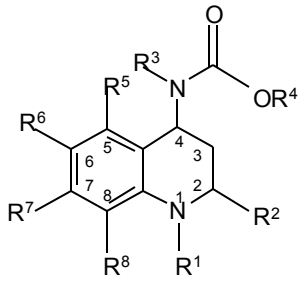


1. 4-Карбоксіаміно-2-заміщені-1,2,3,4-тетрагідрохіноліни загальної формули I:



їх пролікарська форма або фармацевтично прийнятна сіль згаданої сполуки і згаданої пролікарської форми;

де  $R^1$  є воднем, Y, W-X або W-Y;

де W є карбонілом, тіокарбонілом, сульфінілом або сульфонілом;

X є -O-Y, -S-Y, -N(H)-Y або -N-(Y)<sub>2</sub>;

де Y для кожного випадку є, незалежно, Z або повністю насиченим, частково ненасиченим або повністю ненасиченим 1-10-членним нерозгалуженим або розгалуженим вуглеводневим ланцюгом, в якому вуглеці, інші ніж зв'язуючий вуглець, можуть, необов'язково, бути заміщеними одним або двома гетероатомами, що незалежно вибирають з кисню, сірки і азоту і згаданий вуглець є, необов'язково, моно-, ди- або тризаміщеним, незалежно, галогеном, згаданий вуглець є, необов'язково, монозаміщеним гідрокси, згаданий вуглець є, необов'язково, монозаміщеним оксо, згаданий атом сірки є, необов'язково, моно- або дизаміщеним оксо, згаданий атом азоту є, необов'язково, моно-, або дизаміщеним оксо, і згаданий вуглецевий ланцюг є, необов'язково, монозаміщеним Z;

де Z є частково насиченим, повністю насиченим або повністю ненасиченим 3-8-членним кільцем, що необов'язково має до чотирьох гетероатомів, що незалежно вибирають з кисню, сірки і азоту, або біциклічним кільцем, що містить два конденсованих частково насичених, повністю насичених або повністю ненасичених 3-6-членних кільця, взятих незалежно, що необов'язково мають від одного до чотирьох гетероатомів, що незалежно вибирають з азоту, сірки і кисню;

де згаданий Z замісник є, необов'язково, незалежно моно-, ди- або тризаміщеним галогеном, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)алкенілом, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкілом, гідрокси, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкокси, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкілтію, аміно, нітро, ціано, оксо, карбокси, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкілоксикарбонілом, моно-N- або ди-N,N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіламіном, де згаданий (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкільний замісник є, необов'язково, незалежно моно-, ди- або тризаміщеним галогеном, гідрокси, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкокси, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкілтію, аміно, нітро, ціано, оксо, карбокси, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкілоксикарбонілом, моно-N- або ди-N,N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіламіном, згаданий (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкільний замісник є також, необов'язково, заміщеним від одного до дев'яти атомами фтору;

$R^2$  є частково насиченим, повністю насиченим або повністю ненасиченим 1-6-членним нерозгалуженим або розгалуженим вуглеводневим ланцюгом, в якому вуглеці, інші ніж зв'язуючий вуглець, можуть, необов'язково, бути заміщені одним або двома гетероатомами, що незалежно вибирають з кисню, сірки і азоту, де згадані атоми вуглецю є, необов'язково, моно-, ди- або тризаміщеними, незалежно, галогеном, згаданий вуглець є, необов'язково, монозаміщеним оксо, згаданий вуглець є, необов'язково, монозаміщеним гідрокси, згаданий атом сірки є, необов'язково, моно- або дизаміщеним оксо, згаданий атом азоту є, необов'язково, моно- або дизаміщеним оксо; або згаданий  $R^2$  є частково насиченим, повністю насиченим або повністю ненасиченим 3-7-членним кільцем, що необов'язково має від одного до двох гетероатомів, що незалежно вибирають з кисню, сірки і азоту, де згадане  $R^2$  кільце є, необов'язково, приєднаним через (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкіл;

де згадане  $R^2$  кільце є, необов'язково, моно-, ди- або тризаміщеним, незалежно, галогеном, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)алкенілом, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкілом, гідрокси, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкокси, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкілтію, аміно, нітро, ціано, оксо, карбокси, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкілоксикарбонілом, моно-N- або ди-N,N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіламіном, де згаданий (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкільний замісник є, необов'язково, моно-, ди- або тризаміщеним, незалежно, галогеном, гідрокси, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкокси, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкілтію, оксо або (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкілоксикарбонілом;

при умові, що  $R^2$  не є метилом;

$R^3$  є воднем або Q;

де Q є повністю насиченим, частково ненасиченим або повністю ненасиченим 1-6-членним нерозгалуженим або розгалуженим вуглеводневим ланцюгом, де вуглеці інші ніж зв'язуючий вуглець, можуть, необов'язково, бути заміщеними одним гетероатомом, що вибирають з кисню, сірки і азоту і згаданий вуглець є, необов'язково, моно-, ди- або тризаміщеним, незалежно, галогеном, згаданий вуглець є, необов'язково, монозаміщеним гідрокси, згаданий вуглець є, необов'язково, монозаміщеним оксо, згаданий атом сірки є, необов'язково, моно- або дизаміщеним оксо, згаданий атом азоту є, необов'язково, моно- або дизаміщеним оксо, і згаданий вуглецевий ланцюг є, необов'язково, монозаміщеним V;

де V є частково насиченим, повністю насиченим або повністю ненасиченим 3-8-членним кільцем, що необов'язково має від одного до чотирьох гетероатомів, що незалежно вибирають з кисню, сірки і азоту, або біциклічним кільцем, що містить два частково насичених, повністю насичених або повністю ненасичених 3-6-членних кільця, взятих незалежно, що необов'язково мають від одного до чотирьох гетероатомів, що незалежно вибирають з азоту, сірки і кисню;

де згаданий V замісник є, необов'язково, моно-, ди-, три-, або тетразаміщеним, незалежно, галогеном, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкілом, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)алкенілом, гідрокси, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкокси, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкілтію, аміно, нітро, ціано, оксо, карбоксамілом, моно-N- або ди-N,N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкілкарбоксамілом, карбокси, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкілоксикарбонілом, моно-N- або ди-N,N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіламіном, де згаданий (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкільний або (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)алкенільний замісники є, необов'язково, моно-, ди- або тризаміщеним, незалежно, гідрокси, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкокси, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкілтію, аміно, нітро, ціано, оксо, карбокси, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкілоксикарбонілом, моно-N- або ди-N,N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіламіно, згаданий (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкільний або (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)алкенільний замісники також, необов'язково, заміщені від одного до дев'яти атомами фтору;

$R^4$  є Q<sup>1</sup> або V<sup>1</sup>;

де Q<sup>1</sup> є повністю насиченим, частково ненасиченим або повністю ненасиченим 1-6-членним нерозгалуженим або розгалуженим вуглеводневим ланцюгом, де вуглеці, інші ніж зв'язуючий вуглець, можуть, необов'язково, бути заміщеними одним гетероатомом, що вибирають з кисню, сірки і азоту і згаданий вуглець є, необов'язково, моно-,

ди- або тризаміщеним, незалежно, галогеном, згаданий вуглець є, необов'язково, монозаміщеним гідрокси, згаданий вуглець є, необов'язково, монозаміщеним оксо, згаданий атом сірки є, необов'язково, моно- або дизаміщеним оксо, згаданий атом азоту є, необов'язково, моно-або дизаміщеним оксо, і згаданий вуглецевий ланцюг є, необов'язково, монозаміщеним  $V^1$ ;

де  $V^1$  є частково насиченим, повністю насиченим або повністю ненасиченим 3-6-членним кільцем, що необов'язково має від одного до двох гетероатомів, що незалежно вибирають з кисню, сірки і азоту;

де згаданий  $V^1$  замісник є, необов'язково, моно-, ди-, три-, або тетразаміщеним, незалежно, галогеном,  $(C_1-C_6)$ алкілом,  $(C_1-C_6)$ алкокси, аміно, нітро, ціано,  $(C_1-C_6)$ алкілоксикарбонілом, моно-N- або ди-N,N- $(C_1-C_6)$ алкіламіном, де згаданий  $(C_1-C_6)$ алкільний замісник є, необов'язково, монозаміщеним оксо, згаданий  $(C_1-C_6)$ алкільний замісник є також, необов'язково, заміщеним від одного до дев'яти атомами фтору;

де або  $R^3$  повинен містити V, або  $R^4$  повинен містити  $V^1$ ;

$R^5$ ,  $R^6$ ,  $R^7$  і  $R^8$  кожний є незалежно воднем, зв'язком, нітро або галогеном, де згаданий зв'язок є заміщеним T або частково насиченим, повністю насиченим або повністю ненасиченим  $(C_1-C_{12})$  нерозгалуженим або розгалуженим вуглеводневим ланцюгом, де вуглець може, необов'язково, бути заміщеним одним або двома гетероатомами, що незалежно вибирають з кисню, сірки і азоту, де згадані атоми вуглецю є, необов'язково, моно-, ди- або тризаміщеними, незалежно, галогеном, згаданий вуглець є, необов'язково, монозаміщеним гідрокси, згаданий вуглець є, необов'язково, монозаміщеним оксо, згаданий атом сірки є, необов'язково, моно- або дизаміщеним оксо, згаданий атом азоту є, необов'язково, моно- або дизаміщеним оксо, і згаданий вуглець є, необов'язково, монозаміщеним T;

де T є частково насиченим, повністю насиченим або повністю ненасиченим 3-8-членним кільцем, що необов'язково має від одного до чотирьох гетероатомів, що незалежно вибирають з кисню, сірки і азоту, або біциклічним кільцем, що містить два конденсованих частково насичених, повністю насичених або повністю ненасичених 3-6-членних кільця, взятих незалежно, що необов'язково мають від одного до чотирьох гетероатомів, що незалежно вибирають з азоту, сірки і кисню;

де згаданий T замісник є, необов'язково, моно-, ди- або тризаміщеним, незалежно, галогеном,  $(C_1-C_6)$ алкілом,  $(C_2-C_6)$ алкенілом, гідрокси,  $(C_1-C_6)$ алкокси,  $(C_1-C_4)$ алкілтіо, аміно, нітро, ціано, оксо, карбокси,  $(C_1-C_6)$ алкілоксикарбонілом, моно-N- або ди-N,N- $(C_1-C_6)$ алкіламіном, де згаданий  $(C_1-C_6)$ алкільний замісник є, необов'язково, моно-, ди- або тризаміщеним, незалежно, гідрокси,  $(C_1-C_6)$ алкокси,  $(C_1-C_4)$ алкілтіо, аміно, нітро, ціано, оксо, карбокси,  $(C_1-C_6)$ алкілоксикарбонілом, моно-N- або ди-N,N- $(C_1-C_6)$ алкіламіном, згаданий  $(C_1-C_6)$ алкільний замісник є також, необов'язково, заміщеним від одного до дев'яти атомами фтору; і

де  $R^5$  і  $R^6$  або  $R^6$  і  $R^7$ , і/або  $R^7$  і  $R^8$  можуть також бути взяті разом і можуть утворювати, принаймні, одне 4-8-членне кільце, що є частково насиченим або повністю ненасиченим, що необов'язково має від одного до трьох гетероатомів, що незалежно вибирають з азоту, сірки і кисню;

де згадане кільце або кільця утворені  $R^5$  і  $R^6$  або  $R^6$  і  $R^7$ , і/або  $R^7$  і  $R^8$  є, необов'язково, моно-, ди- або тризаміщеними, незалежно, галогеном,  $(C_1-C_6)$ алкілом,  $(C_1-C_4)$ алкілсульфонілом,  $(C_2-C_6)$ алкенілом, гідрокси,  $(C_1-C_6)$ алкокси,  $(C_1-C_4)$ алкілтіо, аміно, нітро, ціано, оксо, карбокси,  $(C_1-C_6)$ алкілоксикарбонілом, моно-N- або ди-N,N- $(C_1-C_6)$ алкіламіном, де згаданий  $(C_1-C_6)$ алкільний замісник є, необов'язково, моно-, ди- або тризаміщеним, незалежно, гідрокси,  $(C_1-C_6)$ алкокси,  $(C_1-C_4)$ алкілтіо, аміно, нітро, ціано, оксо, карбокси,  $(C_1-C_6)$ алкілоксикарбонілом, моно-N- або ди-N,N- $(C_1-C_6)$ алкіламіном, згаданий  $(C_1-C_6)$ алкільний замісник є також, необов'язково, заміщеним від одного до дев'яти атомами фтору;

при умові, що коли  $R^2$  є карбоксиллом або  $(C_1-C_4)$ алкілкарбоксиллом, тоді  $R^1$  не є воднем.

2. Сполука згідно з пунктом 1, де

$R^2$  є бета;

$C^4$  азот є бета;

$R^1$  є W-X;

W є карбонілом, тіокарбонілом або  $-SO_2$ ;

X є  $-O-Y$ -,  $S-Y$ -,  $N(H)-Y$ - або  $-N(Y)_2$ ;

Y для кожного випадку є, незалежно, Z або  $(C_1-C_4)$ алкілом, згаданий  $(C_1-C_4)$ алкіл, необов'язково, заміщений від одного до дев'яти атомами фтору або гідрокси, або згаданий  $(C_1-C_4)$ алкіл, необов'язково, монозаміщений Z;

де Z є частково насиченим, повністю насиченим або повністю ненасиченим 3-6-членним кільцем, що необов'язково має від одного до двох гетероатомів, що незалежно вибирають з кисню, сірки і азоту;

де згаданий Z замісник є, необов'язково, моно-, ди- або тризаміщеним, незалежно, галогеном,  $(C_1-C_4)$ алкілом,  $(C_1-C_4)$ алкокси,  $(C_1-C_4)$ алкілтіо, нітро, ціано, оксо, або  $(C_1-C_4)$ алкілоксикарбонілом, згаданий  $(C_1-C_4)$ алкіл є, необов'язково, заміщеним від одного до дев'яти атомами фтору;

$R^2$  є частково насиченим, повністю насиченим або повністю ненасиченим 1-4-членним нерозгалуженим або розгалуженим вуглеводневим ланцюгом, де вуглеці, інші ніж зв'язуючий вуглець, можуть, необов'язково, бути заміщеними одним гетероатомом, що незалежно вибирають з кисню, сірки і азоту, де згадані атоми вуглецю є, необов'язково, моно-, ди- або тризаміщеними, незалежно, галогеном, згаданий вуглець є, необов'язково, монозаміщеним оксо, згаданий вуглець є, необов'язково, монозаміщеним гідрокси, згаданий атом сірки є, необов'язково, моно- або дизаміщеним оксо, згаданий атом азоту є, необов'язково, моно- або дизаміщеним оксо; або згаданий  $R^2$  є частково насиченим, повністю насиченим або повністю ненасиченим 3-5-членним кільцем, що необов'язково має один гетероатом, що незалежно вибирають з кисню, сірки і азоту;

де згадане  $R^2$  кільце є, необов'язково, моно-, ди- або тризаміщеним, незалежно, галогеном, гідрокси,  $(C_1-C_6)$ алкокси або  $(C_1-C_6)$ алкоксикарбонілом;

$R^3$  є Q-V, де Q є  $(C_1-C_4)$ алкілом і V є 5-6-членним частково насиченим, повністю насиченим або повністю ненасиченим кільцем, що необов'язково має від одного до трьох гетероатомів, що незалежно вибирають з кисню, сірки і азоту;

де згадане V кільце є, необов'язково, моно-, ди-, три- або тетразаміщеним, незалежно, галогеном,  $(C_1-C_6)$ алкілом, гідрокси,  $(C_1-C_6)$ алкокси, нітро, ціано або оксо, де згаданий  $(C_1-C_6)$ алкільний замісник, необов'язково, має від одного до дев'яти атомів фтору;

$R^4$  є  $(C_1-C_4)$ алкілом;

$R^6$  і  $R^7$  кожен є, незалежно, H, галогеном, T або  $(C_1-C_6)$ алкілом, згаданий  $(C_1-C_6)$ алкіл, необов'язково, має від одного до дев'яти атомів фтору або згаданий  $(C_1-C_6)$ алкіл є, необов'язково, монозаміщеним T;

де Т є частково насиченим, повністю насиченим або повністю ненасиченим 5-6-членним кільцем, що необов'язково має від одного до двох гетероатомів, що незалежно вибирають з кисню, сірки і азоту;  
де згаданий Т замісник є, необов'язково, моно-, ди- або тризаміщеним, незалежно, галогеном, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкілом, гідрокси, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкокси, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкілтіо, аміно, оксо, карбокси, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкілоксикарбонілом, моно-N- або ди-N,N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіламіном, де згаданий (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкільний замісник, необов'язково, має від одного до дев'яти атомів фтору; і

R<sup>5</sup> і R<sup>8</sup> є Н,

і її фармацевтично прийнятна сіль.

3. Сполука згідно з пунктом 2, де

W є карбонілом;

X є О-У, де У є (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкілом, згаданий (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкільний замісник, необов'язково, заміщений від одного до дев'яти атомами фтору або гідрокси;

Q є (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкілом і V є фенілом, піридинілом або піримідинілом;

де згадане V кільце є, необов'язково, моно-, ди- або тризаміщеним, незалежно, галогеном, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкілом, гідрокси, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкокси, нітро, ціано або оксо, де згаданий (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкільний замісник, необов'язково, має від одного до дев'яти атомів фтору;

R<sup>2</sup> є повністю насиченим (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) нерозгалуженим або розгалуженим вуглеводневим ланцюгом; або згаданий R<sup>2</sup> є повністю насиченим 3-5-членним кільцем; де згаданий R<sup>2</sup> ланцюг або кільце є, необов'язково, моно-, ди- або тризаміщеним, незалежно, галогеном;

R<sup>6</sup> і R<sup>7</sup> кожен є, незалежно, воднем, галогеном або (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкілом, згаданий (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкільний замісник, необов'язково, має від одного до дев'яти атомів фтору; і

її фармацевтично прийнятна сіль.

4. Сполука згідно з пунктом 3, де

Q є метилом і V є фенілом або піридинілом;

де згадане V кільце є, необов'язково, моно-, ди- або тризаміщеним, незалежно, галогеном, (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)алкілом або нітро, де згаданий (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)алкіл, необов'язково має від одного до п'яти атомів фтору, або її фармацевтично прийнятна сіль.

5. Сполука згідно з пунктом 1, де згаданою сполукою є:

[2S,4S]4-[(3,5-біс-трифторметилбензил)метоксикарбоніламіно]-2-ізопропіл-6-трифторметил-3,4-дигідро-2Н-хінолін-1-карбонової кислоти ізопропіловий естер;

[2S,4S]4-[(3,5-біс-трифторметилбензил)метоксикарбоніламіно]-6-хлор-2-циклопропіл-3,4-дигідро-2Н-хінолін-1-карбонової кислоти ізопропіловий естер;

[2S,4S]2-циклопропіл-4-[(3,5-дихлорбензил)метоксикарбоніламіно]-6-трифторметил-3,4-дигідро-2Н-хінолін-1-карбонової кислоти ізопропіловий естер;

[2S,4S]4-[(3,5-біс-трифторметилбензил)метоксикарбоніламіно]-2-циклопропіл-6-трифторметил-3,4-дигідро-2Н-хінолін-1-карбонової кислоти трет-бутиловий естер;

[2S,4S]4-[(3,5-біс-трифторметилбензил)метоксикарбоніламіно]-2-циклопропіл-6-трифторметил-3,4-дигідро-2Н-хінолін-1-карбонової кислоти ізопропіловий естер;

[2S,4S]4-[(3,5-біс-трифторметилбензил)метоксикарбоніламіно]-2-циклобутил-6-трифторметил-3,4-дигідро-2Н-хінолін-1-карбонової кислоти ізопропіловий естер;

або фармацевтично прийнятна сіль згаданих сполук.

6. Сполука згідно з пунктом 1, де згаданою сполукою є:

[2R,4S]4-[(3,5-біс-трифторметилбензил)метоксикарбоніламіно]-2-етил-6-трифторметил-3,4-дигідро-2Н-хінолін-1-карбонової кислоти ізопропіловий естер;

[2S,4S]4-[(3,5-біс-трифторметилбензил)метоксикарбоніламіно]-2-метоксиметил-6-трифторметил-3,4-дигідро-2Н-хінолін-1-карбонової кислоти ізопропіловий естер;

[2R,4S]4-[(3,5-біс-трифторметилбензил)метоксикарбоніламіно]-2-етил-6-трифторметил-3,4-дигідро-2Н-хінолін-1-карбонової кислоти 2-гідроксietиловий естер;

[2S,4S]4-[(3,5-біс-трифторметилбензил)метоксикарбоніламіно]-2-циклопропіл-6-трифторметил-3,4-дигідро-2Н-хінолін-1-карбонової кислоти етиловий естер;

[2R,4S]4-[(3,5-біс-трифторметилбензил)метоксикарбоніламіно]-2-етил-6-трифторметил-3,4-дигідро-2Н-хінолін-1-карбонової кислоти етиловий естер;

[2S,4S]4-[(3,5-біс-трифторметилбензил)метоксикарбоніламіно]-2-циклопропіл-6-трифторметил-3,4-дигідро-2Н-хінолін-1-карбонової кислоти пропіловий естер;

[2R,4S]4-[(3,5-біс-трифторметилбензил)метоксикарбоніламіно]-2-етил-6-трифторметил-3,4-дигідро-2Н-хінолін-1-карбонової кислоти пропіловий естер;

або її фармацевтично прийнятна сіль.

7. Сполука згідно з пунктом 4,

де У є ізопропілом;

R<sup>2</sup> є ізопропілом;

R<sup>3</sup> є 3,5-біс-трифторметилфенілметилом;

R<sup>4</sup> є метилом;

R<sup>6</sup> є трифторметилом; і

R<sup>7</sup> є Н, або її фармацевтично прийнятна сіль.

8. Сполука згідно з пунктом 4, де У є ізопропілом;

R<sup>2</sup> є циклопропілом;

R<sup>3</sup> є 3,5-біс-трифторметилфенілметилом;

R<sup>4</sup> є метилом;

R<sup>6</sup> є хлором; і

R<sup>7</sup> є Н, або її фармацевтично прийнятна сіль.

9. Сполука згідно з пунктом 4, де У є ізопропілом;

R<sup>2</sup> є циклопропілом;

R<sup>3</sup> є 3,5-дихлорфенілметилом;

$R^4$  є метилом;  
 $R^6$  є трифторметилом; i  
 $R^7$  є H, або її фармацевтично прийнятна сіль.  
10. Сполука згідно з пунктом 4, де  
Y є трет-бутилом;  
 $R^2$  є циклопропілом;  
 $R^3$  є 3,5-біс-трифторметилфенілметилом;  
 $R^4$  є метилом;  
 $R^6$  є трифторметилом; i  
 $R^7$  є H, або її фармацевтично прийнятна сіль.  
11. Сполука згідно з пунктом 4, де  
Y є ізопропілом;  
 $R^2$  є циклопропілом;  
 $R^3$  є 3,5-біс-трифторметилфенілметилом;  
 $R^4$  є метилом;  
 $R^6$  є трифторметилом; i  
 $R^7$  є H, або її фармацевтично прийнятна сіль.  
12. Сполука згідно з пунктом 4, де  
Y є ізопропілом;  
 $R^2$  є циклобутилом;  
 $R^3$  є 3,5-біс-трифторметилфенілметилом;  
 $R^4$  є метилом;  
 $R^6$  є трифторметилом; i  
 $R^7$  є H, або її фармацевтично прийнятна сіль.  
13. Сполука згідно з пунктом 4, де  
Y є ізопропілом;  
 $R^2$  є етилом;  
 $R^3$  є 3,5-біс-трифторметилфенілметилом;  
 $R^4$  є метилом;  
 $R^6$  є трифторметилом; i  
 $R^7$  є H, або її фармацевтично прийнятна сіль.  
14. Сполука згідно з пунктом 4, де  
Y є ізопропілом;  
 $R^2$  є метоксиметилом;  
 $R^3$  є 3,5-біс-трифторметилфенілметилом;  
 $R^4$  є метилом;  
 $R^6$  є трифторметилом; i  
 $R^7$  є H, або її фармацевтично прийнятна сіль.  
15. Сполука згідно з пунктом 4, де  
Y є 2-гідроксіетилом;  
 $R^2$  є етилом;  
 $R^3$  є 3,5-біс-трифторметилфенілметилом;  
 $R^4$  є метилом;  
 $R^6$  є трифторметилом; i  
 $R^7$  є H, або її фармацевтично прийнятна сіль.  
16. Сполука згідно з пунктом 4, де Y є етилом;  
 $R^2$  є циклопропілом;  
 $R^3$  є 3,5-біс-трифторметилфенілметилом;  
 $R^4$  є метилом;  
 $R^6$  є трифторметилом; i  
 $R^7$  є H, або її фармацевтично прийнятна сіль.  
17. Сполука згідно з пунктом 4, де  
Y є етилом;  
 $R^2$  є етилом;  
 $R^3$  є 3,5-біс-трифторметилфенілметилом;  
 $R^4$  є метилом;  
 $R^6$  є трифторметилом; i  
 $R^7$  є H, або її фармацевтично прийнятна сіль.  
18. Сполука згідно з пунктом 4, де  
Y є n-пропілом;  
 $R^2$  є циклопропілом;  
 $R^3$  є 3,5-біс-трифторметилфенілметилом;  
 $R^4$  є метилом;  
 $R^6$  є трифторметилом; i  
 $R^7$  є H, або її фармацевтично прийнятна сіль.  
19. Сполука згідно з пунктом 4, де  
Y є n-пропілом;  
 $R^2$  є етилом;  
 $R^3$  є 3,5-біс-трифторметилфенілметилом;  
 $R^4$  є метилом;  
 $R^6$  є трифторметилом; i  
 $R^7$  є H, або її фармацевтично прийнятна сіль.  
20. Сполука, що вибирають з групи, що вміщує:

[2S,4S]4-[(3,5-біс-трифторметилбензил)метоксикарбоніламіно]-2-ізопропіл-6-трифторметил-3,4-дигідро-2Н-хінолін-1-карбонової кислоти ізопропіловий естер;  
 [2S,4S]4-[(3,5-біс-трифторметилбензил)метоксикарбоніламіно]-6-хлор-2-циклопропіл-3,4-дигідро-2Н-хінолін-1-карбонової кислоти ізопропіловий естер;  
 [2S,4S]2-циклопропіл-4-[(3,5-дихлорбензил)метоксикарбоніламіно]-6-трифторметил-3,4-дигідро-2Н-хінолін-1-карбонової кислоти ізопропіловий естер;  
 [2S,4S]4-[(3,5-біс-трифторметилбензил)метоксикарбоніламіно]-2-циклопропіл-6-трифторметил-3,4-дигідро-2Н-хінолін-1-карбонової кислоти трет-бутиловий естер;  
 [2S,4S]4-[(3,5-біс-трифторметилбензил)метоксикарбоніламіно]-2-циклопропіл-6-трифторметил-3,4-дигідро-2Н-хінолін-1-карбонової кислоти ізопропіловий естер;  
 [2S,4S]4-[(3,5-біс-трифторметилбензил)метоксикарбоніламіно]-2-циклобутил-6-трифторметил-3,4-дигідро-2Н-хінолін-1-карбонової кислоти ізопропіловий естер;  
 [2R,4S]4-[(3,5-біс-трифторметилбензил)метоксикарбоніламіно]-2-етил-6-трифторметил-3,4-дигідро-2Н-хінолін-1-карбонової кислоти ізопропіловий естер;  
 [2S,4S]4-[(3,5-біс-трифторметилбензил)метоксикарбоніламіно]-2-метоксиметил-6-трифторметил-3,4-дигідро-2Н-хінолін-1-карбонової кислоти ізопропіловий естер;  
 [2R,4S]4-[(3,5-біс-трифторметилбензил)метоксикарбоніламіно]-2-етил-6-трифторметил-3,4-дигідро-2Н-хінолін-1-карбонової кислоти 2-гідроксietiловий естер;  
 [2S,4S]4-[(3,5-біс-трифторметилбензил)метоксикарбоніламіно]-2-циклопропіл-6-трифторметил-3,4-дигідро-2Н-хінолін-1-карбонової кислоти етиловий естер;  
 [2R,4S]4-[(3,5-біс-трифторметилбензил)метоксикарбоніламіно]-2-етил-6-трифторметил-3,4-дигідро-2Н-хінолін-1-карбонової кислоти етиловий естер;  
 [2S,4S]4-[(3,5-біс-трифторметилбензил)метоксикарбоніламіно]-2-циклопропіл-6-трифторметил-3,4-дигідро-2Н-хінолін-1-карбонової кислоти пропіловий естер;  
 [2R,4S]4-[(3,5-біс-трифторметилбензил)-метоксикарбоніламіно]-2-етил-6-трифторметил-3,4-дигідро-2Н-хінолін-1-карбонової кислоти пропіловий естер;  
 або їх фармацевтично прийнятна сіль.

21. Сполука згідно з пунктом 1, де

$R^2$  є бета;

$C^4$  азот є бета;

$R^1$  є W-X;

W є карбонілом, тіокарбонілом або сульфонілом;

X є -O-Y-, S-Y-, N(H)-Y- або -N(Y)<sub>2</sub>-;

Y для кожного випадку є, незалежно, Z або (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкілом, згаданий (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкіл, необов'язково, має від одного до дев'яти атомів фтору або згаданий (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкіл, необов'язково, монозаміщений Z;

де Z є частково насиченим, повністю насиченим або повністю ненасиченим 3-6-членним кільцем, що необов'язково має від одного до двох гетероатомів, що незалежно вибирають з кисню, сірки і азоту;

де згаданий Z замінює є, необов'язково, моно-, ди- або тризаміщеним, незалежно, галогеном, (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>)алкілтіо, нітро, ціано, оксо або (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкілоксикарбонілом, згаданий (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкільний замісник, необов'язково, замінює від одного до дев'яти атомами фтору;

$R^2$  є частково насиченим, повністю насиченим або повністю ненасиченим 1-4-членним нерозгалуженим або розгалуженим вуглеводневим ланцюгом, де вуглеці, інші ніж зв'язуючий вуглець, можуть, необов'язково, бути замінює одним гетероатомом, що незалежно вибирають з кисню, сірки і азоту, де згадані атоми вуглецю є, необов'язково, моно-, ди- або тризаміщеними, незалежно, галогеном, згаданий вуглець є, необов'язково, монозаміщеним оксо, згаданий вуглець є, необов'язково, монозаміщеним гідрокси, згаданий атом сірки є, необов'язково, моно- або дизаміщеним оксо, згаданий атом азоту є, необов'язково, моно- або дизаміщеним оксо; або згаданий  $R^2$  є частково насиченим, повністю насиченим або повністю ненасиченим 3-5-членним кільцем, що необов'язково має один гетероатом, що незалежно вибирають з кисню, сірки і азоту;

де згадане  $R^2$  кільце є, необов'язково, моно-, ди- або тризаміщеним, незалежно, галогеном, гідрокси, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкокси або (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкоксикарбонілом;

$R^3$  є Q-V, де Q є (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкілом і V є 5-6-членним частково насиченим, повністю насиченим або повністю ненасиченим кільцем, що необов'язково має від одного до трьох гетероатомів, що незалежно вибирають з кисню, сірки і азоту;

де згадане V кільце є, необов'язково, моно-, ди-, три- або тетразаміщеним, незалежно, галогеном, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкілом, гідрокси, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкокси, нітро, ціано або оксо, де згаданий (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкільний замісник, необов'язково, має від одного до дев'яти атомів фтору;

$R^4$  є (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкілом; і

$R^5$  і  $R^6$  або  $R^6$  і  $R^7$ , або  $R^7$  і  $R^8$  узяті разом і утворюють кільце, що є частково насиченим або повністю ненасиченим п'яти- або шестичленним кільцем, що необов'язково має від одного до двох гетероатомів, що незалежно вибирають з азоту, сірки і кисню;

де згадане кільце, утворене  $R^5$  і  $R^6$  або  $R^6$  і  $R^7$ , або  $R^7$  і  $R^8$  є, необов'язково, моно-, ди- або тризаміщеним, незалежно, галогеном, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкілом, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкілсульфонілом, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкенілом, гідрокси, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкокси, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкілтіо, аміно, нітро, ціано, оксо, карбокси, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкілоксикарбонілом, моно-N- або ди-N,N-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкіламіном, де згаданий (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкільний замісник є, необов'язково, моно-, ди- або тризаміщеним, незалежно, гідрокси, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкокси, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкілтіо, аміно, нітро, ціано, оксо, карбокси, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкілоксикарбонілом, моно-N- або ди-N,N-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкіламіном або згаданий (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкільний замісник, необов'язково, має від одного до дев'яти атомів фтору;

при умові, в залежності від обставин, що  $R^5$ ,  $R^6$ ,  $R^7$  і/або  $R^8$ , коли не утворюють кільце, є воднями;

або її фармацевтично прийнятна сіль.

22. Сполука згідно з пунктом 1, де

$R^2$  є бета;

$C^4$  азот є бета;

$R^1$  є W-Y;

W є карбонілом, тіокарбонілом або сульфонілом;

Y є (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкілом, згаданий (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл, необов'язково, має від одного до дев'яти атомів фтору або згаданий (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл, необов'язково, монозаміщений Z;

де Z є частково насиченим, повністю насиченим або повністю ненасиченим 3-6-членним кільцем, що необов'язково має від одного до двох гетероатомів, що незалежно вибирають з кисню, сірки і азоту;

де згаданий Z замісник є, необов'язково, моно-, ди- або тризаміщеним, незалежно, галогеном, (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>)алкілтіо, нітро, ціано, оксо або (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкілоксикарбонілом, згаданий (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкіл, необов'язково, заміщений від одного до дев'яти атомами фтору;

R<sup>2</sup> є частково насиченим, повністю насиченим або повністю ненасиченим 1-4-членним нерозгалуженим або розгалуженим вуглеводневим ланцюгом, де вуглеці, інші ніж зв'язуючий вуглець, можуть, необов'язково, бути заміщеними одним гетероатомом, що незалежно вибирають з кисню, сірки і азоту, де згадані атоми вуглецю є, необов'язково, моно-, ди- або тризаміщеними, незалежно, галогеном, згаданий вуглець є, необов'язково, монозаміщеним оксо, згаданий вуглець є, необов'язково, монозаміщеним гідрокси, згаданий атом сірки є, необов'язково, моно- або дизаміщеним оксо, згаданий атом азоту є, необов'язково, моно- або дизаміщеним оксо; або згаданий R<sup>2</sup> є частково насиченим, повністю насиченим або повністю ненасиченим 3-5-членним кільцем, що необов'язково має один гетероатом, що незалежно вибирають з кисню, сірки і азоту;

де згадане R<sup>2</sup> кільце є, необов'язково, моно-, ди- або тризаміщеним, незалежно, галогеном, гідрокси, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкокси або (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкоксикарбонілом;

R<sup>3</sup> є Q-V, де Q є (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкілом і V є п'яти- або шестичленним частково насиченим, повністю насиченим або повністю ненасиченим кільцем, що необов'язково має від одного до трьох гетероатомів, що незалежно вибирають з кисню, сірки і азоту;

де згадане V кільце є, необов'язково, моно-, ди-, три- або тетразаміщеним, незалежно, галогеном, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкілом, гідрокси, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкокси, нітро, ціано або оксо, де згаданий (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкільний замісник, необов'язково, має від одного до дев'яти атомів фтору;

R<sup>4</sup> є (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкілом;

R<sup>6</sup> і R<sup>7</sup> кожен є, незалежно, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкілом або (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкокси, згадані (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкільний або (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкокси замісники, необов'язково, мають від одного до дев'яти атомів фтору або згадані (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкокси або (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкільний замісники, необов'язково, моно-заміщені T;

де T є частково насиченим, повністю насиченим або повністю ненасиченим 5-6-членним кільцем, що необов'язково має від одного до двох гетероатомів, що незалежно вибирають з кисню, сірки і азоту;

де згаданий T замісник є, необов'язково, моно-, ди- або тризаміщеним, незалежно, галогеном, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкілом, гідрокси, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкокси, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкілтіо, аміно, оксо, карбокси, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкілоксикарбонілом, моно-N- або ди-N,N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіламіном, де згаданий (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкільний замісник, необов'язково, має від одного до дев'яти атомів фтору;

або R<sup>6</sup> і R<sup>7</sup> узяті разом і утворюють кільце, що є частково насиченим або повністю ненасиченим п'яти або шестичленним кільцем, що необов'язково має від одного до двох гетероатомів, що незалежно вибирають з азоту, сірки і кисню;

де згадане кільце, утворене R<sup>6</sup> і R<sup>7</sup> є, необов'язково, моно-, ди- або тризаміщеним, незалежно, галогеном, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкілом, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкілсульфонілом, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)алкенілом, гідрокси, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкокси, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкілтіо, аміно, нітро, ціано, оксо, карбокси, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкілоксикарбонілом, моно-N - або ди-N,N-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкіламіном, де згаданий (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкільний замісник, необов'язково, має від одного до дев'яти атомів фтору;

R<sup>5</sup> і R<sup>8</sup> є H;

або її фармацевтично прийнятна сіль.

23. Сполука згідно з пунктом 1, де

R<sup>2</sup> є бета;

C<sup>4</sup> азот є бета;

R<sup>1</sup> є Y;

Y є (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)алкенілом або (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкілом, згаданий (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)алкеніл або (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл, необов'язково, мають від одного до дев'яти атомів фтору або згаданий (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)алкеніл або (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл, необов'язково, монозаміщені Z;

де Z є частково насиченим, повністю насиченим або повністю ненасиченим 3-6-членним кільцем, що необов'язково має від одного до двох гетероатомів, що незалежно вибирають з кисню, сірки і азоту;

де згаданий Z замісник є, необов'язково, моно-, ди- або тризаміщеним, незалежно, галогеном, (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>)алкілтіо, нітро, ціано, оксо або (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкілоксикарбонілом, згаданий (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкільний замісник, необов'язково, заміщений від одного до дев'яти атомами фтору;

R<sup>2</sup> є частково насиченим, повністю насиченим або повністю ненасиченим 1-4 членним нерозгалуженим або розгалуженим вуглеводневим ланцюгом, де вуглеці, інші ніж зв'язуючий вуглець, можуть, необов'язково, бути заміщеними одним гетероатомом, що незалежно вибирають з кисню, сірки і азоту, де згадані атоми вуглецю є, необов'язково, моно-, ди- або тризаміщеними, незалежно, галогеном, згаданий вуглець є, необов'язково, монозаміщеним оксо, згаданий вуглець є, необов'язково, монозаміщеним гідрокси, згаданий атом сірки є, необов'язково, моно- або дизаміщеним оксо, згаданий атом азоту є, необов'язково, моно- або дизаміщеним оксо; або згаданий R<sup>2</sup> є частково насиченим, повністю насиченим або повністю ненасиченим 3-5-членним кільцем, що необов'язково має один гетероатом, що незалежно вибирають з кисню, сірки і азоту;

де згадане R<sup>2</sup> кільце є, необов'язково, моно-, ди- або тризаміщеним, незалежно, галогеном, гідрокси, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкокси або (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкоксикарбонілом;

R<sup>3</sup> є Q-V, де Q є (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкілом і V є п'яти- або шестичленним частково насиченим, повністю насиченим або повністю ненасиченим кільцем, що необов'язково має від одного до трьох гетероатомів, що незалежно вибирають з кисню, сірки і азоту;

де згадане V кільце є, необов'язково, моно-, ди-, три- або тетразаміщеним, незалежно, галогеном, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкілом, гідрокси, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкокси, нітро, ціано або оксо, де згаданий (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкільний замісник, необов'язково, має від одного до дев'яти атомів фтору;

R<sup>4</sup> є (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкілом;

$R^6$  і  $R^7$  кожен є, незалежно,  $(C_1-C_6)$ алкілом або  $(C_1-C_6)$ алкокси, згадані  $(C_1-C_6)$ алкільний або  $(C_1-C_6)$ алкокси замісники, необов'язково мають від одного до дев'яти атомів фтору або згадані  $(C_1-C_6)$ алкокси або  $(C_1-C_6)$ алкільний замісники, необов'язково, моно-заміщені Т,  
де Т є частково насиченим, повністю насиченим або повністю ненасиченим 5-6-членним кільцем, що необов'язково має від одного до двох гетероатомів, що незалежно вибирають з кисню, сірки і азоту;  
де згаданий Т замісник є, необов'язково, моно-, ди- або тризаміщеним, незалежно, галогеном,  $(C_1-C_6)$ алкілом, гідрокси,  $(C_1-C_6)$ алкокси,  $(C_1-C_4)$ алкілтіо, аміно, оксо, карбокси,  $(C_1-C_6)$ алкілоксикарбонілом, моно-N- або ди-N,N- $(C_1-C_4)$ алкіламіном, де згаданий  $(C_1-C_4)$ алкільний замісник, необов'язково, має від одного до дев'яти атомів фтору;  
або  $R^6$  і  $R^7$  узяті разом і утворюють кільце, що є частково насиченим або повністю ненасиченим п'яти- або шестичленним кільцем, що необов'язково має від одного до двох гетероатомів, що незалежно вибирають з азоту, сірки і кисню;  
де згадане кільце, утворене  $R^6$  і  $R^7$ , є, необов'язково, моно-, ди- або тризаміщеним, незалежно, галогеном,  $(C_1-C_4)$ алкілом,  $(C_1-C_4)$ алкілсульфонілом,  $(C_2-C_4)$ алкенілом, гідрокси,  $(C_1-C_4)$ алкокси,  $(C_1-C_4)$ алкілтіо, аміно, нітро, ціано, оксо, карбокси,  $(C_1-C_4)$ алкілоксикарбонілом, моно-N- або ди-N,N- $(C_1-C_4)$ алкіламіном, де згаданий  $(C_1-C_4)$ алкільний замісник, необов'язково, має від одного до дев'яти атомів фтору;  
 $R^5$  і  $R^8$  є Н, або її фармацевтично прийнятна сіль.

24. Сполука згідно з пунктом 1, де

$R^2$  є бета;

$C^4$  азот є бета;

$R^1$  є Z;

Z є частково насиченим, повністю насиченим або повністю ненасиченим 3-6-членним кільцем, що необов'язково має від одного до двох гетероатомів, що незалежно вибирають з кисню, сірки і азоту;

де згаданий Z замісник є, необов'язково, моно-, ди- або тризаміщеним, незалежно, галогеном,  $(C_1-C_4)$ алкілом,  $(C_1-C_4)$ алкокси,  $(C_1-C_4)$ алкілтіо, нітро, ціано, оксо або  $(C_1-C_6)$ алкілоксикарбонілом, згаданий  $(C_1-C_4)$ алкільний замісник, необов'язково має від одного до дев'яти атомів фтору;

$R^2$  є частково насиченим, повністю насиченим або повністю ненасиченим 1-4-членним нерозгалуженим або розгалуженим вуглеводневим ланцюгом, де вуглеці, інші ніж зв'язуючий вуглець, можуть, необов'язково, бути заміщеними одним гетероатомом, що незалежно вибирають з кисню, сірки і азоту, де згадані атоми вуглецю є, необов'язково, моно-, ди- або тризаміщеними, незалежно, галогеном, згаданий вуглець є, необов'язково, монозаміщеним оксо, згаданий вуглець є, необов'язково, монозаміщеним гідрокси, згаданий атом сірки є, необов'язково, моно- або дизаміщеним оксо, згаданий атом азоту є, необов'язково, моно- або дизаміщеним оксо; або згаданий  $R^2$  є частково насиченим, повністю насиченим або повністю ненасиченим 3-5-членним кільцем, що необов'язково має один гетероатом, що незалежно вибирають з кисню, сірки і азоту;

де згадане  $R^2$  кільце є, необов'язково, моно-, ди- або тризаміщеним, незалежно, галогеном, гідрокси,  $(C_1-C_6)$ алкокси або  $(C_1-C_6)$ алкоксикарбонілом;

$R^3$  є Q-V, де Q є  $(C_1-C_4)$ алкілом і V є п'яти- або шестичленним частково насиченим, повністю насиченим або повністю ненасиченим кільцем, що необов'язково має від одного до трьох гетероатомів, що незалежно вибирають з кисню, сірки і азоту;

де згадане V кільце є, необов'язково, моно-, ди-, три- або тетразаміщеним, незалежно, галогеном,  $(C_1-C_6)$ алкілом, гідрокси,  $(C_1-C_6)$ алкокси, нітро, ціано або оксо, де згаданий  $(C_1-C_6)$ алкільний замісник, необов'язково має від одного до дев'яти атомів фтору;

$R^4$  є  $(C_1-C_4)$ алкілом;

$R^6$  і  $R^7$  кожен є, незалежно,  $(C_1-C_6)$ алкілом або  $(C_1-C_6)$ алкокси, згадані  $(C_1-C_6)$ алкільний або  $(C_1-C_6)$ алкокси замісники, необов'язково мають від одного до дев'яти атомів фтору або згадані  $(C_1-C_6)$ алкокси або  $(C_1-C_6)$ алкільний замісники, необов'язково, моно-заміщені Т;

де Т є частково насиченим, повністю насиченим або повністю ненасиченим 5-6-членним кільцем, що необов'язково має від одного до двох гетероатомів, що незалежно вибирають з кисню, сірки і азоту;

де згаданий Т замісник є, необов'язково, моно-, ди- або тризаміщеним, незалежно, галогеном,  $(C_1-C_6)$ алкілом, гідрокси,  $(C_1-C_6)$ алкокси,  $(C_1-C_4)$ алкілтіо, аміно, оксо, карбокси,  $(C_1-C_6)$ алкілоксикарбонілом, моно-N- або ди-N,N- $(C_1-C_6)$ алкіламіном, де згаданий  $(C_1-C_6)$ алкільний замісник, необов'язково, має від одного до дев'яти атомів фтору;

або  $R^6$  і  $R^7$  узяті разом і утворюють кільце, що є частково насиченим або повністю ненасиченим п'яти- або шестичленним кільцем, що необов'язково має від одного до двох гетероатомів, що незалежно вибирають з азоту, сірки і кисню;

де згадане кільце, утворене  $R^6$  і  $R^7$ , є, необов'язково, моно-, ди- або тризаміщеним, незалежно, галогеном,  $(C_1-C_4)$ алкілом,  $(C_1-C_4)$ алкілсульфонілом,  $(C_2-C_4)$ алкенілом, гідрокси,  $(C_1-C_4)$ алкокси,  $(C_1-C_4)$ алкілтіо, аміно, нітро, ціано, оксо, карбокси,  $(C_1-C_4)$ алкілоксикарбонілом, моно-N- або ди-N,N- $(C_1-C_4)$ алкіламіном, де згаданий  $(C_1-C_4)$ алкільний замісник, необов'язково, має від одного до дев'яти атомів фтору;

$R^5$  і  $R^8$  є Н, або

її фармацевтично прийнятна сіль.

25. Сполука згідно з пунктом 1, де

$R^2$  є бета;

$C^4$  - азот є бета;

$R^1$  є W-Z;

W є карбонілом, тіокарбонілом або сульфонілом;

Z є частково насиченим, повністю насиченим або повністю ненасиченим 3-6-членним кільцем, що необов'язково має від одного до двох гетероатомів, що незалежно вибирають з кисню, сірки і азоту;

де згаданий Z замісник є, необов'язково, моно-, ди- або тризаміщеним, незалежно, галогеном,  $(C_1-C_4)$ алкілом,  $(C_1-C_4)$ алкокси,  $(C_1-C_4)$ алкілтіо, нітро, ціано, оксо, або  $(C_1-C_6)$ алкілоксикарбонілом, згаданий  $(C_1-C_4)$ алкільний замісник, необов'язково має від одного до дев'яти атомів фтору;

$R^2$  є частково насиченим, повністю насиченим або повністю ненасиченим 1-4-членним нерозгалуженим або розгалуженим вуглеводневим ланцюгом, де вуглеці, інші ніж зв'язуючий вуглець, можуть, необов'язково, бути

заміщеними одним гетероатомом, що незалежно вибирають з кисню, сірки і азоту, де згадані атоми вуглецю є, необов'язково, моно-, ди- або тризаміщеними, незалежно, галогеном, згаданий вуглець є, необов'язково, монозаміщеним оксо, згаданий вуглець є, необов'язково, монозаміщеним гідрокси, згаданий атом сірки є, необов'язково, моно- або дизаміщеним оксо, згаданий атом азоту є, необов'язково, моно- або дизаміщеним оксо; або згаданий  $R^2$  є частково насиченим,

повністю насиченим або повністю ненасиченим 3-5-членним кільцем, що необов'язково має один гетероатом, що незалежно вибирають з кисню, сірки і азоту;

де згадане  $R^2$  кільце є, необов'язково, моно-, ди- або тризаміщеним, незалежно, галогеном, гідрокси,  $(C_1-C_6)$ алкокси або  $(C_1-C_6)$ алкоксикарбонілом;

$R^3$  є Q-V, де Q є  $(C_1-C_4)$ алкілом і V є п'яти- або шестичленним частково насиченим, повністю насиченим або повністю ненасиченим кільцем, що необов'язково має від одного до трьох гетероатомів, що незалежно вибирають з кисню, сірки і азоту;

де згадане V кільце є, необов'язково, моно-, ди-, три- або тетразаміщеним, незалежно, галогеном,  $(C_1-C_6)$ алкілом, гідрокси,  $(C_1-C_6)$ алкокси, нітро, ціано або оксо, де згаданий  $(C_1-C_6)$ алкільний замісник, необов'язково, має від одного до дев'яти атомів фтору;

$R^4$  є  $(C_1-C_4)$ алкілом;

$R^6$  і  $R^7$  кожен є, незалежно,  $(C_1-C_6)$ алкілом або  $(C_1-C_6)$ алкокси, згадані  $(C_1-C_6)$ алкільний або  $(C_1-C_6)$ алкокси замісники, необов'язково, мають від одного до дев'яти атомів фтору або згадані  $(C_1-C_6)$ алкокси або  $(C_1-C_6)$ алкільний замісники, необов'язково, моно-заміщені T;

де T є частково насиченим, повністю насиченим або повністю ненасиченим 5-6-членним кільцем, що необов'язково мають від одного до двох гетероатомів, що незалежно вибирають з кисню, сірки і азоту;

де згаданий T замісник є, необов'язково, моно-, ди- або тризаміщеним, незалежно, галогеном,  $(C_1-C_6)$ алкілом, гідрокси,  $(C_1-C_6)$ алкокси,  $(C_1-C_4)$ алкілію, аміно, оксо, карбокси,  $(C_1-C_6)$ алкілоксикарбонілом, моно-N- або ди-N,N- $(C_1-C_6)$ алкіламіном, де згаданий  $(C_1-C_6)$ алкільний замісник, необов'язково, має від одного до дев'яти атомів фтору;

або  $R^6$  і  $R^7$  узяті разом і утворюють кільце, що є частково насиченим або повністю ненасиченим п'яти- або шестичленним кільцем, що необов'язково має від одного до двох гетероатомів, що незалежно вибирають з азоту, сірки і кисню;

де згадане кільце, утворене  $R^6$  і  $R^7$ , є, необов'язково, моно-, ди- або тризаміщеним, незалежно, галогеном,  $(C_1-C_4)$ алкілом,  $(C_1-C_4)$ алкілсульфонілом,  $(C_1-C_4)$ алкенілом,

гідрокси,  $(C_1-C_4)$ алкокси,  $(C_1-C_4)$ алкілію, аміно, нітро, ціано, оксо, карбокси,  $(C_1-C_4)$ алкілоксикарбонілом, моно-N- або ди-N,N- $(C_1-C_4)$ алкіламіном, де згаданий  $(C_1-C_4)$ алкільний замісник, необов'язково, має від одного до дев'яти атомів фтору;

$R^5$  і  $R^8$  є H, або

її фармацевтично прийнятна сіль.

26. Сполука згідно з пунктом 1, де

$R^2$  є бета;

$C^4$  азот є бета;

$R^1$  є W-X;

W є карбонілом, тіокарбонілом або сульфонілом;

X є -O-Y-, S-Y-, N(H)-Y- або -N(Y)<sub>2</sub>;

Y для кожного випадку є, незалежно, Z або  $(C_1-C_4)$ алкілом, згаданий  $(C_1-C_4)$ алкільний замісник, необов'язково, має від одного до дев'яти атомів фтору або згаданий  $(C_1-C_4)$ алкіл, необов'язково, монозаміщений Z;

де Z є частково насиченим, повністю насиченим або повністю ненасиченим 3-6-членним кільцем, що необов'язково має від одного до двох гетероатомів, що незалежно вибирають з кисню, сірки і азоту;

де згаданий Z замісник є, необов'язково, моно-, ди- або тризаміщеним, незалежно, галогеном,  $(C_1-C_4)$ алкілом,  $(C_1-C_4)$ алкокси,  $(C_1-C_4)$ алкілію, нітро, ціано, оксо або  $(C_1-C_4)$ алкілоксикарбонілом, згаданий  $(C_1-C_4)$ алкільний замісник, необов'язково, заміщений від одного до дев'яти атомами фтору;

$R^2$  є частково насиченим, повністю насиченим або повністю ненасиченим 1-4-членним нерозгалуженим або розгалуженим вуглеводневим ланцюгом, де вуглеці, інші ніж зв'язуючий вуглець, можуть, необов'язково, бути заміщеними одним гетероатомом, що незалежно вибирають з кисню, сірки і азоту, де згадані атоми вуглецю є, необов'язково, моно-, ди- або тризаміщеними, незалежно, галогеном, згаданий вуглець є, необов'язково, монозаміщеним оксо, згаданий вуглець є, необов'язково, монозаміщеним гідрокси, згаданий атом сірки є, необов'язково, моно- або дизаміщеним оксо, згаданий атом азоту є, необов'язково, моно- або дизаміщеним оксо; або згаданий  $R^2$  є частково насиченим, повністю насиченим або повністю ненасиченим 3-5-членним кільцем, що необов'язково має один гетероатом, що незалежно вибирають з кисню, сірки і азоту;

де згадане  $R^2$  кільце є, необов'язково, моно-, ди- або тризаміщеним, незалежно, галогеном, гідрокси,  $(C_1-C_6)$ алкокси або  $(C_1-C_6)$ алкоксикарбонілом;

$R^3$  є Q-V, де Q є  $(C_1-C_4)$ алкілом і V є п'яти- або шестичленним частково насиченим, повністю насиченим або повністю ненасиченим кільцем, що необов'язково має від одного до трьох гетероатомів, що незалежно вибирають з кисню, сірки і азоту;

де згадане V кільце є, необов'язково, моно-, ди-, три- або тетразаміщеним, незалежно, галогеном,  $(C_1-C_6)$ алкілом, гідрокси,  $(C_1-C_6)$ алкокси, нітро, ціано або оксо, де згаданий  $(C_1-C_6)$ алкільний замісник, необов'язково, має від одного до дев'яти атомів фтору;

$R^4$  є  $(C_1-C_4)$ алкілом;

принаймні одна з  $R^6$  і  $R^7$  є  $(C_1-C_4)$ алкокси і принаймні один з  $R^6$  і  $R^7$  є  $(C_1-C_6)$ алкілом, згадані  $(C_1-C_6)$ алкільний і  $(C_1-C_4)$ алкокси замісники, необов'язково мають від одного до дев'яти атомів фтору або згадані  $(C_1-C_6)$ алкільний і  $(C_1-C_4)$ алкокси замісники, необов'язково, монозаміщені T;

де T є частково насиченим, повністю насиченим або повністю ненасиченим 5-6-членним кільцем, що необов'язково мають від одного до двох гетероатомів, що незалежно вибирають з кисню, сірки і азоту;

де згаданий T замісник є, необов'язково, моно-, ди- або тризаміщеним, незалежно, галогеном,  $(C_1-C_6)$ алкілом, гідрокси,  $(C_1-C_6)$ алкокси,  $(C_1-C_4)$ алкілію, аміно, оксо, карбокси,  $(C_1-C_6)$ алкілоксикарбонілом, моно-N- або ди-N,N-

(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіламіном, де згаданий (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкільний замісник, необов'язково, має від одного до дев'яти атомів фтору;

R<sup>5</sup> і R<sup>8</sup> є H, або

її фармацевтично прийнятна сіль.

27. Спосіб лікування атеросклерозу, периферійного васкулярного захворювання, дісліпідемії, гіпербеталіпопротеїнемії, гіпоальфаліпопротеїнемії, гіперхолестеролемії, гіпертригліцеридемії, спадкової гіперхолестеролемії, кардіоваскулярних захворювань, ангіни, ішемії, серцевої ішемії, інсульту, інфаркту міокарда, реперфузивних ушкоджень, ангіопластичного рестенозу, гіпертензії, васкулярних ушкоджень, спричинених діабетом, ожиріння або ендотоксемії у ссавця (включаючи людину, що є або чоловіком, або жінкою), в якому призначають ссавцю, що потребує лікування атеросклерозу, периферійного васкулярного захворювання, дісліпідемії, гіпербеталіпопротеїнемії, гіпоальфаліпопротеїнемії, гіперхолестеролемії, гіпертригліцеридемії, спадкової гіперхолестеролемії, кардіоваскулярних захворювань, ангіни, ішемії, серцевої ішемії, інсульту, інфаркту міокарда, реперфузивних ушкоджень, ангіопластичного рестенозу, гіпертензії, васкулярних ушкоджень, спричинених діабетом, ожиріння або ендотоксемії, лікувальної кількості сполуки згідно з пунктом 1, її пролікарської форми або фармацевтично прийнятної солі згаданої сполуки або згаданої пролікарської форми.

28. Спосіб згідно з пунктом 27, де лікують атеросклероз.

29. Спосіб згідно з пунктом 27, де лікують периферійне васкулярне захворювання.

30. Спосіб згідно з пунктом 27, де лікують дісліпідемію.

31. Спосіб згідно з пунктом 27, де лікують гіпербеталіпопротеїнемію.

32. Спосіб згідно з пунктом 27, де лікують гіпоальфаліпопротеїнемію.

33. Спосіб згідно з пунктом 27, де лікують гіперхолестеролемію.

34. Спосіб згідно з пунктом 27, де лікують гіпертригліцеридемію.

35. Спосіб згідно з пунктом 27, де лікують кардіоваскулярні захворювання.

36. Фармацевтична композиція, яка містить терапевтично ефективну кількість сполуки згідно з пунктом 1, її пролікарську форму або фармацевтично прийнятну сіль згаданої сполуки або згаданої пролікарської форми і фармацевтично прийнятний носій.

37. Фармацевтична композиція для лікування атеросклерозу, периферійного васкулярного захворювання, дісліпідемії, гіпербеталіпопротеїнемії, гіпоальфаліпопротеїнемії, гіперхолестеролемії, гіпертригліцеридемії, спадкової гіперхолестеролемії, кардіоваскулярних захворювань, ангіни, ішемії, серцевої ішемії, інсульту, інфаркту міокарда, реперфузивних ушкоджень, ангіопластичного рестенозу, гіпертензії, васкулярних ушкоджень, спричинених діабетом, ожиріння або ендотоксемії у ссавця, яка містить терапевтично ефективну кількість сполуки згідно з пунктом 1, її пролікарську форму або фармацевтично прийнятну сіль згаданої сполуки або згаданої пролікарської форми і фармацевтично прийнятний носій.

38. Фармацевтична композиція для лікування атеросклерозу у ссавця, яка містить ефективну для лікування атеросклерозу кількість сполуки згідно з пунктом 1, її пролікарську форму або фармацевтично прийнятну сіль згаданої сполуки або згаданої пролікарської форми і фармацевтично прийнятний носій.

39. Фармацевтична комбінована композиція, що включає терапевтично ефективну кількість композиції, що містить першу сполуку, згадану першою сполукою є сполука згідно з пунктом 1, її пролікарська форма або фармацевтично прийнятна сіль згаданої сполуки або згаданої пролікарської форми; другу сполуку, згадану другою сполукою є інгібітор HMG-CoA-редуктази, інгібітор секреції ППМТ/Аро В, активатор PPAR, інгібітор повторного поглинання жовчної кислоти, інгібітор абсорбції холестеролу, інгібітор синтезу холестеролу, фібрат, ніацин, іонообмінна смола, антиоксидант, інгібітор ACAT або секвестрант жовчної кислоти; і фармацевтичний носій.

40. Фармацевтична комбінована композиція згідно з пунктом 39, де другою сполукою є інгібітор HMG-CoA-редуктази або інгібітор секреції ППМТ/Аро В.

41. Фармацевтична комбінована композиція згідно з пунктом 39, де другою сполукою є ловастатин, симвастатин, правастатин, флувастатин, аторвастатин або ривастатин.

42. Спосіб лікування атеросклерозу у ссавця, в якому вводять ссавцю, що потребує такого лікування, першу сполуку, згадану першою сполукою є сполука згідно з пунктом 1, її пролікарська форма або фармацевтично прийнятна сіль згаданої сполуки або згаданої пролікарської форми; і другу сполуку, згадану другою сполукою є інгібітор HMG-CoA-редуктази, інгібітор секреції ППМТ/Аро В, активатор PPAR, інгібітор повторного поглинання жовчної кислоти, інгібітор абсорбції холестеролу, інгібітор синтезу холестеролу, фібрат, ніацин, іонообмінна смола, антиоксидант, інгібітор ACAT або секвестрант жовчної кислоти, де кількості першої і другої сполук підібрані таким чином, що дають терапевтичний ефект.

43. Спосіб лікування атеросклерозу згідно з пунктом 42, в якому другою сполукою є інгібітор HMG-CoA-редуктази або інгібітор секреції ППМТ/Аро В.

44. Спосіб лікування атеросклерозу згідно з пунктом 42, в якому другою сполукою є ловастатин, симвастатин, правастатин, флувастатин, аторвастатин або ривастатин.

45. Набір, що містить:

а) першу сполуку, згадану першою сполукою є сполука згідно з пунктом 1, її пролікарська форма або фармацевтично прийнятна сіль згаданої сполуки або згаданої пролікарської форми і фармацевтично прийнятний носій, у вигляді першої дозованої форми;

б) другу сполуку, згадану другою сполукою є інгібітор HMG-CoA-редуктази, інгібітор секреції ППМТ/Аро В, активатор PPAR, інгібітор повторного поглинання жовчної кислоти, інгібітор абсорбції холестеролу, інгібітор синтезу холестеролу, фібрат, ніацин, іонообмінна смола, антиоксидант, інгібітор ACAT або секвестрант жовчної кислоти і фармацевтично прийнятний носій, у вигляді другої дозованої форми; і

в) контейнер, що містить згадані першу і другу дозовані форми, де кількості першої і другої сполук забезпечують терапевтичний ефект.

46. Набір згідно з пунктом 45, де згадану другою сполукою є інгібітор HMG-CoA-редуктази або інгібітор секреції ППМТ/Аро В.

47. Набір згідно з пунктом 45, де згадану другою сполукою є ловастатин, симвастатин, правастатин, флувастатин, аторвастатин або ривастатин.