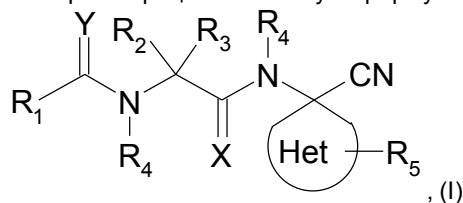


1. Спірогетероциклічні сполуки формули (I):



у якій

Het означає піперидиніл, піролідиніл, азетидиніл, тетрагідропіраніл, тетрагідротіопіраніл, тетрагідрофураніл, гексагідропіримідиніл, гексагідропіридазиніл, піперазиніл, 1,4,5,6-тетрагідропіримідин-2-іламін, дигідрооксазоліл, 1,2-тіазинаніл-1,1-діоксид, 1,2,6-тіадіазинаніл-1,1-діоксид, ізотіазолідиніл-1,1-діоксид або імідазолідиніл-2,4-діон, кожний з яких необов'язково заміщений одним або більше радикалами R₅,

Y означає O або S,

R₁ означає C₁₋₅алкіл, C₁₋₅алкоксигрупу, арилоксигрупу, C₃₋₇циклоалкіл, феніл, бензил, нафтил, тетрагідронафтил, C₁₋₅алкілсульфонілC₁₋₅алкіл, C₃₋₇циклоалкілсульфонілC₁₋₅алкіл, арилсульфонілC₁₋₅алкіл, піролідиніл, піперидиніл, морфолініл, тіоморфолініл, піперазиніл, індолініл, піраніл, тіопіраніл, фураніл, тієніл, піроліл, оксазоліл, ізоксазоліл, тіазоліл, імідазоліл, піридиніл, піримідиніл, піразиніл, індоліл, бензофураніл, бензотієніл, бензимидазоліл, бензтіазоліл, хінолініл, ізохінолініл, хіназолініл, бензоксазоліл, хіноксалиніл або аміногрупу, при цьому R₁ необов'язково заміщений одним або більше радикалами R_a, де

R_a являє собою C₁₋₅алкіл, C₃₋₇циклоалкіл, феніл, нафтил, піролідиніл, піперидиніл, морфолініл, тіоморфолініл, піперазиніл, індолініл, фураніл, тієніл, піроліл, оксазоліл, тіазоліл, імідазоліл, триазоліл, тетразоліл, піридиніл, піримідиніл, піразиніл, індоліл, бензофураніл, бензотієніл, бензимидазоліл, бензтіазоліл, бензоксазоліл, бензізоксазоліл, хінолініл, ізохінолініл, хіназолініл, хіноксалиніл, C₁₋₅алкоксигрупу, C₁₋₅алканоліл, C₁₋₅алканолілоксигрупу, арилоксигрупу, бензілоксигрупу, C₁₋₅алкоксикарбоніл, арилоксикарбоніл, ароїлоксигрупу, карбамоїл, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C₁₋₈алкілом, арилом, піролідинілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом, піперазинілом, індолінілом, фуранілом, тієнілом, піролілом, оксазолілом, тіазолілом, імідазолілом, триазолілом, тетразолілом, піридинілом, піримідинілом, піразинілом, індолілом, бензофуранілом, бензотієнілом, бензимидазолілом, бензтіазолілом, хінолінілом, ізохінолінілом, хіназолінілом або хіноксалинілом, або R_a являє собою C₁₋₅алканоліламіногрупу, ароїламіногрупу, C₁₋₅алкілтіогрупу, арилтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, уреїдогрупу, де будь-який атом азоту може бути незалежно заміщений алкілом, арилом, піролідинілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом, піперазинілом, індолінілом, фуранілом, тієнілом, піролілом, оксазолілом, тіазолілом, імідазолілом, триазолілом, тетразолілом, піридинілом, піримідинілом, піразинілом, індолілом, бензофуранілом, бензотієнілом, бензимидазолілом, бензтіазолілом, хінолінілом, ізохінолінілом, хіназолінілом або хіноксалинілом, C₁₋₅алкоксикарбоніламіногрупу, арилоксикарбоніламіногрупу, C₁₋₅алкілкарбамоїлоксигрупу, арилкарбамоїлоксигрупу, C₁₋₅алкілсульфоніламіногрупу, арилсульфоніламіногрупу, C₁₋₅алкіламіносальфоніл, ариламіносальфоніл, аміногрупу, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений алкілом, арилом, піролідинілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом, піперазинілом, індолінілом, фуранілом, тієнілом, піролілом, оксазолілом, тіазолілом, імідазолілом, триазолілом, тетразолілом, піридинілом, піримідинілом, піразинілом, індолілом, бензофуранілом, бензотієнілом, бензимидазолілом, бензтіазолілом, хінолінілом, ізохінолінілом, хіназолінілом або хіноксалинілом, галоген, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу, ціаногрупу, нітрогрупу, амідногрупу або гуанідногрупу, при цьому R_a додатково необов'язково може бути заміщений одним або більше радикалами R_b, де

R_b означає C₁₋₅алкіл, C₃₋₆циклоалкіл, арил, C₁₋₅алкоксигрупу, арилоксигрупу, бензілоксигрупу, галоген, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу, ціаногрупу, нітрогрупу, амідногрупу або гуанідногрупу,

R₂ означає водень або C₁₋₃алкіл,

R₃ означає водень, C₁₋₅алкіл, C₂₋₅алкілен, C₃₋₇циклоалкіл, арилC₁₋₃алкіл або арил, при цьому R₃ необов'язково заміщений одним або більше радикалами R_c, де

R_c являє собою C₁₋₅алкіл, C₃₋₇циклоалкіл, арил, піролідиніл, піперидиніл, морфолініл, тіоморфолініл, піперазиніл, індолініл, фураніл, тієніл, піроліл, оксазоліл, тіазоліл, імідазоліл, піразоліл, триазоліл, тетразоліл, піридиніл, піримідиніл, піразиніл, індоліл, бензофураніл, бензотієніл, бензимидазоліл, бензтіазоліл, хінолініл, ізохінолініл, хіназолініл, хіноксалиніл, C₁₋₅алкоксигрупу, арилоксигрупу, C₁₋₅алканоліл, ароїл, C₁₋₅алкоксикарбоніл, арилоксикарбоніл, C₁₋₅алканолілоксигрупу, ароїлоксигрупу, карбамоїл, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C₁₋₅алкілом, арилом, піролідинілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом, піперазинілом, індолінілом, фуранілом, тієнілом, піролілом, оксазолілом, тіазолілом, імідазолілом, триазолілом, тетразолілом, піридинілом, піримідинілом, піразинілом, індолілом, бензофуранілом, бензотієнілом, бензимидазолілом, бензтіазолілом, хінолінілом, ізохінолінілом, хіназолінілом або хіноксалинілом, або

R_c являє собою C_{1-5} алканоїламіногрупу, ароїламіногрупу, C_{1-5} алкілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, арилтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, уреїдогрупу, де будь-який атом азоту може бути незалежно заміщений C_{1-5} алкілом, арилом, піролідінілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом, піперазинілом, індолінілом, фуранілом, тієнілом, піролілом, оксазолілом, тiazолілом, імідазолілом, триазолілом, тетразолілом, піридинілом, піримідинілом, піразинілом, індолілом, бензофуранілом, бензотієнілом, бензімідазолілом, бензтіазолілом, хінолінілом, ізохінолінілом, хіназолінілом або хіноксалінілом, C_{1-5} алкоксикарбоніламіногрупу, арилоксикарбоніламіногрупу, C_{1-5} алкілкарбамоїлоксигрупу, арилкарбамоїлоксигрупу, C_{1-5} алкілсульфоніламіногрупу, арилсульфоніламіногрупу, C_{1-5} алкіламіносульфоніл, ариламіносульфоніл, аміногрупу, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C_{1-5} алкілом, арилом, піролідінілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом, піперазинілом, індолінілом, фуранілом, тієнілом, піролілом, оксазолілом, тiazолілом, імідазолілом, триазолілом, тетразолілом, піридинілом, піримідинілом, піразинілом, індолілом, бензофуранілом, бензотієнілом, бензімідазолілом, бензтіазолілом, хінолінілом, ізохінолінілом, хіназолінілом або хіноксалінілом, галоген, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу, ціаногрупу, нітрогрупу, амідиногрупу або гуанідиногрупу, при цьому R_c додатково необов'язково може бути заміщений одним або більше радикалами R_d , де R_d означає C_{1-5} алкіл, C_{3-6} циклоалкіл, арил, арилалкіл, C_{1-5} алкоксигрупу, арилоксигрупу, арил C_{1-5} алкоксигрупу, ароїл, аміногрупу, галоген, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу, ціаногрупу, нітрогрупу, амідиногрупу або гуанідиногрупу, R_4 означає водень або C_{1-3} алкіл,

R_5 означає C_{1-5} алкільний ланцюг, необов'язково перерваний одним або двома атомами O або S, феніл, нафтил, арил C_{1-3} алкіл, фураніл, тієніл, піроліл, імідазоліл, піридиніл, піримідиніл, C_{1-5} алканоїл, ароїл, C_{1-5} алкоксикарбоніл, арилоксикарбоніл, бензилоксикарбоніл, карбамоїл, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C_{1-5} алкілом, арилом, піролідінілом, піперидинілом, морфолінілом, піперазинілом, фуранілом, тієнілом, піролілом, тiazолілом, імідазолілом, піридинілом, бензімідазолілом або хінолінілом, або

R_5 означає C_{1-5} алканоїламіногрупу, ароїламіногрупу, C_{1-5} алкілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, арилтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, C_{1-5} алкілсульфоніламіногрупу, арилсульфоніламіногрупу, C_{1-5} алкіламіносульфоніл, ариламіносульфоніл, аміногрупу, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений алкілом, арилом, піролідінілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом, піперазинілом, індолінілом, фуранілом, тієнілом, піролілом, оксазолілом, тiazолілом, імідазолілом, триазолілом, тетразолілом, піридинілом, піридинілкарбонілом, піримідинілом, піразинілом, індолілом, бензофуранілом, бензотієнілом, бензімідазолілом, бензтіазолілом, хінолінілом, ізохінолінілом, хіназолінілом, хіноксалінілом або арилсульфонілом, або

R_5 означає галоген, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу, ціаногрупу, нітрогрупу, амідиногрупу або гуанідиногрупу, при цьому R_5 додатково необов'язково може бути заміщений одним або більше радикалами R_e , де

R_e являє собою C_{1-5} алкіл, C_{3-6} циклоалкіл, арил, піролідініл, піперидиніл, морфолініл, тіоморфолініл, піперазиніл, індолініл, піраніл, тіопіраніл, фураніл, тієніл, піроліл, оксазоліл, тiazоліл, імідазоліл, піридиніл, піримідиніл, піразиніл, індоліл, бензофураніл, бензотієніл, бензімідазоліл, бензтіазоліл, хінолініл, ізохінолініл, хіназолініл, бензоксазоліл, хіноксалініл, C_{1-5} алкоксигрупу, арилоксигрупу, ароїл, аміногрупу, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C_{1-5} алкілом, арилом, піролідінілом, піперидинілом, морфолінілом, фуранілом, тієнілом, піролілом або піридинілом, галоген, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу, ціаногрупу, нітрогрупу, бензилоксигрупу, арил C_{1-3} алкоксикарбоніл, амідиногрупу або гуанідиногрупу, і

X означає O або S,

та їх фармацевтично прийнятні похідні.

2. Сполука за п. 1, у якій

Het означає піперидиніл, піролідиніл, тетрагідропіраніл або тетрагідротіопіраніл, при цьому кожне з вказаних кілець заміщене одним або більше радикалами R_5 ,

Y означає O,

R_1 означає C_{1-3} алкіл, C_{1-3} алкоксигрупу, C_{3-7} циклоалкіл, феніл, бензил, нафтил, тетрагідронафтил, піперидиніл, морфолініл, піперазиніл, фураніл, тієніл, піридиніл, ізоксазоліл, піразиніл, індоліл, хінолініл, бензофураніл, бензімідазоліл, бензоізоксазоліл або аміногрупу, при цьому R_1 необов'язково заміщений одним або більше радикалами R_a , де

R_a являє собою C_{1-3} алкіл, феніл, нафтил, піперидиніл, індолініл, морфолініл, піперазиніл, фураніл, тієніл, бензімідазоліл, C_{1-3} алкоксигрупу, C_{1-3} алканоїл, феноксигрупу, нафтилоксигрупу, бензилоксигрупу, C_{1-3} алкоксикарбоніл, бензоїлоксигрупу, карбамоїл, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C_{1-5} алкілом, фенілом, піперидинілом, морфолінілом, піперазинілом, фуранілом, тієнілом або піридинілом, або

R_a являє собою C_{1-5} алканоїламіногрупу, бензоїламіногрупу, C_{1-3} алкілсульфоніл, фенілсульфоніл, уреїдогрупу, де будь-який атом азоту може бути незалежно заміщений алкілом, фенілом, піперидинілом, морфолінілом, фуранілом, тієнілом або піридинілом, C_{1-3} алкоксикарбоніламіногрупу, C_{1-5} алкілкарбамоїлоксигрупу, C_{1-5} алкілсульфоніламіногрупу,

фенілсульфоніламіногрупу, C₁₋₅алкіламіносульфоніл, феніламіносульфоніл, аміногрупу, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C₁₋₅алкілом, фенілом, піперидинілом, морфолінілом, піперазинілом, фуранілом, тієнілом або піридинілом, галоген, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу, нітрогрупу або ціаногрупу, при цьому R_a додатково необов'язково може бути заміщений одним або більше радикалами R_b, де

R_b являє собою галоген, гідроксигрупу, бензилоксигрупу, оксогрупу або ціаногрупу,

R₂ означає водень,

R₃ означає C₁₋₅алкіл або C₂₋₅алкілен, C₄₋₆циклоалкіл або бензил, при цьому R₃ необов'язково заміщений одним або більше радикалами R_c, де

R_c являє собою C₁₋₄алкіл, C₅₋₆циклоалкіл, феніл, нафтил, C₁₋₄алкоксигрупу, феноксигрупу, бензоїлгрупу, бензилоксигрупу, індолініл, імідазоліл, C₁₋₃алкілтіогрупу, C₁₋₃алкілсульфоніл, галоген, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу, нітрогрупу або ціаногрупу, причому R_c додатково необов'язково може бути заміщений одним або більше радикалами R_d, де

R_d означає метил, феніл, бензил, бензилоксигрупу, C₁₋₃алкоксигрупу, галоген, гідроксигрупу, нітрогрупу або ціаногрупу,

R₄ означає водень,

R₅ означає C₁₋₄алкільний ланцюг, необов'язково перерваний одним атомом O або S, феніл, фенілC₁₋₂алкіл, фураніл, піримідиніл, тієніл, C₁₋₃алканоліл, бензоїл, C₁₋₄алкоксикарбоніл, карбамоїл, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C₁₋₅алкілом, фенілом, піперидинілом, морфолінілом, піперазинілом, фуранілом, тієнілом або піридинілом, C₁₋₃алкілтіогрупу, фенілтіогрупу, C₁₋₅алкіламіносульфоніл, феніламіносульфоніл, C₁₋₅алкіламіногрупу, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений нафтилсульфонілом або піридинілкарбонілом, галоген, гідроксигрупу, карбоксигрупу, оксогрупу або ціаногрупу, при цьому R₅ додатково необов'язково може бути заміщений одним або більше радикалами R_e, де

R_e являє собою C₁₋₃алкіл, C₅₋₆циклоалкіл, феніл, нафтилметил, піперидиніл, морфолініл, піперазиніл, імідазоліл, піридиніл, піримідиніл, піразиніл, бензімідазоліл, хінолініл, ізохінолініл, C₁₋₄алкоксигрупу, бензоїл, аміногрупу, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C₁₋₅алкілом, фенілом, піперидинілом, морфолінілом, фуранілом, тієнілом або піридинілом, галоген, гідроксигрупу, оксогрупу або ціаногрупу, і

X означає O.

3. Сполука за п. 2, у якій

R₁ означає метил, етил, феніл, піперидиніл, морфолініл, піперазиніл, піридиніл, піразиніл, фураніл, тієніл, бензил, бензофураніл, циклогексил, хінолініл або аміногрупу, при цьому R₁ необов'язково заміщений одним або більше радикалами R_a, де

R_a являє собою C₁₋₃алкіл, феніл, піперидиніл, тієніл, C₁₋₃алкоксигрупу, феноксигрупу, C₁₋₃алканоліл, C₁₋₃алкоксикарбоніл, бензилоксигрупу, C₁₋₃алканоліламіногрупу, тіофеніл, бензімідазоліл, C₁₋₃алкілтіогрупу або хлор, причому R_a додатково необов'язково може бути заміщений одним або більше радикалами R_b, де

R_b означає бром, хлор, фтор, йод, гідроксигрупу, оксогрупу або ціаногрупу,

R₃ означає метил, етил, н-пропіл, н-бутил, ізобутил, пропеніл, бутеніл, ізобутеніл, C₃₋₇циклоалкіл або бензил, при цьому R₃ необов'язково заміщений одним або більше радикалами R_c, де

R_c являє собою метил, етил, н-пропіл, ізопропіл, н-бутил, ізобутил, трет-бутил, метоксигрупу, етоксигрупу, метилтіогрупу, етилтіогрупу, циклогексил, феніл, нафтил, імідазоліл, індолініл, бром, хлор, фтор, йод, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу, нітрогрупу, бензоїл, бензилоксигрупу, N-бензилімідазоліл або ціаногрупу, причому R_c додатково необов'язково може бути заміщений одним або більше радикалами R_d, де

R_d означає метил, метоксигрупу, етоксигрупу, хлор, фтор, нітрогрупу або гідроксигрупу,

R₅ означає метил, етил, н-пропіл, ізопропіл, н-бутил, ізобутил, трет-бутил, феніл, метоксикарбоніл, етоксикарбоніл, н-пропоксикарбоніл, ізопропоксикарбоніл, н-бутоксикарбоніл, ізобутоксикарбоніл, трет-бутоксикарбоніл і піримідиніл, при цьому R₅ додатково необов'язково може бути заміщений одним або більше радикалами R_e, де

R_e являє собою метил, етил, н-пропіл, ізопропіл, феніл, метоксигрупу, етоксигрупу, н-пропоксигрупу, ізопропоксигрупу, н-бутоксигрупу, ізобутоксигрупу, трет-бутоксикарбоніл, бром, хлор, фтор, йод, гідроксигрупу, оксогрупу або ціаногрупу.

4. Сполука за п. 3, у якій

Het означає піперидиніл або піролідиніл,

R₁ означає N-ацетиламінофеніл, хлорфеніл, метоксифеніл, м-феноксифеніл, морфолініл, піразиніл, піридиніл, фураніл, хлортієніл, тієніл або тієнілметил,

R₃ означає н-бутил, ізобутил, 2,2-диметилпропіл, циклогексилметил, п-метоксибензил або 2-нафтилметил,

при цьому конфігурація у стереоцентрі, що визначається замісниками R₂ і R₃, коли вони мають різні значення, і атомом вуглецю, до якого вони приєднані, являє собою L-конфігурацію, і

R₅ означає метил, пропіл, ізопропіл, етоксикарбоніл, бензилоксикарбоніл, бензил, фенетил, N,N-диметиламіноацетил або піримідиніл.

5. Сполука за п. 4, у якій

Het означає піперидин-4-іл або піролідиніл,

R₁ означає морфолініл або N-ацетиламінофеніл,

R₃ означає 2,2-диметилпропіл або циклогексилметил і

R₅ означає метил, пропіл, ізопропіл, етоксикарбоніл, бензилоксикарбоніл, бензил, фенетил, N,N-диметиламіноацетил або піримідиніл.

6. Сполука за пунктом 1, вибрана з групи, яка включає:

[1-(4-ціано-1-метилпіперидин-4-ілкарбамоїл)-2-циклогексилетил]амід морфолін-4-карбонової кислоти,
 4-ацетиламіно-N-[1-(4-ціано-1-метилпіперидин-4-ілкарбамоїл)-2-циклогексилетил]бензамід,
 4-ацетиламіно-N-[1-(4-ціано-1-метилпіперидин-4-ілкарбамоїл)-3,3-диметилбутил]бензамід,
 [1-(4-ціано-1-метилпіперидин-4-ілкарбамоїл)-3,3-диметилбутил]амід морфолін-4-карбонової кислоти,
 [1-(1-бензил-4-ціанопіперидин-4-ілкарбамоїл)-2-циклогексилетил]амід морфолін-4-карбонової кислоти,
 гідрохлорид [1-(4-ціанопіперидин-4-ілкарбамоїл)-2-циклогексилетил]амід морфолін-4-карбонової кислоти,
 {1-[4-ціано-1-(1-метилетил)піперидин-4-ілкарбамоїл]-2-циклогексилетил}амід морфолін-4-карбонової кислоти,
 [1-(4-ціано-1-фенетилпіперидин-4-ілкарбамоїл)-2-циклогексилетил]амід морфолін-4-карбонової кислоти,
 {1-[3-ціано-1-бензилпіролідін-3-ілкарбамоїл]-2-циклогексилетил}амід морфолін-4-карбонової кислоти,
 [1-(4-ціано-1-пропілпіперидин-4-ілкарбамоїл)-2-циклогексилетил]амід морфолін-4-карбонової кислоти,
 [1-(4-ціано-1-ізопропілпіперидин-4-ілкарбамоїл)-3,3-диметилбутил]амід морфолін-4-карбонової кислоти,
 [1-(1-фенетил-4-ціанопіперидин-4-ілкарбамоїл)-3,3-диметилбутил]амід морфолін-4-карбонової кислоти,
 [1-(1-н-пропіл-4-ціанопіперидин-4-ілкарбамоїл)-3,3-диметилбутил]амід морфолін-4-карбонової кислоти,
 [1-(1-бензил-4-ціанопіперидин-4-ілкарбамоїл)-3,3-диметилбутил]амід морфолін-4-карбонової кислоти,
 4-ацетиламіно-N-[1-(1-бензил-4-ціанопіперидин-4-ілкарбамоїл)-2-циклогексилетил]бензамід,
 4-ацетиламіно-N-[1-(4-ціано-1-ізопропілпіперидин-4-ілкарбамоїл)-2-циклогексилетил]бензамід,
 [1-(1-бензил-3-ціанопіперидин-3-ілкарбамоїл)-2-циклогексилетил]амід морфолін-4-карбонової кислоти,
 N-[1-(4-ціано-1-метилпіперидин-4-ілкарбамоїл)-2-циклогексилетил]бензамід,
 4-(ацетиламінометил)-N-[1-(4-ціано-1-метилпіперидин-4-ілкарбамоїл)-2-циклогексилетил]бензамід,
 N-[1-(4-ціано-1-метилпіперидин-4-ілкарбамоїл)-2-циклогексилетил]ізонікотинамід,
 [1-(4-ціано-1-метилпіперидин-4-ілкарбамоїл)-2-циклогексилетил]амід піразин-2-карбонової кислоти,
 [1-(4-ціано-1-метилпіперидин-4-ілкарбамоїл)-2-циклогексилетил]амід 5-хлортіофен-2-карбонової кислоти,
 4-хлор-N-[1-(4-ціано-1-метилпіперидин-4-ілкарбамоїл)-2-циклогексилетил]бензамід,
 N-[1-(4-ціано-1-метилпіперидин-4-ілкарбамоїл)-2-циклогексилетил]-3-феноксibenзамід,
 N-[1-(1-бензил-3-ціанопіролідін-3-ілкарбамоїл)-2-циклогексилетил]ізонікотинамід,
 [1-(1-бензил-3-ціанопіролідін-3-ілкарбамоїл)-2-циклогексилетил]амід піразин-2-карбонової кислоти,
 {1-[3-ціано-1-(циклогексилметил)піролідін-3-ілкарбамоїл]-2-циклогексилетил}амід морфолін-4-карбонової кислоти,
 [1-(3-ціано-1-бензилпіролідін-3-ілкарбамоїл)-3,3-диметилбутил]амід морфолін-4-карбонової кислоти,
 N-[1-(1-бензил-3-ціанопіролідін-3-ілкарбамоїл)-3,3-диметилбутил]бензамід,
 [1-(1-бензил-3-ціанопіролідін-3-ілкарбамоїл)-3,3-диметилбутил]амід піразин-2-карбонової кислоти,
 {1-[3-ціано-1-(1-метилетил)піролідін-3-ілкарбамоїл]-2-циклогексилетил}амід морфолін-4-карбонової кислоти,
 N-[1-(1-бензил-3-ціанопіролідін-3-ілкарбамоїл)-3,3-диметилбутил]-4-метансульфоніламінобензамід,
 N-[1-(1-бензил-3-ціанопіролідін-3-ілкарбамоїл)-2-циклогексилетил]-4-метансульфоніламінобензамід,
 N-[1-(4-ціано-1-метилпіперидин-4-ілкарбамоїл)-3,3-диметилбутил]бензамід,
 N-[1-(4-ціано-1-метилпіперидин-4-ілкарбамоїл)-2-циклогексилетил]-4-фторбензамід,
 N-[1-(4-ціано-1-метилпіперидин-4-ілкарбамоїл)-3,3-диметилбутил]-4-метансульфоніламінобензамід,
 [1-(3-ціано-1-циклогексилпіролідін-3-ілкарбамоїл)-2-циклогексилетил]амід морфолін-4-карбонової кислоти,

[illegible]

[2-(4-хлорфеніл)-1-(4-ціано-1-пропілпіперидин-4-ілкарбамоїл)етил]амід морфолін-4-карбонової кислоти,

[1-(4-ціано-1-пропілпіперидин-4-ілкарбамоїл)-2-(3,4-дихлорфеніл)етил]амід морфолін-4-карбонової кислоти,

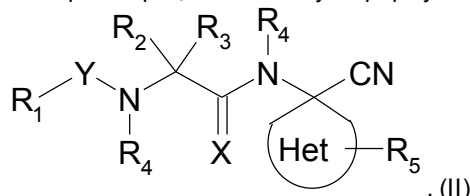
[1-(4-ціано-1-пропілпіперидин-4-ілкарбамоїл)-2-нафталін-2-ілетил]амід морфолін-4-карбонової кислоти,

[1-(4-ціано-1-пропілпіперидин-4-ілкарбамоїл)-3-метилбутил]амід морфолін-4-карбонової кислоти,

[1-(4-ціано-1,2-диметилпіперидин-4-ілкарбамоїл)-3,3-диметилбутил]амід морфолін-4-карбонової кислоти

та їх фармацевтично прийнятні похідні.

7. Спірогетероциклічні сполуки формули (II):



у якій

Het означає азепаніл, піперидиніл, піролідиніл, азетидиніл, оксепаніл, тетрагідропіраніл, тетрагідротіопіраніл, тетрагідрофураніл, оксетаніл, азоканіл, оксоканіл, 1,3-діазоканіл, 1,4-діазоканіл, 1,5-діазоканіл, 1,3-діоксоканіл, 1,4-діоксоканіл, 1,5-діоксоканіл, 1,3-оксазоканіл, 1,4-оксазоканіл, 1,5-оксазоканіл, 1,3-діазепаніл, 1,4-діазепаніл, 1,3-діоксепаніл, 1,4-діоксепаніл, 1,3-оксазепаніл, 1,4-оксазепаніл, 1,2-тіазоканіл-1,1-діоксид, 1,2,8-тіадіазоканіл-1,1-діоксид, 1,2-тіазепаніл-1,1-діоксид, 1,2,7-тіадіазепаніл-1,1-діоксид, тетрагідротіофеніл, гексагідропіримідиніл, гексагідропіридазиніл, піперазиніл, 1,4,5,6-тетрагідропіримідиніл, піразолідиніл, дигідрооксазоліл, дигідротіазоліл, дигідромідазоліл, ізоксазолініл, оксазолідиніл, 1,2-тіазинаніл-1,1-діоксид, 1,2,6-тіадіазинаніл-1,1-діоксид, ізотіазолідиніл-1,1-діоксид, імідазолідиніл-2,4-діон, імідазолідиніл, морфолініл, діоксаніл, тетрагідропіридиніл, тіоморфолініл, тіазолідиніл, дигідропіраніл, дитаніл, декагідрохінолініл, декагідроізохінолініл, 1,2,3,4-тетрагідрохінолініл, індолініл, октагідрохінолізиніл, дигідроіндолізиніл, октагідроіндолізиніл, октагідроіндоліл, декагідрохіназолініл, декагідрохіноксалініл, 1,2,3,4-тетрагідрохіназолініл або 1,2,3,4-тетрагідрохіноксалініл або

з'єднану місточковим зв'язком C₆-C₁₀біциклогрупу, у якій один або більше атомів вуглецю необов'язково замінені на гетероатом, вибраний з N, O і S, при цьому кожний із вказаних замісників необов'язково заміщений одним або більше радикалами R₅,

Y означає C(O), C(S) або S(O)₂,

R₁ означає зв'язок, водень, C₁₋₁₀алкіл, C₁₋₁₀алкоксигрупу, арилоксигрупу, C₃₋₈циклоалкіл, C₃₋₈циклоалкілоксигрупу, арил, бензил, тетрагідронафтил, інденіл, інданіл, C₁₋₁₀алкілсульфонілC₁₋₁₀алкіл, C₃₋₈циклоалкілсульфонілC₁₋₁₀алкіл, арилсульфонілC₁₋₁₀алкіл, гетероцикліл, вибраний із групи, яка включає піролідиніл, піперидиніл, морфолініл, тіоморфолініл, піперазиніл, індолініл, піраніл, тетрагідропіраніл, тетрагідротіопіраніл, тіопіраніл, фураніл, тетрагідрофураніл, тієніл, піроліл, оксазоліл, ізоксазоліл, тіазоліл, імідазоліл, триазоліл, тетразоліл, піридиніл, піримідиніл, піразиніл, тетразоліл, піразоліл, індоліл, бензофураніл, бензотієніл, бензімідазоліл, бензтіазоліл, бензізоксазоліл, хінолініл, тетрагідрохінолініл, ізохінолініл, тетрагідроізохінолініл, хіназолініл, тетрагідрохіназолініл, бензоксазоліл і хіноксалініл, або означає гетероциклілоксигрупу, у якій гетероциклільний фрагмент вибраний із групи, описаної вище в цьому абзаці, гідроксигрупу або аміногрупу, де R₁ необов'язково заміщений одним або більше радикалами R_a, де R_a являє собою зв'язок, C₁₋₁₀алкіл, C₃₋₈циклоалкіл, арил, тетрагідронафтил, інденіл, інданіл, піролідиніл, піперидиніл, морфолініл, тіоморфолініл, піперазиніл, індолініл, фураніл, тієніл, піроліл, оксазоліл, тіазоліл, імідазоліл, триазоліл, тетразоліл, піридиніл, піримідиніл, піразиніл, індоліл, бензофураніл, бензотієніл, бензімідазоліл, бензтіазоліл, бензоксазоліл, бензізоксазоліл, хінолініл, ізохінолініл, хіназолініл, хіноксалініл, C₁₋₁₀алкоксигрупу, C₁₋₁₀алканоліл, C₁₋₁₀алканолілоксигрупу, арилоксигрупу, бензилоксигрупу, C₁₋₁₀алкоксикарбоніл, арилоксикарбоніл, ароїлоксигрупу, карбамоїл, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C₁₋₁₀алкілом, арилом, піролідинілом, піперидинілом, морфолініном, тіоморфолініном, піперазиніном, індолініном, фуранілом, тієнілом, піролілом, оксазолілом, тіазолілом, імідазолілом, триазолілом, тетразолілом, піридинілом, піримідинілом, піразинілом, індолілом, бензофуранілом, бензотієнілом, бензімідазолілом, бензтіазолілом, хінолінілом, ізохінолінілом, хіназолінілом або хіноксалінілом, або

R_a являє собою C₁₋₁₀алканоліламіногрупу, ароїламіногрупу, C₁₋₁₀алкілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, арилтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, уреїдогрупу, де будь-який атом азоту може бути незалежно заміщений C₁₋₁₀алкілом, арилом, піролідинілом, піперидинілом, морфолініном, тіоморфолініном, піперазиніном, індолініном, фуранілом, тієнілом, піролілом, оксазолілом, тіазолілом, імідазолілом, триазолілом, тетразолілом, піридинілом, піримідинілом, піразинілом, індолілом, бензофуранілом,

бензотієнілом, бензімідазолілом, бензтіазолілом, хінолінілом, ізохінолінілом, хіназолінілом або хіноксалінілом, або

R_a являє собою C_{1-10} алкоксикарбоніламіногрупу, арилоксикарбоніламіногрупу, C_{1-10} алкілкарбамоїлоксигрупу, арилкарбамоїлоксигрупу, C_{1-10} алкілсульфоніламіногрупу, арилсульфоніламіногрупу, C_{1-10} алкіламіносульфоніл, ариламіносульфоніл, аміногрупу, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C_{1-10} алкілом, арилом, піролідінілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом, піперазинілом, індолінілом, фуранілом, тієнілом, піролілом, оксазолілом, тіазолілом, імідазолілом, триазолілом, тетразолілом, піридинілом, піримідинілом, піразинілом, індолілом, бензофуранілом, бензотієнілом, бензімідазолілом, бензтіазолілом, хінолінілом, ізохінолінілом, хіназолінілом або хіноксалінілом, або

R_a являє собою галоген, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу, ціаногрупу, нітрогрупу, карбоксамід, амідиногрупу або гуанідиногрупу, при цьому R_a додатково необов'язково може бути заміщений одним або більше радикалами R_b , за умови, що R_1 і R_a одночасно не можуть означати зв'язок, при цьому R_b означає насичений або ненасичений розгалужений або нерозгалужений C_{1-6} вуглецевий ланцюг, який необов'язково частково або повністю галогенований, при цьому один або більше атомів вуглецю необов'язково замінені на O, N, S(O), S(O)₂ або S, а вказаний ланцюг необов'язково незалежно заміщений 1-2 оксогрупами, групою -NH₂ або одним або більше замісниками, вибраними з групи, яка включає C_{1-4} алкіл, піролідиніл, піперидиніл, морфолініл, тіоморфолініл, піперазиніл, індолініл, фураніл, тієніл, піроліл, оксазоліл, тіазоліл, імідазоліл, триазоліл, тетразоліл, піридиніл, піримідиніл, піразиніл, індоліл, бензофураніл, бензотієніл, бензімідазоліл, бензтіазоліл, хінолініл, ізохінолініл, хіназолініл і хіноксалініл, або

R_b означає C_{3-6} циклоалкіл, арил, арилоксигрупу, бензилоксигрупу, галоген, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу, ціаногрупу, нітрогрупу, моно- C_{1-5} алкіламіногрупу, ді- C_{1-5} алкіламіногрупу, карбоксамід, амідиногрупу або гуанідиногрупу,

R_2 означає водень або C_{1-3} алкіл,

R_3 означає зв'язок, водень, C_{1-10} алкіл, C_{2-10} алкілен, C_{3-8} циклоалкіл, арил C_{1-5} алкіл або арил, при цьому R_3 необов'язково заміщений одним або більше радикалами R_c , де

R_c являє собою C_{1-10} алкіл, C_{3-8} циклоалкіл, арил, інданіл, інденіл, біцикло[2.2.1]гептаніл, біцикло[2.2.2]октаніл, біцикло[4.1.0]гептаніл, біцикло[3.1.0]гексаніл, біцикло[1.1.1]пентаніл, кубаніл, 1,2,3,4-тетрагідронафтил, декагідронафтил, піролідиніл, піперидиніл, морфолініл, тіоморфолініл, піперазиніл, індолініл, фураніл, тетрагідрофураніл, піраніл, тетрагідропіраніл, тетрагідротіопіраніл, тієніл, піроліл, оксазоліл, тіазоліл, імідазоліл, піразоліл, триазоліл, тетразоліл, піридиніл, піримідиніл, піразиніл, індоліл, дигідробензофураніл, октогідробензофураніл, бензофураніл, бензотієніл, бензімідазоліл, бензтіазоліл, тетрагідрохінолініл, хінолініл, тетрагідроізохінолініл, ізохінолініл, хіназолініл, хіноксалініл, C_{1-10} алкоксигрупу, арилоксигрупу, C_{1-10} алканоїл, ароїл, C_{1-10} алкоксикарбоніл, арилоксикарбоніл, C_{1-10} алканоїлоксигрупу, ароїлоксигрупу, карбамоїл, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C_{1-10} алкілом, арилом, піролідінілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом, піперазинілом, індолінілом, фуранілом, тієнілом, піролілом, оксазолілом, тіазолілом, імідазолілом, триазолілом, тетразолілом, піридинілом, піримідинілом, піразинілом, індолілом, бензофуранілом, бензотієнілом, бензімідазолілом, бензтіазолілом, хінолінілом, ізохінолінілом, хіназолінілом або хіноксалінілом, або

R_c являє собою C_{1-10} алканоїламіногрупу, ароїламіногрупу, C_{1-10} алкілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, арилтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, уреїдогрупу, де будь-який атом азоту може бути незалежно заміщений C_{1-10} алкілом, арилом, піролідінілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом, піперазинілом, індолінілом, фуранілом, тієнілом, піролілом, оксазолілом, тіазолілом, імідазолілом, триазолілом, тетразолілом, піридинілом, піримідинілом, піразинілом, індолілом, бензофуранілом, бензотієнілом, бензімідазолілом, бензтіазолілом, хінолінілом, ізохінолінілом, хіназолінілом або хіноксалінілом, або

R_c являє собою C_{1-10} алкоксикарбоніламіногрупу, арилоксикарбоніламіногрупу, C_{1-10} алкілкарбамоїлоксигрупу, арилкарбамоїлоксигрупу, C_{1-10} алкілсульфоніламіногрупу, арилсульфоніламіногрупу, C_{1-10} алкіламіносульфоніл, ариламіносульфоніл, аміногрупу, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C_{1-10} алкілом, арилом, піролідінілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом, піперазинілом, індолінілом, фуранілом, тієнілом, піролілом, оксазолілом, тіазолілом, імідазолілом, триазолілом, тетразолілом, піридинілом, піримідинілом, піразинілом, індолілом, бензофуранілом, бензотієнілом, бензімідазолілом, бензтіазолілом, хінолінілом, ізохінолінілом, хіназолінілом або хіноксалінілом, або

R_c являє собою галоген, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу, ціаногрупу, нітрогрупу, амідиногрупу або гуанідиногрупу, при цьому R_c додатково необов'язково може бути заміщений одним або більше радикалами R_d , де

R_d означає C_{1-5} алкіл, C_{3-6} циклоалкіл, арил, арил C_{1-5} алкіл, C_{1-5} алкоксигрупу, арилоксигрупу, арил C_{1-5} алкоксигрупу, ароїл, аміногрупу, галоген, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу, ціаногрупу, нітрогрупу, амідиногрупу або гуанідиногрупу, або

R_2 і R_3 разом з атомом вуглецю, до якого вони приєднані, необов'язково утворюють неароматичне 5-7-членне циклоалкільне або гетероциклічне кільце,

R₄ означає водень, гідроксигрупу або C₁₋₃алкіл,

R₅ означає зв'язок, водень, карбоніл, C₁₋₁₀алкіл, C₁₋₁₀алкоксіC₁₋₁₀алкіл, C₁₋₁₀алкіламіноC₁₋₁₀алкіл, C₁₋₁₀алкілтіоC₁₋₁₀алкіл, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, C₁₋₁₀алкоксигрупу, арилоксигрупу, C₃₋₈циклоалкіл, арил, бензил, тетрагідронафтил, інденіл, інданіл, C₃₋₇циклоалкілсульфонілC₁₋₅алкіл, арилсульфонілC₁₋₅алкіл, гетероцикліл, вибраний із групи, яка включає піролідініл, піперидиніл, морфолініл, тіоморфолініл, піперазиніл, індолініл, піраніл, тетрагідропіраніл, тіопіраніл, тетрагідротіопіраніл, фураніл, тетрагідрофураніл, тієніл, піроліл, оксазоліл, ізоксазоліл, тiazоліл, імідазоліл, піридиніл, піримідиніл, піразиніл, піридазиніл, тетразоліл, триазоліл, піразоліл, індоліл, бензофураніл, бензотієніл, бензимидазоліл, бензтіазоліл, хінолініл, тетрагідрохінолініл, ізохінолініл, тетрагідроізохінолініл, хіназолініл, тетрагідрохіназолініл, бензоксазоліл і хіноксалініл, гетероциклілоксигрупу, у якій гетероциклільний фрагмент вибраний із групи, вказаної вище в цьому абзаці, C₁₋₁₀алканоїл, ароїл, C₁₋₁₀алканоїлоксигрупу, бензилоксигрупу, C₁₋₁₀алкоксикарбоніл, арилC₁₋₅алкоксикарбоніл, арилоксикарбоніл, ароїлоксигрупу, карбамоїл, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C₁₋₁₀алкілом, арилом, піролідінілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом, піперазинілом, індолінілом, фуранілом, тієнілом, піролілом, оксазолілом, тiazолілом, імідазолілом, триазолілом, тетразолілом, піридинілом, піримідинілом, піразинілом, індолілом, бензофуранілом, бензотієнілом, бензимидазолілом, бензтіазолілом, хінолінілом, ізохінолінілом, хіназолінілом або хіноксалінілом, або

R₅ означає C₁₋₁₀алканоїламіногрупу, ароїламіногрупу, C₁₋₁₀алкілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, арилтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, уреїдогрупу, де будь-який атом азоту може бути незалежно заміщений C₁₋₁₀алкілом, арилом, піролідінілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом, піперазинілом, індолінілом, фуранілом, тієнілом, піролілом, оксазолілом, тiazолілом, імідазолілом, триазолілом, тетразолілом, піридинілом, піримідинілом, піразинілом, індолілом, бензофуранілом, бензотієнілом, бензимидазолілом, бензтіазолілом, хінолінілом, ізохінолінілом, хіназолінілом або хіноксалінілом, або

R₅ означає C₁₋₁₀алкоксикарбоніламіногрупу, арилоксикарбоніламіногрупу, C₁₋₁₀алкілкарбамоїлоксигрупу, арилкарбамоїлоксигрупу, C₁₋₁₀алкілсульфоніламіногрупу, арилсульфоніламіногрупу, C₁₋₁₀алкіламіносульфоніл, ариламіносульфоніл, аміногрупу, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C₁₋₁₀алкілом, арилом, піролідінілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом, піперазинілом, індолінілом, фуранілом, тієнілом, піролілом, оксазолілом, тiazолілом, імідазолілом, триазолілом, тетразолілом, піридинілом, піримідинілом, піразинілом, індолілом, бензофуранілом, бензотієнілом, бензимидазолілом, бензтіазолілом, хінолінілом, ізохінолінілом, хіназолінілом або хіноксалінілом, або

R₅ означає галоген, гідроксигрупу, оксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу, ціаногрупу, нітрогрупу, карбоксамід, амідногрупу або гуанідногрупу, при цьому R₅ додатково необов'язково може бути заміщений одним або більше радикалами R_e, де

R_e являє собою C₁₋₁₀алкіл, C₁₋₁₀алкоксіC₁₋₁₀алкіл, C₁₋₁₀алкіламіноC₁₋₁₀алкіл, C₁₋₁₀алкілтіоC₁₋₁₀алкіл, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, C₁₋₁₀алкоксигрупу, C₃₋₈циклоалкіл, арил, тетрагідронафтил, інденіл, інданіл, піролідініл, піперидиніл, морфолініл, тіоморфолініл, піперазиніл, індолініл, тіопіраніл, тетрагідротіопіраніл, піраніл, тетрагідропіраніл, тетрагідрофураніл, фураніл, тієніл, піроліл, оксазоліл, тiazоліл, імідазоліл, триазоліл, тетразоліл, піридиніл, піримідиніл, піразиніл, індоліл, бензофураніл, бензотієніл, бензимидазоліл, бензтіазоліл, бензоксазоліл, бензізоксазоліл, хінолініл, ізохінолініл, хіназолініл, хіноксалініл, C₁₋₁₀алканоїл, ароїл, C₁₋₁₀алканоїлоксигрупу, арилоксигрупу, бензилоксигрупу, C₁₋₁₀алкоксикарбоніл, арилC₁₋₃алкоксикарбоніл, арилоксикарбоніл, ароїлоксигрупу, карбамоїл, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C₁₋₁₀алкілом, арилом, піролідінілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом, піперазинілом, індолінілом, фуранілом, тієнілом, піролілом, оксазолілом, тiazолілом, імідазолілом, триазолілом, тетразолілом, піридинілом, піримідинілом, піразинілом, індолілом, бензофуранілом, бензотієнілом, бензимидазолілом, бензтіазолілом, хінолінілом, ізохінолінілом, хіназолінілом або хіноксалінілом, або

R_e являє собою C₁₋₁₀алканоїламіногрупу, ароїламіногрупу, C₁₋₁₀алкілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, арилтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, уреїдогрупу, де будь-який атом азоту може бути незалежно заміщений C₁₋₁₀алкілом, арилом, піролідінілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом, піперазинілом, індолінілом, фуранілом, тієнілом, піролілом, оксазолілом, тiazолілом, імідазолілом, триазолілом, тетразолілом, піридинілом, піримідинілом, піразинілом, індолілом, бензофуранілом, бензотієнілом, бензимидазолілом, бензтіазолілом, хінолінілом, ізохінолінілом, хіназолінілом або хіноксалінілом, або

R_e являє собою C₁₋₁₀алкоксикарбоніламіногрупу, арилоксикарбоніламіногрупу, C₁₋₁₀алкілкарбамоїлоксигрупу, арилкарбамоїлоксигрупу, C₁₋₁₀алкілсульфоніламіногрупу, арилсульфоніламіногрупу, C₁₋₁₀алкіламіносульфоніл, ариламіносульфоніл, аміногрупу, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C₁₋₁₀алкілом, арилом, піролідінілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом, піперазинілом, індолінілом, фуранілом, тієнілом, піролілом, оксазолілом, тiazолілом, імідазолілом, триазолілом, тетразолілом, піридинілом,

піримідинілом, піразинілом, індолілом, бензофуранілом, бензотієнілом, бензимидазолілом, бензтіазолілом, хінолінілом, ізохінолінілом, хіназолінілом або хіноксалінілом, або R_e являє собою галоген, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу, ціаногрупу, нітрогрупу, карбоксамід, амідногрупу або гуанідногрупу, при цьому R_e додатково необов'язково може бути заміщений одним або більше радикалами R_f , де

R_f означає C_{1-5} алкіл, C_{3-6} циклоалкіл, толілсульфоніл, C_{1-5} алкоксигрупу, арил, арилоксигрупу, бензилоксигрупу, галоген, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу, ціаногрупу, нітрогрупу, карбоксамід, амідногрупу або гуанідногрупу, і

X означає O або S ,

та їх фармацевтично прийнятні похідні.

8. Сполука за п. 7, у якій

Het означає піперидиніл, піролідиніл, тетрагідропіраніл, тетрагідротіопіраніл, азетидиніл, азепаніл, оксепаніл, тетрагідрофураніл, оксетаніл, гексагідропіримідиніл, гексагідропіридазиніл, піперазиніл, 1,4,5,6-тетрагідропіримідиніл, октагідроіндолізиніл, октагідрохінолізиніл, декагідрохінолініл, 1,2,3,4-тетрагідрохінолініл, дигідрооксазоліл, 1,2-тіазинаніл-1,1-діоксид, 1,2,6-тіадіазинаніл-1,1-діоксид, ізотіазолідиніл-1,1-діоксид, імідазолідиніл, піразолідиніл або з'єднану містчковим зв'язком біциклогрупу, вибрану з групи, яка включає азабіцикло[3.2.1]октан, азабіцикло[2.2.1]гептан, азабіцикло[2.2.2]октан, азабіцикло[3.2.2]нонан, азабіцикло[2.1.1]гексан, азабіцикло[3.1.1]гептан, азабіцикло[3.3.2]декан і 2-окса- або 2-тіа-5-азабіцикло[2.2.1]гептан, при цьому кожне з вказаних кілець заміщене одним або більше радикалами R_5 , Y означає $C(O)$ або $S(O)_2$,

R_1 означає зв'язок, водень, C_{1-7} алкіл, C_{1-7} алкоксигрупу, C_{3-7} циклоалкіл, арилоксигрупу, феніл, бензил, нафтил, тетрагідронафтил, C_{1-7} алкілсульфоніл, C_{1-7} алкіл, C_{3-7} циклоалкілсульфоніл, C_{1-7} алкіл, арилсульфоніл, C_{1-7} алкіл, піролідиніл, піперидиніл, морфолініл, тіоморфолініл, піперазиніл, індолініл, піраніл, тіопіраніл, фураніл, тієніл, піроліл, оксазоліл, тіазоліл, імідазоліл, піридиніл, ізоксазоліл, піримідиніл, піразиніл, піридазиніл, індоліл, хінолініл, бензофураніл, бензтієніл, бензимидазоліл, бензтіазоліл, бензоізоксазоліл, бензоксазоліл або аміногрупу, при цьому R_1 необов'язково заміщений одним або більше радикалами R_a , де

R_a являє собою зв'язок C_{1-7} алкіл, C_{3-6} циклоалкіл, феніл, нафтил, піролідиніл, піперидиніл, морфолініл, тіоморфолініл, піперазиніл, фураніл, тієніл, оксазоліл, тіазоліл, імідазоліл, триазоліл, тетразоліл, піридиніл, піримідиніл, піразиніл, індоліл, бензофураніл, бензотієніл, бензимидазоліл, бензтіазоліл, бензоксазоліл, хінолініл, ізохінолініл, хіназолініл, хіноксалініл, C_{1-7} алкоксигрупу, C_{1-7} алканоліл, C_{1-7} алканолілоксигрупу, арилоксигрупу, бензилоксигрупу, C_{1-7} алкоксикарбоніл, арилоксикарбоніл, ароілоксигрупу, карбамоіл, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C_{1-7} алкілом, арилом, піролідинілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом, піперазинілом, фуранілом, тієнілом, оксазолілом, тіазолілом, імідазолілом, триазолілом, тетразолілом, піридинілом, піримідинілом, піразинілом, індолілом, бензофуранілом, бензотієнілом, бензимидазолілом, бензтіазолілом, хінолінілом, ізохінолінілом, хіназолінілом або хіноксалінілом, або

R_a являє собою C_{1-7} алканоліламіногрупу, ароїламіногрупу, C_{1-7} алкілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, арилтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, уреїдогрупу, де будь-який атом азоту може бути незалежно заміщений C_{1-7} алкілом, арилом, піролідинілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом, піперазинілом, фуранілом, тієнілом, оксазолілом, тіазолілом, імідазолілом, триазолілом, тетразолілом, піридинілом, піримідинілом, піразинілом, індолілом, бензофуранілом, бензотієнілом, бензимидазолілом, бензтіазолілом, хінолінілом, ізохінолінілом, хіназолінілом або хіноксалінілом, або

R_a являє собою C_{1-7} алкоксикарбоніламіногрупу, арилоксикарбоніламіногрупу, C_{1-7} алкілкарбамоїлоксигрупу, арилкарбамоїлоксигрупу, C_{1-7} алкілсульфоніламіногрупу, арилсульфоніламіногрупу, C_{1-7} алкіламіносульфоніл, ариламіносульфоніл, аміногрупу, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C_{1-7} алкілом, арилом, піролідинілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом, піперазинілом, фуранілом, тієнілом, оксазолілом, тіазолілом, імідазолілом, триазолілом, тетразолілом, піридинілом, піримідинілом, піразинілом, індолілом, бензофуранілом, бензотієнілом, бензимидазолілом, бензтіазолілом, хінолінілом, ізохінолінілом, хіназолінілом або хіноксалінілом, або

R_a являє собою галоген, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу, ціаногрупу, нітрогрупу, карбоксамід, амідногрупу або гуанідногрупу, при цьому R_a додатково необов'язково може бути заміщений одним або більше радикалами R_b , де

R_b означає C_{1-5} алкіл, C_{3-6} циклоалкіл, арил, C_{1-5} алкоксигрупу, арилоксигрупу, бензилоксигрупу, галоген, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу, ціаногрупу, нітрогрупу, карбоксамід, амідногрупу або гуанідногрупу,

R_2 означає водень, метил або етил,

R_3 означає зв'язок, водень, C_{1-5} алкіл, C_{2-5} алкілен, C_{3-7} циклоалкіл, арил, C_{1-3} алкіл або арил, при цьому R_3 необов'язково заміщений одним або більше радикалами R_c , де

R_c являє собою C_{1-5} алкіл, C_{3-7} циклоалкіл, арил, інданіл, інденіл, біцикло[2.2.1]гептаніл, біцикло[2.2.2]октаніл, біцикло[4.1.0]гептаніл, біцикло[3.1.0]гексаніл, біцикло[1.1.1]пентаніл, кубаніл, 1,2,3,4-тетрагідронафтил, піролідиніл, піперидиніл, морфолініл, тіоморфолініл, піперазиніл,

індолініл, фураніл, тетрагідрофураніл, піраніл, тетрагідропіраніл, тієніл, піроліл, оксазоліл, тіазоліл, імідазоліл, піразоліл, триазоліл, тетразоліл, піридиніл, піримідиніл, піразиніл, індоліл, бензофураніл, бензотієніл, бензимидазоліл, бензтіазоліл, хінолініл, ізохінолініл, хіназолініл, хіноксалініл, C₁₋₅алкоксигрупу, арилоксигрупу, C₁₋₅алканоїл, ароїл, C₁₋₅алкоксикарбоніл, арилоксикарбоніл, C₁₋₅алканоїлоксигрупу, ароїлоксигрупу, карбамоїл, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C₁₋₅алкілом, арилом, піролідінілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом, піперазинілом, індолінілом, фуранілом, тієнілом, піролілом, оксазолілом, тіазолілом, імідазолілом, триазолілом, тетразолілом, піридинілом, піримідинілом, піразинілом, індолілом, бензофуранілом, бензотієнілом, бензимидазолілом, бензтіазолілом, хінолінілом, ізохінолінілом, хіназолінілом або хіноксалінілом, або

R_c являє собою C₁₋₅алканоїламіногрупу, ароїламіногрупу, C₁₋₅алкілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, уреїдогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, уреїдогрупу, у якій будь-який атом азоту може бути незалежно заміщений C₁₋₅алкілом, арилом, піролідінілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом, піперазинілом, індолінілом, фуранілом, тієнілом, піролілом, оксазолілом, тіазолілом, імідазолілом, триазолілом, тетразолілом, піридинілом, піримідинілом, піразинілом, індолілом, бензофуранілом, бензотієнілом, бензимидазолілом, бензтіазолілом, хінолінілом, ізохінолінілом, хіназолінілом або хіноксалінілом, або

R_c являє собою C₁₋₅алкоксикарбоніламіногрупу, арилоксикарбоніламіногрупу, C₁₋₅алкілкарбамоїлоксигрупу, арилкарбамоїлоксигрупу, C₁₋₅алкілсульфоніламіногрупу, арилсульфоніламіногрупу, C₁₋₅алкіламіносульфоніл, ариламіносульфоніл, аміногрупу, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C₁₋₅алкілом, арилом, піролідінілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом, піперазинілом, індолінілом, фуранілом, тієнілом, піролілом, оксазолілом, тіазолілом, імідазолілом, триазолілом, тетразолілом, піридинілом, піримідинілом, піразинілом, індолілом, бензофуранілом, бензотієнілом, бензимидазолілом, бензтіазолілом, хінолінілом, ізохінолінілом, хіназолінілом або хіноксалінілом, або

R_c являє собою галоген, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу, ціаногрупу, нітрогрупу, амідногрупу або гуанідногрупу, при цьому R_c додатково необов'язково може бути заміщений одним або більше радикалами R_d, де

R_d означає C₁₋₅алкіл, C₃₋₆циклоалкіл, арил, арилC₁₋₄алкіл, C₁₋₅алкоксигрупу, арилоксигрупу, арилC₁₋₅алкоксигрупу, ароїл, галоген, гідроксигрупу, оксогрупу або ціаногрупу,

R₄ означає водень або метил,

R₅ означає зв'язок, водень, карбоніл, C₁₋₈алкіл, C₁₋₈алкоксіC₁₋₈алкіл, C₁₋₈алкіламіноC₁₋₈алкіл, C₁₋₈алкілтіоC₁₋₈алкіл, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, C₁₋₈алкоксигрупу, арилоксигрупу, C₃₋₇циклоалкіл, арил, бензил, тетрагідронафтил, інданіл, гетероцикліл, вибраний із групи, яка включає піролідініл, піперидиніл, морфолініл, тіоморфолініл, піперазиніл, індолініл, піраніл, тетрагідропіраніл, тіопіраніл, тетрагідротіопіраніл, фураніл, тетрагідрофураніл, тієніл, оксазоліл, тіазоліл, імідазоліл, піридиніл, піримідиніл, піразиніл, тетразоліл, триазоліл, піразоліл, індоліл, бензофураніл, бензотієніл, бензимидазоліл, бензтіазоліл, хінолініл, ізохінолініл, хіназолініл, бензоксазоліл і хіноксалініл, гетероциклілоксигрупу, у якій гетероциклільний фрагмент вибраний із групи, вказаної вище в цьому абзаці, C₁₋₇алканоїл, ароїл, C₁₋₇алканоїлоксигрупу, бензилоксигрупу, C₁₋₇алкоксикарбоніл, арилC₁₋₄алкоксикарбоніл, арилоксикарбоніл, ароїлоксигрупу, карбамоїл, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C₁₋₇алкілом, арилом, піролідінілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом, піперазинілом, фуранілом, тієнілом, оксазолілом, тіазолілом, імідазолілом, піридинілом, піримідинілом, піразинілом, індолілом, бензофуранілом, бензотієнілом, бензимидазолілом, бензтіазолілом, хінолінілом, ізохінолінілом, хіназолінілом або хіноксалінілом, або

R₅ означає C₁₋₇алканоїламіногрупу, ароїламіногрупу, C₁₋₇алкілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, ариліогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, уреїдогрупу, у якій будь-який атом азоту може бути незалежно заміщений C₁₋₇алкілом, арилом, піролідінілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом, піперазинілом, фуранілом, тієнілом, оксазолілом, тіазолілом, імідазолілом, піридинілом, піримідинілом, піразинілом, індолілом, бензофуранілом, бензотієнілом, бензимидазолілом, бензтіазолілом, хінолінілом, ізохінолінілом, хіназолінілом або хіноксалінілом, або

R₅ означає C₁₋₇алкоксикарбоніламіногрупу, арилоксикарбоніламіногрупу, C₁₋₇алкілкарбамоїлоксигрупу, арилкарбамоїлоксигрупу, C₁₋₇алкілсульфоніламіногрупу, арилсульфоніламіногрупу, C₁₋₇алкіламіносульфоніл, ариламіносульфоніл, аміногрупу, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C₁₋₇алкілом, арилом, піролідінілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом, піперазинілом, фуранілом, тієнілом, піролілом, оксазолілом, тіазолілом, імідазолілом, піридинілом, піримідинілом, піразинілом, індолілом, бензофуранілом, бензотієнілом, бензимидазолілом, бензтіазолілом, хінолінілом, ізохінолінілом, хіназолінілом або хіноксалінілом, або

R₅ означає галоген, гідроксигрупу, оксигрупу, карбоксигрупу, ціаногрупу, нітрогрупу або карбоксамід, при цьому R₅ додатково необов'язково може бути заміщений одним або більше радикалами R_e, де

R_e являє собою C₁₋₇алкіл, C₁₋₇алкоксіC₁₋₇алкіл, C₁₋₇алкіламіноC₁₋₇алкіл, C₁₋₇алкілтіоC₁₋₇алкіл, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, C₁₋₇алкоксигрупу, C₃₋₇циклоалкіл,

арил, тетрагідронафтил, інданіл, піролідиніл, піперидиніл, морфолініл, тіоморфолініл, піперазиніл, тіопіраніл, тетрагідротіопіраніл, тетрагідропіраніл, тетрагідрофураніл, фураніл, тієніл, оксазоліл, тіазоліл, імідазоліл, піридиніл, піримідиніл, піразиніл, індоліл, бензофураніл, бензотієніл, бензимидазоліл, бензтіазоліл, бензоксазоліл, хінолініл, ізохінолініл, хіназолініл, хіноксалініл, C₁₋₅алканоліл, ароїл, C₁₋₅алканолілоксигрупу, арилоксигрупу, бензилоксигрупу, C₁₋₅алкоксикарбоніл, арилоксикарбоніл, ароїлоксигрупу, карбамоїл, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C₁₋₅алкілом, арилом, піролідинілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом, піперазинілом, фуранілом, тієнілом, оксазолілом, тіазолілом, імідазолілом, піридинілом, піримідинілом, піразинілом, індолілом, бензофуранілом, бензотієнілом, бензимидазолілом, бензтіазолілом, хінолінілом, ізохінолінілом, хіназолінілом або хіноксалінілом, або R_e являє собою C₁₋₅алканоліламіногрупу, ароїламіногрупу, C₁₋₅алкілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, арилтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, уреїдогрупу, у якій будь-який атом азоту може бути незалежно заміщений C₁₋₅алкілом, арилом, піролідинілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом, піперазинілом, фуранілом, тієнілом, оксазолілом, тіазолілом, імідазолілом, піридинілом, піримідинілом, піразинілом, індолілом, бензофуранілом, бензотієнілом, бензимидазолілом, бензтіазолілом, хінолінілом, ізохінолінілом, хіназолінілом або хіноксалінілом, або R_e являє собою C₁₋₅алкоксикарбоніламіногрупу, арилоксикарбоніламіногрупу, C₁₋₅алкілкарбамоїлоксигрупу, арилкарбамоїлоксигрупу, C₁₋₅алкілсульфоніламіногрупу, арилсульфоніламіногрупу, C₁₋₅алкіламіносольфоніл, ариламіносольфоніл, аміногрупу, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C₁₋₅алкілом, арилом, піролідинілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом, піперазинілом, фуранілом, тієнілом, оксазолілом, тіазолілом, імідазолілом, піридинілом, піримідинілом, піразинілом, індолілом, бензофуранілом, бензотієнілом, бензимидазолілом, бензтіазолілом, хінолінілом, ізохінолінілом, хіназолінілом або хіноксалінілом, або R_e являє собою галоген, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу, ціаногрупу, нітрогрупу, карбоксамід, амідиногрупу або гуанідиногрупу, при цьому R_e додатково необов'язково може бути заміщений одним або більше радикалами R_f, де R_f означає метил, етил, трет-бутил, толілсульфоніл, C₁₋₃алкоксигрупу, циклопропіл, циклогексил, феніл, нафтил, феноксигрупу, бензилоксигрупу, фтор, хлор, бром, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу, ціаногрупу, нітрогрупу або карбоксамід, і X означає O.

9. Сполука за п. 8, у якій

Het означає піперидиніл, піролідиніл, азетидиніл, азепаніл, оксепаніл, тетрагідропіраніл, тетрагідротіопіраніл, тетрагідрофураніл, оксетаніл, октагідроіндолізиніл, октагідрохінолізиніл або азабіцикло[3.2.1]октаніл, при цьому кожне з вказаних кілець необов'язково заміщене одним або більше радикалами R₅,

R₁ означає зв'язок, C₁₋₅алкіл, C₁₋₅алкоксигрупу, C₃₋₆циклоалкіл, арилоксигрупу, феніл, бензил, нафтил, C₁₋₃алкілсульфоніл, C₁₋₃алкіл, C₃₋₆циклоалкілсульфоніл, C₁₋₃алкіл, арилсульфоніл, C₁₋₃алкіл, піролідиніл, піперидиніл, морфолініл, тіоморфолініл, піперазиніл, фураніл, тієніл, оксазоліл, тіазоліл, імідазоліл, піридиніл, ізоксазоліл, піримідиніл, піразиніл, піридазиніл, індоліл, хінолініл, бензофураніл, бензтієніл, бензимидазоліл, бензтіазоліл, бензоксазоліл або аміногрупу, при цьому R₁ необов'язково заміщений одним або більше радикалами R_a, де

R_a являє собою зв'язок, C₁₋₃алкіл, циклопропіл, циклопентил, циклогексил, феніл, нафтил, піролідиніл, піперидиніл, морфолініл, тіоморфолініл, піперазиніл, фураніл, тієніл, оксазоліл, тіазоліл, імідазоліл, піридиніл, піримідиніл, бензимидазоліл, бензтіазоліл, бензоксазоліл, C₁₋₃алкоксигрупу, C₁₋₃алканоліл, C₁₋₃алканолілоксигрупу, арилоксигрупу, бензилоксигрупу, C₁₋₃алкоксикарбоніл, арилоксикарбоніл, ароїлоксигрупу, карбамоїл, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C₁₋₃алкілом, арилом, піролідинілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом, піперазинілом, тієнілом, оксазолілом, тіазолілом, імідазолілом, піридинілом, піримідинілом, бензимидазолілом або бензтіазолілом, або

R_a являє собою C₁₋₃алканоліламіногрупу, ароїламіногрупу, C₁₋₃алкілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, арилтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, уреїдогрупу, у якій будь-який атом азоту може бути незалежно заміщений C₁₋₃алкілом, арилом, піролідинілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом або піперазинілом, або

R_a являє собою C₁₋₃алкоксикарбоніламіногрупу, арилоксикарбоніламіногрупу, C₁₋₃алкілкарбамоїлоксигрупу, арилкарбамоїлоксигрупу, C₁₋₃алкілсульфоніламіногрупу, арилсульфоніламіногрупу, C₁₋₃алкіламіносольфоніл, ариламіносольфоніл, аміногрупу, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C₁₋₃алкілом, арилом, піролідинілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом або піперазинілом, або

R_a являє собою галоген, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу, ціаногрупу, нітрогрупу, карбоксамід, амідиногрупу або гуанідиногрупу, при цьому R_a додатково необов'язково може бути заміщений одним або більше радикалами R_b, де

R_b означає C₁₋₃алкіл, C₃₋₆циклоалкіл, арил, C₁₋₃алкоксигрупу, арилоксигрупу, бензилоксигрупу, галоген, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу, ціаногрупу, нітрогрупу, карбоксамід, амідиногрупу або гуанідиногрупу,

R₂ означає водень або метил,

R₃ означає зв'язок, водень, C₁₋₅алкіл, C₂₋₅алкілен, C₄₋₆циклоалкіл або арилC₁₋₂алкіл, при цьому R₃ необов'язково заміщений одним або більше радикалами R_c, де

R_c являє собою C₁₋₄алкіл, C₅₋₆циклоалкіл, феніл, нафтил, інданіл, біцикло[2.2.1]гептаніл, біцикло[2.2.2]октаніл, біцикло[4.1.0]гептаніл, біцикло[3.1.0]гексаніл, біцикло[1.1.1]пентаніл, кубаніл, 1,2,3,4-тетрагідронафтил, піролідиніл, піперидиніл, морфолініл, тіоморфолініл, індолініл, фураніл, тетрагідрофураніл, піраніл, тетрагідропіраніл, тієніл, піроліл, оксазоліл, тіазоліл, імідазоліл, піразоліл, піридиніл, піримідиніл, піразиніл, індоліл, бензофураніл, бензотієніл, бензимидазоліл, бензтіазоліл, хінолініл, ізохінолініл, хіназолініл, хіноксалініл, C₁₋₄алкоксигрупу, феноксигрупу, нафтилоксигрупу, C₁₋₃алканоїл, бензоїл, C₁₋₃алкоксикарбоніл, феноксикарбоніл, C₁₋₃алканоїлоксигрупу, бензоїлоксигрупу, карбамоїл, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C₁₋₅алкілом або арилом, або

R_c являє собою C₁₋₃алканоїламіногрупу, бензоїламіногрупу, C₁₋₃алкілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, фенілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, уреїдогрупу, у якій будь-який атом азоту може бути незалежно заміщений C₁₋₅алкілом або арилом, або

R_c являє собою C₁₋₃алкоксикарбоніламіногрупу, арилоксикарбоніламіногрупу, C₁₋₃алкілкарбамоїлоксигрупу, арилкарбамоїлоксигрупу, C₁₋₃алкілсульфоніламіногрупу, арилсульфоніламіногрупу, C₁₋₃алкіламіносульфоніл, ариламіносульфоніл, аміногрупу, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C₁₋₅алкілом або арилом, або

R_c являє собою галоген, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу, ціаногрупу, нітрогрупу, амідногрупу або гуанідногрупу, при цьому R_c додатково необов'язково може бути заміщений одним або більше радикалами R_d, де

R_d означає C₁₋₃алкіл, C₃₋₆циклоалкіл, феніл, бензил, C₁₋₃алкоксигрупу, феноксигрупу, фенілC₁₋₃алкоксигрупу, бензоїл, галоген, гідроксигрупу, оксогрупу або ціаногрупу,

R₄ означає водень,

R₅ означає зв'язок, водень, карбоніл, C₁₋₆алкіл, C₁₋₆алкоксіC₁₋₆алкіл, C₁₋₆алкіламіноC₁₋₆алкіл, C₁₋₆алкілтіоC₁₋₆алкіл, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, C₁₋₆алкоксигрупу, феноксигрупу, нафтилоксигрупу, C₃₋₆циклоалкіл, феніл, нафтил, бензил, інданіл, гетероцикліл, вибраний із групи, яка включає піролідиніл, піперидиніл, морфолініл, тіоморфолініл, піперазиніл, тетрагідропіраніл, тетрагідротіопіраніл, фураніл, тетрагідрофураніл, тієніл, оксазоліл, тіазоліл, імідазоліл, піридиніл, піримідиніл, піразоліл, бензофураніл, бензотієніл, бензимидазоліл, бензтіазоліл, хінолініл, ізохінолініл і бензоксазоліл, гетероциклілоксигрупу, у якій гетероциклільний фрагмент вибраний із групи, вказаної вище в цьому абзаці, C₁₋₃алканоїл, бензоїл, нафтоїл, C₁₋₄алканоїлоксигрупу, бензилоксигрупу, C₁₋₄алкоксикарбоніл, арилC₁₋₂алкоксикарбоніл, феноксикарбоніл, бензоїлоксигрупу, карбамоїл, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C₁₋₃алкілом, фенілом, піролідинілом, піперидинілом, морфолінілом, піперазинілом, оксазолілом, тіазолілом, імідазолілом, піридинілом або піримідинілом, або

R₅ означає C₁₋₄алканоїламіногрупу, ароїламіногрупу, C₁₋₄алкілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, арилтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, уреїдогрупу, у якій будь-який атом азоту може бути незалежно заміщений C₁₋₃алкілом, фенілом, нафтилом, піролідинілом, піперидинілом, морфолінілом, піперазинілом, оксазолілом, тіазолілом, імідазолілом, піридинілом, піримідинілом, піразинілом, індолілом, бензофуранілом, бензотієнілом, бензимидазолілом або бензтіазолілом, або

R₅ означає C₁₋₄алкоксикарбоніламіногрупу, феноксикарбоніламіногрупу, C₁₋₄алкілкарбамоїлоксигрупу, фенілкарбамоїлоксигрупу, C₁₋₄алкілсульфоніламіногрупу, фенілсульфоніламіногрупу, C₁₋₃алкіламіносульфоніл, феніламіносульфоніл, аміногрупу, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C₁₋₄алкілом, арилом, піролідинілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом, піперазинілом, фуранілом, тієнілом, оксазолілом, тіазолілом, імідазолілом, піридинілом, піримідинілом, бензимидазолілом або бензтіазолілом, або

R₅ означає галоген, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу, ціаногрупу, нітрогрупу або карбоксамід, при цьому R₅ додатково необов'язково може бути заміщений одним або більше радикалами R_e, де

R_e являє собою C₁₋₄алкіл, C₁₋₄алкоксигрупу, C₃₋₇циклоалкіл, феніл, нафтил, інданіл, піролідиніл, піперидиніл, морфолініл, тіоморфолініл, піперазиніл, тетрагідротіопіраніл, тетрагідропіраніл, тетрагідрофураніл, тієніл, оксазоліл, тіазоліл, імідазоліл, піридиніл, піримідиніл, піразиніл, індоліл, бензимидазоліл, бензтіазоліл, бензоксазоліл, хінолініл, ізохінолініл, хіназолініл, хіноксалініл, C₁₋₄алканоїл, ароїл, C₁₋₄алканоїлоксигрупу, феноксигрупу, нафтилоксигрупу, бензилоксигрупу, C₁₋₄алкоксикарбоніл, феноксикарбоніл, бензоїлоксигрупу, карбамоїл, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C₁₋₃алкілом, фенілом, нафтилом, піролідинілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом, піперазинілом, фуранілом, тієнілом, оксазолілом, тіазолілом, імідазолілом, піридинілом, піримідинілом, бензимидазолілом або бензтіазолілом, або

R_e являє собою C₁₋₄алканоїламіногрупу, бензоїламіногрупу, C₁₋₄алкілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, фенілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, уреїдогрупу, у якій будь-який атом азоту може бути незалежно заміщений C₁₋₃алкілом, фенілом, нафтилом, піролідинілом, піперидинілом, морфолінілом,

тіоморфолінілом, піперазинілом, фуранілом, тієнілом, оксазолілом, тiazолілом, імідазолілом, придинілом, піримідинілом, бензимидазолілом або бензтіазолілом, або R_e являє собою C_{1-4} алкоксикарбоніламіногрупу, феноксикарбоніламіногрупу, C_{1-4} алкілкарбамоїлоксигрупу, фенілкарбамоїлоксигрупу, C_{1-4} алкілсульфоніламіногрупу, фенілсульфоніламіногрупу, C_{1-4} алкіламіносульфоніл, феніламіносульфоніл, аміногрупу, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C_{1-3} алкілом, фенілом, нафтилом, піролідінілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом, піперазинілом, фуранілом, тієнілом, оксазолілом, тiazолілом, імідазолілом, придинілом, піримідинілом, бензимидазолілом або бензтіазолілом, або

R_e являє собою галоген, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу, ціаногрупу, нітрогрупу або карбоксамід, при цьому R_e додатково необов'язково може бути заміщений одним або більше радикалами R_f , де

R_f означає метил, етил, трет-бутил, толілсульфоніл, метоксигрупу, циклопропіл, феніл, феноксигрупу, бензилоксигрупу, фтор, хлор, бром, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу або карбоксамід.

10. Сполука за п. 9, у якій

Het означає піперидиніл, піролідиніл, азетидиніл, азепаніл, оксепаніл, тетрагідропіраніл, оксетаніл або тетрагідротіопіраніл, при цьому кожне з вказаних кілець необов'язково заміщене одним або більше радикалами R_5 ,

R_1 означає зв'язок, C_{1-5} алкіл, C_{1-5} алкоксигрупу, C_{3-6} циклоалкіл, арилоксигрупу, феніл, бензил, нафтил, піролідиніл, піперидиніл, морфолініл, тіоморфолініл, піперазиніл, фураніл, тієніл, оксазоліл, тiazоліл, імідазоліл, придиніл, піримідиніл, піразиніл, піридазиніл, індоліл, хінолініл, бензофураніл, бензтієніл, бензимидазоліл, бензтіазоліл, бензоксазоліл або аміногрупу, при цьому R_1 необов'язково заміщений одним або більше радикалами R_a , де

R_a являє собою зв'язок, C_{1-3} алкіл, циклопропіл, циклогексил, феніл, піролідиніл, піперидиніл, морфолініл, тіоморфолініл, піперазиніл, тієніл, імідазоліл, C_{1-3} алкоксигрупу, C_{1-3} алканоліл, C_{1-3} алканолілоксигрупу, арилоксигрупу, бензилоксигрупу, C_{1-3} алкоксикарбоніл, арилоксикарбоніл, ароїлоксигрупу, карбамоїл, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C_{1-3} алкілом, арилом, піролідінілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом або піперазинілом, або

R_a являє собою C_{1-3} алканоліламіногрупу, ароїламіногрупу, C_{1-3} алкілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, арилтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, уреїдогрупу, у якій будь-який атом азоту може бути незалежно заміщений C_{1-3} алкілом, арилом, піролідінілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом або піперазинілом, або

R_a являє собою C_{1-3} алкоксикарбоніламіногрупу, арилоксикарбоніламіногрупу, C_{1-3} алкілкарбамоїлоксигрупу, арилкарбамоїлоксигрупу, C_{1-3} алкілсульфоніламіногрупу, арилсульфоніламіногрупу, C_{1-3} алкіламіносульфоніл, ариламіносульфоніл, аміногрупу, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C_{1-3} алкілом, арилом, піролідінілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом або піперазинілом, або

R_a являє собою галоген, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу, ціаногрупу, нітрогрупу, карбоксамід, амідногрупу або гуанідногрупу, при цьому R_a додатково необов'язково може бути заміщений одним або більше радикалами R_b , де

R_b означає метил, етил, н-пропіл, ізопропіл, циклопропіл, циклопентил, циклогексил, феніл, метоксигрупу, етоксигрупу, н-пропоксигрупу, ізопропоксигрупу, феноксигрупу, бензилоксигрупу, фтор, хлор, бром, йод, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу, ціаногрупу, нітрогрупу або карбоксамід,

R_2 означає водень,

R_3 означає зв'язок, C_{1-3} алкіл, C_{2-4} алкілен, C_{5-6} циклоалкіл, бензил або нафтилметил, при цьому R_3 необов'язково заміщений одним або більше радикалами R_c , де

R_c являє собою C_{1-3} алкіл, C_{5-6} циклоалкіл, феніл, нафтил, інданіл, біцикло[2.2.1]гептаніл, біцикло[2.2.2]октаніл, біцикло[4.1.0]гептаніл, біцикло[3.1.0]гексаніл, біцикло[1.1.1]пентаніл, кубаніл, 1,2,3,4-тетрагідронафтил, фураніл, тетрагідропіраніл, тієніл, оксазоліл, тiazоліл, імідазоліл, піримідиніл, індоліл, бензофураніл, бензотієніл, бензтіазоліл, C_{1-3} алкоксигрупу, феноксигрупу, нафтилоксигрупу, C_{1-2} алканоліл, бензоїл, C_{1-2} алкоксикарбоніл, феноксикарбоніл, C_{1-2} алканолілоксигрупу, бензоїлоксигрупу, карбамоїл, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C_{1-3} алкілом або арилом, або

R_c являє собою C_{1-2} алканоліламіногрупу, бензоїламіногрупу, C_{1-2} алкілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, фенілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, уреїдогрупу, у якій будь-який атом азоту може бути незалежно заміщений C_{1-3} алкілом або арилом, або

R_c являє собою C_{1-2} алкоксикарбоніламіногрупу, феноксикарбоніламіногрупу, C_{1-2} алкілкарбамоїлоксигрупу, арилкарбамоїлоксигрупу, C_{1-2} алкілсульфоніламіногрупу, фенілсульфоніламіногрупу, C_{1-2} алкіламіносульфоніл, феніламіносульфоніл, аміногрупу, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C_{1-3} алкілом або фенілом, або

R_c являє собою галоген, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу або ціаногрупу, при цьому R_c додатково необов'язково може бути заміщений одним або більше радикалами R_d , де

R_d означає метил, циклопропіл, циклогексил, феніл, бензил, метоксигрупу, феноксигрупу, бензилоксигрупу, бензоїл, фтор, хлор, оксогрупу або ціаногрупу,
 R_5 означає зв'язок, водень, карбоніл, C_{1-5} алкіл, C_{1-5} алкоксі, C_{1-5} алкіламіно, C_{1-5} алкілтіо, C_{1-5} алкіл, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, C_{1-5} алкоксигрупу, феноксигрупу, C_{3-6} циклоалкіл, феніл, нафтил, бензил, інданіл, гетероцикліл, вибраний із групи, яка включає піролідиніл, піперидиніл, морфолініл, тіоморфолініл, піперазиніл, тетрагідропіраніл, оксазоліл, тiazоліл, імідазоліл, піридиніл, піримідиніл, бензимидазоліл і бензтіазоліл, гетероциклілоксигрупу, у якій гетероциклільний фрагмент вибраний із групи, вказаної вище в цьому абзаці, C_{1-3} алканоїл, бензоїл, нафтоїл, C_{1-3} алканоїлоксигрупу, бензилоксигрупу, C_{1-3} алкоксикарбоніл, бензилоксикарбоніл, феноксикарбоніл, бензоїлоксигрупу, карбамоїл, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C_{1-3} алкілом, фенілом, піролідинілом, піперидинілом, морфолінілом, піперазинілом, оксазолілом, тiazолілом, імідазолілом, піридинілом або піримідинілом, або

R_5 означає C_{1-3} алканоїламіногрупу, ароїламіногрупу, C_{1-3} алкілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, фенілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, уреїдогрупу, у якій будь-який атом азоту може бути незалежно заміщений C_{1-3} алкілом, фенілом, піролідинілом, піперидинілом, морфолінілом, піперазинілом, оксазолілом, тiazолілом, імідазолілом, піридинілом, піримідинілом, бензофуранілом, бензотієнілом, бензимидазолілом або бензтіазолілом, або

R_5 означає C_{1-3} алкоксикарбоніламіногрупу, феноксикарбоніламіногрупу, C_{1-3} алкілкарбамоїлоксигрупу, фенілкарбамоїлоксигрупу, C_{1-3} алкілсульфоніламіногрупу, фенілсульфоніламіногрупу, C_{1-3} алкіламіносульфоніл, феніламіносульфоніл, аміногрупу, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C_{1-3} алкілом, фенілом, піролідинілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом, піперазинілом, оксазолілом, тiazолілом, імідазолілом, піридинілом, піримідинілом, бензимидазолілом або бензтіазолілом, або
 R_5 означає галоген, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу, ціаногрупу або карбоксамід, при цьому R_5 додатково необов'язково може бути заміщений одним або більше радикалами R_e , де R_e являє собою C_{1-3} алкіл, C_{1-3} алкоксигрупу, C_{3-7} циклоалкіл, феніл, нафтил, інданіл, піролідиніл, піперидиніл, морфолініл, піперазиніл, тетрагідропіраніл, індоліл, тієніл, оксазоліл, тiazоліл, імідазоліл, піридиніл, піримідиніл, бензимидазоліл, бензтіазоліл, бензоксазоліл, C_{1-3} алканоїл, ароїл, C_{1-3} алканоїлоксигрупу, феноксигрупу, бензилоксигрупу, C_{1-3} алкоксикарбоніл, феноксикарбоніл, бензоїлоксигрупу, карбамоїл, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C_{1-3} алкілом, фенілом, піролідинілом, піперидинілом, морфолінілом, піперазинілом, оксазолілом, тiazолілом, імідазолілом, піридинілом, піримідинілом, бензимидазолілом або бензтіазолілом, або

R_e являє собою C_{1-3} алканоїламіногрупу, бензоїламіногрупу, C_{1-3} алкілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, фенілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, уреїдогрупу, у якій будь-який атом азоту може бути незалежно заміщений C_{1-3} алкілом, фенілом, піролідинілом, піперидинілом, морфолінілом, піперазинілом, оксазолілом, тiazолілом, імідазолілом, піридинілом, піримідинілом, бензимидазолілом або бензтіазолілом, або

R_e являє собою C_{1-3} алкоксикарбоніламіногрупу, феноксикарбоніламіногрупу, C_{1-3} алкілкарбамоїлоксигрупу, фенілкарбамоїлоксигрупу, C_{1-3} алкілсульфоніламіногрупу, фенілсульфоніламіногрупу, C_{1-3} алкіламіносульфоніл, феніламіносульфоніл, аміногрупу, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C_{1-3} алкілом, фенілом, нафтилом, піролідинілом, піперидинілом, морфолінілом, піперазинілом, оксазолілом, тiazолілом, імідазолілом, піридинілом, піримідинілом, бензимидазолілом або бензтіазолілом, або
 R_e являє собою галоген, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу, ціаногрупу або карбоксамід, при цьому R_e додатково необов'язково може бути заміщений одним або більше радикалами R_f , де R_f означає метил, феніл, толілсульфоніл, метоксигрупу, феноксигрупу, бензилоксигрупу, фтор, хлор, бром, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу або карбоксамід.

11. Сполука за п. 10, у якій

Het означає піперидиніл, піролідиніл, азетидиніл, азепаніл або тетрагідропіраніл, при цьому кожне з вказаних кілець заміщене одним або більше радикалами R_5 ,

Y означає $C(O)$,

R_1 означає зв'язок, метил, етил, ізопропіл, метоксигрупу, етоксигрупу, циклопропіл, циклопентил, циклогексил, феноксигрупу, феніл, бензил, нафтил, піролідиніл, піперидиніл, морфолініл, тіоморфолініл, піперазиніл, фураніл, тієніл, тiazоліл, імідазоліл, піридиніл, піразиніл або аміногрупу, при цьому R_1 необов'язково заміщений одним або більше радикалами R_a , де R_a являє собою зв'язок, метил, етил, циклопропіл, феніл, піролідиніл, піперидиніл, морфолініл, тіоморфолініл, піперазиніл, тієніл, імідазоліл, метоксигрупу, ацетил, ацетоксигрупу, феноксигрупу, бензилоксигрупу, метоксикарбоніл, феноксикарбоніл, бензоїлоксигрупу, карбамоїл, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений метилом, етилом або фенілом, або

R_a являє собою ацетиламіногрупу, бензоїламіногрупу, метилтіогрупу, фенілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, уреїдогрупу, у якій будь-який атом азоту може бути незалежно заміщений метилом, етилом або фенілом, або

R_a являє собою метоксикарбоніламіногрупу, феноксикарбоніламіногрупу, метилкарбамоїлоксигрупу, фенілкарбамоїлоксигрупу, метилсульфоніламіногрупу, фенілсульфоніламіногрупу, метиламіносульфоніл, феніламіносульфоніл, аміногрупу, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений метилом або фенілом, або R_a являє собою фтор, хлор, бром, йод, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу, ціаногрупу, нітрогрупу або карбоксамід, при цьому R_a додатково необов'язково може бути заміщений одним або більше радикалами R_b , де R_b означає метил, циклопропіл, феніл, метоксигрупу, феноксигрупу, бензилоксигрупу, фтор, хлор, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу або карбоксамід, R_3 означає зв'язок, C_{1-3} алкіл, C_{2-4} алкілен, C_{5-6} циклоалкіл, бензил або нафтилметил, при цьому R_3 необов'язково заміщений одним або більше радикалами R_c , де R_c являє собою метил, етил, н-пропіл, ізопропіл, C_{5-6} циклоалкіл, інданіл, біцикло[2.2.1]гептаніл, біцикло[2.2.2]октаніл, біцикло[4.1.0]гептаніл, біцикло[3.1.0]гексаніл, біцикло[1.1.1]пентаніл, кубаніл, 1,2,3,4-тетрагідронафтил, тієніл, оксазоліл, тіазоліл, індоліл, бензофураніл, бензотієніл, бензтіазоліл, метоксигрупу, етоксигрупу, феноксигрупу, ацетил, бензоїл, метоксикарбоніл, феноксикарбоніл, ацетоксигрупу, бензоїлоксигрупу, карбамоїл, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений метилом, етилом або арилом, або R_c являє собою ацетиламіногрупу, бензоїламіногрупу, метилтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, фенілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, уреїдогрупу, у якій будь-який атом азоту може бути незалежно заміщений метилом, етилом або арилом, або R_c являє собою метоксикарбоніламіногрупу, феноксикарбоніламіногрупу, метилкарбамоїлоксигрупу, фенілкарбамоїлоксигрупу, метилсульфоніламіногрупу, фенілсульфоніламіногрупу, метиламіносульфоніл, феніламіносульфоніл, аміногрупу, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений метилом, етилом або фенілом, або R_c являє собою фтор, хлор або оксогрупу, при цьому R_c додатково необов'язково може бути заміщений одним або більше радикалами R_d , де R_d означає метил, циклопропіл, феніл, метоксигрупу, фтор, хлор або оксогрупу, R_5 означає зв'язок, водень, карбоніл, C_{1-4} алкіл, C_{1-4} алкоксі- C_{1-4} алкіл, C_{1-4} алкіламіно- C_{1-4} алкіл, C_{1-4} алкілтіо- C_{1-4} алкіл, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, C_{1-4} алкоксигрупу, феноксигрупу, циклопропіл, циклопентил, циклогексил, феніл, нафтил, бензил, інданіл, гетероцикліл, вибраний із групи, яка включає піролідініл, піперидиніл, морфолініл, піперазиніл, тетрагідропіраніл, оксазоліл, тіазоліл, імідазоліл, піридиніл, піримідиніл, бензимидазоліл і бензтіазоліл, гетероциклілоксигрупу, у якій гетероциклільний фрагмент вибраний із групи, вказаної вище в цьому абзаці, C_{1-2} алканойл, бензоїл, нафтоїл, C_{1-2} алканойлоксигрупу, бензилоксигрупу, C_{1-2} алкоксикарбоніл, бензилоксикарбоніл, феноксикарбоніл, бензоїлоксигрупу, карбамоїл, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C_{1-2} алкілом, фенілом, піролідінілом, піперидинілом, морфолінілом, піперазинілом, оксазолілом, тіазолілом, імідазолілом, піридинілом або піримідинілом, або R_5 означає C_{1-2} алканойламіногрупу, бензоїламіногрупу, C_{1-2} алкілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, фенілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, уреїдогрупу, у якій будь-який атом азоту може бути незалежно заміщений C_{1-2} алкілом, фенілом, піролідінілом, піперидинілом, морфолінілом, піперазинілом, оксазолілом, тіазолілом, імідазолілом, піридинілом, піримідинілом, бензимидазолілом або бензтіазолілом, або R_5 означає C_{1-2} алкоксикарбоніламіногрупу, феноксикарбоніламіногрупу, C_{1-2} алкілкарбамоїлоксигрупу, фенілкарбамоїлоксигрупу, C_{1-2} алкілсульфоніламіногрупу, фенілсульфоніламіногрупу, C_{1-2} алкіламіносульфоніл, феніламіносульфоніл, аміногрупу, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C_{1-2} алкілом, фенілом, піролідінілом, піперидинілом, морфолінілом, піперазинілом, оксазолілом, тіазолілом, імідазолілом, піридинілом або піримідинілом, або R_5 означає фтор, хлор, бром, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу або карбоксамід, при цьому R_5 додатково необов'язково може бути заміщений одним або більше радикалами R_e , де R_e являє собою C_{1-3} алкіл, C_{1-2} алкоксигрупу, C_{3-6} циклоалкіл, феніл, нафтил, інданіл, піролідініл, піперидиніл, морфолініл, піперазиніл, тетрагідропіраніл, індоліл, тієніл, оксазоліл, тіазоліл, імідазоліл, піридиніл, піримідиніл, бензимидазоліл, бензтіазоліл, бензоксазоліл, C_{1-2} алканойл, ароїл, C_{1-2} алканойлоксигрупу, феноксигрупу, бензилоксигрупу, C_{1-2} алкоксикарбоніл, феноксикарбоніл, бензоїлоксигрупу, карбамоїл, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C_{1-2} алкілом, фенілом, піролідінілом, піперидинілом, морфолінілом, піперазинілом, оксазолілом, тіазолілом, імідазолілом, піридинілом або піримідинілом, або R_e являє собою C_{1-2} алканойламіногрупу, бензоїламіногрупу, C_{1-2} алкілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, фенілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, уреїдогрупу, у якій будь-який атом азоту може бути незалежно заміщений C_{1-2} алкілом, фенілом, піролідінілом, піперидинілом, морфолінілом, піперазинілом, оксазолілом, тіазолілом, імідазолілом, піридинілом або піримідинілом, або R_e являє собою C_{1-2} алкоксикарбоніламіногрупу, феноксикарбоніламіногрупу, C_{1-2} алкілкарбамоїлоксигрупу, фенілкарбамоїлоксигрупу, C_{1-2} алкілсульфоніламіногрупу,

фенілсульфоніламіногрупу, C_{1-2} алкіламіносульфоніл, феніламіносульфоніл, аміногрупу, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C_{1-2} алкілом, фенілом, нафтилом, піролідінілом, піперидинілом, морфолінілом, піперазинілом, оксазолілом, тiazолілом, імідазолілом, піридинілом або піримідинілом, або

R_e являє собою фтор, хлор, бром, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу або карбоксамід, при цьому R_e додатково необов'язково може бути заміщений одним або більше радикалами R_f , де R_f означає метил, феніл, толілсульфоніл, метоксигрупу, феноксигрупу, бензилоксигрупу, фтор, хлор, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу або карбоксамід.

12. Сполука за п. 11, у якій

Het означає піперидин-4-іл, піперидин-3-іл, піролідин-3-іл, азетидин-3-іл, азебан-3-іл, азебан-4-іл або тетрагідропіран-4-іл, при цьому кожне з вказаних кілець необов'язково заміщене одним або більше радикалами R_5 ,

R_1 означає зв'язок, метил, етил, ізопропіл, метоксигрупу, циклопропіл, циклогексил, феноксигрупу, феніл, бензил, нафтил, піролідиніл, піперидиніл, морфолініл, тіоморфолініл, піперазиніл, фураніл, тієніл, тiazоліл, імідазоліл, піридиніл, піразиніл або аміногрупу, при цьому R_1 необов'язково заміщений одним або більше радикалами R_a , де

R_a являє собою метил, феніл, тієніл, метоксигрупу, ацетил, ацетоксигрупу, феноксигрупу, бензилоксигрупу, метоксикарбоніл, бензоїлоксигрупу, карбамоїл, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений метилом або фенілом, або

R_a являє собою ацетиламіногрупу, метилтіогрупу, фенілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, уреїдогрупу, у якій будь-який атом азоту може бути незалежно заміщений метилом або фенілом, або

R_a являє собою метоксикарбоніламіногрупу, метилкарбамоїлоксигрупу, фенілкарбамоїлоксигрупу, метилсульфоніламіногрупу, фенілсульфоніламіногрупу, аміногрупу, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений метилом або фенілом, або

R_a являє собою фтор, хлор, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу, ціаногрупу або карбоксамід, R_3 означає зв'язок, метил, етил, н-пропіл, пропеніл, бутеніл, ізобутеніл, циклогексил, бензил або нафтилметил, при цьому R_3 необов'язково заміщений одним або більше радикалами R_c , де

R_c являє собою метил, етил, н-пропіл, ізопропіл, циклогексил, цикlopентил, інданіл, біцикло[2.2.1]гептаніл, біцикло[2.2.2]октаніл, біцикло[4.1.0]гептаніл, біцикло[3.1.0]гексаніл, біцикло[1.1.1]пентаніл, кубаніл, 1,2,3,4-тетрагідронафтил, метоксигрупу, феноксигрупу, ацетил, бензоїл, метоксикарбоніл, феноксикарбоніл, ацетоксигрупу, бензоїлоксигрупу, метилтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, фенілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, фтор, хлор або оксогрупу,

R_5 означає зв'язок, водень, карбоніл, C_{1-4} алкіл, C_{1-2} алкоксі- C_{1-2} алкіл, C_{1-2} алкіламіно- C_{1-2} алкіл, C_{1-2} алкілтіо- C_{1-2} алкіл, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, C_{1-2} алкоксигрупу, феноксигрупу, циклопропіл, cyclopentил, циклогексил, феніл, бензил, гетероцикліл, вибраний із групи, яка включає піролідиніл, піперидиніл, морфолініл, тетрагідропіраніл, піридиніл і піримідиніл, гетероциклілоксигрупу, у якій гетероциклільний фрагмент вибраний із групи, вказаної вище в цьому абзаці, ацетил, бензоїл, ацетилоксигрупу, бензилоксигрупу, метоксикарбоніл, етоксикарбоніл, бензилоксикарбоніл, бензоїлоксигрупу, карбамоїл, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений метилом, етилом або фенілом, або

R_5 означає ацетиламіногрупу, бензоїламіногрупу, метилтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, фенілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, уреїдогрупу, у якій будь-який атом азоту може бути незалежно заміщений метилом, етилом або фенілом, або

R_5 означає метоксикарбоніламіногрупу, етоксикарбоніламіногрупу, феноксикарбоніламіногрупу, метилкарбамоїлоксигрупу, фенілкарбамоїлоксигрупу, метилсульфоніламіногрупу, фенілсульфоніламіногрупу, метиламіносульфоніл, феніламіносульфоніл, аміногрупу, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений метилом, етилом або фенілом, або

R_5 означає фтор, хлор, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу або карбоксамід, при цьому R_5 додатково необов'язково може бути заміщений одним або більше радикалами R_e , де

R_e являє собою метил, метоксигрупу, етоксигрупу, циклопропіл, cyclopentил, циклогексил, феніл, нафтил, інданіл, піперидиніл, морфолініл, індоліл, тієніл, піридиніл, ацетил, бензоїл, ацетилоксигрупу, феноксигрупу, бензилоксигрупу, метоксикарбоніл, етоксикарбоніл, карбамоїл, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений метилом, етилом або фенілом, або R_e являє собою ацетиламіногрупу, бензоїламіногрупу, метилтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, фенілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, уреїдогрупу, у якій будь-який атом азоту може бути незалежно заміщений метилом, етилом або фенілом, або

R_e являє собою метоксикарбоніламіногрупу, етоксикарбоніламіногрупу, фенілкарбамоїлоксигрупу, метилкарбамоїлоксигрупу, фенілкарбамоїлоксигрупу, метилсульфоніламіногрупу, фенілсульфоніламіногрупу, метиламіносульфоніл, феніламіносульфоніл, аміногрупу, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений метилом, етилом або фенілом, або

R_e являє собою фтор, хлор, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу або карбоксамід, при цьому R_e додатково необов'язково може бути заміщений одним або більше радикалами R_f , де R_f означає метил, феніл, толілсульфоніл, феноксигрупу, бензилоксигрупу, фтор, хлор або оксогрупу.

13. Сполука за п. 12, у якій

Het означає піперидин-4-іл, піперидин-3-іл, піролідин-3-іл, азетидин-3-іл або тетрагідропіран-4-іл, при цьому кожне з вказаних кілець заміщене одним або більше радикалами R_5 ,

R_1 означає ізопропіл, бензилоксигрупу, циклогексил, феніл, 4-(ацетиламіно)феніл, 4-(метансульфоніламіно)феніл, 4-метоксифеніл, 3-феноксифеніл, 4-хлорфеніл, 4-фторфеніл, 2-фторфеніл, 2-фтор-4-хлорфеніл, нафтил, тієнілметил, піперидиніл, морфолініл, піролідиніл, піперазиніл, фураніл, тієніл, 5-хлортієніл, піридин-4-іл, піразиніл, метиламіногрупу, етиламіногрупу, диметиламіногрупу або діетиламіногрупу,

R_3 означає етил, н-пропіл, пропеніл, бутеніл, ізобутеніл, бензил або нафтилметил, при цьому R_3 необов'язково заміщений одним або більше радикалами R_c , де

R_c являє собою метил, циклогексил, цикlopентил, інданіл, 1,2,3,4-тетрагідронафтил, метоксигрупу, метилтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, фтор або хлор,

R_5 означає зв'язок, карбоніл, метил, етил, н-пропіл, н-бутил, трет-бутил, ізопропіл, ізобутил, циклопропіл, цикlopентил, циклогексил, феніл, бензил, піперидиніл, тетрагідропіраніл, піримідиніл, ацетил, бензоїл, етоксикарбоніл, бензилоксикарбоніл, метилсульфоніламіногрупу, фенілсульфоніламіногрупу, метиламіногрупу, диметиламіногрупу, фтор, оксогрупу або карбоксигрупу, при цьому R_5 додатково необов'язково може бути заміщений одним або більше радикалами R_e , де

R_e являє собою метил, циклопропіл, цикlopентил, циклогексил, феніл, нафтил, інданіл, тієніл, 5-метилтієніл, метоксигрупу, феноксигрупу, бензилоксигрупу, піперидиніл, піридиніл, індоліл, 1-(толілсульфоніл)індоліл, карбамоїл, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений метилом, фенілом або бензилом, або

R_e являє собою гідроксигрупу, фтор, хлор, оксогрупу, диметиламіногрупу або трифторметил.

14. Сполука за п. 13, у якій

Het означає піперидин-4-іл, піперидин-3-іл, піролідин-3-іл або азетидин-3-іл, при цьому кожне з вказаних кілець заміщене одним або більше радикалами R_5 ,

R_1 означає феніл, 4-(ацетиламіно)феніл, 4-(метансульфоніламіно)феніл, 3-феноксифеніл, 4-хлорфеніл, 4-фторфеніл, тієнілметил, морфолініл, піролідиніл, піперидиніл, піперазиніл, 5-хлортієніл, піридин-4-іл або піразиніл,

R_3 означає н-бутил, ізобутил, 2,2-диметилпропіл, циклогексилметил, пропеніл, ізобутеніл, 4-метоксибензил, 4-хлорбензил, 3,4-дихлорбензил, 3-хлорбензил, 2,4-дихлорбензил, 4-метилбензил, 3-метилбензил або нафт-2-илметил, при цьому конфігурація у стереоцентрі, що визначається замісниками R_2 і R_3 , коли вони мають різні значення, і атомом вуглецю, до якого вони приєднані, являє собою L-конфігурацію, і

R_5 означає зв'язок, метил, етил, н-пропіл, н-бутил, н-пентил, 2-пентил, 3-пентил, фенетил, фенпропіл, 2,2-диметилпропіл, трет-бутил, ізопропіл, ізобутил, циклопропіл, цикlopентил, циклогексил, циклопропілметил, цикlopентилметил, циклогексилметил, феніл, бензил, нафтилметил, інданілметил, піридинілметил, індолілметил, тієнілметил, 5-метилтієнілметил, піперидиніл, піперидинілкарбоніл, піридинілкарбоніл, тетрагідропіраніл, піримідиніл, ацетил, бензоїл, етоксикарбоніл, бензилоксикарбоніл, трет-бутоксикарбоніл, метилкарбамоїл, фенілкарбамоїл, бензилкарбамоїл, метилсульфоніламіногрупу, фенілсульфоніламіногрупу, метиламіногрупу, диметиламіногрупу, метилциклогексил, метилбензил, метоксибензил, феноксифеніл, бензилоксифеніл, N-[(4-метилфеніл)сульфоніл]індолілметил, фторбензил, дифторбензил, хлорбензил, N,N-диметиламіноацетил, трифторметилбензил, фтор, оксогрупу або карбоксигрупу.

15. Сполука за п. 9, у якій

Het означає піперидиніл, піролідиніл, азетидиніл, азепаніл, оксепаніл, тетрагідропіраніл, оксетаніл або тетрагідротіопіраніл, при цьому кожне з вказаних кілець необов'язково заміщене одним або більше радикалами R_5 ,

R_1 означає зв'язок, C_{1-4} алкіл, C_{1-4} алкоксигрупу, циклопропіл, циклогексил, феноксигрупу, нафтилоксигрупу, феніл, бензил, нафтил, піролідиніл, піперидиніл, морфолініл, тіоморфолініл, піперазиніл, фураніл, тієніл, оксазоліл, тіазоліл, імідазоліл, піридиніл, піримідиніл, піразиніл, піридазиніл, індоліл, хінолініл, бензофураніл, бензтієніл, бензімідазоліл, бензтіазоліл, бензоксазоліл або аміногрупу, при цьому R_1 необов'язково заміщений одним або більше радикалами R_a , де

R_a являє собою метил, етил, пропіл, ізопропіл, циклопропіл, циклогексил, феніл, піролідиніл, піперидиніл, морфолініл, тіоморфолініл, піперазиніл, тієніл, імідазоліл, метоксигрупу, етоксигрупу, ацетил, ацетоксигрупу, феноксигрупу, нафтилоксигрупу, бензилоксигрупу, метоксикарбоніл, етоксикарбоніл, феноксикарбоніл, нафтилоксикарбоніл, бензоїлоксигрупу, карбамоїл, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений метилом, етилом, фенілом, нафтилом, піролідинілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом або піперазинілом, або

R_a являє собою ацетиламіногрупу, бензоїламіногрупу, метилтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, етилтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, фенілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, уреїдогрупу, у якій будь-який атом азоту може бути незалежно заміщений метилом, етилом, фенілом, нафтилом, піролідінілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом або піперазинілом, або

R_a являє собою метоксикарбоніламіногрупу, етоксикарбоніламіногрупу, феноксикарбоніламіногрупу, C₁₋₂алкілкарбамоїлоксигрупу, фенілкарбамоїлоксигрупу, нафтилкарбамоїлоксигрупу, C₁₋₂алкілсульфоніламіногрупу, фенілсульфоніламіногрупу, нафтилсульфоніламіногрупу, C₁₋₂алкіламіносальфоніл, феніламіносальфоніл, нафтиламіносальфоніл, аміногрупу, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений метилом, етилом, фенілом, нафтилом, піролідінілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом або піперазинілом, або

R_a являє собою галоген, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу, ціаногрупу, нітрогрупу, карбоксамід, амідногрупу або гуанідногрупу, при цьому R_a додатково необов'язково може бути заміщений одним або більше радикалами R_b, де

R_b означає метил, етил, циклопропіл, циклогексил, феніл, метоксигрупу, етоксигрупу, феноксигрупу, бензилоксигрупу, фтор, хлор, бром, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу, ціаногрупу, нітрогрупу або карбоксамід,

R₂ означає водень або метил,

R₃ означає зв'язок, метил, етил, н-пропіл, ізопропіл, н-бутил, ізобутил, н-пентил, пропеніл, ізобутеніл, циклогексил, бензил або нафтилметил, при цьому R₃ необов'язково заміщений одним або більше радикалами R_c, де

R_c являє собою метил, етил, циклогексил, циклопентил, феніл, нафтил, біцикло[3.1.0]гексаніл, біцикло[1.1.1]пентаніл, кубаніл, фураніл, тетрагідропіраніл, тієніл, оксазоліл, тіазоліл, імідазоліл, піримідиніл, метоксигрупу, етоксигрупу, феноксигрупу, ацетил, бензоїл, метоксикарбоніл, феноксикарбоніл, ацетоксигрупу, бензоїлоксигрупу, карбамоїл, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений метилом або фенілом, або

R_c являє собою ацетиламіногрупу, бензоїламіногрупу, метилтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, фенілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, уреїдогрупу, у якій будь-який атом азоту може бути незалежно заміщений метилом або фенілом, або

R_c являє собою метоксикарбоніламіногрупу, феноксикарбоніламіногрупу, метилкарбамоїлоксигрупу, фенілкарбамоїлоксигрупу, метилсульфоніламіногрупу, фенілсульфоніламіногрупу, метиламіносальфоніл, феніламіносальфоніл, аміногрупу, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений метилом або фенілом, або

R_c являє собою хлор, фтор, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу або ціаногрупу, або

R₂ і R₃ разом з атомом вуглецю, до якого вони приєднані, необов'язково утворюють кільце, вибране з групи, яка включає циклопентил, циклогексил, циклогептил, тетрагідропіраніл, тетрагідротіопіраніл, тетрагідрофураніл, піролідініл, піперидиніл, піперазиніл, морфолініл і тетрагідротіофеніл,

R₄ означає водень,

R₅ означає зв'язок, водень, карбоніл, C₁₋₅алкіл, C₁₋₅алкоксіC₁₋₅алкіл, C₁₋₅алкіламіноC₁₋₅алкіл, C₁₋₅алкілтіоC₁₋₅алкіл, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, C₁₋₅алкоксигрупу, феноксигрупу, нафтилоксигрупу, циклопропіл, циклопентил, циклогексил, феніл, бензил, гетероцикліл, вибраний із групи, яка включає піролідініл, піперидиніл, морфолініл, тетрагідропіраніл, піридиніл і піримідиніл, гетероциклілоксигрупу, у якій гетероциклільний фрагмент вибраний із групи, вказаної вище в цьому абзаці, ацетил, бензоїл, ацилоксигрупу, бензилоксигрупу, метоксикарбоніл, етоксикарбоніл, бензилоксикарбоніл, бензоїлоксигрупу, карбамоїл, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений метилом, етилом або фенілом, або

R₅ означає ацетиламіногрупу, бензоїламіногрупу, фенілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, уреїдогрупу, у якій будь-який атом азоту може бути незалежно заміщений метилом, етилом або фенілом, або

R₅ означає метоксикарбоніламіногрупу, етоксикарбоніламіногрупу, феноксикарбоніламіногрупу, метилкарбамоїлоксигрупу, фенілкарбамоїлоксигрупу, фенілсульфоніламіногрупу, феніламіносальфоніл, аміногрупу, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений метилом, етилом або фенілом, або

R₅ означає фтор, хлор, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу або карбоксамід, при цьому R₅ додатково необов'язково може бути заміщений одним або більше радикалами R_e, де

R_e являє собою метил, етил, метоксигрупу, етоксигрупу, циклопропіл, циклопентил, циклогексил, феніл, нафтил, інданіл, піперидиніл, морфолініл, індолил, тієніл, піридиніл, метоксигрупу, етоксигрупу, ацетил, бензоїл, ацилоксигрупу, феноксигрупу, бензилоксигрупу, метоксикарбоніл, етоксикарбоніл, карбамоїл, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений метилом, етилом або фенілом, або

R_e являє собою ацетиламіногрупу, бензоїламіногрупу, метилтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, фенілтіогрупу або метилтіогрупу, де атом сірки може

бути окислений до сульфоксиду або сульфону, уреїдогрупу, у якій будь-який атом азоту може бути незалежно заміщений метилом, етилом або фенілом, або

R_e являє собою метоксикарбоніламіногрупу, етоксикарбоніламіногрупу, феноксикарбоніламіногрупу, метилкарбамоїлоксигрупу, фенілкарбамоїлоксигрупу, метилсульфоніламіногрупу, фенілсульфоніламіногрупу, метиламіносульфоніл, феніламіносульфоніл, аміногрупу, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений метилом, етилом або фенілом, або

R_e являє собою фтор, хлор, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу або карбоксамід, при цьому R_e додатково необов'язково може бути заміщений одним або більше радикалами R_f , де R_f означає метил, феніл, толілсульфоніл, феноксигрупу, бензилоксигрупу, фтор, хлор або оксогрупу.

16. Сполука за п. 15, у якій

R_1 означає зв'язок, метил, етил, н-пропіл, ізопропіл, метоксигрупу, етоксигрупу, бензилоксигрупу, циклопропіл, циклогексил, феноксигрупу, нафтилоксигрупу, феніл, бензил, нафтил, піролідиніл, піперидиніл, морфолініл, тіоморфолініл, піперазиніл, фураніл, тієніл, оксазоліл, тіазоліл, імідазоліл, піридиніл, піримідиніл, піразиніл, піридазиніл, індоліл, хінолініл, бензофураніл, бензтієніл, бензімідазоліл, бензтіазоліл, бензоксазоліл або аміногрупу, при цьому R_1

необов'язково заміщений одним або більше радикалами R_a , де

R_a являє собою метил, циклопропіл, феніл, галоген, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу, ціаногрупу, нітрогрупу або карбоксамід.

R_3 означає зв'язок, метил, етил, н-пропіл, ізопропіл, н-бутил, ізобутил, н-пентил, пропеніл, ізобутеніл, бензил або нафтилметил, при цьому R_3 необов'язково заміщений одним або більше радикалами R_c , де

R_c являє собою метил, етил, циклогексил, циклопентил, феніл, фураніл, тетрагідропіраніл, тієніл, оксазоліл, тіазоліл, метоксигрупу, феноксигрупу, ацетил, бензоїл, метоксикарбоніл, карбамоїл, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений метилом або фенілом, або

R_c являє собою ацетиламіногрупу, бензоїламіногрупу, метилтіогрупу, метоксикарбоніламіногрупу, метилкарбамоїлоксигрупу, метилсульфоніламіногрупу, метиламіносульфоніл, аміногрупу, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений метилом, або

R_c являє собою фтор або оксогрупу, при цьому

R_2 і R_3 разом з атомом вуглецю, до якого вони приєднані, необов'язково утворюють кільце,

вибране з групи, яка включає циклопентил, циклогексил, циклогептил, тетрагідропіраніл,

тетрагідротіопіраніл, тетрагідрофураніл, піролідиніл і піперидиніл,

R_5 означає метил, етил, н-пропіл, н-бутил, н-пентил, 2-пентил, 3-пентил, фенетил, фенпропіл, 2,2-диметилпропіл, трет-бутил, ізопропіл, ізобутил, циклопропіл, циклопентил, циклогексил,

циклопропілметил, циклопентилметил, циклогексилметил, феніл, бензил, 2-метилбензил, 3-

метилбензил, 4-метилбензил, 2,6-диметилбензил, 2,5-диметилбензил, 2,4-диметилбензил, 2,3-

диметилбензил, 3,4-диметилбензил, 3,5-диметилбензил, 2,4,6-триметилбензил, 2-метоксибензил,

3-метоксибензил, 4-метоксибензил, 2-феноксибензил, 3-феноксибензил, 4-феноксибензил, 2-

бензилоксибензил, 3-бензилоксибензил, 4-бензилоксибензил, 2-фторбензил, 3-фторбензил, 4-

фторбензил, 2,6-дифторбензил, 2,5-дифторбензил, 2,4-дифторбензил, 2,3-дифторбензил, 3,4-

дифторбензил, 3,5-дифторбензил, 2,4,6-трифторбензил, 2-трифторметилбензил, 3-

трифторметилбензил, 4-трифторметилбензил, нафтилметил, інданілметил, піридинілметил,

індолілметил, тієнілметил, 5-метилтієнілметил, піперидиніл, піперидинілкарбоніл,

піридинілкарбоніл, тетрагідропіраніл, піримідиніл, ацетил, бензоїл, етоксикарбоніл,

бензилоксикарбоніл, трет-бутоксикарбоніл, метилкарбамоїл, фенілкарбамоїл, бензилкарбамоїл,

метилсульфоніламіногрупу, фенілсульфоніламіногрупу, метиламіногрупу, диметиламіногрупу,

фтор, оксогрупу або карбоксигрупу.

17. Сполука за п. 16, у якій

R_1 означає метоксигрупу, бензилоксигрупу, циклогексил, феноксигрупу, нафтилоксигрупу, феніл,

бензил, нафтил, піролідиніл, піперидиніл, морфолініл, тіоморфолініл, піперазиніл, фураніл, тієніл,

оксазоліл, тіазоліл, імідазоліл, піридиніл, піримідиніл, піразиніл, індоліл, хінолініл, бензофураніл,

бензтієніл, бензімідазоліл, бензтіазоліл, бензоксазоліл або аміногрупу, при цьому R_1

необов'язково заміщений одним або більше радикалами R_a , де

R_a являє собою метил, феніл, фтор, хлор, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу або карбоксамід,

R_3 означає зв'язок, метил, етил, н-пропіл, ізопропіл, н-бутил, ізобутил, н-пентил, пропеніл, ізобутеніл або бензил, при цьому R_3 необов'язково заміщений одним або більше радикалами R_c ,

де

R_c являє собою метил, етил, циклогексил, циклопентил, феніл, фураніл, тетрагідропіраніл, тієніл,

оксазоліл, тіазоліл, метоксигрупу, феноксигрупу, ацетил, бензоїл, метоксикарбоніл,

ацетиламіногрупу, метилтіогрупу, метилсульфоніламіногрупу або фтор, при цьому

R_2 і R_3 разом з атомом вуглецю, до якого вони приєднані, необов'язково утворюють кільце,

вибране з групи, яка включає циклопентил, циклогексил, циклогептил, тетрагідропіраніл,

тетрагідротіопіраніл і тетрагідрофураніл, і

R_5 означає метил, етил, н-пропіл, н-бутил, фенетил, фенпропіл, трет-бутил, ізопропіл, ізобутил,

циклопропіл, циклогексил, циклопропілметил, циклогексилметил, феніл, бензил, 2-метоксибензил,

3-метоксибензил, 4-метоксибензил 4-фторбензил, 3,5-дифторбензил, 4-трифторметилбензил, нафтилметил, піридинілметил, індолілметил, тієнілметил, ацетил, бензоїл, етоксикарбоніл, бензилоксикарбоніл, трет-бутоксикарбоніл, фенілкарбамоїл, фенілсульфоніламіногрупу або фтор.

18. Сполука за п. 17, у якій

Het означає піролідиніл, піперидиніл або тетрагідропіраніл,

R₁ означає бензилоксигрупу, феноксигрупу, нафтилоксигрупу, феніл, нафтил, піролідиніл, піперидиніл, морфолініл, тіоморфолініл, піперазиніл, піридиніл, індоліл, хінолініл, бензофураніл, бензтієніл, бензimidазоліл, бензтіазоліл, бензоксазоліл або феніламіногрупу,

R₃ означає н-пропіл, ізобутил, пропеніл, ізобутеніл або 2,2-диметилпропіл,

R₂ і R₃ разом з атомом вуглецю, до якого вони приєднані, необов'язково утворюють кільце, вибране з групи, яка включає циклопентил, циклогексил і циклогептил, і

R₅ означає метил, етил, н-пропіл, фенетил, трет-бутил, ізопропіл, ізобутил, циклогексил, циклогексилметил, бензил, 4-фторбензил, нафтилметил, ацетил, бензоїл або бензилоксикарбоніл.

19. Сполука за пунктом 7, вибрана з групи, яка включає:

[1-(4-ціано-1-метилпіперидин-4-ілкарбамоїл)-2-циклогексилетил]амід морфолін-4-карбонової кислоти,

4-ацетиламіно-N-[1-(4-ціано-1-метилпіперидин-4-ілкарбамоїл)-2-циклогексилетил]бензамід,

4-ацетиламіно-N-[1-(4-ціано-1-метилпіперидин-4-ілкарбамоїл)-3,3-диметилбутил]бензамід,

[1-(4-ціано-1-метилпіперидин-4-ілкарбамоїл)-3,3-диметилбутил]амід морфолін-4-карбонової кислоти,

[1-(1-бензил-4-ціано піперидин-4-ілкарбамоїл)-2-циклогексилетил]амід морфолін-4-карбонової кислоти,

гідрохлорид [1-(4-ціано піперидин-4-ілкарбамоїл)-2-циклогексилетил]амід морфолін-4-карбонової кислоти,

{1-[4-ціано-1-(1-метилетил)піперидин-4-ілкарбамоїл]-2-циклогексилетил]амід морфолін-4-карбонової кислоти,

[1-(4-ціано-1-фенетилпіперидин-4-ілкарбамоїл)-2-циклогексилетил]амід морфолін-4-карбонової кислоти,

{1-[3-ціано-1-бензилпіролідин-3-ілкарбамоїл]-2-циклогексилетил]амід морфолін-4-карбонової кислоти,

[1-(4-ціано-1-пропілпіперидин-4-ілкарбамоїл)-2-циклогексилетил]амід морфолін-4-карбонової кислоти,

[1-(4-ціано-1-ізопропілпіперидин-4-ілкарбамоїл)-3,3-диметилбутил]амід морфолін-4-карбонової кислоти,

[1-(1-фенетил-4-ціано піперидин-4-ілкарбамоїл)-3,3-диметилбутил]амід морфолін-4-карбонової кислоти,

[1-(1-н-пропіл-4-ціано піперидин-4-ілкарбамоїл)-3,3-диметилбутил]амід морфолін-4-карбонової кислоти,

[1-(1-бензил-4-ціано піперидин-4-ілкарбамоїл)-3,3-диметилбутил]амід морфолін-4-карбонової кислоти,

4-ацетиламіно-N-[1-(1-бензил-4-ціано піперидин-4-ілкарбамоїл)-2-циклогексилетил]бензамід,

4-ацетиламіно-N-[1-(4-ціано-1-ізопропілпіперидин-4-ілкарбамоїл)-2-циклогексилетил]бензамід,

[1-(1-бензил-3-ціано піперидин-3-ілкарбамоїл)-2-циклогексилетил]амід морфолін-4-карбонової кислоти,

N-[1-(4-ціано-1-метилпіперидин-4-ілкарбамоїл)-2-циклогексилетил]бензамід,

4-(ацетиламінометил)-N-[1-(4-ціано-1-метилпіперидин-4-ілкарбамоїл)-2-циклогексилетил]бензамід,

N-[1-(4-ціано-1-метилпіперидин-4-ілкарбамоїл)-2-циклогексилетил]ізонікотинамід,

[1-(4-ціано-1-метилпіперидин-4-ілкарбамоїл)-2-циклогексилетил]амід піразин-2-карбонової кислоти,

[1-(4-ціано-1-метилпіперидин-4-ілкарбамоїл)-2-циклогексилетил]амід 5-хлортіофен-2-карбонової кислоти,

4-хлор-N-[1-(4-ціано-1-метилпіперидин-4-ілкарбамоїл)-2-циклогексилетил]бензамід,

N-[1-(4-ціано-1-метилпіперидин-4-ілкарбамоїл)-2-циклогексилетил]-3-феноксibenзамід,

N-[1-(1-бензил-3-ціано піролідин-3-ілкарбамоїл)-2-циклогексилетил]ізонікотинамід,

[1-(1-бензил-3-ціано піролідин-3-ілкарбамоїл)-2-циклогексилетил]амід піразин-2-карбонової кислоти,

{1-[3-ціано-1-(циклогексилметил)піролідин-3-ілкарбамоїл]-2-циклогексилетил]амід морфолін-4-карбонової кислоти,

[1-(3-ціано-1-бензилпіролідин-3-ілкарбамоїл)-3,3-диметилбутил]амід морфолін-4-карбонової кислоти,

N-[1-(1-бензил-3-ціано піролідин-3-ілкарбамоїл)-3,3-диметилбутил]бензамід,

[1-(1-бензил-3-ціано піролідин-3-ілкарбамоїл)-3,3-диметилбутил]амід піразин-2-карбонової кислоти,

{1-[3-ціано-1-(1-метилетил)піролідин-3-ілкарбамоїл]-2-циклогексилетил]амід морфолін-4-

карбонової кислоти,

[illegible]

[1-(3-ціано-1-циклогексилметилпіролідін-3-ілкарбамоїл)-3-метилбутил]амід морфолін-4-карбонової кислоти,
 4-хлор-N-[1-(4-ціано-1-пропілпіперидин-4-ілкарбамоїл)-3,3-диметилбутил]бензамід,
 [1-(4-ціано-1-пропілпіперидин-4-ілкарбамоїл)-3,3-диметилбутил]амід піразин-2-карбонової кислоти,
 (4-ціано-1-пропілпіперидин-4-іл)амід 4,4-диметил-2-(2-тіофен-2-ілацетиламіно)пентанової кислоти,
 [1-(1-бензил-3-ціанопіролідін-3-ілкарбамоїл)-3-метилбутил]амід морфолін-4-карбонової кислоти,
 [1-(4-ціано-1-циклогексилпіперидин-4-ілкарбамоїл)-3,3-диметилбутил]амід морфолін-4-карбонової кислоти,
 [2-(4-хлорфеніл)-1-(4-ціано-1-пропілпіперидин-4-ілкарбамоїл)етил]амід морфолін-4-карбонової кислоти,
 [1-(4-ціано-1-пропілпіперидин-4-ілкарбамоїл)-2-(3,4-дихлорфеніл)етил]амід морфолін-4-карбонової кислоти,
 [1-(4-ціано-1-пропілпіперидин-4-ілкарбамоїл)-2-нафталін-2-ілетил]амід морфолін-4-карбонової кислоти,
 [1-(4-ціано-1-пропілпіперидин-4-ілкарбамоїл)-3-метилбутил]амід морфолін-4-карбонової кислоти,
 [1-(4-ціано-1,2-диметилпіперидин-4-ілкарбамоїл)-3,3-диметилбутил]амід морфолін-4-карбонової кислоти

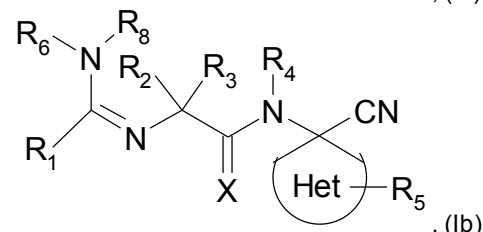
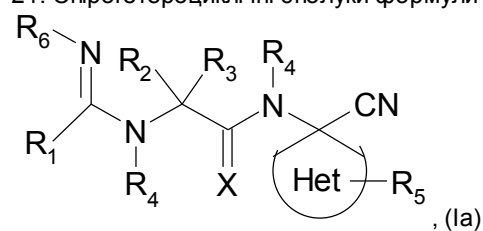
та їх фармацевтично прийнятні похідні.

20. Сполука за п. 15, вибрана з групи, яка включає:

бензиловий ефір [1-(1-бензил-4-ціанопіперидин-4-ілкарбамоїл)-3-метилбутил]карбамінової кислоти,
 трет-бутиловий ефір [1-(1-бензил-3-ціанопіролідін-3-ілкарбамоїл)циклогексил]карбамінової кислоти,
 бензиловий ефір [1-(4-ціано-1-метилпіперидин-4-ілкарбамоїл)-3-метилбутил]карбамінової кислоти,
 бензиловий ефір [1-(1-бензил-3-ціанопіролідін-3-ілкарбамоїл)циклогексил]карбамінової кислоти,
 [1-(1-бензил-3-ціанопіролідін-3-ілкарбамоїл)-3-метилбутил]амід нафталін-2-карбонової кислоти,
 [1-(4-ціано-1-пропілпіперидин-4-ілкарбамоїл)-3-метилбутил]амід морфолін-4-карбонової кислоти,
 [1-(3-ціано-1-циклогексилметилпіролідін-3-ілкарбамоїл)-3-метилбутил]амід нафталін-2-карбонової кислоти,
 бензиловий ефір [1-(1-бензил-3-ціанопіролідін-3-ілкарбамоїл)-3-метилбутил]карбамінової кислоти,
 [1-(1-бензил-3-ціанопіролідін-3-ілкарбамоїл)-3-метилбутил]амід морфолін-4-карбонової кислоти,
 бензиловий ефір [1-(3-ціано-1-циклогексилметилпіролідін-3-ілкарбамоїл)-3-метилбутил]карбамінової кислоти,
 [1-(3-ціано-1-циклогексилметилпіролідін-3-ілкарбамоїл)-3-метилбутил]амід морфолін-4-карбонової кислоти,
 [1-(1-бензил-3-ціанопіролідін-3-ілкарбамоїл)-3-метилбут-3-еніл]амід морфолін-4-карбонової кислоти

та їх фармацевтично прийнятні похідні.

21. Спірогетероциклічні сполуки формули (Ia) або (Ib):



де

Het означає азепаніл, піперидиніл, піролідиніл, азетидиніл, оксепаніл, тетрагідропіраніл, тетрагідротіопіраніл, тетрагідрофураніл, оксетаніл, азоканіл, оксоканіл, 1,3-діазоканіл, 1,4-діазоканіл, 1,5-діазоканіл, 1,3-діоксоканіл, 1,4-діоксоканіл, 1,5-діоксоканіл, 1,3-оксазоканіл, 1,4-оксазоканіл, 1,5-оксазоканіл, 1,3-діазепаніл, 1,4-діазепаніл, 1,3-діоксепаніл, 1,4-діоксепаніл, 1,3-оксазепаніл, 1,4-оксазепаніл, 1,2-тіазоканіл-1,1-діоксид, 1,2,8-тіадіазоканіл-1,1-діоксид, 1,2-тіазепаніл-1,1-діоксид, 1,2,7-тіадіазепаніл-1,1-діоксид, тетрагідротіофеніл, гексагідропіримідиніл,

гексагідропіридазиніл, піперазиніл, 1,4,5,6-тетрагідропіримідиніл, піразолідиніл, дигідрооксазоліл, дигідротіазоліл, дигідромідазоліл, ізоксазолініл, оксазолідиніл, 1,2-тіазинаніл-1,1-діоксид, 1,2,6-тіадіазинаніл-1,1-діоксид, ізотіазолідиніл-1,1-діоксид, імідазолідиніл-2,4-діон, імідазолідиніл, морфолініл, діоксаніл, тетрагідропіридиніл, тіоморфолініл, тіазолідиніл, дигідропіраніл, дитіаніл, декагідрохінолініл, декагідрохінолініл, 1,2,3,4-тетрагідрохінолініл, індолініл, октагідрохінолініл, дигідроіндолініл, октагідроіндолініл, октагідроіндолініл, декагідрохіназолініл, декагідрохінокалініл, 1,2,3,4-тетрагідрохіназолініл або 1,2,3,4-тетрагідрохінокалініл, або

з'єднану місточковим зв'язком C_6-C_{10} біциклогрупу, у якій один або більше атомів вуглецю необов'язково замінені на гетероатом, вибраний з N, O і S, при цьому кожний із вказаних замісників необов'язково заміщений одним або більше радикалами R_5 , R_1 означає зв'язок, водень, C_{1-10} алкіл, C_{1-10} алкоксигрупу, арилоксигрупу, C_{3-8} циклоалкіл, C_{3-8} циклоалкілоксигрупу, арил, бензил, тетрагідронафтил, інденіл, інданіл, C_{1-10} алкілсульфоніл, C_{1-10} алкіл, C_{3-8} циклоалкілсульфоніл, C_{1-10} алкіл, арилсульфоніл, C_{1-10} алкіл, гетероцикліл, вибраний із групи, яка включає азепаніл, азоканіл, піролідиніл, піперидиніл, морфолініл, тіоморфолініл, піперазиніл, індолініл, піраніл, тетрагідропіраніл, тетрагідротіопіраніл, тіопіраніл, фураніл, тетрагідрофураніл, тієніл, піроліл, оксазоліл, ізоксазоліл, тіазоліл, імідазоліл, піридиніл, піримідиніл, піразиніл, придазиніл, тетразоліл, піразоліл, індоліл, бензофураніл, бензотієніл, бензімідазоліл, бензтіазоліл, бензізоксазоліл, хінолініл, тетрагідрохінолініл, ізохінолініл, тетрагідрохінолініл, хіназолініл, тетрагідрохіназолініл, бензоксазоліл і хіноксалініл, гетероциклілоксигрупу, у якій гетероциклільний фрагмент вибраний із групи, вказаної вище в цьому абзаці, гідроксигрупу або аміногрупу, при цьому R_1 необов'язково заміщений одним або більше радикалами R_a , де

R_a являє собою зв'язок, C_{1-10} алкіл, C_{3-8} циклоалкіл, арил, тетрагідронафтил, інденіл, інданіл, піролідиніл, піперидиніл, морфолініл, тіоморфолініл, піперазиніл, індолініл, фураніл, тієніл, піроліл, оксазоліл, тіазоліл, імідазоліл, триазоліл, тетразоліл, піридиніл, піримідиніл, піразиніл, індоліл, бензофураніл, бензотієніл, бензімідазоліл, бензтіазоліл, бензоксазоліл, хінолініл, ізохінолініл, хіназолініл, хіноксалініл, C_{1-10} алкоксигрупу, C_{1-10} алканойл, C_{1-10} алканойлоксигрупу, арилоксигрупу, бензилоксигрупу, C_{1-10} алкоксикарбоніл, арилоксикарбоніл, ароїлоксигрупу, карбамоїл, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C_{1-10} алкілом, арилом, піролідинілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом, піперазинілом, індолінілом, фуранілом, тієнілом, піролілом, оксазолілом, тіазолілом, імідазолілом, триазолілом, тетразолілом, піридинілом, піримідинілом, піразинілом, індолілом, бензофуранілом, бензотієнілом, бензімідазолілом, бензтіазолілом, хінолінілом, ізохінолінілом, хіназолінілом або хіноксалінілом, або

R_a являє собою C_{1-10} алканойламіногрупу, ароїламіногрупу, C_{1-10} алкілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, арилтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, уреїдогрупу, у якій будь-який атом азоту може бути незалежно заміщений C_{1-10} алкілом, арилом, піролідинілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом, піперазинілом, індолінілом, фуранілом, тієнілом, піролілом, оксазолілом, тіазолілом, імідазолілом, триазолілом, тетразолілом, піридинілом, піримідинілом, піразинілом, індолілом, бензофуранілом, бензотієнілом, бензімідазолілом, бензтіазолілом, хінолінілом, ізохінолінілом, хіназолінілом або хіноксалінілом, або

R_a являє собою C_{1-10} алкоксикарбоніламіногрупу, арилоксикарбоніламіногрупу, C_{1-10} алкілкарбамоїлоксигрупу, арилкарбамоїлоксигрупу, C_{1-10} алкілсульфоніламіногрупу, арилсульфоніламіногрупу, C_{1-10} алкіламіносульфоніл, ариламіносульфоніл, аміногрупу, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C_{1-10} алкілом, арилом, піролідинілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом, піперазинілом, індолінілом, фуранілом, тієнілом, піролілом, оксазолілом, тіазолілом, імідазолілом, триазолілом, тетразолілом, піридинілом, піримідинілом, піразинілом, індолілом, бензофуранілом, бензотієнілом, бензімідазолілом, бензтіазолілом, хінолінілом, ізохінолінілом, хіназолінілом або хіноксалінілом, або

R_a являє собою галоген, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу, ціаногрупу, нітрогрупу, карбоксамід, амідногрупу або гуанідногрупу, при цьому R_a додатково необов'язково може бути заміщений одним або більше радикалами R_b ,

за умови, що R_1 і R_a одночасно не можуть означати зв'язок, при цьому

R_b означає насичений або ненасичений розгалужений або нерозгалужений C_{1-6} вуглецевий ланцюг, який необов'язково частково або повністю галогенований, при цьому один або більше атомів вуглецю необов'язково замінені на O, N, S(O), S(O)₂ або S, а вказаний ланцюг необов'язково незалежно заміщений 1-2 оксогрупами, групою -NH₂ або одним або більше замісниками, вибраними з групи, яка включає C_{1-4} алкіл, піролідиніл, піперидиніл, морфолініл, тіоморфолініл, піперазиніл, індолініл, фураніл, тієніл, піроліл, оксазоліл, тіазоліл, імідазоліл, триазоліл, тетразоліл, піридиніл, піримідиніл, піразиніл, індоліл, бензофураніл, бензотієніл, бензімідазоліл, бензтіазоліл, хінолініл, ізохінолініл, хіназолініл і хіноксалініл, або

R_b означає C_{3-6} циклоалкіл, арил, арилоксигрупу, бензилоксигрупу, галоген, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу, ціаногрупу, нітрогрупу, моно- C_{1-5} алкіламіногрупу, ді- C_{1-5} алкіламіногрупу, карбоксамід, амідногрупу або гуанідногрупу,

R_2 означає водень або C_{1-3} алкіл,

R₃ означає зв'язок, водень, C₁₋₁₀алкіл, C₂₋₁₀алкілен, C₃₋₈циклоалкіл, арилC₁₋₅алкіл або арил, при цьому R₃ необов'язково заміщений одним або більше радикалами R_c, де R_c являє собою C₁₋₁₀алкіл, C₃₋₈циклоалкіл, арил, інданіл, інденіл, біцикло[2.2.1]гептаніл, біцикло[2.2.2]октаніл, біцикло[4.1.0]гептаніл, біцикло[3.1.0]гексаніл, біцикло[1.1.1]пентаніл, кубаніл, 1,2,3,4-тетрагідронафтил, декагідронафтил, піролідиніл, піперидиніл, морфолініл, тіоморфолініл, піперазиніл, індолініл, фураніл, тетрагідрофураніл, піраніл, тетрагідропіраніл, тетрагідротіопіраніл, тієніл, піроліл, оксазоліл, тіазоліл, імідазоліл, піразоліл, триазоліл, тетразоліл, піридиніл, піримідиніл, піразиніл, індоліл, дигідробензофураніл, октогідробензофураніл, бензофураніл, бензотієніл, бензимидазоліл, бензтіазоліл, тетрагідрохінолініл, хінолініл, тетрагідроізохінолініл, ізохінолініл, хіназолініл, хіноксалініл, C₁₋₁₀алкоксигрупу, арилоксигрупу, C₁₋₁₀алканоїл, ароїл, C₁₋₁₀алкоксикарбоніл, арилоксикарбоніл, C₁₋₁₀алканілоксигрупу, ароїлоксигрупу, карбамоїл, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C₁₋₁₀алкілом, арилом, піролідинілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом, піперазинілом, індолінілом, фуранілом, тієнілом, піролілом, оксазолілом, тіазолілом, імідазолілом, триазолілом, тетразолілом, піридинілом, піримідинілом, піразинілом, індолілом, бензофуранілом, бензотієнілом, бензимидазолілом, бензтіазолілом, хінолінілом, ізохінолінілом, хіназолінілом або хіноксалінілом, або

R_c являє собою C₁₋₁₀алканоїламіногрупу, ароїламіногрупу, C₁₋₁₀алкілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, арилтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, уреїдогрупу, у якій будь-який атом азоту може бути незалежно заміщений C₁₋₁₀алкілом, арилом, піролідинілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом, піперазинілом, індолінілом, фуранілом, тієнілом, піролілом, оксазолілом, тіазолілом, імідазолілом, триазолілом, тетразолілом, піридинілом, піримідинілом, піразинілом, індолілом, бензофуранілом, бензотієнілом, бензимидазолілом, бензтіазолілом, хінолінілом, ізохінолінілом, хіназолінілом або хіноксалінілом, або

R_c являє собою C₁₋₁₀алкоксикарбоніламіногрупу, арилоксикарбоніламіногрупу, C₁₋₁₀алкілкарбамоїлоксигрупу, арилкарбамоїлоксигрупу, C₁₋₁₀алкілсульфоніламіногрупу, арилсульфоніламіногрупу, C₁₋₁₀алкіламіносульфоніл, ариламіносульфоніл, аміногрупу, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C₁₋₁₀алкілом, арилом, піролідинілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом, піперазинілом, індолінілом, фуранілом, тієнілом, піролілом, оксазолілом, тіазолілом, імідазолілом, триазолілом, тетразолілом, піридинілом, піримідинілом, піразинілом, індолілом, бензофуранілом, бензотієнілом, бензимидазолілом, бензтіазолілом, хінолінілом, ізохінолінілом, хіназолінілом або хіноксалінілом, або

R_c являє собою галоген, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу, ціаногрупу, нітрогрупу, амідногрупу або гуанідногрупу, при цьому R_c додатково необов'язково може бути заміщений одним або більше радикалами R_d, де

R_d означає C₁₋₅алкіл, C₃₋₆циклоалкіл, арил, арилC₁₋₅алкіл, C₁₋₅алкоксигрупу, арилоксигрупу, арилC₁₋₅алкоксигрупу, ароїл, аміногрупу, галоген, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу, ціаногрупу, нітрогрупу, амідногрупу або гуанідногрупу, або

R₂ і R₃ разом з атомом вуглецю, до якого вони приєднані, необов'язково утворюють неароматичне 5-7-членне циклоалкільне або гетероциклічне кільце,

R₄ у кожному випадку незалежно означає водень, гідроксигрупу або C₁₋₃алкіл,

R₅ означає зв'язок, водень, карбоніл, C₁₋₁₀алкіл, C₁₋₁₀алкоксіC₁₋₁₀алкіл, C₁₋₁₀алкіламіноC₁₋₁₀алкіл, C₁₋₁₀алкілтіоC₁₋₁₀алкіл, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, C₁₋₁₀алкоксигрупу, арилоксигрупу, C₃₋₈циклоалкіл, арил, бензил, тетрагідронафтил, інденіл, інданіл, C₃₋₇циклоалкілсульфонілC₁₋₅алкіл, арилсульфонілC₁₋₅алкіл, гетероцикліл, вибраний із групи, яка включає піролідиніл, піперидиніл, морфолініл, тіоморфолініл, піперазиніл, індолініл, піраніл, тетрагідропіраніл, тіопіраніл, тетрагідротіопіраніл, фураніл, тетрагідрофураніл, тієніл, піроліл, оксазоліл, ізоксазоліл, тіазоліл, імідазоліл, піридиніл, піримідиніл, піразиніл, піридазиніл, тетразоліл, триазоліл, піразоліл, індоліл, бензофураніл, бензотієніл, бензимидазоліл, бензтіазоліл, хінолініл, тетрагідрохінолініл, ізохінолініл, тетрагідроізохінолініл, хіназолініл, тетрагідрохіназолініл, бензоксазоліл і хіноксалініл, гетероциклілоксигрупу, у якій гетероциклільний фрагмент вибраний із групи, вказаної вище в цьому абзаці, C₁₋₁₀алканоїл, ароїл, C₁₋₁₀алканоїлоксигрупу, бензилоксигрупу, C₁₋₁₀алкоксикарбоніл, арилC₁₋₅алкоксикарбоніл, арилоксикарбоніл, ароїлоксигрупу, карбамоїл, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C₁₋₁₀алкілом, арилом, піролідинілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом, піперазинілом, індолінілом, фуранілом, тієнілом, піролілом, оксазолілом, тіазолілом, імідазолілом, триазолілом, тетразолілом, піридинілом, піримідинілом, піразинілом, індолілом, бензофуранілом, бензотієнілом, бензимидазолілом, бензтіазолілом, хінолінілом, ізохінолінілом, хіназолінілом або хіноксалінілом, або

R₅ означає C₁₋₁₀алканоїламіногрупу, ароїламіногрупу, C₁₋₁₀алкілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, арилтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, уреїдогрупу, у якій будь-який атом азоту може бути незалежно заміщений C₁₋₁₀алкілом, арилом, піролідинілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом, піперазинілом, індолінілом, фуранілом, тієнілом, піролілом, оксазолілом, тіазолілом, імідазолілом, триазолілом, тетразолілом, піридинілом, піримідинілом, піразинілом, індолілом, бензофуранілом, бензотієнілом, бензимидазолілом, бензтіазолілом, хінолінілом, ізохінолінілом, хіназолінілом або хіноксалінілом, або

бензотієнілом, бензимидазолілом, бензтіазолілом, хінолінілом, ізохінолінілом, хіназолінілом або хіноксалінілом, або

R_5 означає C_{1-10} алкоксикарбоніламіногрупу, арилоксикарбоніламіногрупу, C_{1-10} алкілкарбамоїлоксигрупу, арилкарбамоїлоксигрупу, C_{1-10} алкілсульфоніламіногрупу, арилсульфоніламіногрупу, C_{1-10} алкіламіносульфоніл, ариламіносульфоніл, аміногрупу, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C_{1-10} алкілом, арилом, піролідинілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом, піперазинілом, індолінілом, фуранілом, тієнілом, піролілом, оксазолілом, тіазолілом, імідазолілом, триазолілом, тетразолілом, піридинілом, примідинілом, піразинілом, індолілом, бензофуранілом, бензотієнілом, бензимидазолілом, бензтіазолілом, хінолінілом, ізохінолінілом, хіназолінілом або хіноксалінілом, або

R_5 означає галоген, гідроксигрупу, оксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу, ціаногрупу, нітрогрупу, карбоксамід, амідиногрупу або гуанідиногрупу, при цьому R_5 додатково необов'язково може бути заміщений одним або більше радикалами R_e , де

R_e являє собою C_{1-10} алкіл, C_{1-10} алкоксі- C_{1-10} алкіл, C_{1-10} алкіламіно- C_{1-10} алкіл, C_{1-10} алкілтіо- C_{1-10} алкіл, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, C_{1-10} алкоксигрупу, C_{3-8} циклоалкіл, арил, тетрагідронафтил, іденіл, інданіл, піролідиніл, піперидиніл, морфолініл, тіоморфолініл, піперазиніл, індолініл, тіопіраніл, тетрагідротіопіраніл, піраніл, тетрагідропіраніл, тетрагідрофураніл, фураніл, тієніл, піроліл, оксазоліл, тіазоліл, імідазоліл, триазоліл, тетразоліл, піридиніл, примідиніл, піразиніл, індоліл, бензофураніл, бензотієніл, бензимидазоліл, бензтіазоліл, бензоксазоліл, бензізоксазоліл, хінолініл, ізохінолініл, хіназолініл, хіноксалініл, C_{1-10} алканоліл, ароіл, C_{1-10} алканолілоксигрупу, арилоксигрупу, бензилоксигрупу, C_{1-10} алкоксикарбоніл, арил- C_{1-10} алкоксикарбоніл, арилоксикарбоніл, ароїлоксигрупу, карбамоїл, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C_{1-10} алкілом, арилом, піролідинілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом, піперазинілом, індолінілом, фуранілом, тієнілом, піролілом, оксазолілом, тіазолілом, імідазолілом, триазолілом, тетразолілом, піридинілом, примідинілом, піразинілом, індолілом, бензофуранілом, бензотієнілом, бензимидазолілом, бензтіазолілом, хінолінілом, ізохінолінілом, хіназолінілом або хіноксалінілом, або

R_e являє собою C_{1-10} алканоліламіногрупу, ароїламіногрупу, C_{1-10} алкілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, арилтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, уреїдогрупу, у якій будь-який атом азоту може бути незалежно заміщений C_{1-10} алкілом, арилом, піролідинілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом, піперазинілом, індолінілом, фуранілом, тієнілом, піролілом, оксазолілом, тіазолілом, імідазолілом, триазолілом, тетразолілом, піридинілом, примідинілом, піразинілом, індолілом, бензофуранілом, бензотієнілом, бензимидазолілом, бензтіазолілом, хінолінілом, ізохінолінілом, хіназолінілом або хіноксалінілом, або

R_e являє собою C_{1-10} алкоксикарбоніламіногрупу, арилоксикарбоніламіногрупу, C_{1-10} алкілкарбамоїлоксигрупу, арилкарбамоїлоксигрупу, C_{1-10} алкілсульфоніламіногрупу, арилсульфоніламіногрупу, C_{1-10} алкіламіносульфоніл, ариламіносульфоніл, аміногрупу, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C_{1-10} алкілом, арилом, піролідинілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом, піперазинілом, індолінілом, фуранілом, тієнілом, піролілом, оксазолілом, тіазолілом, імідазолілом, триазолілом, тетразолілом, піридинілом, примідинілом, піразинілом, індолілом, бензофуранілом, бензотієнілом, бензимидазолілом, бензтіазолілом, хінолінілом, ізохінолінілом, хіназолінілом або хіноксалінілом, або

R_e являє собою галоген, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу, ціаногрупу, нітрогрупу, карбоксамід, амідиногрупу або гуанідиногрупу, при цьому R_e додатково необов'язково може бути заміщений одним або більше радикалами R_f , де

R_f означає C_{1-5} алкіл, C_{3-6} циклоалкіл, толілсульфоніл, C_{1-5} алкоксигрупу, арил, арилоксигрупу, бензилоксигрупу, галоген, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу, ціаногрупу, нітрогрупу, карбоксамід, амідиногрупу або гуанідиногрупу,

R_6 означає водень, гідроксигрупу, нітрil або

насичений або ненасичений розгалужений або нерозгалужений C_{1-6} вуглецевий ланцюг, який необов'язково частково або повністю галогенований, при цьому один або більше С-атомів необов'язково замінені на О, NH, S(O), S(O)₂ або S, а вказаний ланцюг необов'язково незалежно заміщений 1-2 оксогрупами, групою -NH₂ або одним або більше замісниками, вибраними з групи, яка включає C_{1-4} алкіл, піролідиніл, піперидиніл, морфолініл, тіоморфолініл, піперазиніл, індолініл, піраніл, тіопіраніл, фураніл, тієніл, піроліл, оксазоліл, ізоксазоліл, тіазоліл, імідазоліл, піридиніл, примідиніл, піразиніл, індоліл, бензофураніл, бензотієніл, бензимидазоліл, бензтіазоліл, хінолініл, ізохінолініл, хіназолініл, бензоксазоліл і хіноксалініл, при цьому R_1 і R_6 у формулі (I) або (II) необов'язково утворюють 4-8-членну моно- або 7-12-членну поліциклічну гетерокільцеву систему, кожна з яких є ароматичною або неароматичною, причому кожне таке гетерокільце необов'язково заміщене одним або більше радикалами R_7 ,

R_7 і R_8 кожен незалежно означає

- C_{1-5} алкільний ланцюг, необов'язково перерваний одним або двома атомами N, O або групами S(O)_m і необов'язково заміщену 1-2 замісниками, вибраними з групи, яка включає оксогрупу, аміногрупу, гідроксигрупу, галоген, C_{1-4} алкіл, піролідиніл, піперидиніл, морфолініл, тіоморфолініл, піперазиніл, індолініл, піраніл, тіопіраніл, фураніл, тієніл, піроліл, оксазоліл, ізоксазоліл, тіазоліл,

імідазоліл, піридиніл, піримідиніл, піразиніл, індоліл, бензофураніл, бензотієніл, бензимидазоліл, бензтіазоліл, хінолініл, ізохінолініл, хіназолініл, бензоксазоліл і хіноксалініл,
- арил, арилоксигрупу, ароїл, фураніл, тієніл, піроліл, імідазоліл, піридиніл, піримідиніл, C₁-5алканоїл, C₁-5алкоксикарбоніл, арилоксикарбоніл, бензилоксикарбоніл, C₁-5алканоїламіногрупу, ароїламіногрупу, C₁-5алкілтіогрупу, арилтіогрупу, C₁-5алкілсульфоніламіногрупу, арилсульфоніламіногрупу, C₁-5алкіламіносульфоніл, ариламіносульфоніл, C₃-6циклоалкіл і бензилоксигрупу, при цьому кожний із вказаних вище залишків необов'язково галогенований,
- галоген, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу, нітрил, нітрогрупу або NH₂C(O)-, при цьому m означає 0, 1 або 2, і

X означає =O, =S або =N-R₆, де R₆ має вищевказані значення, та їх фармацевтично прийнятні похідні.

22. Сполука за п. 21, у якій

Het означає піперидиніл, піролідиніл, тетрагідропіраніл, тетрагідротіопіраніл, азетидиніл, азепаніл, оксепаніл, тетрагідрофураніл, оксетаніл, гексагідропіримідиніл, гексагідропіридазиніл, піперазиніл, 1,4,5,6-тетрагідропіримідиніл, октагідроіндолізиніл, октагідрохінолізиніл, декагідрохінолініл, 1,2,3,4-тетрагідрохінолініл, дигідрооксазоліл, 1,2-тіазинаніл-1,1-діоксид, 1,2,6-тіадіазинаніл-1,1-діоксид, ізотіазолідиніл-1,1-діоксид, імідазолідиніл, піразолідиніл або з'єднану містчковим зв'язком біциклогрупу, вибрану з групи, яка включає азабіцикло[3.2.1]октан, азабіцикло[2.2.1]гептан, азабіцикло[2.2.2]октан, азабіцикло[3.2.2]нонан, азабіцикло[2.1.1]гексан, азабіцикло[3.1.1]гептан, азабіцикло[3.3.2]декан і 2-окса- або 2-тіа-5-азабіцикло[2.2.1]гептан, при цьому кожне з вказаних кілець заміщене одним або більше радикалами R₅,

R₁ означає зв'язок, водень, C₁-7алкіл, C₁-7алкоксигрупу, C₃-7циклоалкіл, арилоксигрупу, феніл, бензил, нафтил, тетрагідронафтил, C₁-7алкілсульфоніл, C₁-7алкіл, C₃-7циклоалкілсульфоніл, C₁-7алкіл, арилсульфоніл, C₁-7алкіл, піролідиніл, піперидиніл, морфолініл, тіоморфолініл, піперазиніл, індолініл, піраніл, тіопіраніл, фураніл, тієніл, піроліл, оксазоліл, тіазоліл, імідазоліл, піридиніл, ізоксазоліл, піримідиніл, піразиніл, піридазиніл, індоліл, хінолініл, бензофураніл, бензтієніл, бензимидазоліл, бензтіазоліл, бензоізоксазоліл, бензоксазоліл або аміногрупу, при цьому R₁ необов'язково заміщений одним або більше радикалами R_a, де R_a являє собою зв'язок C₁-7алкіл, C₃-6циклоалкіл, феніл, нафтил, піролідиніл, піперидиніл, морфолініл, тіоморфолініл, піперазиніл, фураніл, тієніл, оксазоліл, тіазоліл, імідазоліл, триазоліл, тетразоліл, піридиніл, піримідиніл, піразиніл, індоліл, бензофураніл, бензотієніл, бензимидазоліл, бензтіазоліл, бензоксазоліл, хінолініл, ізохінолініл, хіназолініл, хіноксалініл, C₁-7алкоксигрупу, C₁-7алканоїл, C₁-7алканоїлоксигрупу, арилоксигрупу, бензилоксигрупу, C₁-7алкоксикарбоніл, арилоксикарбоніл, ароїлоксигрупу, карбамоїл, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C₁-7алкілом, арилом, піролідинілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом, піперазинілом, фуранілом, тієнілом, оксазолілом, тіазолілом, імідазолілом, триазолілом, тетразолілом, піридинілом, піримідинілом, піразинілом, індолілом, бензофуранілом, бензотієнілом, бензимидазолілом, бензтіазолілом, хінолінілом, ізохінолінілом, хіназолінілом або хіноксалінілом, або

R_a являє собою C₁-7алканоїламіногрупу, ароїламіногрупу, C₁-7алкілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, арилтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, уреїдогрупу, у якій будь-який атом азоту може бути незалежно заміщений C₁-7алкілом, арилом, піролідинілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом, піперазинілом, фуранілом, тієнілом, оксазолілом, тіазолілом, імідазолілом, триазолілом, тетразолілом, піридинілом, піримідинілом, піразинілом, індолілом, бензофуранілом, бензотієнілом, бензимидазолілом, бензтіазолілом, хінолінілом, ізохінолінілом, хіназолінілом або хіноксалінілом, або

R_a являє собою C₁-7алкоксикарбоніламіногрупу, арилоксикарбоніламіногрупу, C₁-7алкілкарбамоїлоксигрупу, арилкарбамоїлоксигрупу, C₁-7алкілсульфоніламіногрупу, арилсульфоніламіногрупу, C₁-7алкіламіносульфоніл, ариламіносульфоніл, аміногрупу, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C₁-7алкілом, арилом, піролідинілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом, піперазинілом, фуранілом, тієнілом, оксазолілом, тіазолілом, імідазолілом, триазолілом, тетразолілом, піридинілом, піримідинілом, піразинілом, індолілом, бензофуранілом, бензотієнілом, бензимидазолілом, бензтіазолілом, хінолінілом, ізохінолінілом, хіназолінілом або хіноксалінілом, або

R_a являє собою галоген, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу, ціаногрупу, нітрогрупу, карбоксамід, амідногрупу або гуанідногрупу, при цьому R_a додатково необов'язково може бути заміщений одним або більше радикалами R_b, де

R_b означає C₁-5алкіл, C₃-6циклоалкіл, арил, C₁-5алкоксигрупу, арилоксигрупу, бензилоксигрупу, галоген, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу, ціаногрупу, нітрогрупу, карбоксамід, амідногрупу або гуанідногрупу,

R₂ означає водень, метил або етил,

R₃ означає зв'язок, водень, C₁-5алкіл, C₂-5алкілен, C₃-7циклоалкіл, арил, C₁-3алкіл або арил, при цьому R₃ необов'язково заміщений одним або більше радикалами R_c, де

R_c являє собою C₁-5алкіл, C₃-7циклоалкіл, арил, інданіл, інденіл, біцикло[2.2.1]гептаніл, біцикло[2.2.2]октаніл, біцикло[4.1.0]гептаніл, біцикло[3.1.0]гексаніл, біцикло[1.1.1]пентаніл, кубаніл, 1,2,3,4-тетрагідронафтил, піролідиніл, піперидиніл, морфолініл, тіоморфолініл, піперазиніл,

індолініл, фураніл, тетрагідрофураніл, піраніл, тетрагідропіраніл, тієніл, піроліл, оксазоліл, тіазоліл, імідазоліл, піразоліл, триазоліл, тетразоліл, піридиніл, піримідиніл, піразиніл, індоліл, бензофураніл, бензотієніл, бензимидазоліл, бензтіазоліл, хінолініл, ізохінолініл, хіназолініл, хіноксалініл, C₁₋₅алкоксигрупу, арилоксигрупу, C₁₋₅алканоїл, ароїл, C₁₋₅алкоксикарбоніл, арилоксикарбоніл, C₁₋₅алканоїлоксигрупу, ароїлоксигрупу, карбамоїл, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C₁₋₅алкілом, арилом, піролідінілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом, піперазинілом, індолінілом, фуранілом, тієнілом, піролілом, оксазолілом, тіазолілом, імідазолілом, триазолілом, тетразолілом, піридинілом, піримідинілом, піразинілом, індолілом, бензофуранілом, бензотієнілом, бензимидазолілом, бензтіазолілом, хінолінілом, ізохінолінілом, хіназолінілом або хіноксалінілом, або

R_c являє собою C₁₋₅алканоїламіногрупу, ароїламіногрупу, C₁₋₅алкілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, уреїдогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, уреїдогрупу, у якій будь-який атом азоту може бути незалежно заміщений C₁₋₅алкілом, арилом, піролідінілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом, піперазинілом, індолінілом, фуранілом, тієнілом, піролілом, оксазолілом, тіазолілом, імідазолілом, триазолілом, тетразолілом, піридинілом, піримідинілом, піразинілом, індолілом, бензофуранілом, бензотієнілом, бензимидазолілом, бензтіазолілом, хінолінілом, ізохінолінілом, хіназолінілом або хіноксалінілом, або

R_c являє собою C₁₋₅алкоксикарбоніламіногрупу, арилоксикарбоніламіногрупу, C₁₋₅алкілкарбамоїлоксигрупу, арилкарбамоїлоксигрупу, C₁₋₅алкілсульфоніламіногрупу, арилсульфоніламіногрупу, C₁₋₅алкіламіносульфоніл, ариламіносульфоніл, аміногрупу, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C₁₋₅алкілом, арилом, піролідінілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом, піперазинілом, індолінілом, фуранілом, тієнілом, піролілом, оксазолілом, тіазолілом, імідазолілом, триазолілом, тетразолілом, піридинілом, піримідинілом, піразинілом, індолілом, бензофуранілом, бензотієнілом, бензимидазолілом, бензтіазолілом, хінолінілом, ізохінолінілом, хіназолінілом або хіноксалінілом, або

R_c являє собою галоген, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу, ціаногрупу, нітрогрупу, амідногрупу або гуанідногрупу, при цьому R_c додатково необов'язково може бути заміщений одним або більше радикалами R_d, де

R_d являє собою C₁₋₅алкіл, C₃₋₆циклоалкіл, арил, арилC₁₋₄алкіл, C₁₋₅алкоксигрупу, арилоксигрупу, арилC₁₋₅алкоксигрупу, ароїл, галоген, гідроксигрупу, оксогрупу або ціаногрупу,

R₄ означає водень або метил,

R₅ означає зв'язок, водень, карбоніл, C₁₋₈алкіл, C₁₋₈алкоксіC₁₋₈алкіл, C₁₋₈алкіламіноC₁₋₈алкіл, C₁₋₈алкілтіоC₁₋₈алкіл, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, C₁₋₈алкоксигрупу, арилоксигрупу, C₃₋₇циклоалкіл, арил, бензил, тетрагідронафтил, інданіл, гетероцикліл, вибраний із групи, яка включає піролідініл, піперидиніл, морфолініл, тіоморфолініл, піперазиніл, індолініл, піраніл, тетрагідропіраніл, тіопіраніл, тетрагідротіопіраніл, фураніл, тетрагідрофураніл, тієніл, оксазоліл, тіазоліл, імідазоліл, піридиніл, піримідиніл, піразиніл, тетразоліл, триазоліл, піразоліл, індоліл, бензофураніл, бензотієніл, бензимидазоліл, бензтіазоліл, хінолініл, ізохінолініл, хіназолініл, бензоксазоліл і хіноксалініл, гетероциклілоксигрупу, у якій гетероциклільний фрагмент вибраний із групи, вказаної вище в цьому абзаці, C₁₋₇алканоїл, ароїл, C₁₋₇алканоїлоксигрупу, бензилоксигрупу, C₁₋₇алкоксикарбоніл, арилC₁₋₄алкоксикарбоніл, арилоксикарбоніл, ароїлоксигрупу, карбамоїл, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C₁₋₇алкілом, арилом, піролідінілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом, піперазинілом, фуранілом, тієнілом, оксазолілом, тіазолілом, імідазолілом, піридинілом, піримідинілом, піразинілом, індолілом, бензофуранілом, бензотієнілом, бензимидазолілом, бензтіазолілом, хінолінілом, ізохінолінілом, хіназолінілом або хіноксалінілом, або

R₅ означає C₁₋₇алканоїламіногрупу, ароїламіногрупу, C₁₋₇алкілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, уреїдогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, уреїдогрупу, у якій будь-який атом азоту може бути незалежно заміщений C₁₋₇алкілом, арилом, піролідінілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом, піперазинілом, фуранілом, тієнілом, оксазолілом, тіазолілом, імідазолілом, піридинілом, піримідинілом, піразинілом, індолілом, бензофуранілом, бензотієнілом, бензимидазолілом, бензтіазолілом, хінолінілом, ізохінолінілом, хіназолінілом або хіноксалінілом, або

R₅ означає C₁₋₇алкоксикарбоніламіногрупу, арилоксикарбоніламіногрупу, C₁₋₇алкілкарбамоїлоксигрупу, арилкарбамоїлоксигрупу, C₁₋₇алкілсульфоніламіногрупу, арилсульфоніламіногрупу, C₁₋₇алкіламіносульфоніл, ариламіносульфоніл, аміногрупу, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C₁₋₇алкілом, арилом, піролідінілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом, піперазинілом, фуранілом, тієнілом, оксазолілом, тіазолілом, імідазолілом, піридинілом, піримідинілом, піразинілом, індолілом, бензофуранілом, бензотієнілом, бензимидазолілом, бензтіазолілом, хінолінілом, ізохінолінілом, хіназолінілом або хіноксалінілом, або

R₅ означає галоген, гідроксигрупу, оксигрупу, карбоксигрупу, ціаногрупу, нітрогрупу або карбоксамід, при цьому R₅ додатково необов'язково може бути заміщений одним або більше радикалами R_e, де

R_e являє собою C₁₋₇алкіл, C₁₋₇алкоксіC₁₋₇алкіл, C₁₋₇алкіламіноC₁₋₇алкіл, C₁₋₇алкілтіоC₁₋₇алкіл, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, C₁₋₇алкоксигрупу, C₃₋₇циклоалкіл,

арил, тетрагідронафтил, інданіл, піролідиніл, піперидиніл, морфолініл, тіоморфолініл, піперазиніл, тіопіраніл, тетрагідротіопіраніл, тетрагідропіраніл, тетрагідрофураніл, фураніл, тієніл, оксазоліл, тіазоліл, імідазоліл, піридиніл, піримідиніл, піразиніл, індоліл, бензофураніл, бензотієніл, бензимидазоліл, бензтіазоліл, бензоксазоліл, хінолініл, ізохінолініл, хіназолініл, хіноксалініл, C₁₋₅алканоїл, ароїл, C₁₋₅алканоїлоксигрупу, арилоксигрупу, бензилоксигрупу, C₁₋₅алкоксикарбоніл, арилоксикарбоніл, ароїлоксигрупу, карбамоїл, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C₁₋₅алкілом, арилом, піролідинілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом, піперазинілом, фуранілом, тієнілом, оксазолілом, тіазолілом, імідазолілом, піридинілом, піримідинілом, піразинілом, індолілом, бензофуранілом, бензотієнілом, бензимидазолілом, бензтіазолілом, хінолінілом, ізохінолінілом, хіназолінілом або хіноксалінілом, або

R_e являє собою C₁₋₅алканоїламіногрупу, ароїламіногрупу, C₁₋₅алкілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, арилтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, уреїдогрупу, у якій будь-який атом азоту може бути незалежно заміщений C₁₋₅алкілом, арилом, піролідинілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом, піперазинілом, фуранілом, тієнілом, оксазолілом, тіазолілом, імідазолілом, піридинілом, піримідинілом, піразинілом, індолілом, бензофуранілом, бензотієнілом, бензимидазолілом, бензтіазолілом, хінолінілом, ізохінолінілом, хіназолінілом або хіноксалінілом, або

R_e являє собою C₁₋₅алкоксикарбоніламіногрупу, арилоксикарбоніламіногрупу, C₁₋₅алкілкарбамоїлоксигрупу, арилкарбамоїлоксигрупу, C₁₋₅алкілсульфоніламіногрупу, арилсульфоніламіногрупу, C₁₋₅алкіламіносульфоніл, ариламіносульфоніл, аміногрупу, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C₁₋₅алкілом, арилом, піролідинілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом, піперазинілом, фуранілом, тієнілом, оксазолілом, тіазолілом, імідазолілом, піридинілом, піримідинілом, піразинілом, індолілом, бензофуранілом, бензотієнілом, бензимидазолілом, бензтіазолілом, хінолінілом, ізохінолінілом, хіназолінілом або хіноксалінілом, або

R_e являє собою галоген, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу, ціаногрупу, нітрогрупу, карбоксамід, амідиногрупу або гуанідиногрупу, при цьому R_e додатково необов'язково може бути заміщений одним або більше радикалами R_f, де

R_f означає метил, етил, трет-бутил, толілсульфоніл, C₁₋₃алкоксигрупу, циклопропіл, циклогексил, феніл, нафтил, феноксигрупу, бензилоксигрупу, фтор, хлор, бром, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу, ціаногрупу, нітрогрупу або карбоксамід,

R₆ означає водень, гідроксигрупу, нітрil або насичений або ненасичений розгалужений або нерозгалужений C₁₋₆вуглецевий ланцюг, який необов'язково частково або повністю галогенований, при цьому один або більше C-атомів необов'язково замінені на O, NH, S(O), S(O)₂ або S, а вказаний ланцюг необов'язково незалежно заміщений 1-2 оксогрупами, групою -NH₂ або одним або більше замісниками, вибраними з групи, яка включає C₁₋₄алкіл, піролідиніл, піперидиніл, морфолініл, тіоморфолініл, піперазиніл, індолініл, піраніл, тіопіраніл, фураніл, тієніл, піроліл, оксазоліл, ізоксазоліл, тіазоліл, імідазоліл, піридиніл, піримідиніл, піразиніл, індоліл, бензофураніл, бензотієніл, бензимидазоліл, бензтіазоліл, хінолініл, ізохінолініл, хіназолініл, бензоксазоліл і хіноксалініл,

при цьому R₁ і R₆ у сполуці формули (Ia) або формули (Ib) утворюють моноциклічне 5-, 6- або 7-членне ароматичне або неароматичне гетероциклічне кільце, необов'язково заміщене радикалом R₇, або біциклічне кільце, у якого перше 5-, 6- або 7-членне ароматичне або неароматичне гетероциклічне кільце сконденсоване з другим 5-7-членним ароматичним або неароматичним гетероциклічним або карбоциклічним кільцем, при цьому кожне з таких кілець необов'язково незалежно заміщене одним або більше радикалами R₇,

R₇ і R₈ незалежно один від одного означають C₁₋₅алкіл, C₃₋₆циклоалкіл, арил, C₁₋₅алкоксигрупу, арилоксигрупу, бензилоксигрупу, при цьому кожний із вказаних залишків необов'язково галогенований, або означають галоген, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу, нітрil, нітрогрупу або NH₂C(O)-,

m означає 0, 1 або 2, i

X означає O або S.

23. Сполука за п. 22, у якій

Het означає піперидиніл, піролідиніл, азетидиніл, азепаніл, оксепаніл, тетрагідропіраніл, тетрагідротіопіраніл, тетрагідрофураніл, оксетаніл, октагідроіндолізиніл, октагідрохінолізиніл або азабіцикло[3.2.1]октаніл, при цьому кожне з вказаних кілець необов'язково заміщене одним або більше радикалами R₅,

R₁ означає зв'язок, C₁₋₅алкіл, C₁₋₅алкоксигрупу, C₃₋₆циклоалкіл, арилоксигрупу, феніл, бензил, нафтил, C₁₋₃алкілсульфоніл, C₁₋₃алкіл, C₃₋₆циклоалкілсульфоніл, C₁₋₃алкіл, арилсульфоніл, C₁₋₃алкіл, піролідиніл, піперидиніл, морфолініл, тіоморфолініл, піперазиніл, фураніл, тієніл, оксазоліл, тіазоліл, імідазоліл, піридиніл, ізоксазоліл, піримідиніл, піразиніл, піридазиніл, індоліл, хінолініл, бензофураніл, бензтієніл, бензимидазоліл, бензтіазоліл, бензоксазоліл або аміногрупу, при цьому R₁ необов'язково заміщений одним або більше радикалами R_a, де

R_a являє собою зв'язок, C₁₋₃алкіл, циклопропіл, циклопентил, циклогексил, феніл, нафтил, піролідиніл, піперидиніл, морфолініл, тіоморфолініл, піперазиніл, фураніл, тієніл, оксазоліл, тіазоліл, імідазоліл, піридиніл, піримідиніл, бензимидазоліл, бензтіазоліл, бензоксазоліл, C₁₋₃алкоксигрупу, C₁₋₃алканоїл, C₁₋₃алканоїлоксигрупу, арилоксигрупу, бензилоксигрупу, C₁₋

залкоксикарбоніл, арилоксикарбоніл, ароїлоксигрупу, карбамоїл, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C_{1-3} алкілом, арилом, піролідінілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом, піперазинілом, тієнілом, оксазолілом, тіазолілом, імідазолілом, піридинілом, піримідинілом, бензимидазолілом або бензтіазолілом, або R_a являє собою C_{1-3} алканоліаміногрупу, ароїламіногрупу, C_{1-3} алкілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, арилтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, уреїдогрупу, у якій будь-який атом азоту може бути незалежно заміщений C_{1-3} алкілом, арилом, піролідінілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом або піперазинілом, або

R_a являє собою C_{1-3} залкоксикарбоніламіногрупу, арилоксикарбоніламіногрупу, C_{1-3} алкілкарбамоїлоксигрупу, арилкарбамоїлоксигрупу, C_{1-3} алкілсульфоніламіногрупу, арилсульфоніламіногрупу, C_{1-3} алкіламіносульфоніл, ариламіносульфоніл, аміногрупу, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C_{1-3} алкілом, арилом, піролідінілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом або піперазинілом, або

R_a являє собою галоген, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу, ціаногрупу, нітрогрупу, карбоксамід, амідіногрупу або гуанідіногрупу, при цьому R_a додатково необов'язково може бути заміщений одним або більше радикалами R_b , де

R_b означає C_{1-3} алкіл, C_{3-6} циклоалкіл, арил, C_{1-3} алкоксигрупу, арилоксигрупу, бензилоксигрупу, галоген, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу, ціаногрупу, нітрогрупу, карбоксамід, амідіногрупу або гуанідіногрупу,

R_2 означає водень або метил,

R_3 означає зв'язок, водень, C_{1-5} алкіл, C_{2-5} алкілен, C_{4-6} циклоалкіл або арил C_{1-2} алкіл, при цьому R_3 необов'язково заміщений одним або більше радикалами R_c , де

R_c являє собою C_{1-4} алкіл, C_{5-6} циклоалкіл, феніл, нафтил, інданіл, біцикло[2.2.1]гептаніл, біцикло[2.2.2]октаніл, біцикло[4.1.0]гептаніл, біцикло[3.1.0]гексаніл, біцикло[1.1.1]пентаніл, кубаніл, 1,2,3,4-тетрагідронафтил, піролідініл, піперидиніл, морфолініл, тіоморфолініл, індолініл, фураніл, тетрагідрофураніл, піраніл, тетрагідропіраніл, тієніл, піроліл, оксазоліл, тіазоліл, імідазоліл, піразоліл, піридиніл, піримідиніл, піразиніл, індоліл, бензофураніл, бензотієніл, бензимидазоліл, бензтіазоліл, хінолініл, ізохінолініл, хіназолініл, хіноксалініл, C_{1-4} алкоксигрупу, феноксигрупу, нафтилоксигрупу, C_{1-3} алканоліл, бензоїл, C_{1-3} алкоксикарбоніл, феноксикарбоніл, C_{1-3} алканоліоксигрупу, бензоїлоксигрупу, карбамоїл, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C_{1-5} алкілом або арилом, або

R_c являє собою C_{1-3} алканоліаміногрупу, бензоїламіногрупу, C_{1-3} алкілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, фенілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, уреїдогрупу, у якій будь-який атом азоту може бути незалежно заміщений C_{1-5} алкілом або арилом, або

R_c являє собою C_{1-3} залкоксикарбоніламіногрупу, арилоксикарбоніламіногрупу, C_{1-3} алкілкарбамоїлоксигрупу, арилкарбамоїлоксигрупу, C_{1-3} алкілсульфоніламіногрупу, арилсульфоніламіногрупу, C_{1-3} алкіламіносульфоніл, ариламіносульфоніл, аміногрупу, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C_{1-5} алкілом або арилом, або

R_c являє собою галоген, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу, ціаногрупу, нітрогрупу, амідіногрупу або гуанідіногрупу, при цьому R_c додатково необов'язково може бути заміщений одним або більше радикалами R_d , де

R_d означає C_{1-3} алкіл, C_{3-6} циклоалкіл, феніл, бензил, C_{1-3} алкоксигрупу, феноксигрупу, феніл C_{1-3} алкоксигрупу, бензоїл, галоген, гідроксигрупу, оксогрупу або ціаногрупу,

R_4 означає водень,

R_5 означає зв'язок, водень, карбоніл, C_{1-6} алкіл, C_{1-6} алкоксил, C_{1-6} алкіламіно C_{1-6} алкіл, C_{1-6} алкілтіо C_{1-6} алкіл, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, C_{1-6} алкоксигрупу, феноксигрупу, нафтилоксигрупу, C_{3-6} циклоалкіл, феніл, нафтил, бензил, інданіл, гетероцикліл, вибраний із групи, яка включає піролідініл, піперидиніл, морфолініл, тіоморфолініл, піперазиніл, тетрагідропіраніл, тетрагідротіопіраніл, фураніл, тетрагідрофураніл, тієніл, оксазоліл, тіазоліл, імідазоліл, піридиніл, піримідиніл, піразоліл, бензофураніл, бензотієніл, бензимидазоліл, бензтіазоліл, хінолініл, ізохінолініл і бензоксазоліл, гетероциклілоксигрупу, у якій гетероциклільний фрагмент вибраний із групи, вказаної вище в цьому абзаці, C_{1-3} алканоліл, бензоїл, нафтоїл, C_{1-4} алканоліоксигрупу, бензилоксигрупу, C_{1-4} алкоксикарбоніл, арил C_{1-2} алкоксикарбоніл, феноксикарбоніл, бензоїлоксигрупу, карбамоїл, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C_{1-3} алкілом, фенілом, піролідінілом, піперидинілом, морфолінілом, піперазинілом, оксазолілом, тіазолілом, імідазолілом, піридинілом або піримідинілом, або

R_5 означає C_{1-4} алканоліаміногрупу, ароїламіногрупу, C_{1-4} алкілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, арилтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, уреїдогрупу, у якій будь-який атом азоту може бути незалежно заміщений C_{1-3} алкілом, фенілом, нафтилом, піролідінілом, піперидинілом, морфолінілом, піперазинілом, оксазолілом, тіазолілом, імідазолілом, піридинілом, піримідинілом, піразинілом, індолілом, бензофуранілом, бензотієнілом, бензимидазолілом або бензтіазолілом, або

R_5 означає C_{1-4} алкоксикарбоніламіногрупу, феноксикарбоніламіногрупу, C_{1-4} алкілкарбамоїлоксигрупу, фенілкарбамоїлоксигрупу, C_{1-4} алкілсульфоніламіногрупу, фенілсульфоніламіногрупу, C_{1-3} алкіламіносульфоніл, феніламіносульфоніл, аміногрупу, де атом

азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C_{1-4} алкілом, арилом, піролідінілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом, піперазинілом, фуранілом, тієнілом, оксазолілом, тiazолілом, імідазолілом, піридинілом, піримідинілом, бензимидазолілом або бензтіазолілом, або R_5 означає галоген, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу, ціаногрупу, нітрогрупу або карбоксамід, при цьому R_5 додатково необов'язково може бути заміщений одним або більше радикалами R_e , де

R_e являє собою C_{1-4} алкіл, C_{1-4} алкоксигрупу, C_{3-7} циклоалкіл, феніл, нафтил, інданіл, піролідиніл, піперидиніл, морфолініл, тіоморфолініл, піперазиніл, тетрагідротіопіраніл, тетрагідропіраніл, тетрагідрофураніл, тієніл, оксазоліл, тiazоліл, імідазоліл, піридиніл, піримідиніл, піразиніл, індоліл, бензимидазоліл, бензтіазоліл, бензоксазоліл, хінолініл, ізохінолініл, хіназолініл, хіноксалініл, C_{1-4} алканоліл, ароїл, C_{1-4} алканолілоксигрупу, феноксигрупу, нафтилоксигрупу, бензилоксигрупу, C_{1-4} алкоксикарбоніл, феноксикарбоніл, бензоїлоксигрупу, карбамоїл, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C_{1-3} алкілом, фенілом, нафтилом, піролідінілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом, піперазинілом, фуранілом, тієнілом, оксазолілом, тiazолілом, імідазолілом, піридинілом, піримідинілом, бензимидазолілом або бензтіазолілом, або R_e являє собою C_{1-4} алканоліламіногрупу, бензоїламіногрупу, C_{1-4} алкілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, фенілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, уреїдогрупу, у якій будь-який атом азоту може бути незалежно заміщений C_{1-3} алкілом, фенілом, нафтилом, піролідінілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом, піперазинілом, фуранілом, тієнілом, оксазолілом, тiazолілом, імідазолілом, піридинілом, піримідинілом, бензимидазолілом або бензтіазолілом, або R_e являє собою C_{1-4} алкоксикарбоніламіногрупу, феноксикарбоніламіногрупу, C_{1-4} алкілкарбамоїлоксигрупу, фенілкарбамоїлоксигрупу, C_{1-4} алкілсульфоніламіногрупу, фенілсульфоніламіногрупу, C_{1-4} алкіламіносульфоніл, феніламіносульфоніл, аміногрупу, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C_{1-3} алкілом, фенілом, нафтилом, піролідінілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом, піперазинілом, фуранілом, тієнілом, оксазолілом, тiazолілом, імідазолілом, піридинілом, піримідинілом, бензимидазолілом або бензтіазолілом, або

R_e являє собою галоген, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу, ціаногрупу, нітрогрупу або карбоксамід, при цьому R_e додатково необов'язково може бути заміщений одним або більше радикалами R_f , де

R_f означає метил, етил, трет-бутил, толілсульфоніл, метоксигрупу, циклопропіл, феніл, феноксигрупу, бензилоксигрупу, фтор, хлор, бром, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу або карбоксамід,

при цьому R_1 і R_6 у сполучі формули (Ia) або формули (Ib) необов'язково утворюють моноциклічне 5- або 6-членне ароматичне або неароматичне гетероциклічне кільце, необов'язково заміщене радикалом R_7 , або біциклічне кільце, у якого перше 5-, 6- або 7-членне ароматичне або неароматичне гетероциклічне кільце сконденсоване з другим 5-6-членним ароматичним або неароматичним гетероциклічним або карбоциклічним кільцем, причому кожне з таких кілець необов'язково незалежно заміщене одним або більше радикалами R_7 , R_7 і R_8 незалежно один від одного означають C_{1-4} алкіл, C_{5-6} циклоалкіл, C_{1-4} алкоксигрупу, галоген, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу, нітріл, нітрогрупу або $NH_2C(O)-$, і X означає O .

24. Сполука за п. 23, у якій

Het означає піперидиніл, піролідиніл, азетидиніл, азепаніл, оксепаніл, тетрагідропіраніл, оксетаніл або тетрагідротіопіраніл, при цьому кожне з вказаних кілець необов'язково заміщене одним або більше радикалами R_5 ,

R_1 означає зв'язок, C_{1-5} алкіл, C_{1-5} алкоксигрупу, C_{3-6} циклоалкіл, арилоксигрупу, феніл, бензил, нафтил, піролідиніл, піперидиніл, морфолініл, тіоморфолініл, піперазиніл, фураніл, тієніл, оксазоліл, тiazоліл, імідазоліл, піридиніл, піримідиніл, піразиніл, піридазиніл, індоліл, хінолініл, бензофураніл, бензтієніл, бензимидазоліл, бензтіазоліл, бензоксазоліл або аміногрупу, при цьому R_1 необов'язково заміщений одним або більше радикалами R_a , де

R_a являє собою зв'язок, C_{1-3} алкіл, циклопропіл, циклогексил, феніл, піролідиніл, піперидиніл, морфолініл, тіоморфолініл, піперазиніл, тієніл, імідазоліл, C_{1-3} алкоксигрупу, C_{1-3} алканоліл, C_{1-3} алканолілоксигрупу, арилоксигрупу, бензилоксигрупу, C_{1-3} алкоксикарбоніл, арилоксикарбоніл, ароїлоксигрупу, карбамоїл, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C_{1-3} алкілом, арилом, піролідінілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом або піперазинілом, або

R_a являє собою C_{1-3} алканоліламіногрупу, ароїламіногрупу, C_{1-3} алкілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, арилтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, уреїдогрупу, у якій будь-який атом азоту може бути незалежно заміщений C_{1-3} алкілом, арилом, піролідінілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом або піперазинілом, або

R_a являє собою C_{1-3} алкоксикарбоніламіногрупу, арилоксикарбоніламіногрупу, C_{1-3} алкілкарбамоїлоксигрупу, арилкарбамоїлоксигрупу, C_{1-3} алкілсульфоніламіногрупу, арилсульфоніламіногрупу, C_{1-3} алкіламіносульфоніл, ариламіносульфоніл, аміногрупу, де атом

азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C_{1-3} алкілом, арилом, піролідинілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом або піперазинілом, або R_a являє собою галоген, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу, ціаногрупу, нітрогрупу, карбоксамід, амідногрупу або гуанідногрупу, при цьому R_a додатково необов'язково може бути заміщений одним або більше радикалами R_b , де R_b означає метил, етил, н-пропіл, ізопропіл, циклопропіл, циклопентил, циклогексил, феніл, метоксигрупу, етоксигрупу, н-пропоксигрупу, ізопропоксигрупу, феноксигрупу, бензилоксигрупу, фтор, хлор, бром, йод, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу, ціаногрупу, нітрогрупу або карбоксамід, R_2 означає водень, R_3 означає зв'язок, C_{1-3} алкіл, C_{2-4} алкілен, C_{5-6} циклоалкіл, бензил або нафтилметил, при цьому R_3 необов'язково заміщений одним або більше радикалами R_c , де R_c являє собою C_{1-3} алкіл, C_{5-6} циклоалкіл, феніл, нафтил, інданіл, біцикло[2.2.1]гептаніл, біцикло[2.2.2]октаніл, біцикло[4.1.0]гептаніл, біцикло[3.1.0]гексаніл, біцикло[1.1.1]пентаніл, кубаніл, 1,2,3,4-тетрагідронафтил, фураніл, тетрагідропіраніл, тієніл, оксазоліл, тiazоліл, імідазоліл, піримідиніл, індоліл, бензофураніл, бензотієніл, бензтіазоліл, C_{1-3} алкоксигрупу, феноксигрупу, нафтилоксигрупу, C_{1-2} алканоліл, бензоліл, C_{1-2} алкоксикарбоніл, феноксикарбоніл, C_{1-2} алканолілоксигрупу, бензолілоксигрупу, карбамоїл, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C_{1-3} алкілом або арилом, або R_c являє собою C_{1-2} алканоліламіногрупу, бензоліламіногрупу, C_{1-2} алкілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, фенілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, уреїдогрупу, у якій будь-який атом азоту може бути незалежно заміщений C_{1-3} алкілом або арилом, або R_c являє собою C_{1-2} алкоксикарбоніламіногрупу, феноксикарбоніламіногрупу, C_{1-2} алкілкарбамоїлоксигрупу, арилкарбамоїлоксигрупу, C_{1-2} алкілсульфоніламіногрупу, фенілсульфоніламіногрупу, C_{1-2} алкіламіносульфоніл, феніламіносульфоніл, аміногрупу, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C_{1-3} алкілом або фенілом, або R_c являє собою галоген, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу або ціаногрупу, при цьому R_c додатково необов'язково може бути заміщений одним або більше радикалами R_d , де R_d означає метил, циклопропіл, циклогексил, феніл, бензил, метоксигрупу, феноксигрупу, бензилоксигрупу, бензоліл, фтор, хлор, оксогрупу або ціаногрупу, R_5 означає зв'язок, водень, карбоніл, C_{1-5} алкіл, C_{1-5} алкоксі- C_{1-5} алкіл, C_{1-5} алкіламіно- C_{1-5} алкіл, C_{1-5} алкілтіо- C_{1-5} алкіл, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, C_{1-5} алкоксигрупу, феноксигрупу, C_{3-6} циклоалкіл, феніл, нафтил, бензил, інданіл, гетероцикліл, вибраний із групи, яка включає піролідиніл, піперидиніл, морфолініл, тіоморфолініл, піперазиніл, тетрагідропіраніл, оксазоліл, тiazоліл, імідазоліл, піридиніл, піримідиніл, бензімідазоліл і бензтіазоліл, гетероциклілоксигрупу, у якій гетероциклільний фрагмент вибраний із групи, вказаної вище в цьому абзаці, C_{1-3} алканоліл, бензоліл, нафтоліл, C_{1-3} алканолілоксигрупу, бензилоксигрупу, C_{1-3} алкоксикарбоніл, бензилоксикарбоніл, феноксикарбоніл, бензолілоксигрупу, карбамоїл, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C_{1-3} алкілом, фенілом, піролідинілом, піперидинілом, морфолінілом, піперазинілом, оксазолілом, тiazолілом, імідазолілом, піридинілом або піримідинілом, або R_5 означає C_{1-3} алканоліламіногрупу, ароїламіногрупу, C_{1-3} алкілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, фенілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, уреїдогрупу, у якій будь-який атом азоту може бути незалежно заміщений C_{1-3} алкілом, фенілом, піролідинілом, піперидинілом, морфолінілом, піперазинілом, оксазолілом, тiazолілом, імідазолілом, піридинілом, піримідинілом, бензофуранілом, бензотієнілом, бензімідазолілом або бензтіазолілом, або R_5 означає C_{1-3} алкоксикарбоніламіногрупу, феноксикарбоніламіногрупу, C_{1-3} алкілкарбамоїлоксигрупу, фенілкарбамоїлоксигрупу, C_{1-3} алкілсульфоніламіногрупу, фенілсульфоніламіногрупу, C_{1-3} алкіламіносульфоніл, феніламіносульфоніл, аміногрупу, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C_{1-3} алкілом, фенілом, піролідинілом, піперидинілом, морфолінілом, піперазинілом, оксазолілом, тiazолілом, імідазолілом, піридинілом, піримідинілом, бензімідазолілом або бензтіазолілом, або R_5 означає галоген, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу, ціаногрупу або карбоксамід, при цьому R_5 додатково необов'язково може бути заміщений одним або більше радикалами R_e , де R_e являє собою C_{1-3} алкіл, C_{1-3} алкоксигрупу, C_{3-7} циклоалкіл, феніл, нафтил, інданіл, піролідиніл, піперидиніл, морфолініл, піперазиніл, тетрагідропіраніл, індоліл, тієніл, оксазоліл, тiazоліл, імідазоліл, піридиніл, піримідиніл, бензімідазоліл, бензтіазоліл, бензоксазоліл, C_{1-3} алканоліл, ароїл, C_{1-3} алканолілоксигрупу, феноксигрупу, бензилоксигрупу, C_{1-3} алкоксикарбоніл, феноксикарбоніл, бензолілоксигрупу, карбамоїл, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C_{1-3} алкілом, фенілом, піролідинілом, піперидинілом, морфолінілом, піперазинілом, оксазолілом, тiazолілом, імідазолілом, піридинілом, піримідинілом, бензімідазолілом або бензтіазолілом, або R_e являє собою C_{1-3} алканоліламіногрупу, бензоліламіногрупу, C_{1-3} алкілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, фенілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, уреїдогрупу, у якій будь-який атом азоту може бути незалежно

заміщений C_{1-3} алкілом, фенілом, піролідінілом, піперидинілом, морфолінілом, піперазинілом, оксазолілом, тіазолілом, імідазолілом, піридинілом, піримідинілом, бензимидазолілом або бензтіазолілом, або

R_e являє собою C_{1-3} алкоксикарбоніламіногрупу, феноксикарбоніламіногрупу, C_{1-3} алкілкарбамоїлоксигрупу, фенілкарбамоїлоксигрупу, C_{1-3} алкілсульфоніламіногрупу, фенілсульфоніламіногрупу, C_{1-3} алкіламіносульфоніл, феніламіносульфоніл, аміногрупу, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C_{1-3} алкілом, фенілом, нафтилом, піролідінілом, піперидинілом, морфолінілом, піперазинілом, оксазолілом, тіазолілом, імідазолілом, піридинілом, піримідинілом, бензимидазолілом або бензтіазолілом, або R_e являє собою галоген, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу, ціаногрупу або карбоксамід, при цьому R_e додатково необов'язково може бути заміщений одним або більше радикалами R_f , де R_f означає метил, феніл, толілсульфоніл, метоксигрупу, феноксигрупу, бензилоксигрупу, фтор, хлор, бром, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу або карбоксамід, при цьому R_1 і R_6 у сполучі формули (Ia) або формули (Ib) утворюють біциклічне кільце, у якого перше 5- або 6-членне ароматичне або неароматичне гетероциклічне кільце сконденсоване з другим 5-6-членним гетероарильним, гетероциклічним або фенільним кільцем, причому кожне з таких кілець необов'язково незалежно заміщене одним або двома радикалами R_7 .

25. Сполука за п. 24, у якій

Het означає піперидиніл, піролідиніл, азетидиніл, азепаніл або тетрагідропіраніл, при цьому кожне з вказаних кілець заміщене одним або більше радикалами R_5 ,

R_1 означає зв'язок, метил, етил, ізопропіл, метоксигрупу, етоксигрупу, циклопропіл, циклопентил, циклогексил, феноксигрупу, феніл, бензил, нафтил, піролідиніл, піперидиніл, морфолініл, тіоморфолініл, піперазиніл, фураніл, тієніл, тіазоліл, імідазоліл, піридиніл, піразиніл або аміногрупу, при цьому R_1 необов'язково заміщений одним або більше радикалами R_a , де R_a являє собою зв'язок, метил, етил, циклопропіл, феніл, піролідиніл, піперидиніл, морфолініл, тіоморфолініл, піперазиніл, тієніл, імідазоліл, метоксигрупу, ацетил, ацетоксигрупу, феноксигрупу, бензилоксигрупу, метоксикарбоніл, феноксикарбоніл, бензоїлоксигрупу, карбамоїл, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений метилом, етилом або фенілом, або R_a являє собою ацетиламіногрупу, бензоїламіногрупу, метилтіогрупу, фенілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, уреїдогрупу, у якій будь-який атом азоту може бути незалежно заміщений метилом, етилом або фенілом, або

R_a являє собою метоксикарбоніламіногрупу, феноксикарбоніламіногрупу, метилкарбамоїлоксигрупу, фенілкарбамоїлоксигрупу, метилсульфоніламіногрупу, фенілсульфоніламіногрупу, метиламіносульфоніл, феніламіносульфоніл, аміногрупу, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений метилом або фенілом, або R_a являє собою фтор, хлор, бром, йод, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу, ціаногрупу, нітрогрупу або карбоксамід, при цьому R_a додатково необов'язково може бути заміщений одним або більше радикалами R_b , де

R_b означає метил, циклопропіл, феніл, метоксигрупу, феноксигрупу, бензилоксигрупу, фтор, хлор, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу або карбоксамід,

R_3 означає зв'язок, C_{1-3} алкіл, C_{2-4} алкілен, C_{5-6} циклоалкіл, бензил або нафтилметил, при цьому R_3 необов'язково заміщений одним або більше радикалами R_c , де

R_c являє собою метил, етил, н-пропіл, ізопропіл, C_{5-6} циклоалкіл, інданіл, біцикло[2.2.1]гептаніл, біцикло[2.2.2]октаніл, біцикло[4.1.0]гептаніл, біцикло[3.1.0]гексаніл, біцикло[1.1.1]пентаніл, кубаніл, 1,2,3,4-тетрагідронафтил, тієніл, оксазоліл, тіазоліл, індоліл, бензофураніл, бензотієніл, бензтіазоліл, метоксигрупу, етоксигрупу, феноксигрупу, ацетил, бензоїл, метоксикарбоніл, феноксикарбоніл, ацетоксигрупу, бензоїлоксигрупу, карбамоїл, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений метилом, етилом або арилом, або

R_c являє собою ацетиламіногрупу, бензоїламіногрупу, метилтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, фенілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, уреїдогрупу, у якій будь-який атом азоту може бути незалежно заміщений метилом, етилом або арилом,

R_c являє собою метоксикарбоніламіногрупу, феноксикарбоніламіногрупу, метилкарбамоїлоксигрупу, фенілкарбамоїлоксигрупу, метилсульфоніламіногрупу, фенілсульфоніламіногрупу, метиламіносульфоніл, феніламіносульфоніл, аміногрупу, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений метилом, етилом або фенілом, або R_c являє собою фтор, хлор або оксогрупу, при цьому R_c додатково необов'язково може бути заміщений одним або більше радикалами R_d , де

R_d означає метил, циклопропіл, феніл, метоксигрупу, фтор, хлор або оксогрупу,

R_5 означає зв'язок, водень, карбоніл, C_{1-4} алкіл, C_{1-4} алкоксі- C_{1-4} алкіл, C_{1-4} алкіламіно- C_{1-4} алкіл, C_{1-4} алкілтіо- C_{1-4} алкіл, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, C_{1-4} алкоксигрупу, феноксигрупу, циклопропіл, циклопентил, циклогексил, феніл, нафтил, бензил, інданіл, гетероцикліл, вибраний із групи, яка включає піролідиніл, піперидиніл, морфолініл, піперазиніл, тетрагідропіраніл, оксазоліл, тіазоліл, імідазоліл, піридиніл, піримідиніл, бензимидазоліл і бензтіазоліл, гетероциклілоксигрупу, у якій гетероциклільний фрагмент вибраний із групи, вказаної вище в цьому абзаці, C_{1-2} алканоїл, бензоїл, нафтоїл, C_{1-2} алканоїлоксигрупу, бензилоксигрупу, C_{1-2} алкоксикарбоніл, бензилоксикарбоніл, феноксикарбоніл, бензоїлоксигрупу,

карбамоїл, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C_{1-2} алкілом, фенілом, піролідінілом, піперидинілом, морфолінілом, піперазинілом, оксазолілом, тiazолілом, імідазолілом, піридинілом або піримідинілом, або

R_5 означає C_{1-2} алканоїламіногрупу, бензоїламіногрупу, C_{1-2} алкілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, фенілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, уреїдогрупу, у якій будь-який атом азоту може бути незалежно заміщений C_{1-2} алкілом, фенілом, піролідінілом, піперидинілом, морфолінілом, піперазинілом, оксазолілом, тiazолілом, імідазолілом, піридинілом, піримідинілом, бензімідазолілом або бензтіазолілом, або

R_5 означає C_{1-2} алкоксикарбоніламіногрупу, феноксикарбоніламіногрупу, C_{1-2} алкілкарбамоїлоксигрупу, фенілкарбамоїлоксигрупу, C_{1-2} алкілсульфоніламіногрупу, фенілсульфоніламіногрупу, C_{1-2} алкіламіносульфоніл, феніламіносульфоніл, аміногрупу, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C_{1-2} алкілом, фенілом, піролідінілом, піперидинілом, морфолінілом, піперазинілом, оксазолілом, тiazолілом, імідазолілом, піридинілом або піримідинілом, або

R_5 означає фтор, хлор, бром, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу або карбоксамід, при цьому R_5 додатково необов'язково може бути заміщений одним або більше радикалами R_e , де

R_e являє собою C_{1-3} алкіл, C_{1-2} алкоксигрупу, C_{3-6} циклоалкіл, феніл, нафтил, інданіл, піролідиніл, піперидиніл, морфолініл, піперазиніл, тетрагідропіраніл, індоліл, тієніл, оксазоліл, тiazоліл, імідазоліл, піридиніл, піримідиніл, бензімідазоліл, бензтіазоліл, бензоксазоліл, C_{1-2} алканоїл, ароїл, C_{1-2} алканоїлоксигрупу, феноксигрупу, бензилоксигрупу, C_{1-2} алкоксикарбоніл, феноксикарбоніл, бензоїлоксигрупу, карбамоїл, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C_{1-2} алкілом, фенілом, піролідінілом, піперидинілом, морфолінілом, піперазинілом, оксазолілом, тiazолілом, імідазолілом, піридинілом або піримідинілом, або

R_e являє собою C_{1-2} алканоїламіногрупу, бензоїламіногрупу, C_{1-2} алкілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, фенілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, уреїдогрупу, у якій будь-який атом азоту може бути незалежно заміщений C_{1-2} алкілом, фенілом, піролідінілом, піперидинілом, морфолінілом, піперазинілом, оксазолілом, тiazолілом, імідазолілом, піридинілом або піримідинілом, або

R_e являє собою C_{1-2} алкоксикарбоніламіногрупу, феноксикарбоніламіногрупу, C_{1-2} алкілкарбамоїлоксигрупу, фенілкарбамоїлоксигрупу, C_{1-2} алкілсульфоніламіногрупу, фенілсульфоніламіногрупу, C_{1-2} алкіламіносульфоніл, феніламіносульфоніл, аміногрупу, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C_{1-2} алкілом, фенілом, нафтилом, піролідінілом, піперидинілом, морфолінілом, піперазинілом, оксазолілом, тiazолілом, імідазолілом, піридинілом або піримідинілом, або

R_e являє собою фтор, хлор, бром, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу або карбоксамід, при цьому R_e додатково необов'язково може бути заміщений одним або більше радикалами R_f , де R_f означає метил, феніл, толілсульфоніл, метоксигрупу, феноксигрупу, бензилоксигрупу, фтор, хлор, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу або карбоксамід, і

R_1 і R_6 у сполуці формули (Ia) або формули (Ib) утворюють біциклічне кільце, у якого 5-6-членне ароматичне або неароматичне гетероциклічне кільце сконденсоване з фенільним кільцем, причому кожне з таких кілець необов'язково незалежно заміщене одним або двома радикалами R_7 .

26. Сполука за п. 25, у якій

Het означає піперидин-4-іл, піперидин-3-іл, піролідин-3-іл, азетидин-3-іл, азепан-3-іл, азепан-4-іл або тетрагідропіран-4-іл, при цьому кожне з вказаних кілець необов'язково заміщене одним або більше радикалами R_5 ,

R_1 означає зв'язок, метил, етил, ізопропіл, метоксигрупу, циклопропіл, циклогексил, феноксигрупу, феніл, бензил, нафтил, піролідиніл, піперидиніл, морфолініл, тіоморфолініл, піперазиніл, фураніл, тієніл, тiazоліл, імідазоліл, піридиніл, піразиніл або аміногрупу, при цьому R_1 необов'язково заміщений одним або більше радикалами R_a , де

R_a являє собою метил, феніл, тієніл, метоксигрупу, ацетил, ацетоксигрупу, феноксигрупу, бензилоксигрупу, метоксикарбоніл, бензоїлоксигрупу, карбамоїл, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений метилом або фенілом, або

R_a являє собою ацетиламіногрупу, метилтіогрупу, фенілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, уреїдогрупу, у якій будь-який атом азоту може бути незалежно заміщений метилом або фенілом, або

R_a являє собою метоксикарбоніламіногрупу, метилкарбамоїлоксигрупу, фенілкарбамоїлоксигрупу, метилсульфоніламіногрупу, фенілсульфоніламіногрупу, аміногрупу, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений метилом або фенілом, або

R_a являє собою фтор, хлор, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу, ціаногрупу або карбоксамід, R_3 означає зв'язок, метил, етил, н-пропіл, пропеніл, бутеніл, ізобутеніл, циклогексил, бензил або нафтилметил, при цьому R_3 необов'язково заміщений одним або більше радикалами R_c , де

R_c являє собою метил, етил, н-пропіл, ізопропіл, циклогексил, циклопентил, інданіл, біцикло[2.2.1]гептаніл, біцикло[2.2.2]октаніл, біцикло[4.1.0]гептаніл, біцикло[3.1.0]гексаніл, біцикло[1.1.1]пентаніл, кубаніл, 1,2,3,4-тетрагідронафтил, метоксигрупу, феноксигрупу, ацетил, бензоїл, метоксикарбоніл, феноксикарбоніл, ацетоксигрупу, бензоїлоксигрупу, метилтіогрупу, де

атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, фенілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, фтор, хлор або оксогрупу,

R_5 означає зв'язок, водень, карбоніл, C_{1-4} алкіл, C_{1-2} алкоксі- C_{1-2} алкіл, C_{1-2} алкіламіно- C_{1-2} алкіл, C_{1-2} алкілтіо- C_{1-2} алкіл, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, C_{1-2} алкоксигрупу, феноксигрупу, циклопропіл, циклопентил, циклогексил, феніл, бензил, гетероцикліл, вибраний із групи, яка включає піролідиніл, піперидиніл, морфолініл, тетрагідропіраніл, піридиніл і піримідиніл, гетероциклілоксигрупу, у якій гетероциклільний фрагмент вибраний із групи, вказаної вище в цьому абзаці, ацетил, бензоїл, ацетилоксигрупу, бензилоксигрупу, метоксикарбоніл, етоксикарбоніл, бензилоксикарбоніл, бензоїлоксигрупу, карбамоїл, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений метилом, етилом або фенілом, або

R_5 означає ацетиламіногрупу, бензоїламіногрупу, метилтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, фенілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, уреїдогрупу, у якій будь-який атом азоту може бути незалежно заміщений метилом, етилом або фенілом, або

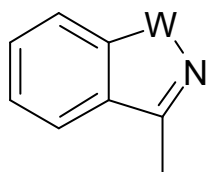
R_5 означає метоксикарбоніламіногрупу, етоксикарбоніламіногрупу, феноксикарбоніламіногрупу, метилкарбамоїлоксигрупу, фенілкарбамоїлоксигрупу, метилсульфоніламіногрупу, фенілсульфоніламіногрупу, метиламіносульфоніл, феніламіносульфоніл, аміногрупу, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений метилом, етилом або фенілом, або

R_5 означає фтор, хлор, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу або карбоксамід, при цьому R_5 додатково необов'язково може бути заміщений одним або більше радикалами R_e , де R_e являє собою метил, метоксигрупу, етоксигрупу, циклопропіл, циклопентил, циклогексил, феніл, нафтил, інданіл, піперидиніл, морфолініл, індоліл, тієніл, піридиніл, ацетил, бензоїл, ацетилоксигрупу, феноксигрупу, бензилоксигрупу, метоксикарбоніл, етоксикарбоніл, карбамоїл, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений метилом, етилом або фенілом, або R_e являє собою ацетиламіногрупу, бензоїламіногрупу, метилтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, фенілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, уреїдогрупу, у якій будь-який атом азоту може бути незалежно заміщений метилом, етилом або фенілом, або

R_e являє собою метоксикарбоніламіногрупу, етоксикарбоніламіногрупу, феноксикарбоніламіногрупу, метилкарбамоїлоксигрупу, фенілкарбамоїлоксигрупу, метилсульфоніламіногрупу, фенілсульфоніламіногрупу, метиламіносульфоніл, феніламіносульфоніл, аміногрупу, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений метилом, етилом або фенілом, або

R_e являє собою фтор, хлор, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу або карбоксамід, при цьому R_e додатково необов'язково може бути заміщений одним або більше радикалами R_f , де R_f означає метил, феніл, толілсульфоніл, феноксигрупу, бензилоксигрупу, фтор, хлор або оксогрупу, і

R_1 і R_6 у сполучі формули (Ia) або формули (Ib) утворюють біциклічне кільце



де W означає $-S(O)_n-$, $-O-C(O)-$ або $-N-C(O)-$, n означає 0, 1 або 2, і де кожне кільце необов'язково незалежно заміщене одним або двома радикалами R_7 .

27. Сполука за п. 26, у якій

Het означає піперидин-4-іл, піперидин-3-іл, піролідин-3-іл, азетидин-3-іл або тетрагідропіран-4-іл, при цьому кожне з вказаних кілець заміщене одним або більше радикалами R_5 ,

R_1 означає ізопропіл, бензилоксигрупу, циклогексил, феніл, 4-(ацетиламіно)феніл, 4-(метансульфоніламіно)феніл, 4-метоксифеніл, 3-феноксифеніл, 4-хлорфеніл, 4-фторфеніл, 2-фторфеніл, 2-фтор-4-хлорфеніл, нафтил, тієнілметил, піперидиніл, морфолініл, піролідиніл, піперазиніл, фураніл, тієніл, 5-хлортієніл, піридин-4-іл, піразиніл, метиламіногрупу, етиламіногрупу, диметиламіногрупу або діетиламіногрупу,

R_3 означає етил, n -пропіл, пропеніл, бутеніл, ізобутеніл, бензил або нафтилметил, при цьому R_3 необов'язково заміщений одним або більше радикалами R_c , де

R_c являє собою метил, циклогексил, циклопентил, інданіл, 1,2,3,4-тетрагідронафтил, метоксигрупу, метилтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, фтор або хлор,

R_5 означає зв'язок, карбоніл, метил, етил, n -пропіл, n -бутил, трет-бутил, ізопропіл, ізобутил, циклопропіл, циклопентил, циклогексил, феніл, бензил, піперидиніл, тетрагідропіраніл, піримідиніл, ацетил, бензоїл, етоксикарбоніл, бензилоксикарбоніл, метилсульфоніламіногрупу, фенілсульфоніламіногрупу, метиламіногрупу, диметиламіногрупу, фтор, оксогрупу або карбоксигрупу, при цьому R_5 додатково необов'язково може бути заміщений одним або більше радикалами R_e , де

R_e являє собою метил, циклопропіл, циклопентил, циклогексил, феніл, нафтил, інданіл, тієніл, 5-метилтієніл, метоксигрупу, феноксигрупу, бензилоксигрупу, піперидиніл, піридиніл, індоліл, 1-(толілсульфоніл)індоліл, карбамоїл, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений метилом, фенілом або бензилом, або

R_e являє собою гідроксигрупу, фтор, хлор, оксогрупу, диметиламіногрупу або трифторметил, і n означає 2.

28. Сполука за п. 21, у якій

R_1 і R_6 залишаються ациклічними,

Het означає піперидиніл, піролідиніл, азетидиніл, азепаніл, оксепаніл, тетрагідропіраніл, оксетаніл або тетрагідротіопіраніл, при цьому кожне з вказаних кілець необов'язково заміщене одним або більше радикалами R_5 ,

R_1 означає зв'язок, C_{1-5} алкіл, C_{1-5} алкоксигрупу, C_{3-6} циклоалкіл, арилоксигрупу, феніл, бензил, нафтил, піролідиніл, піперидиніл, морфолініл, тіоморфолініл, піперазиніл, фураніл, тієніл, оксазоліл, тіазоліл, імідазоліл, піридиніл, піримідиніл, піразиніл, піридазиніл, індоліл, хінолініл, бензофураніл, бензтієніл, бензімідазоліл, бензтіазоліл, бензоксазоліл або аміногрупу, при цьому R_1 необов'язково заміщений одним або більше радикалами R_a , де

R_a являє собою зв'язок, C_{1-3} алкіл, циклопропіл, циклогексил, феніл, піролідиніл, піперидиніл, морфолініл, тіоморфолініл, піперазиніл, тієніл, імідазоліл, C_{1-3} алкоксигрупу, C_{1-3} алканоліл, C_{1-3} алканолілоксигрупу, арилоксигрупу, бензилоксигрупу, C_{1-3} алкоксикарбоніл, арилоксикарбоніл, ароілоксигрупу, карбамоїл, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C_{1-3} алкілом, арилом, піролідинілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом або піперазинілом, або

R_a являє собою C_{1-3} алканоліламіногрупу, ароїламіногрупу, C_{1-3} алкілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, арилтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, уреїдогрупу, у якій будь-який атом азоту може бути незалежно заміщений C_{1-3} алкілом, арилом, піролідинілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом або піперазинілом, або

R_a являє собою C_{1-3} алкоксикарбоніламіногрупу, арилоксикарбоніламіногрупу, C_{1-3} алкілкарбамоїлоксигрупу, арилкарбамоїлоксигрупу, C_{1-3} алкілсульфоніламіногрупу, арилсульфоніламіногрупу, C_{1-3} алкіламіносульфоніл, ариламіносульфоніл, аміногрупу, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C_{1-3} алкілом, арилом, піролідинілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом або піперазинілом, або

R_a являє собою галоген, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу, ціаногрупу, нітрогрупу, карбоксамід, амідногрупу або гуанідногрупу, при цьому R_a додатково необов'язково може бути заміщений одним або більше радикалами R_b , де

R_b означає метил, етил, n -пропіл, ізопропіл, циклопропіл, циклопентил, циклогексил, феніл, метоксигрупу, етоксигрупу, n -пропоксигрупу, ізопропоксигрупу, феноксигрупу, бензилоксигрупу, фтор, хлор, бром, йод, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу, ціаногрупу, нітрогрупу або карбоксамід,

R_2 означає водень,

R_3 означає зв'язок, C_{1-3} алкіл, C_{2-4} алкілен, C_{5-6} циклоалкіл, бензил або нафтилметил, при цьому R_3 необов'язково заміщений одним або більше радикалами R_c , де

R_c являє собою C_{1-3} алкіл, C_{5-6} циклоалкіл, феніл, нафтил, інданіл, біцикло[2.2.1]гептаніл, біцикло[2.2.2]октаніл, біцикло[4.1.0]гептаніл, біцикло[3.1.0]гексаніл, біцикло[1.1.1]пентаніл, кубаніл, 1,2,3,4-тетрагідронафтил, фураніл, тетрагідропіраніл, тієніл, оксазоліл, тіазоліл, імідазоліл, піримідиніл, індоліл, бензофураніл, бензотієніл, бензтіазоліл, C_{1-3} алкоксигрупу, феноксигрупу, нафтилоксигрупу, C_{1-2} алканоліл, бензоїл, C_{1-2} алкоксикарбоніл, феноксикарбоніл, C_{1-2} алканолілоксигрупу, бензоїлоксигрупу, карбамоїл, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C_{1-3} алкілом або арилом, або

R_c являє собою C_{1-2} алканоліламіногрупу, бензоїламіногрупу, C_{1-2} алкілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, фенілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, уреїдогрупу, у якій будь-який атом азоту може бути незалежно заміщений C_{1-3} алкілом або арилом, або

R_c являє собою C_{1-2} алкоксикарбоніламіногрупу, феноксикарбоніламіногрупу, C_{1-2} алкілкарбамоїлоксигрупу, арилкарбамоїлоксигрупу, C_{1-2} алкілсульфоніламіногрупу, фенілсульфоніламіногрупу, C_{1-2} алкіламіносульфоніл, феніламіносульфоніл, аміногрупу, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C_{1-3} алкілом або фенілом, або

R_c являє собою галоген, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу або ціаногрупу, при цьому R_c додатково необов'язково може бути заміщений одним або більше радикалами R_d , де

R_d означає метил, циклопропіл, циклогексил, феніл, бензил, метоксигрупу, феноксигрупу, бензилоксигрупу, бензоїл, фтор, хлор, оксогрупу або ціаногрупу,

R_4 означає водень,

R_5 означає зв'язок, водень, карбоніл, C_{1-5} алкіл, C_{1-5} алкоксигрупу, C_{1-5} алкіламіногрупу, C_{1-5} алкілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, C_{1-5} алкоксигрупу, феноксигрупу, C_{3-6} циклоалкіл, феніл, нафтил, бензил, інданіл, гетероцикл, вибраний із групи, яка включає піролідиніл, піперидиніл, морфолініл, тіоморфолініл, піперазиніл, тетрагідропіраніл, оксазоліл, тіазоліл, імідазоліл, піридиніл, піримідиніл, бензімідазоліл і

бензтіазоліл, гетероциклоксигрупу, у якій гетероциклільний фрагмент вибраний із групи, вказаної вище в цьому абзаці, С₁₋₃алканоїл, бензоїл, нафтоїл, С₁₋₃алканоїлоксигрупу, бензилоксигрупу, С₁₋₃алкоксикарбоніл, бензилоксикарбоніл, феноксикарбоніл, бензоїлоксигрупу, карбамоїл, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений С₁₋₃алкілом, фенілом, піролідінілом, піперидинілом, морфолінілом, піперазинілом, оксазолілом, тіазолілом, імідазолілом, піридинілом або піримідинілом, або

R₅ означає С₁₋₃алканоїламіногрупу, ароїламіногрупу, С₁₋₃алкілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, фенілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, уреїдогрупу, у якій будь-який атом азоту може бути незалежно заміщений С₁₋₃алкілом, фенілом, піролідінілом, піперидинілом, морфолінілом, піперазинілом, оксазолілом, тіазолілом, імідазолілом, піридинілом, піримідинілом, бензофуранілом, бензімідазолілом або бензтіазолілом, або

R₅ означає С₁₋₃алкоксикарбоніламіногрупу, феноксикарбоніламіногрупу, С₁₋₃алкілкарбамоїлоксигрупу, фенілкарбамоїлоксигрупу, С₁₋₃алкілсульфоніламіногрупу, фенілсульфоніламіногрупу, С₁₋₃алкіламіносульфоніл, феніламіносульфоніл, аміногрупу, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений С₁₋₃алкілом, фенілом, піролідінілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом, піперазинілом, оксазолілом, тіазолілом, імідазолілом, піридинілом, піримідинілом, бензімідазолілом або бензтіазолілом, або

R₅ означає галоген, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу, ціаногрупу або карбоксамід, при цьому R₅ додатково необов'язково може бути заміщений одним або більше радикалами R_e, де R_e являє собою С₁₋₃алкіл, С₁₋₃алкоксигрупу, С₃₋₇циклоалкіл, феніл, нафтил, інданіл, піролідиніл, піперидиніл, морфолініл, піперазиніл, тетрагідропіраніл, індоліл, тієніл, оксазоліл, тіазоліл, імідазоліл, піридиніл, піримідиніл, бензімідазоліл, бензтіазоліл, бензоксазоліл, С₁₋₃алканоїл, ароїл, С₁₋₃алканоїлоксигрупу, феноксигрупу, бензилоксигрупу, С₁₋₃алкоксикарбоніл, феноксикарбоніл, бензоїлоксигрупу, карбамоїл, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений С₁₋₃алкілом, фенілом, піролідінілом, піперидинілом, морфолінілом, піперазинілом, оксазолілом, тіазолілом, імідазолілом, піридинілом, піримідинілом, бензімідазолілом або бензтіазолілом, або

R_e являє собою С₁₋₃алканоїламіногрупу, бензоїламіногрупу, С₁₋₃алкілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, фенілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, уреїдогрупу, у якій будь-який атом азоту може бути незалежно заміщений С₁₋₃алкілом, фенілом, піролідінілом, піперидинілом, морфолінілом, піперазинілом, оксазолілом, тіазолілом, імідазолілом, піридинілом, піримідинілом, бензімідазолілом або бензтіазолілом, або

R_e являє собою С₁₋₃алкоксикарбоніламіногрупу, феноксикарбоніламіногрупу, С₁₋₃алкілкарбамоїлоксигрупу, фенілкарбамоїлоксигрупу, С₁₋₃алкілсульфоніламіногрупу, фенілсульфоніламіногрупу, С₁₋₃алкіламіносульфоніл, феніламіносульфоніл, аміногрупу, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений С₁₋₃алкілом, фенілом, нафтилом, піролідінілом, піперидинілом, морфолінілом, піперазинілом, оксазолілом, тіазолілом, імідазолілом, піридинілом, піримідинілом, бензімідазолілом або бензтіазолілом, або R_e являє собою галоген, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу, ціаногрупу або карбоксамід, при цьому R_e додатково необов'язково може бути заміщений одним або більше радикалами R_f, де R_f означає метил, феніл, толілсульфоніл, метоксигрупу, феноксигрупу, бензилоксигрупу, фтор, хлор, бром, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу або карбоксамід,

R₆ означає гідроксигрупу, нітрил або насичений або ненасичений розгалужений або нерозгалужений С₁₋₅-вуглецевий ланцюг, який необов'язково частково або повністю галогенований, при цьому один або більше С-атомів необов'язково замінені на О, NH або S(O)₂, а вказаний ланцюг необов'язково незалежно заміщений 1-2 оксогрупами, групою -NH₂ або одним або двома замісниками, вибраними з групи, яка включає С₁₋₄алкіл, піролідиніл, піперидиніл, морфолініл, тіоморфолініл, піперазиніл, індолініл, піраніл, тіопіраніл, фураніл, тієніл, піроліл, оксазоліл, ізоксазоліл, тіазоліл, імідазоліл, піридиніл, піримідиніл, піразиніл, індоліл, бензофураніл, бензотієніл, бензімідазоліл, бензтіазоліл, хінолініл, ізохінолініл, хіназолініл, бензоксазоліл і хіноксалініл, і

X означає О.

29. Сполука за п. 28, у якій

R₁ означає зв'язок, метил, етил, ізопропіл, метоксигрупу, етоксигрупу, циклопропіл, циклопентил, циклогексил, феноксигрупу, феніл, бензил, нафтил, піролідиніл, піперидиніл, морфолініл, тіоморфолініл, піперазиніл, фураніл, тієніл, тіазоліл, імідазоліл, піридиніл, піразиніл або аміногрупу, при цьому R₁ необов'язково заміщений одним або більше радикалами R_a, де R_a являє собою зв'язок, метил, етил, циклопропіл, феніл, піролідиніл, піперидиніл, морфолініл, тіоморфолініл, піперазиніл, тієніл, імідазоліл, метоксигрупу, ацетил, ацетоксигрупу, феноксигрупу, бензилоксигрупу, метоксикарбоніл, феноксикарбоніл, бензоїлоксигрупу, карбамоїл, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений метилом, етилом або фенілом, або

R_a являє собою ацетиламіногрупу, бензоїламіногрупу, метилтіогрупу, фенілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, уреїдогрупу, у якій будь-який атом азоту може бути незалежно заміщений метилом, етилом або фенілом, або

R_a являє собою метоксикарбоніламіногрупу, феноксикарбоніламіногрупу, метилкарбамоїлоксигрупу, фенілкарбамоїлоксигрупу, метилсульфоніламіногрупу, фенілсульфоніламіногрупу, метиламіносульфоніл, феніламіносульфоніл, аміногрупу, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений метилом або фенілом, або R_a являє собою фтор, хлор, бром, йод, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу, ціаногрупу, нітрогрупу або карбоксамід, при цьому R_a додатково необов'язково може бути заміщений одним або більше радикалами R_b , де R_b означає метил, циклопропіл, феніл, метоксигрупу, феноксигрупу, бензилоксигрупу, фтор, хлор, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу або карбоксамід, R_3 означає зв'язок, C_{1-3} алкіл, C_{2-4} алкілен, C_{5-6} циклоалкіл, бензил або нафтилметил, при цьому R_3 необов'язково заміщений одним або більше радикалами R_c , де R_c являє собою метил, етил, н-пропіл, ізопропіл, C_5-6 циклоалкіл, інданіл, біцикло[2.2.1]гептаніл, біцикло[2.2.2]октаніл, біцикло[4.1.0]гептаніл, біцикло[3.1.0]гексаніл, біцикло[1.1.1]пентаніл, кубаніл, 1,2,3,4-тетрагідронафтил, тієніл, оксазоліл, тіазоліл, індоліл, бензофураніл, бензотієніл, бензтіазоліл, метоксигрупу, етоксигрупу, феноксигрупу, ацетил, бензоїл, метоксикарбоніл, феноксикарбоніл, ацетоксигрупу, бензоїлоксигрупу, карбамоїл, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений метилом, етилом або арилом, або R_c являє собою ацетиламіногрупу, бензоїламіногрупу, метилтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, фенілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, уреїдогрупу, у якій будь-який атом азоту може бути незалежно заміщений метилом, етилом або арилом, або R_c являє собою, метоксикарбоніламіногрупу, феноксикарбоніламіногрупу, метилкарбамоїлоксигрупу, фенілкарбамоїлоксигрупу, метилсульфоніламіногрупу, фенілсульфоніламіногрупу, метиламіносульфоніл, феніламіносульфоніл, аміногрупу, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений метилом, етилом або фенілом, або R_c являє собою фтор, хлор або оксогрупу, при цьому R_c додатково необов'язково може бути заміщений одним або більше радикалами R_d , де R_d означає метил, циклопропіл, феніл, метоксигрупу, фтор, хлор або оксогрупу, R_5 означає зв'язок, водень, карбоніл, C_{1-4} алкіл, C_{1-4} алкоксі- C_{1-4} алкіл, C_{1-4} алкіламіно- C_{1-4} алкіл, C_{1-4} алкілтіо- C_{1-4} алкіл, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, C_{1-4} алкоксигрупу, феноксигрупу, циклопропіл, циклопентил, циклогексил, феніл, нафтил, бензил, інданіл, гетероцикліл, вибраний із групи, яка включає піролідиніл, піперидиніл, морфолініл, піперазиніл, тетрагідропіраніл, оксазоліл, тіазоліл, імідазоліл, піридиніл, піримідиніл, бензимидазоліл і бензтіазоліл, гетероциклільний фрагмент вибраний із групи, вказаної вище в цьому абзаці, C_{1-2} алканойл, бензоїл, нафтоїл, C_{1-2} алканойлоксигрупу, бензилоксигрупу, C_{1-2} алкоксикарбоніл, бензилоксикарбоніл, феноксикарбоніл, бензоїлоксигрупу, карбамоїл, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C_{1-2} алкілом, фенілом, піролідинілом, піперидинілом, морфолінілом, піперазинілом, оксазолілом, тіазолілом, імідазолілом, піридинілом або піримідинілом, або R_5 означає C_{1-2} алканойламіногрупу, бензоїламіногрупу, C_{1-2} алкілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, фенілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, уреїдогрупу, у якій будь-який атом азоту може бути незалежно заміщений C_{1-2} алкілом, фенілом, піролідинілом, піперидинілом, морфолінілом, піперазинілом, оксазолілом, тіазолілом, імідазолілом, піридинілом, піримідинілом, бензимидазолілом або бензтіазолілом, або R_5 означає C_{1-2} алкоксикарбоніламіногрупу, феноксикарбоніламіногрупу, C_{1-2} алкілкарбамоїлоксигрупу, фенілкарбамоїлоксигрупу, C_{1-2} алкілсульфоніламіногрупу, фенілсульфоніламіногрупу, C_{1-2} алкіламіносульфоніл, феніламіносульфоніл, аміногрупу, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C_{1-2} алкілом, фенілом, піролідинілом, піперидинілом, морфолінілом, піперазинілом, оксазолілом, тіазолілом, імідазолілом, піридинілом або піримідинілом, або R_5 означає фтор, хлор, бром, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу або карбоксамід, при цьому R_5 додатково необов'язково може бути заміщений одним або більше радикалами R_e , де R_e являє собою C_{1-3} алкіл, C_{1-2} алкоксигрупу, C_{3-6} циклоалкіл, феніл, нафтил, інданіл, піролідиніл, піперидиніл, морфолініл, піперазиніл, тетрагідропіраніл, індоліл, тієніл, оксазоліл, тіазоліл, імідазоліл, піридиніл, піримідиніл, бензимидазоліл, бензтіазоліл, бензоксазоліл, C_{1-2} алканойл, ароїл, C_{1-2} алканойлоксигрупу, феноксигрупу, бензилоксигрупу, C_{1-2} алкоксикарбоніл, феноксикарбоніл, бензоїлоксигрупу, карбамоїл, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C_{1-2} алкілом, фенілом, піролідинілом, піперидинілом, морфолінілом, піперазинілом, оксазолілом, тіазолілом, імідазолілом, піридинілом або піримідинілом, або R_e являє собою C_{1-2} алканойламіногрупу, бензоїламіногрупу, C_{1-2} алкілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, фенілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, уреїдогрупу, у якій будь-який атом азоту може бути незалежно заміщений C_{1-2} алкілом, фенілом, піролідинілом, піперидинілом, морфолінілом, піперазинілом, оксазолілом, тіазолілом, імідазолілом, піридинілом або піримідинілом, або R_e являє собою C_{1-2} алкоксикарбоніламіногрупу, феноксикарбоніламіногрупу, C_{1-2} алкілкарбамоїлоксигрупу, фенілкарбамоїлоксигрупу, C_{1-2} алкілсульфоніламіногрупу,

фенілсульфоніламіногрупу, C₁₋₂алкіламіносульфоніл, феніламіносульфоніл, аміногрупу, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений C₁₋₂алкілом, фенілом, нафтилом, піролідінілом, піперидинілом, морфолінілом, піперазинілом, оксазолілом, тiazолілом, імідазолілом, піридинілом або піримідинілом, або

R_e являє собою фтор, хлор, бром, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу або карбоксамід, при цьому R_e додатково необов'язково може бути заміщений одним або більше радикалами R_f, де R_f означає метил, феніл, толілсульфоніл, метоксигрупу, феноксигрупу, бензилоксигрупу, фтор, хлор, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу або карбоксамід, і

R₆ означає нітрил або насичений або ненасичений розгалужений або нерозгалужений C₁₋₅ вуглецевий ланцюг, який необов'язково частково або повністю галогенований, при цьому один або більше C-атомів необов'язково замінені на O, NH або S(O)₂, а вказаний ланцюг необов'язково незалежно заміщений оксогрупою, групою -NH₂, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом, піперазинілом, піридинілом, піримідинілом або піразинілом.

30. Сполука за п. 29, у якій

Het означає піперидин-4-іл, піперидин-3-іл, піролідин-3-іл, азетидин-3-іл, азепан-3-іл, азепан-4-іл або тетрагідропіран-4-іл, при цьому кожне з вказаних кілець необов'язково заміщене одним або більше радикалами R₅,

R₁ означає зв'язок, метил, етил, ізопропіл, метоксигрупу, циклопропіл, циклогексил, феноксигрупу, феніл, бензил, нафтил, піролідиніл, піперидиніл, морфолініл, тіоморфолініл, піперазиніл, фураніл, тієніл, тiazоліл, імідазоліл, піридиніл, піразиніл або аміногрупу, при цьому R₁ необов'язково заміщений одним або більше радикалами R_a, де

R_a являє собою метил, феніл, тієніл, метоксигрупу, ацетил, ацетоксигрупу, феноксигрупу, бензилоксигрупу, метоксикарбоніл, бензоїлоксигрупу, карбамоїл, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений метилом або фенілом, або

R_a являє собою ацетиламіногрупу, метилтіогрупу, фенілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, уреїдогрупу, у якій будь-який атом азоту може бути незалежно заміщений метилом або фенілом, або

R_a являє собою метоксикарбоніламіногрупу, метилкарбамоїлоксигрупу, фенілкарбамоїлоксигрупу, метилсульфоніламіногрупу, фенілсульфоніламіногрупу, аміногрупу, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений метилом або фенілом, або

R_a являє собою фтор, хлор, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу, ціаногрупу або карбоксамід, R₃ означає зв'язок, метил, етил, н-пропіл, пропеніл, бутеніл, ізобутеніл, циклогексил, бензил або нафтилметил, при цьому R₃ необов'язково заміщений одним або більше радикалами R_c, де

R_c являє собою метил, етил, н-пропіл, ізопропіл, циклогексил, циклопентил, інданіл, біцикло[2.2.1]гептаніл, біцикло[2.2.2]октаніл, біцикло[4.1.0]гептаніл, біцикло[3.1.0]гексаніл, біцикло[1.1.1]пентаніл, кубаніл, 1,2,3,4-тетрагідронафтил, метоксигрупу, феноксигрупу, ацетил, бензоїл, метоксикарбоніл, феноксикарбоніл, ацетоксигрупу, бензоїлоксигрупу, метилтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, фенілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, фтор, хлор або оксогрупу, при цьому конфігурація у стереоцентрі, що визначається замісниками R₂ і R₃, коли вони мають різні значення, і атомом вуглецю, до якого вони приєднані, являє собою L-конфігурацію,

R₅ означає зв'язок, водень, карбоніл, C₁₋₄алкіл, C₁₋₂алкоксіC₁₋₂алкіл, C₁₋₂алкіламіноC₁₋₂алкіл, C₁₋₂алкілтіоC₁₋₂алкіл, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, C₁₋₂алкоксигрупу, феноксигрупу, циклопропіл, циклопентил, циклогексил, феніл, бензил, гетероцикліл, вибраний із групи, яка включає піролідиніл, піперидиніл, морфолініл, тетрагідропіраніл, піридиніл і піримідиніл, гетероциклілоксигрупу, у якій гетероциклільний фрагмент вибраний із групи, вказаної вище в цьому абзаці, ацетил, бензоїл, ацетилоксигрупу, бензилоксигрупу, метоксикарбоніл, етоксикарбоніл, бензилоксикарбоніл, бензоїлоксигрупу, карбамоїл, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений метилом, етилом або фенілом, або

R₅ означає ацетиламіногрупу, бензоїламіногрупу, метилтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, фенілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, уреїдогрупу, у якій будь-який атом азоту може бути незалежно заміщений метилом, етилом або фенілом, або

R₅ означає метоксикарбоніламіногрупу, етоксикарбоніламіногрупу, феноксикарбоніламіногрупу, метилкарбамоїлоксигрупу, фенілкарбамоїлоксигрупу, метилсульфоніламіногрупу, фенілсульфоніламіногрупу, метиламіносульфоніл, феніламіносульфоніл, аміногрупу, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений метилом, етилом або фенілом, або

R₅ означає фтор, хлор, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу або карбоксамід, при цьому R₅ додатково необов'язково може бути заміщений одним або більше радикалами R_e, де

R_e являє собою метил, метоксигрупу, етоксигрупу, циклопропіл, циклопентил, циклогексил, феніл, нафтил, інданіл, піперидиніл, морфолініл, індоліл, тієніл, піридиніл, ацетил, бензоїл, ацетилоксигрупу, феноксигрупу, бензилоксигрупу, метоксикарбоніл, етоксикарбоніл, карбамоїл, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений метилом, етилом або фенілом, або

R_e являє собою ацетиламіногрупу, бензоїламіногрупу, метилтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, фенілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до

сульфоксиду або сульфону, уреїдогрупу, у якій будь-який атом азоту може бути незалежно заміщений метилом, етилом або фенілом, або

R_e являє собою метоксикарбоніламіногрупу, етоксикарбоніламіногрупу, феноксикарбоніламіногрупу, метилкарбамоїлоксигрупу, фенілкарбамоїлоксигрупу, метилсульфоніламіногрупу, фенілсульфоніламіногрупу, метиламіносальфоніл, феніламіносальфоніл, аміногрупу, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений метилом, етилом або фенілом, або

R_e являє собою фтор, хлор, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу або карбоксамід, при цьому R_e додатково необов'язково може бути заміщений одним або більше радикалами R_f , де R_f означає метил, феніл, толілсульфоніл, феноксигрупу, бензилоксигрупу, фтор, хлор або оксогрупу, і

R_6 означає нітрил або насичений або ненасичений розгалужений або нерозгалужений C_{1-5} -вуглецевий ланцюг, який необов'язково частково або повністю галогенований, при цьому один або більше С-атомів необов'язково замінені на О, NH або $S(O)_2$, а вказаний ланцюг необов'язково незалежно заміщений оксогрупою, групою $-NH_2$, морфолінілом або піперазинілом.

31. Сполука за п. 30, у якій

Het означає піперидин-4-іл, піперидин-3-іл, піролідин-3-іл, азетидин-3-іл або тетрагідропіран-4-іл, при цьому кожне з вказаних кілець заміщене одним або більше радикалами R_5 ,

R_1 означає ізопропіл, бензилоксигрупу, циклогексил, феніл, 4-(ацетиламіно)феніл, 4-(метансульфоніламіно)феніл, 4-метоксифеніл, 3-феноксифеніл, 4-хлорфеніл, 4-фторфеніл, 2-фторфеніл, 2-фтор-4-хлорфеніл, нафтил, тієнілметил, піперидиніл, морфолініл, піролідиніл, піперазиніл, фураніл, тієніл, 5-хлортієніл, піридин-4-іл, піразиніл, метиламіногрупу, етиламіногрупу, диметиламіногрупу або діетиламіногрупу,

R_3 означає етил, н-пропіл, пропеніл, бутеніл, ізобутеніл, бензил або нафтилметил, при цьому R_3 необов'язково заміщений одним або більше радикалами R_c , де

R_c являє собою метил, циклогексил, циклопентил, інданіл, 1,2,3,4-тетрагідронафтил, метоксигрупу, метилтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, фтор або хлор,

R_5 означає зв'язок, карбоніл, метил, етил, н-пропіл, н-бутил, трет-бутил, ізопропіл, ізобутил, циклопропіл, циклопентил, циклогексил, феніл, бензил, піперидиніл, тетрагідропіраніл, примідиніл, ацетил, бензоіл, етоксикарбоніл, бензилоксикарбоніл, метилсульфоніламіногрупу, фенілсульфоніламіногрупу, метиламіногрупу, диметиламіногрупу, фтор, оксогрупу або карбоксигрупу, при цьому R_5 додатково необов'язково може бути заміщений одним або більше радикалами R_e , де

R_e являє собою метил, циклопропіл, циклопентил, циклогексил, феніл, нафтил, інданіл, тієніл, 5-метилтієніл, метоксигрупу, феноксигрупу, бензилоксигрупу, піперидиніл, піридиніл, індоліл, 1-(толілсульфоніл)індоліл, карбамоїл, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений метилом, фенілом або бензилом, або

R_e являє собою гідроксигрупу, фтор, хлор, оксогрупу, диметиламіногрупу або трифторметил, і R_6 означає ацетил, C_{1-3} алкіламінокарбоніл або C_{1-3} алкоксикарбоніл.

32. Сполука за п. 31, у якій

Het означає піперидин-4-іл або піролідин-3-іл,

R_1 означає морфолін-4-іл, п-фторфеніл або п-метоксифеніл,

R_5 означає метил, пропіл, н-пентил або циклогексил, і

R_6 означає ацетил, етиламінокарбоніл або етоксикарбоніл.

33. Сполука за п. 21, у якій

Het означає піперидиніл, піролідиніл, азетидиніл, азепаніл, оксепаніл, тетрагідропіраніл, оксетаніл або тетрагідротіопіраніл, при цьому кожне з вказаних кілець необов'язково заміщене одним або більше радикалами R_5 ,

R_1 означає зв'язок, C_{1-4} алкіл, C_{1-4} алкоксигрупу, циклопропіл, циклогексил, феноксигрупу, нафтилоксигрупу, феніл, бензил, нафтил, піролідиніл, піперидиніл, морфолініл, тіоморфолініл, піперазиніл, фураніл, тієніл, оксазоліл, тіазоліл, імідазоліл, піридиніл, піримідиніл, піразиніл, піридазиніл, індоліл, хінолініл, бензофураніл, бензтієніл, бензімідазоліл, бензтіазоліл, бензоксазоліл або аміногрупу, при цьому R_1 необов'язково заміщений одним або більше радикалами R_a , де

R_a являє собою метил, етил, пропіл, ізопропіл, циклопропіл, циклогексил, феніл, піролідиніл, піперидиніл, морфолініл, тіоморфолініл, піперазиніл, тієніл, імідазоліл, метоксигрупу, етоксигрупу, ацетил, ацетоксигрупу, феноксигрупу, нафтилоксигрупу, бензилоксигрупу, метоксикарбоніл, етоксикарбоніл, феноксикарбоніл, нафтилоксикарбоніл, бензоїлоксигрупу, карбамоїл, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений метилом, етилом, фенілом, нафтилом, піролідинілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом або піперазинілом, або R_a являє собою ацетиламіногрупу, бензоїламіногрупу, метилтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, етилтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, фенілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, уреїдогрупу, у якій будь-який атом азоту може бути незалежно заміщений метилом, етилом, фенілом, нафтилом, піролідинілом, піперидинілом, морфолінілом, тіоморфолінілом або піперазинілом, або

R_a являє собою метоксикарбоніламіногрупу, етоксикарбоніламіногрупу, феноксикарбоніламіногрупу, C₁₋₂алкілкарбамоїлоксигрупу, фенілкарбамоїлоксигрупу, нафтилкарбамоїлоксигрупу, C₁₋₂алкілсульфоніламіногрупу, фенілсульфоніламіногрупу, нафтилсульфоніламіногрупу, C₁₋₂алкіламіносульфоніл, феніламіносульфоніл, нафтиламіносульфоніл, аміногрупу, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений метилом, етилом, фенілом, нафтилом, піролідінілом, піперидінілом, морфолінілом, тіоморфолінілом або піперазинілом, або

R_a являє собою галоген, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу, ціаногрупу, нітрогрупу, карбоксамід, амідиногрупу або гуанідиногрупу, при цьому R_a додатково необов'язково може бути заміщений одним або більше радикалами R_b, де

R_b означає метил, етил, циклопропіл, циклогексил, феніл, метоксигрупу, етоксигрупу, феноксигрупу, бензилоксигрупу, фтор, хлор, бром, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу, ціаногрупу, нітрогрупу або карбоксамід,

R₂ означає водень або метил,

R₃ означає зв'язок, метил, етил, н-пропіл, ізопропіл, н-бутил, ізобутил, н-пентил, пропеніл, ізобутеніл, циклогексил, бензил або нафтилметил, при цьому R₃ необов'язково заміщений одним або більше радикалами R_c, де

R_c являє собою метил, етил, циклогексил, циклопентил, феніл, нафтил, біцикло[3.1.0]гексаніл, біцикло[1.1.1]пентаніл, кубаніл, фураніл, тетрагідропіраніл, тіеніл, оксазоліл, тіазоліл, імідазоліл, піримідиніл, метоксигрупу, етоксигрупу, феноксигрупу, ацетил, бензоїл, метоксикарбоніл, феноксикарбоніл, ацетоксигрупу, бензоїлоксигрупу, карбамоїл, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений метилом або фенілом, або

R_c являє собою ацетиламіногрупу, бензоїламіногрупу, метилтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, фенілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, уреїдогрупу, у якій будь-який атом азоту може бути незалежно заміщений метилом або фенілом, або

R_c являє собою метоксикарбоніламіногрупу, феноксикарбоніламіногрупу, метилкарбамоїлоксигрупу, фенілкарбамоїлоксигрупу, метилсульфоніламіногрупу, фенілсульфоніламіногрупу, метиламіносульфоніл, феніламіносульфоніл, аміногрупу, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений метилом або фенілом, або

R_c являє собою хлор, фтор, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу або ціаногрупу, при цьому R₂ і R₃ разом з атомом вуглецю, до якого вони приєднані, необов'язково утворюють кільце, вибране з групи, яка включає циклопентил, циклогексил, циклогептил, тетрагідропіраніл, тетрагідротіопіраніл, тетрагідрофураніл, піролідиніл, піперидиніл, піперазиніл, морфолініл і тетрагідротіофеніл,

R₄ означає водень,

R₅ означає зв'язок, водень, карбоніл, C₁₋₅алкіл, C₁₋₅алкоксіC₁₋₅алкіл, C₁₋₅алкіламіноC₁₋₅алкіл, C₁₋₅алкілтіоC₁₋₅алкіл, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, C₁₋₅алкоксигрупу, феноксигрупу, нафтилоксигрупу, циклопропіл, циклопентил, циклогексил, феніл, бензил, гетероцикліл, вибраний із групи, яка включає піролідиніл, піперидиніл, морфолініл, тетрагідропіраніл, піридиніл і піримідиніл, гетероциклілоксигрупу, у якій гетероциклільний фрагмент вибраний із групи, вказаної вище в цьому абзаці, ацетил, бензоїл, ацетилоксигрупу, бензилоксигрупу, метоксикарбоніл, етоксикарбоніл, бензилоксикарбоніл, бензоїлоксигрупу, карбамоїл, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений метилом, етилом або фенілом, або

R₅ означає ацетиламіногрупу, бензоїламіногрупу, фенілтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, уреїдогрупу, у якій будь-який атом азоту може бути незалежно заміщений метилом, етилом або фенілом, або

R₅ означає метоксикарбоніламіногрупу, етоксикарбоніламіногрупу, феноксикарбоніламіногрупу, метилкарбамоїлоксигрупу, фенілкарбамоїлоксигрупу, фенілсульфоніламіногрупу, феніламіносульфоніл, аміногрупу, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений метилом, етилом або фенілом, або

R₅ означає фтор, хлор, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу або карбоксамід, при цьому R₅ додатково необов'язково може бути заміщений одним або більше радикалами R_e, де

R_e являє собою метил, етил, метоксигрупу, етоксигрупу, циклопропіл, циклопентил, циклогексил, феніл, нафтил, інданіл, піперидиніл, морфолініл, індоліл, тіеніл, піридиніл, метоксигрупу, етоксигрупу, ацетил, бензоїл, ацетилоксигрупу, феноксигрупу, бензилоксигрупу, метоксикарбоніл, етоксикарбоніл, карбамоїл, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений метилом, етилом або фенілом, або

R_e являє собою ацетиламіногрупу, бензоїламіногрупу, метилтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, фенілтіогрупу або метилтіогрупу, де атом сірки може бути окислений до сульфоксиду або сульфону, уреїдогрупу, у якій будь-який атом азоту може бути незалежно заміщений метилом, етилом або фенілом, або

R_e являє собою метоксикарбоніламіногрупу, етоксикарбоніламіногрупу, феноксикарбоніламіногрупу, метилкарбамоїлоксигрупу, фенілкарбамоїлоксигрупу, метилсульфоніламіногрупу, фенілсульфоніламіногрупу, метиламіносульфоніл,

феніламіносульфоніл, аміногрупу, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений метилом, етилом або фенілом, або

R_e являє собою фтор, хлор, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу або карбоксамід, при цьому R_e додатково необов'язково може бути заміщений одним або більше радикалами R_f , де R_f означає метил, феніл, толілсульфоніл, феноксигрупу, бензилоксигрупу, фтор, хлор або оксогрупу.

34. Сполука за п. 33, у якій

R_1 означає зв'язок, метил, етил, н-пропіл, ізопропіл, метоксигрупу, етоксигрупу, бензилоксигрупу, циклопропіл, циклогексил, феноксигрупу, нафтилоксигрупу, феніл, бензил, нафтил, піролідініл, піперидиніл, морфолініл, тіоморфолініл, піперазиніл, фураніл, тієніл, оксазоліл, тіазоліл, імідазоліл, піридиніл, піримідиніл, піразиніл, піридазиніл, індоліл, хінолініл, бензофураніл, бензтієніл, бензімідазоліл, бензтіазоліл, бензоксазоліл або аміногрупу, при цьому R_1 необов'язково заміщений одним або більше радикалами R_a , де

R_a являє собою метил, циклопропіл, феніл, галоген, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу, ціаногрупу, нітрогрупу або карбоксамід,

R_3 означає зв'язок, метил, етил, н-пропіл, ізопропіл, н-бутил, ізобутил, н-пентил, пропеніл, ізобутеніл, бензил або нафтилметил, при цьому R_3 необов'язково заміщений одним або більше радикалами R_c , де

R_c являє собою метил, етил, циклогексил, циклопентил, феніл, фураніл, тетрагідропіраніл, тієніл, оксазоліл, тіазоліл, метоксигрупу, феноксигрупу, ацетил, бензоїл, метоксикарбоніл, карбамоїл, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений метилом або фенілом, або

R_c являє собою ацетиламіногрупу, бензоїламіногрупу, метилтіогрупу, метоксикарбоніламіногрупу, метилкарбамоїлоксигрупу, метилсульфоніламіногрупу, метиламіносульфоніл, аміногрупу, де атом азоту може бути незалежно моно- або дизаміщений метилом, або

R_c являє собою фтор або оксогрупу,

при цьому R_2 і R_3 разом з атомом вуглецю, до якого вони приєднані, необов'язково утворюють кільце, вибране з групи, яка включає циклопентил, циклогексил, циклогептил, тетрагідропіраніл, тетрагідротіопіраніл, тетрагідрофураніл, піролідініл і піперидиніл, і

R_5 означає метил, етил, н-пропіл, н-бутил, н-пентил, 2-пентил, 3-пентил, фенетил, фенпропіл, 2,2-диметилпропіл, трет-бутил, ізопропіл, ізобутил, циклопропіл, циклопентил, циклогексил, циклопропілметил, циклопентилметил, циклогексилметил, феніл, бензил, 2-метилбензил, 3-метилбензил, 4-метилбензил, 2,6-диметилбензил, 2,5-диметилбензил, 2,4-диметилбензил, 2,3-диметилбензил, 3,4-диметилбензил, 3,5-диметилбензил, 2,4,6-триметилбензил, 2-метоксибензил, 3-метоксибензил, 4-метоксибензил, 2-феноксибензил, 3-феноксибензил, 4-феноксибензил, 2-бензилоксибензил, 3-бензилоксибензил, 4-бензилоксибензил, 2-фторбензил, 3-фторбензил, 4-фторбензил, 2,6-дифторбензил, 2,5-дифторбензил, 2,4-дифторбензил, 2,3-дифторбензил, 3,4-дифторбензил, 3,5-дифторбензил, 2,4,6-трифторбензил, 2-трифторметилбензил, 3-трифторметилбензил, 4-трифторметилбензил, нафтилметил, інданілметил, піридинілметил, індолілметил, тієнілметил, 5-метилтієнілметил, піперидиніл, піперидинілкарбоніл, піридинілкарбоніл, тетрагідропіраніл, піримідиніл, ацетил, бензоїл, етоксикарбоніл, бензилоксикарбоніл, трет-бутоксикарбоніл, метилкарбамоїл, фенілкарбамоїл, бензилкарбамоїл, метилсульфоніламіногрупу, фенілсульфоніламіногрупу, метиламіногрупу, диметиламіногрупу, фтор, оксогрупу або карбоксигрупу.

35. Сполука за п. 34, у якій

R_1 означає метоксигрупу, бензилоксигрупу, циклогексил, феноксигрупу, нафтилоксигрупу, феніл, бензил, нафтил, піролідініл, піперидиніл, морфолініл, тіоморфолініл, піперазиніл, фураніл, тієніл, оксазоліл, тіазоліл, імідазоліл, піридиніл, піримідиніл, піразиніл, індоліл, хінолініл, бензофураніл, бензтієніл, бензімідазоліл, бензтіазоліл, бензоксазоліл або аміногрупу, при цьому R_1 необов'язково заміщений одним або більше радикалами R_a , де

R_a являє собою метил, феніл, фтор, хлор, гідроксигрупу, оксогрупу, карбоксигрупу або карбоксамід,

R_3 означає зв'язок, метил, етил, н-пропіл, ізопропіл, н-бутил, ізобутил, н-пентил, пропеніл, ізобутеніл або бензил, при цьому R_3 необов'язково заміщений одним або більше радикалами R_c , де

R_c являє собою метил, етил, циклогексил, циклопентил, феніл, фураніл, тетрагідропіраніл, тієніл, оксазоліл, тіазоліл, метоксигрупу, феноксигрупу, ацетил, бензоїл, метоксикарбоніл, ацетиламіногрупу, метилтіогрупу, метилсульфоніламіногрупу або фтор,

при цьому R_2 і R_3 разом з атомом вуглецю, до якого вони приєднані, необов'язково утворюють кільце, вибране з групи, яка включає циклопентил, циклогексил, циклогептил, тетрагідропіраніл, тетрагідротіопіраніл і тетрагідрофураніл, і

R_5 означає метил, етил, н-пропіл, н-бутил, фенетил, фенпропіл, трет-бутил, ізопропіл, ізобутил, циклопропіл, циклогексил, циклопропілметил, циклогексилметил, феніл, бензил, 2-метоксибензил, 3-метоксибензил, 4-метоксибензил, 4-фторбензил, 3,5-дифторбензил, 4-трифторметилбензил, нафтилметил, піридинілметил, індолілметил, тієнілметил, ацетил, бензоїл, етоксикарбоніл, бензилоксикарбоніл, трет-бутоксикарбоніл, фенілкарбамоїл, фенілсульфоніламіногрупу або фтор.

36. Сполука за п. 35, у якій

Het означає піролідініл, піперидиніл або тетрагідропіраніл,

R₁ означає бензилоксигрупу, феноксигрупу, нафтилоксигрупу, феніл, нафтил, піролідиніл, піперидиніл, морфолініл, тіоморфолініл, піперазиніл, піридиніл, індоліл, хінолініл, бензофураніл, бензтієніл, бензімідазоліл, бензтіазоліл, бензоксазоліл або феніламіногрупу,
R₃ означає н-пропіл, ізобутил, пропеніл, ізобутеніл або 2,2-диметилпропіл,
при цьому R₂ і R₃ разом з атомом вуглецю, до якого вони приєднані, необов'язково утворюють кільце, вибране з групи, яка включає циклопентил, циклогексил і циклогептил, і
R₅ означає метил, етил, н-пропіл, фенетил, трет-бутил, ізопропіл, ізобутил, циклогексил, циклогексилметил, бензил, 4-фторбензил, нафтилметил, ацетил, бензоїл або бензилоксикарбоніл.

37. Сполука за п. 21, вибрана з групи, яка включає:

етиловий ефір {[1-(4-ціано-1-пропілпіперидин-4-ілкарбамоїл)-3,3-диметилбутиліміно]морфолін-4-ілметил}карбамінової кислоти,

N-(4-ціанометилпіперидин-4-іл)-3-циклогексил-2-(3-оксо-3H-ізоіндол-1-іламіно)пропіонамід,
(4-ціано-1-пропілпіперидин-4-іл)амід 4,4-диметил-2-(3-оксо-3H-ізоіндол-1-іламіно)пентанової кислоти,

N-(4-ціано-1-метилпіперидин-4-іл)-3-циклогексил-2-(2-оксо-2H-бензо[e][1,3]оксазин-4-іламіно)пропіонамід,

етиловий ефір {[1-(4-ціано-1-метилпіперидин-4-ілкарбамоїл)-2-циклогексилетиламіно]піперидин-1-ілметил}карбамінової кислоти,

'2-[(ацетилімінофенілметил)аміно]-N-(4-ціано-1-метилпіперидин-4-іл)-

3-циклогексилпропіонамід,

етиловий ефір {[1-(4-ціано-1-метилпіперидин-4-ілкарбамоїл)-2-циклогексилетиламіно]морфолін-4-ілметил}карбамінової кислоти,

'2-[(ацетилімінофенілметил)аміно]-N-[3-ціано-1-(1-етилпропіл)піролідин-3-іл]-3-

циклогексилпропіонамід,

етиловий ефір '([1-[3-ціано-1-(1-етилпропіл)піролідин-3-ілкарбамоїл]-2-

циклогексилетиламіно]морфолін-4-ілметил)карбамінової кислоти,

'N-(4-ціано-1-метилпіперидин-4-іл)-3-циклогексил-2-

[(етилкарбамоїлімінофенілметил)аміно]пропіонамід,

'N-[4-ціано-1-метилпіперидин-4-іл)-3-циклогексил-2-(1,1-діоксо-1H- λ^6 -бензо[d]ізотіазол-3-іламіно)пропіонамід,

'N-[3-ціано-1-(1-етилпропіл)піролідин-3-іл]-3-циклогексил-2-(1,1-діоксо-1H- λ^6 -бензо[d]ізотіазол-3-іламіно)пропіонамід,

N-(3-ціано-1-циклогексилпіролідин-3-іл)-3-циклогексил-2-(1,1-діоксо-1H- λ^6 -бензо[d]ізотіазол-3-іламіно)пропіонамід,

N-(3-ціано-1-циклогексилпіролідин-3-іл)-3-циклогексил-2-(1,1-діоксо-1H- λ^6 -бензо[d]ізотіазол-3-іламіно)пропіонамід,

N-(4-ціано-1-пропілпіперидин-4-іл)-3-циклогексил-2-(1,1-діоксо-1H- λ^6 -бензо[d]ізотіазол-3-іламіно)пропіонамід,

(4-ціано-1-пропілпіперидин-4-іл)амід '2-(1,1-діоксо-1H- λ^6 -бензо[d]ізотіазол-3-іламіно)-4,4-диметилпентанової кислоти

та їх фармацевтично прийнятні похідні.

38. Фармацевтична композиція, яка містить фармацевтично ефективну кількість сполуки за п. 1, 7, 15, 21 або 33.

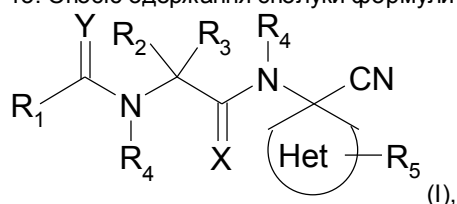
39. Спосіб модуляції аутоімунного захворювання, який полягає у введенні пацієнту при необхідності такого лікування фармацевтично ефективної кількості сполуки за п. 1, 7 або 21.

40. Спосіб за п. 39, у якому аутоімунне захворювання являє собою ревматоїдний артрит, системний червоний вовчок, хворобу Крона, неспецифічний виразковий коліт, множинний склероз, синдром Гійєна-Барре, псоріаз, хворобу Грейвса, важку псевдопаралітичну міастенію, склеродермію, гломерулонефрит, atopічний дерматит або інсулінзалежний цукровий діабет.

41. Спосіб лікування захворювання, вибраного із групи, яка включає хворобу Альцгеймера, атеросклероз та астму, який полягає у введенні пацієнту при необхідності такого лікування фармацевтично ефективної кількості сполуки за п. 1, 7 або 21.

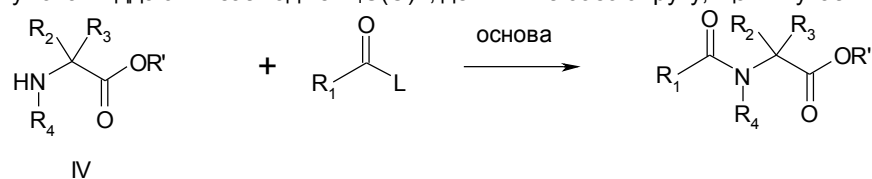
42. Спосіб лікування остеопорозу, який полягає у введенні пацієнту при необхідності такого лікування фармацевтично ефективної кількості сполуки за п. 15 або 33.

43. Спосіб одержання сполуки формули (I)



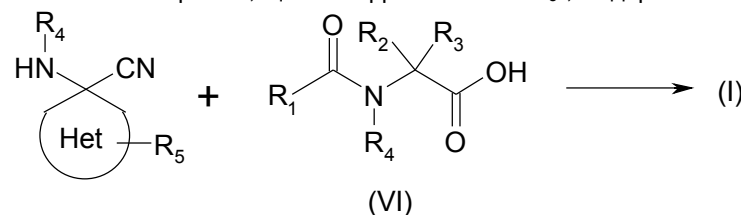
у якій $R_1, R_2, R_3, R_4, \text{Het}$ і R_5 мають вказані в п. 1 значення, а Y і X обидва означають O , який полягає в тому, що

а) ефір амінокислоти формули (IV), у якій R' являє собою захисну групу, у прийнятних реакційних умовах піддають взаємодії з $R_1C(O)L$, де L являє собою групу, що вилучається:

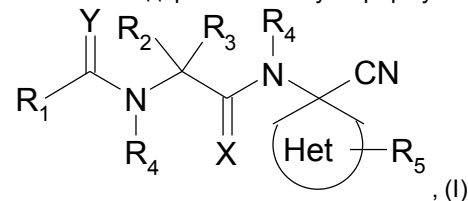


б) з одержаної на стадії а) сполуки видаляють захисну групу R' з одержанням відповідної карбонової кислоти, і

в) одержаний на стадії б) продукт в умовах сполучення піддають взаємодії з представленим нижче амініонітрилом, що несе фрагмент " Het-R_5 ", з одержанням сполуки формули (I):

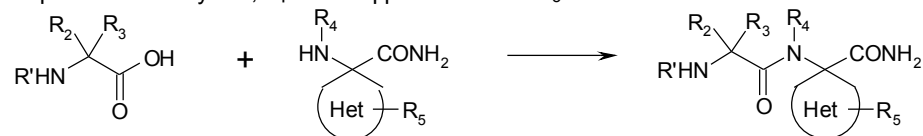


44. Спосіб одержання сполуки формули (I)



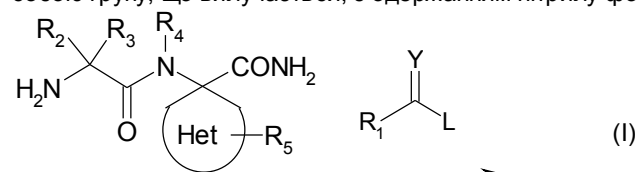
у якій $R_1, R_2, R_3, R_4, \text{Het}$ і R_5 мають вказані в п. 1 значення, а Y і X обидва означають O , який полягає в тому, що

а) захищену захисною групою R' амінокислоту в умовах сполучення піддають взаємодії з нітрильною сполукою, що несе фрагмент " Het-R_5 ":

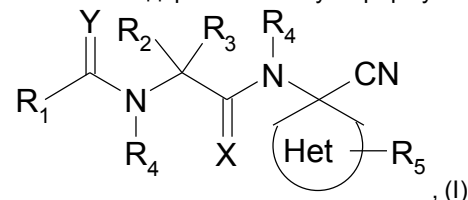


б) з одержаної на стадії а) сполуки видаляють захисну групу R' , і

в) одержану на стадії б) сполуку піддають взаємодії з активованою кислотою $R_1C(Y)L$, де L являє собою групу, що вилучається, з одержанням нітрилу формули (I)

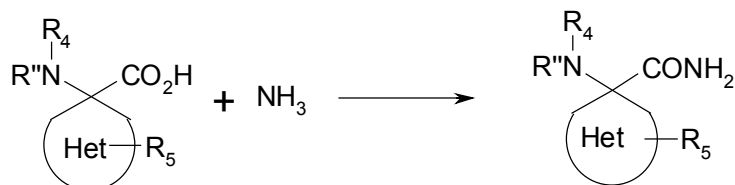


45. Спосіб одержання сполуки формули (I)

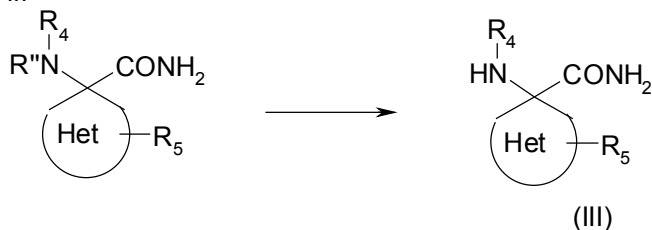


у якій $R_1, R_2, R_3, R_4, \text{Het}$ і R_5 мають вказані в п. 1 значення, а Y і X обидва означають O , який полягає в тому, що

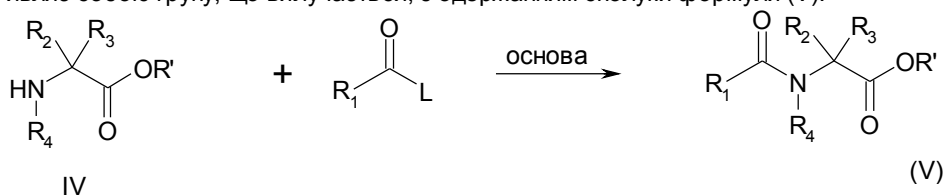
а) аміак у прийнятних умовах реакції сполучення піддають взаємодії з захищеною амінокислотою, що несе фрагмент " Het-R_5 ", де R' являє собою захисну групу:



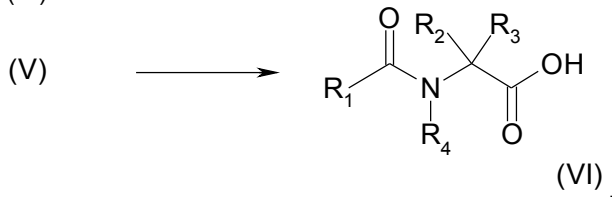
б) з одержаного на стадії а) продукту видаляють захисну групу R'' з одержанням сполуки формули III



в) амінофір формули (IV) у присутності прийнятної основи піддають взаємодії з R₁C(O)L, де L являє собою групу, що вилучається, з одержанням сполуки формули (V):



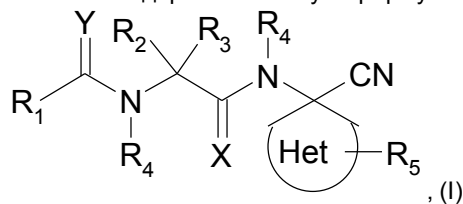
г) одержаний на стадії в) продукт піддають гідролізу з одержанням карбонової кислоти формули (VI):



і

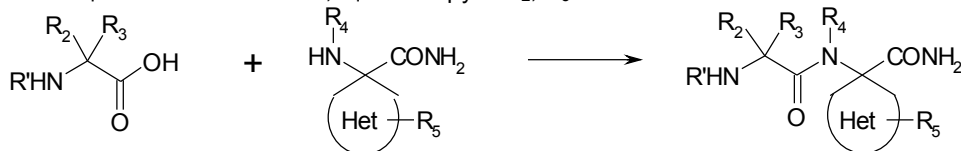
д) одержаний на стадії б) продукт формули (III) у прийнятних умовах реакції сполучення піддають взаємодії з одержаним на стадії г) продуктом формули (VI) з наступною дегідратацією, одержуючи нітрильну сполуку формули (I).

46. Спосіб одержання сполуки формули (I)



у якій R₁, R₂, R₃, R₄, Het і R₅ мають вказані в п. 1 значення, а Y і X обидва означають O, який полягає в тому, що

а) амід амінокислоти, що несе фрагмент "Het-R₅", в умовах реакції сполучення піддають взаємодії з захищеною амінокислотою, що несе групи R₂, R₃:



б) з одержаної на стадії а) сполуки видаляють захисну групу R', і

в) одержаний на стадії б) продукт у прийнятних умовах реакції сполучення піддають взаємодії зі сполукою формули R₁C(O)L, де L являє собою групу, що вилучається, з наступною дегідратацією, одержуючи нітрильну сполуку формули (I).