)феніл)акрилова кислота;

2-(4-метоксифеніл)-3-[4-(2-піперидин-1-ілетокси)фенокси]бензо[*b*]тіофен-6-ол;

цис-6-(4-фторфеніл)-5-(4-(2-піперидин-1-ілетокси)феніл)-5,6,7,8-тетрагідронафталін-2-ол;

(-)-цис-6-феніл-5-(4-(2-піролідин-1-ілетокси)феніл)-5,6,7,8-тетрагідронафталін-2-ол;

цис-6-феніл-5-(4-(2-піролідин-1-ілетокси)феніл)-5,6,7,8-тетрагідронафталін-2-ол;

цис-1-(6'-піролодинетокси-3'-піридил)-2-феніл-6-гідрокси-1,2,3,4-тетрагідронафталін;

1-(4'-піролодинетоксифеніл)-2-(4''-фторфеніл)-6-гідрокси-1,2,3,4-тетрагідроксисохинолін;

цис-6-(4-гідроксифеніл)-5-(4-(2-піперидин-1-ілетокси)феніл)-5,6,7,8-тетрагідронафталін-2-ол або

1-(4'-піролодинолетоксифеніл)-2-феніл-6-гідрокси-1,2,3,4-тетрагідроізохінолін,

його пролікарська форма або фармацевтично прийнятна сіль згаданого агента або згаданої пролікарської форми.

85. Набір згідно з пунктом 83, в якому антирезорбтивним агентом є тілудронова кислота, алендренова кислота, золедренова кислота, ібандронова кислота, ризедронова кислота, етидренова кислота, клодронова кислота і памідренова кислота, її пролікарська форма або фармацевтично прийнятна сіль згаданого агента або згаданої пролікарської форми.

86. Фармацевтична композиція, яка містить:

а) певну кількість сполуки згідно з пунктом 1, її пролікарської форми або фармацевтично прийнятної солі згаданої сполуки або згаданої пролікарської форми;

б) певну кількість іншого анаболічного агента кісткової маси, його пролікарської форми або фармацевтично прийнятної солі згаданого агента або згаданої пролікарської форми;

в) фармацевтичний носій або розріджувач.

87. Фармацевтична композиція згідно з пунктом 86, в якій анаболічним агентом кісткової маси в компоненті б є IGF-1, протеїн морфогенезу кісток, простагландин, агоніст/антагоніст простагландину, фторид натрію, паратиреоїдний гормон (ПТГ), активний фрагмент або фрагменти паратиреоїдного гормону, гормон росту або речовина, що підсилює секрецію гормону росту, його пролікарська форма або фармацевтично прийнятна сіль згаданого агента або згаданої пролікарської форми.

88. Спосіб лікування ссавця з ознаками низької кісткової маси, що включає введення згаданому ссавцю:

а) певної кількості сполуки згідно з пунктом 1, її пролікарської форми або фармацевтично прийнятної солі згаданої сполуки або згаданої пролікарської форми;

б) певної кількості іншого анаболічного агента кісткової маси, його пролікарської форми або фармацевтично прийнятної солі згаданого агента або згаданої пролікарської форми.

89. Спосіб згідно з пунктом 86, де кістково анаболічним агентом кісткової маси в компоненті б є IGF-1, протеїн морфогенезу кісток, простагландин, агоніст/антагоніст простагландину, фторид натрію, паратиреоїдний гормон (ПТГ), активний фрагмент або фрагменти паратиреоїдного гормону, гормон росту або речовина, що підсилює секрецію гормону росту та його пролікарська форма або фармацевтично прийнятна сіль згаданого агента або згаданої пролікарської форми.

90. Спосіб лікування ссавця з ознаками дегенерації нирки, при якому вводять згаданому ссавцю ефективну для лікування дегенерації нирки кількість сполуки згідно з пунктом 1, її пролікарської форми або фармацевтично прийнятної солі згаданої сполуки або згаданої пролікарської форми.

91. Набір, який містить:

а) певну кількість сполуки за п. 1, її пролікарської форми або фармацевтично прийнятної солі згаданої сполуки або згаданої пролікарської форми в першій одиничній дозованій формі;

б) певну кількість антирезорбтивного агента, його пролікарської форми або фармацевтично прийнятної солі згаданого агента або згаданої пролікарської форми в другій одиничній дозованій формі; та

с) засоби зберігання для розміщення згаданих першої і другої дозованих форм.

92. Набір згідно з пунктом 91, де анаболічним агентом кісткової маси в компоненті б є IGF-1, протеїн морфогенезу кісток, простагландин, агоніст/антагоніст простагландину, фторид натрію, паратиреоїдний гормон (ПТГ), активний фрагмент або фрагменти паратиреоїдного гормону, гормон росту або речовина, що підсилює секрецію гормону росту, його пролікарська форма або фармацевтично прийнятна сіль згаданого агента або згаданої пролікарської форми.

93. Спосіб нарощення та збереження кісткової маси у хребетних, при якому вводять згаданому хребетному:

а) певну кількість сполуки згідно з пунктом 1, її пролікарської форми або фармацевтично прийнятної солі згаданої сполуки або згаданої пролікарської форми;

б) певну кількість антирезорбтивного агента, його пролікарської форми або фармацевтично прийнятної солі згаданого агента або згаданої пролікарської форми.

94. Спосіб згідно з пунктом 93, де антирезорбтивним агентом є дролоксифен, ралоксифен, тамоксифен; 4-гідрокситамоксифен; тореміфен; центхроман; левормелоксифен; ідоксифен; 6-(4-гідроксифеніл)-5-(4-(2-піперидин-1-ілетокси)бензил)нафталін-2-ол; (4-(2-(2-азабіцикло[2.2.1]гепт-2-ил)етокси)феніл)-(6-гідрокси-2-(4-гідроксифеніл)бензо[*b*]тіофен-3-іл)метанон;

3-(4-(1,2-дифенілбут-1-еніл)феніл)акрилова кислота;

2-(4-метоксифеніл)-3-[4-(2-піперидин-1-ілетокси)фенокси]бензо[*b*]тіофен-6-ол;

цис-6-(4-фторфеніл)-5-(4-(2-піперидин-1-ілетокси)феніл)-5,6,7,8-тетрагідронафталін-2-ол;

(-)-цис-6-феніл-5-(4-(2-піролідин-1-ілетокси)феніл)-5,6,7,8-тетрагідронафталін-2-ол;

цис-6-феніл-5-(4-(2-піролідин-1-ілетокси)феніл)-5,6,7,8-тетрагідронафталін-2-ол;

цис-1-(6'-піролідинетокси-3'-піридил)-2-феніл-6-гідрокси-1,2,3,4-тетрагідронафталін;

1-(4'-піролідинетоксифеніл)-2-(4''-фторфеніл)-6-гідрокси-1,2,3,4-тетрагідроізохінолін;

цис-6-(4-гідроксифеніл)-5-(4-(2-піперидин-1-ілетокси)феніл)-5,6,7,8-тетрагідронафталін-2-ол або

1-(4'-піролідинолетоксифеніл)-2-феніл-6-гідрокси-1,2,3,4-тетрагідроізохінолін,

його пролікарська форма або фармацевтично прийнятна сіль згаданого агента або згаданої пролікарської форми.

95. Спосіб згідно з пунктом 93, де антирезорбтивним агентом є тілудронова кислота, алендренова кислота, золедренова кислота, ібандронова кислота, ризедронова кислота, етидренова кислота, клодронова кислота і памідренова кислота, її пролікарська форма або фармацевтично прийнятна сіль згаданого агента або згаданої пролікарської форми.

96. Спосіб нарощення та збереження кісткової маси у хребетних, при якому вводять згаданому хребетному:

а) певну кількість сполуки згідно з пунктом 1, її пролікарської форми або фармацевтично прийнятної солі згаданої сполуки або згаданої пролікарської форми; та

б) певну кількість іншого анаболічного агента кісткової маси, його пролікарської форми або фармацевтично прийнятної солі згаданого агента або згаданої пролікарської форми.

97. Спосіб згідно з пунктом 96, де згаданим анаболічним агентом кісткової маси в компоненті б є IGF-1, протеїн морфогенезу кісток, простагландин, агоніст/антагоніст простагландину, фторид натрію, паратиреоїдний гормон (ПТГ), активний фрагмент або фрагменти паратиреоїдного гормону, гормон росту або речовина, що підсилює секрецію гормонів росту, його пролікарська форма або фармацевтично прийнятна сіль згаданого агента або згаданої пролікарської форми.

98. Спосіб лікування глаукоми у ссавця, що страждає від глаукоми, при якому вводять згаданому ссавцю терапевтично ефективну кількість сполуки згідно з пунктом 1, її пролікарської форми або фармацевтично прийнятної солі згаданої сполуки або згаданої пролікарської форми.

99. Спосіб лікування у ссавця, що страждає від очулярної гіпертензії, при якому вводять згаданому ссавцю терапевтично ефективну кількість сполуки згідно з пунктом 1, її пролікарської форми або фармацевтично прийнятної солі згаданої сполуки або згаданої пролікарської форми.

100. Сполука згідно з пунктом 1, її пролікарська форма або фармацевтично прийнятна сіль згаданої сполуки або згаданої пролікарської форми, де А є SO₂, В є N, G є Ar, К - метилен, Z - карбоксил, (C₁-C₆)алкоксикарбоніл або тетразоліл; Q є CH₂-X-CH₂-CH₂, CH₂-X-O-CH₂, CH₂-X-O-CH(CH₃), CH₂-X-CH₂-CH(CH₃); а X – метафенілен, причому згаданий X необов'язково моно- або дизаміщений хлором, фтором, метилом, метокси, дифторметокси, трифторметилом або трифторметокси; М є Ar³ або Ar⁴-Ar⁵; Ar³ - циклопентил, циклогексил, феніл, тієніл, піридазиніл, піримідиніл, піразиніл, індоліл, бензофурил, бензо(*b*)тієніл, бензоксазоліл, бензтіазоліл, хінолініл, ізохінолініл, нафтил, тетралініл, 2Н-1-бензопіраніл, 1,3-бензодіоксоліл, 2,3-дигідробензофураніл або 1,4-бензодіоксан та необов'язково моно-, ди- або тризаміщений R³¹, хлором, фтором, метилом, метокси, дифторметокси, трифторметилом або трифторметокси; R³¹ - (C₁-C₇)алкіл, моно-N- або ди-N,N-(C₁-C₄)алкіламін або (C₁-C₅)алкокси, згадані (C₁-C₇)алкіл або (C₁-C₅)алкокси необов'язково моно-, ди- або тризаміщені незалежно гідрокси або фтором; Ar - феніл, піридил, піразоліл, імідазоліл, піримідил, тієніл або тіазоліл, де Ar необов'язково моно-, ди- або тризаміщений на вуглеці хлором, фтором, метилом, метокси, дифторметокси, трифторметилом або трифторметокси, або моно- або дизаміщений на азоті метилом або трифторметокси; Ar⁴ - феніл, тієніл, фураніл або піридил, де Ar⁴ необов'язково моно-, ди- або тризаміщений хлором, фтором, метилом, метокси, дифторметокси, трифторметилом або трифторметокси; Ar⁵

- циклопропіл, циклобутил, циклопентил, циклогексил, циклогептил, феніл, піридил, імідазоліл, піримідил, тієніл, піридазиніл, піразиніл, піразоліл або тіазоліл, де Ar^5 необов'язково моно-, ди- або тризаміщений хлором, фтором, метилом, метокси, дифторметокси, трифторметокси або трифторметилом.

101. Сполука згідно з пунктом 100, її пролікарська форма або фармацевтично прийнятна сіль згаданої сполуки або згаданої пролікарської форми, де Z - карбоксил або (C_1-C_3) алкоксикарбоніл; ; Q є $CH_2-X-CH_2-CH_2$ або $CH_2-X-O-CH_2$; Ar - феніл, 3-фторфеніл, 3-хлорфеніл, 4-фторфеніл, 4-хлорфеніл, 2-тіазоліл, 2-тієніл, 2-(5-хлортієніл), 2-піридил, 3-піридил або 4-(1-метилімідазоліл); M є Ar^3 ; Ar^3 - циклопентил, циклогексил, феніл, тієніл, піридазиніл, піримідиніл, піразиніл, індоліл, бензофурил, бензо(b)тієніл, бензоксазоліл, бензтіазоліл, хінолініл, ізохінолініл, нафтил, тетралініл, 2H-1-бензопіраніл, 1,3-бензодіоксоліл, 2,3-дигідробензофураніл або 1,4-бензодіоксан та необов'язково моно-, ди- або тризаміщений R^{31} , хлором, фтором, метилом, метокси, дифторметокси, трифторметилом або трифторметокси; R^{31} - (C_1-C_7) алкіл або (C_1-C_5) алкокси, згадані (C_1-C_7) алкіл або (C_1-C_5) алкокси необов'язково моно-, ди- або тризаміщені незалежно гідрокси або фтором; і X - метафенілен.

102. Сполука згідно з пунктом 100, її пролікарська форма або фармацевтично прийнятна сіль згаданої сполуки або згаданої пролікарської форми, де Z - карбоксил або (C_1-C_3) алкоксикарбоніл; Ar - феніл, 3-фторфеніл, 3-хлорфеніл, 4-фторфеніл, 4-хлорфеніл, 2-тіазоліл, 2-тієніл, 2-(5-хлортієніл), 2-піридил, 3-піридил або 4-(1-метилімідазоліл); M є Ar^4-Ar^5 ; Ar^4 необов'язково моно- або дизаміщений хлором або фтором; і X - метафенілен.

103. Сполука згідно з пунктом 102, її пролікарська форма або фармацевтично прийнятна сіль згаданої сполуки або згаданої пролікарської форми, де Ar - 4-хлорфеніл; Q є $CH_2-X-O-CH_2$; X - метафенілен; Z - карбоксил; Ar^4 - парафенілен; а Ar^5 - 2-тіазоліл.

104. 3-([(4-хлорбензолсульфоніл)-(4-тіазоліл-2-ілбензил)аміно]метил)фенокси)-оцтова кислота.

105. Сполука згідно з пунктом 102, її пролікарська форма або фармацевтично прийнятна сіль згаданої сполуки або згаданої пролікарської форми, де Z - карбоксил; Q є $CH_2-X-CH_2-CH_2$; X - метафенілен; Ar - феніл, 3-фторфеніл, 4-фторфеніл, 4-хлорфеніл, 2-тіазоліл, 2-тієніл, 2-(5-хлортієніл), 2-піридил або 3-піридил; Ar^4 - феніл, заміщений в пара-положенні Ar^5 , причому згаданий Ar^4 додатково необов'язково заміщений хлором або фтором; і Ar^5 - циклопентил, циклогексил, феніл, 2-піридил, 3-піридил, 4-піридил, 1-імідазоліл, 2-піримідил, 5-піримідил, 2-тієніл, 6-піридазиніл, 2-піразиніл, 1-піразоліл, 2-тіазоліл або 5-піридазиніл, які необов'язково моно- або дизаміщені на вуглці хлором, фтором, метилом, метокси, дифторметокси, трифторметокси або трифторметилом.

106. Сполука згідно з пунктом 105, її пролікарська форма або фармацевтично прийнятна сіль згаданої сполуки або згаданої пролікарської форми, що вибирається з 3-(3-([(піридин-3-сульфоніл)-(4-піридин-3-ілбензил)аміно]метил)феніл)пропіонової кислоти; 3-(3-([(4-хлорбензол-сульфоніл)-(4-піразин-2-ілбензил)аміно]метил)феніл)пропіонової кислоти; 3-(3-([(4-піразин-2-ілбензил)-(тіазол-2-сульфоніл)аміно]метил)феніл)пропіонової кислота та 3-(3-([(4-хлорбензолсульфоніл)-(4-піримідин-2-ілбензил)аміно]метил)феніл)пропіонової кислоти.

107. Сполука згідно з пунктом 105, її пролікарська форма або фармацевтично прийнятна сіль згаданої сполуки або згаданої пролікарської форми, де Ar - 3-піридил; Ar^4 - парафенілен; а Ar^5 - 3-піридил.

108. Сполука згідно з пунктом 105, її пролікарська форма або фармацевтично прийнятна сіль згаданої сполуки або згаданої пролікарської форми, де Ar - 4-хлорфеніл; Ar^4 - парафенілен; а Ar^5 - 2-піразиніл.

109. Сполука згідно з пунктом 105, її пролікарська форма або фармацевтично прийнятна сіль згаданої сполуки або згаданої пролікарської форми, де Ar - 4-хлорфеніл; Ar^4 - парафенілен; а Ar^5 - 2-піримідиніл.

110. Сполука згідно з пунктом 105, її пролікарська форма або фармацевтично прийнятна сіль згаданої сполуки або згаданої пролікарської форми, де Ar є 2-тіазоліл; Ar^4 - парафенілен; а Ar^5 - 2-піразиніл.