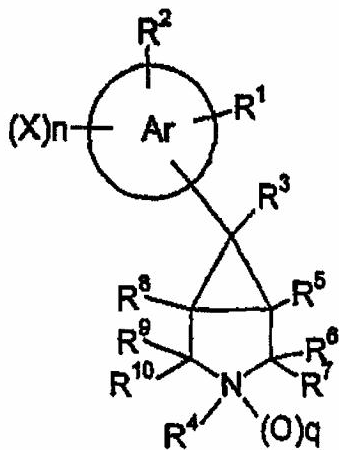


1. Сполука, що являє собою сполуку формули I



, (I)

де кільце «Ar» являє собою бензоконденсований феніл або 5- або 6-членне гетероарильне кільце;

$R^1$ , узятий окремо, являє собою H, галоген,  $\text{NO}_2$ ,  $\text{NH}_2$ ,  $\text{NY}^2\text{WY}^1$ , Het<sup>1</sup>, AD,  $\text{CO}_2\text{R}^7$ ,  $\text{C}(\text{O})\text{R}^8$ ,  $\text{C}(\text{=NOH})\text{R}^8$  або OE,

$\text{Y}^2$  являє собою H,  $\text{C}_{1-6}$ алкіл,  $\text{C}_{3-6}$ алкеніл (кожний із зазначених алкілу й алкенілу необов'язково заміщений арилом, арилоксигрупою або Het<sup>1</sup>),

W являє собою  $\text{SO}_2$ , CO,  $\text{C}(\text{O})\text{O}$ ,  $\text{P}(\text{Y}^1)=\text{O}$ ,  $\text{P}(\text{Y}^1)=\text{S}$ ,

$\text{Y}^1$  являє собою  $\text{C}_{1-10}$ алкіл (необов'язково заміщений одним або декількома замісниками, незалежно вибраними з галогену, OH,  $\text{C}_{1-4}$ алкокси-,  $\text{C}_{1-6}$ алканолілоксигрупи,  $\text{CONH}_2$ ,  $\text{C}_{1-6}$  алкоксикарбонілу,  $\text{NH}_2$ , арилу, моно- або ді( $\text{C}_{1-4}$  алкіл)аміногрупи,  $\text{C}_{3-8}$ циклоалкілу, фталімідилу, Het<sup>1</sup>), Het, арил (необов'язково заміщений одним або декількома замісниками, незалежно вибраними з  $\text{C}_{1-4}$ алкілу,  $\text{C}_{1-4}$ галогеналкілу або галогену),  $\text{NH}_2$ , N( $\text{C}_{1-6}$ алкіл)<sub>2</sub> або NH( $\text{C}_{1-6}$ алкіл),

Het<sup>1</sup> являє собою гетероциклічну групу, що містить до 4 гетероатомів, вибраних з N, O і S, що може включати до 3 кілець (переважно, гетероарильна група, необов'язково, бензо- або піридинконденсований гетероарил), необов'язково заміщений одним або декількома замісниками, незалежно вибраними з  $\text{C}_{1-6}$ алкілу,  $\text{C}_{1-6}$ алкоксигрупи,  $\text{C}_{3-8}$ циклоалкілу,  $\text{C}_{1-6}$ галогеналкоксигрупи,  $\text{C}_{1-6}$ галогеналкілу,  $\text{C}_{3-6}$ галогенциклоалкілу, =O, OH, галогену,  $\text{NO}_2$ ,  $\text{SiR}^{19a}\text{R}^{19b}\text{R}^{19c}$ ,  $\text{CONR}^{20a}\text{R}^{20b}$ ,  $\text{NR}^{20a}\text{R}^{20b}$ ,  $\text{SR}^{21a}$ ,  $\text{NR}^{21b}\text{SO}_2\text{R}^{22a}$ ,  $\text{NR}^{21c}(\text{O})\text{OR}^{22b}$ ,  $\text{NR}^{21d}\text{COR}^{22c}$  і  $\text{C}_{1-6}$ алкоксикарбонілу,

і якщо атом S є присутнім у кільці, він може бути представлений як частина групи -S-, S(O)- або S(O)<sub>2</sub>-,

і атоми вуглецю в кільці можуть бути представлені як частина карбонільного фрагмента;

$\text{R}^{19a}$ ,  $\text{R}^{19b}$ ,  $\text{R}^{19c}$ , кожен незалежно, являють собою  $\text{C}_{1-6}$ алкіл або арил,

$\text{R}^{20a}$  і  $\text{R}^{20b}$ , кожен незалежно, являють собою H,  $\text{C}_{1-6}$ алкіл, арил, ( $\text{C}_{1-4}$ алкіл)феніл, і кожний із зазначених алкілу, арилу й алкілфенілу необов'язково заміщений одним або декількома  $\text{C}_{1-4}$ алкілом,  $\text{C}_{1-4}$ алкоксигрупою, OH,  $\text{NO}_2$ ,  $\text{NH}_2$  і/або галогеном,

або  $\text{R}^{20a}$  і  $\text{R}^{20b}$  разом з атомом N, до якого вони приєднані, можуть утворювати 4-6-членне кільце, необов'язково заміщене одним або декількома замісниками, незалежно вибраними з одного або декількох  $\text{C}_{1-4}$ алкілу,  $\text{C}_{1-4}$ алкоксигрупи, OH, =O,  $\text{NO}_2$ ,  $\text{NH}_2$  і/або галогену,

$\text{R}^{21a, b, c, d}$ , кожен незалежно, являють собою H,  $\text{C}_{1-6}$ алкіл, арил або  $\text{C}_{1-4}$ алкілфеніл, і кожний із зазначених алкілу, арилу й алкілфенілу необов'язково заміщений одним або декількома  $\text{C}_{1-4}$ алкілом,  $\text{C}_{1-4}$ алкокси, OH,  $\text{NO}_2$ , галогеном,  $\text{NH}_2$ ,

$\text{R}^{22a, b, c}$ , кожний незалежно, являють собою  $\text{C}_{1-6}$ алкіл, арил або  $\text{C}_{1-4}$ алкілфеніл, і кожний із зазначених алкілу, арилу й алкілфенілу необов'язково заміщений одним або декількома  $\text{C}_{1-4}$ алкілом,  $\text{C}_{1-4}$ алкокси-, OH,  $\text{NO}_2$ , галогеном,  $\text{NH}_2$ ,

A являє собою  $\text{C}_{1-4}$ алкілен,  $\text{C}_{2-4}$ алкенілен або  $\text{C}_{2-4}$ алкінілен, кожний з який необов'язково заміщений одним або декількома  $\text{C}_{1-4}$ алкілом,  $\text{C}_{1-4}$ алкокси-, галогеном і/або OH,

D являє собою H, OH, CN,  $\text{NR}^{25}\text{R}^{26}$ ,  $\text{CONR}^{25}\text{R}^{26}$ ,  $\text{NHR}^{27}$ ,  $\text{CO}_2\text{R}^{28}$ ,  $\text{COR}^{29}$ ,  $\text{C}(\text{=NOH})\text{R}^{29}$ ,

або AD являє собою CN,  $\text{NR}^{25}\text{R}^{26}$ ,  $\text{CONR}^{25}\text{R}^{26}$ ,

де  $\text{R}^{25}$  і  $\text{R}^{26}$ , кожен незалежно, являють собою H,  $\text{C}_{1-3}$ алкіл,  $\text{C}_{3-8}$ циклоалкіл, арил,  $\text{C}_{1-4}$ алкілфеніл (кожний із зазначених  $\text{C}_{1-3}$ алкілу,  $\text{C}_{3-8}$ циклоалкілу, арилу і  $\text{C}_{1-4}$ алкілфенілу необов'язково заміщений одним або декількома  $\text{NO}_2$ , галогеном,  $\text{C}_{1-4}$ алкілом і/або  $\text{C}_{1-4}$  алкоксигрупою (кожний із зазначених останніх  $\text{C}_{1-4}$  алкілу і/або  $\text{C}_{1-4}$ алкоксигрупи необов'язково заміщений одним або декількома галогенами)),

або  $\text{R}^{25}$  і  $\text{R}^{26}$  разом з атомом N, до якого вони приєднані, можуть утворювати 4-7-членне гетероциклічне кільце, що необов'язково містить один або декілька додаткових гетероатомів, вибраних з N, O і S, і зазначене кільце необов'язково заміщене одним або декількома  $\text{C}_{1-4}$ алкілом, OH, =O,  $\text{NO}_2$ ,  $\text{NH}_2$  і/або галогеном,

$\text{R}^{27}$  являє собою  $\text{COR}^{30}$ ,  $\text{CO}_2\text{R}^{31a}$ ,  $\text{SO}_2\text{R}^{31b}$ ,

$\text{R}^{28}$  і  $\text{R}^{29}$ , кожен незалежно, являють собою H,  $\text{C}_{1-6}$ алкіл,  $\text{C}_{3-8}$ циклоалкіл, арил або  $\text{C}_{1-4}$ алкілфеніл, і кожний із зазначених  $\text{C}_{1-6}$ алкілу,  $\text{C}_{3-8}$ циклоалкілу, арилу або  $\text{C}_{1-4}$ алкілфенілу необов'язково заміщений одним або декількома  $\text{NO}_2$ , галогеном,  $\text{C}_{1-4}$ алкілом,  $\text{C}_{1-4}$ алкоксигрупою (кожний з останніх  $\text{C}_{1-4}$ алкілу і  $\text{C}_{1-4}$ алкокси- необов'язково заміщений одним або декількома галогенами)),

$\text{R}^{30}$  являє собою H,  $\text{C}_{1-4}$ алкіл,  $\text{C}_{3-8}$ циклоалкіл,  $\text{C}_{1-4}$ алкокси-,  $\text{C}_{3-8}$ циклоалкоксигрупу, арил, арилоксигрупу,  $\text{C}_{1-4}$ алкілфеніл, феніл( $\text{C}_{1-4}$ )алкоксигрупу (кожний із зазначених  $\text{C}_{1-4}$ алкілу,  $\text{C}_{3-8}$ циклоалкілу,  $\text{C}_{1-4}$ алкокси-,  $\text{C}_{3-8}$ циклоалкокси-, арилу, арилокси-,  $\text{C}_{1-4}$ алкілфенілу, феніл ( $\text{C}_{1-4}$ )алкокси- необов'язково заміщений одним або декількома  $\text{NO}_2$ , галогеном,  $\text{C}_{1-4}$ алкілом  $\text{C}_{1-4}$ алкокси (і останні алкіл і алкокси необов'язково заміщені одним або декількома галогенами)),

$R^{31a}$  і  $R^{31b}$ , кожен незалежно, являють собою  $C_{1-4}$ алкіл,  $C_{3-8}$ циклоалкіл, арил або  $C_{1-4}$ алкілфеніл, кожний з яких необов'язково заміщений одним або декількома  $NO_2$ , галогеном,  $C_{1-4}$ алкілом або  $C_{1-4}$ алкокси-, і кожний з останніх алкілу й алкокси- необов'язково заміщений одним або декількома галогенами,  $E$  являє собою  $H$ ,  $CONR^{32}R^{33}$ ,  $CSNR^{32}R^{33}$ ,  $COR^{34}$ ,  $CO_2R^{34}$ ,  $COCH(R^{34a})NH_2$ ,  $R^{35}$ ,  $CH_2CO_2R^{35a}$ ,  $CHR^{35b}O_2R^{35a}$ ,  $CH_2OCO_2R^{35c}$ ,  $CHR^{35d}OCO_2R^{35c}$ ,  $COCR^{36}=CR^{37}NH_2$ ,  $COCHR^{36}CHR^{37}NH_2$  або  $PO(OR^{38})_2$ ,  $R^{32}$  і  $R^{33}$ , кожен незалежно, являють собою  $H$ ,  $C_{3-10}$ алкілалкеніл,  $C_{3-7}$ циклоалкіл (необов'язково заміщений  $C_{1-4}$ алкілом), феніл (необов'язково заміщений  $(X)_n$ ),  $C_{1-10}$ алкіл (необов'язково заміщений  $C_{4-7}$ циклоалкілом (необов'язково заміщеним  $C_{1-4}$ алкілом) або фенілом, необов'язково заміщеним  $(X)_n$ ), або  $R^{32}$  і  $R^{33}$  разом з атомом  $N$ , до якого приєднані, можуть утворювати 5-8-членний гетероцикл, що необов'язково включає додаткові гетероатомі, вибрані з  $N$ ,  $O$  і  $S$ , і зазначений гетероцикл необов'язково заміщений  $C_{1-4}$ алкілом, необов'язково заміщеним одним або декількома галогенами,  $R^{34}$  являє собою  $H$ ,  $C_{4-7}$ циклоалкіл (необов'язково заміщений одним або декількома  $C_{1-4}$ алкілами), феніл (необов'язково заміщений  $(X)_n$ ,  $C_{1-4}$ алканойлоксигрупою,  $NR^{32}R^{33}$ ,  $CONR^{32}R^{33}$  і/або  $OH$ ) або  $C_{1-6}$ алкіл (необов'язково заміщений одним або декількома галогенами,  $C_{4-7}$ циклоалкілом (необов'язково заміщеним одним або декількома  $C_{1-4}$  алкілами), або фенілом (необов'язково заміщеним  $(X)_n$ ,  $C_{1-4}$ алканойлоксигрупою,  $NR^{32}R^{33}$ ,  $CONR^{32}R^{33}$  і/або  $OH$ )),  $R^{34a}$  являє собою  $H$ ,  $C_{1-6}$ алкіл (необов'язково заміщений одним або декількома галогенами,  $C_{4-7}$ циклоалкілом (необов'язково заміщеним одним або декількома  $C_{1-4}$  алкілами) або фенілом (необов'язково заміщеним  $(X)_n$ ,  $C_{1-4}$ алканойлокси,  $NR^{32}R^{33}$ ,  $CONR^{32}R^{33}$  і/або  $OH$ )),  $C_{4-7}$ циклоалкіл (необов'язково заміщений одним або декількома  $C_{1-4}$  алкілами), феніл (необов'язково заміщений  $(X)_n$ ,  $C_{1-4}$ алканойлокси,  $NR^{32}R^{33}$ ,  $CONR^{32}R^{33}$  і/або  $OH$ ) або природний амінокислотний замісник,  $R^{35}$  являє собою  $C_{4-7}$ циклоалкіл, необов'язково заміщений одним або декількома  $C_{1-4}$ алкілом, фенілом (необов'язково заміщеним одним або декількома  $(X)_n$ ,  $C_{1-4}$ алканойлом,  $NHR^{32}$ ,  $CON(R^{32})_2$  і/або  $OH$ ),  $C_{1-6}$ алкілом (необов'язково заміщеним  $C_{4-7}$ циклоалкілом, необов'язково заміщеним одним або декількома  $C_{1-4}$ алкілом або фенілом (необов'язково заміщеним одним або декількома  $(X)_n$ ,  $C_{1-4}$  алканойлом,  $NHR^{32}$ ,  $CON(R^{32})_2$  і/або  $OH$ )),  $C_{1-4}$ алкоксі( $C_{1-4}$ алкілом), феніл( $C_{1-4}$ алкілокси( $C_{1-4}$ алкілом, тетрагідропіранілом, тетрагідрофуранілом, цинамілом або триметилсилілом,  $R^{35a, b, c}$ , кожен незалежно, являють собою  $H$ ,  $C_{4-7}$  циклоалкіл, необов'язково заміщений одним або декількома  $C_{1-4}$ алкілом, фенілом, необов'язково заміщеним одним або декількома  $(X)_n$  або  $C_{1-6}$ алкілом (необов'язково заміщеним  $C_{4-7}$ циклоалкілом, необов'язково заміщеним одним або декількома  $C_{1-4}$ алкілом або фенілом, необов'язково заміщеним одним або декількома  $(X)_n$ ),  $R^{36}$  і  $R^{37}$ , кожен незалежно, являють собою  $H$ ,  $C_{3-6}$ алкілалкеніл,  $C_{4-7}$ циклоалкіл, феніл, необов'язково заміщений одним або декількома  $(X)_n$  або  $C_{1-6}$ алкілом (необов'язково заміщеним  $C_{4-7}$ циклоалкілом, необов'язково заміщеним одним або декількома  $C_{1-4}$ алкілом або фенілом, необов'язково заміщеним одним або декількома  $(X)_n$ ),  $R^{38}$  являє собою  $C_{4-7}$ циклоалкіл, необов'язково заміщений одним або декількома  $C_{1-4}$ алкілом, фенілом, необов'язково заміщеним одним або декількома  $(X)_n$  або  $C_{1-6}$ алкілом (необов'язково заміщеним  $C_{4-7}$ циклоалкілом, необов'язково заміщеним одним або декількома  $C_{1-4}$ алкілом або фенілом, необов'язково заміщеним одним або декількома  $(X)_n$ ),  $R^2$ , узятий окремо, являє собою  $H$  або галоген; або  $R^1$  і  $R^2$ , приєднані до сусідніх атомів вуглецю, можуть разом з атомами вуглецю, до яких приєднані, представляти  $Net^{1a}$ ;  $Net^{1a}$  являє собою гетероциклічну групу, що містить до 4 гетероатомів, вибраних з  $N$ ,  $O$  і  $S$ , що може включати до 3 кілець (і переважно являє собою бензо-конденсоване 5-7-членне гетероциклічне кільце), і зазначена група є необов'язково заміщеною одним або декількома замісниками, незалежно вибраними з  $OH$ ,  $=O$ , галогену,  $C_{1-4}$ алкілу,  $C_{1-4}$ галогеналкілу,  $C_{1-4}$ алкокси- і  $C_{1-4}$ галогеналкоксигрупи, зазначені  $C_{1-4}$ алкіл,  $C_{1-4}$ галогеналкіл,  $C_{1-4}$ алкокси- і  $C_{1-4}$ галогеналкоксигрупа можуть бути необов'язково заміщені одним або декількома  $C_{3-6}$ циклоалкілом, арил( $C_{1-6}$ )алкілом, і арильна група є необов'язково заміщеною одним або декількома галогеном,  $C_{1-4}$ алкілом,  $C_{1-4}$ галогеналкілом,  $C_{1-4}$ алкокси- і  $C_{1-4}$ галогеналкоксигрупою; і останні  $C_{1-4}$ алкіл,  $C_{1-4}$ галогеналкіл,  $C_{1-4}$ алкокси- і  $C_{1-4}$ галогеналкоксигрупа можуть бути необов'язково заміщені одним або декількома  $NR^{23}R^{24}$ ,  $NR^{23}S(O)_n^{24}$ ,  $NR^{23}C(O)_m^{24}$ , і якщо в кільці присутній атом  $S$ , він може бути представлений як частина групи  $-S-$ ,  $S(O)-$  або  $-S(O_2)-$ , і  $R^{23}$  і  $R^{24}$ , кожний окремо, незалежно являють собою  $H$ ,  $C_{1-4}$ алкіл або  $C_{1-4}$ галогеналкіл; або  $R^{23}$  і  $R^{24}$  разом з атомом  $N$ , до якого вони приєднані, можуть утворювати 4-6-членне гетероциклічне кільце, що необов'язково включає один або декілька додаткових гетероатомів, вибраних з  $N$ ,  $O$  або  $S$ , і зазначене гетероциклічне кільце є необов'язково заміщеним одним або декількома галогеном,  $C_{1-4}$ алкілом,  $C_{1-4}$ галогеналкілом,  $C_{1-4}$ алкокси- і/або  $C_{1-4}$ галогеналкоксигрупами;  $R^3$  являє собою  $H$ ,  $CN$ , галоген,  $C_{1-6}$ алкоксигрупу,  $C_{1-6}$ алкоксикарбоніл,  $C_{2-6}$ алканойл,  $C_{2-6}$ алканойлоксигрупу,  $C_{3-8}$ циклоалкіл,  $C_{3-8}$ циклоалкілокси,  $C_{4-9}$ циклоалканойл, арил, арилокси, гетероарил, насичений гетероцикл,  $NR^{12}R^{13}$ ,  $CONR^{12}R^{13}$ ,  $NY^2WY^1$ ,  $C_{1-6}$ алкіл,  $C_{2-10}$ алкеніл,  $C_{2-10}$ алкініл (кожна з зазначених алкільної, алкенільної і алкінільної груп є необов'язково заміщеною одним або декількома  $CN$ , галогеном,  $OH$ ,  $C_{1-6}$ алкоксигрупою,  $C_{1-6}$ алкоксикарбонілом,  $C_{2-6}$ алкілоксикарбонілоксигрупою,  $C_{1-6}$ алканойлом,  $C_{1-6}$ алканойлоксигрупою,  $C_{3-8}$ циклоалкілом,  $C_{3-8}$ циклоалкілоксигрупою,  $C_{4-9}$ циклоалканойлом, арилом, арилоксигрупою, гетероарилом, насиченим гетероциклом,  $NR^{12}R^{13}$ ,  $CONR^{12}R^{13}$  і/або  $NY^2WY^1$ ),  $R^4$  являє собою  $C_{1-10}$ алкіл,  $C_{3-10}$ алкеніл або  $C_{3-10}$ алкініл, і кожна з цих груп приєднана до атома  $N$  через  $sp^3$  - вуглець і заміщена одним або декількома замісниками, вибраними з наступних груп:  $C_{1-6}$ алкоксигрупа [заміщена однією або декількома групами, вибраними з  $OH$ ,  $NR^{25}R^{26}$ ,  $CONR^{25}R^{26}$ , галогену,  $C_{1-6}$ алкоксигрупи,  $C_{2-4}$ алкінілу,  $C_{2-4}$ алкенілу, гетероарилу<sup>1</sup>, арилу<sup>1</sup>,  $COCH_2CN$ ,  $C$ (гетероарилу<sup>1</sup>),  $CO$ (арилу<sup>1</sup>),  $CO_2$ (гетероарилу<sup>1</sup>),  $COCH_2$ (арилу<sup>1</sup>),  $COCH_2$ (гетероарилу<sup>1</sup>),  $CO_2CH_2$ (арилу<sup>1</sup>),  $CO_2CH_2$ (гетероарилу<sup>1</sup>),  $S(O)_n$ ( $C_{1-6}$ алкілу),  $S(O)_n$ (арилу<sup>1</sup>),  $S(O)_n$ (гетероарилу<sup>1</sup>),  $SO_2NR^{25}R^{26}$ , циклоалкільної групи, яка являє собою  $C_{3-10}$ карбоциклічну систему з одним або двома кільцями і циклоалкілу<sup>1</sup>],  $S(O)_n$  $C_{1-6}$ алкіл [необов'язково заміщений однією або декількома групами, вибраними з  $OH$ ,  $NR^{25}R^{26}$ ,  $CONR^{25}R^{26}$ , галогену,  $C_{1-6}$ алкоксигрупи,  $C_{2-4}$ алкінілу,  $C_{2-4}$ алкенілу, гетероарилу<sup>1</sup>, арилу<sup>1</sup>,  $COCH_2CN$ ,  $CO$ (гетероарилу<sup>1</sup>),

$\text{CO}(\text{арилу}^1)$ ,  $\text{CO}_2(\text{гетероарилу}^1)$ ,  $\text{COCH}_2(\text{арилу}^1)$ ,  $\text{COCH}_2(\text{гетероарилу}^1)$ ,  $\text{CO}_2\text{CH}_2(\text{арилу}^1)$ ,  $\text{CO}_2\text{CH}_2(\text{гетероарилу}^1)$ ,  
 $\text{S}(\text{O})_n(\text{C}_{1-6}\text{алкілу})$ ,  $\text{S}(\text{O})_n(\text{арилу}^1)$ ,  $\text{S}(\text{O})_n(\text{гетероарилу}^1)$ ,  $\text{SO}_2\text{NR}^{25}\text{R}^{26}$  і  $\text{циклоалкілу}^1$ ,  
 $\text{арил}^1$ ,  
 $\text{CO}_2\text{CH}_2(\text{гетероарил}^1)$ ,  
 $\text{CO}_2\text{CH}_2(\text{арил}^1)$ ,  
 $\text{циклоалкіл}^1$ ,  
 $\text{циклоалкільна група, яка являє собою C}_{3-10}\text{карбоциклічну систему з одним або двома кільцями,}$   
 $\text{CO}(\text{гетероарил}^1)$ ,  
 $\text{CO}(\text{арил}^1)$ ,  
 $\text{OCO}(\text{арил}^1)$ ,  
 $\text{OCO}(\text{гетероарил}^1)$ ,  
 $\text{OCO}(\text{C}_{1-6}\text{ алкіл})$ ,  
 $\text{OCOCH}_2\text{CN}$ ,  
 $\text{CO}_2(\text{гетероарил}^1)$ ,  
 $\text{CO}_2(\text{арил}^1)$ ,  
 $\text{COCH}_2(\text{гетероарил}^1)$ ,  
 $\text{S}(\text{O})_n\text{арил}^1$ ,  
 $\text{S}(\text{O})_n\text{CH}_2\text{арил}^1$ ,  
 $\text{S}(\text{O})_n(\text{гетероарил}^1)$ ,  
 $\text{S}(\text{O})_n\text{CH}_2(\text{гетероарил}^1)$ ,  
 $\text{NHSO}_2\text{арил}^1$ ,  
 $\text{NHSO}_2(\text{гетероарил}^1)$ ,  
 $\text{NHSO}_2\text{CH}_2(\text{гетероарил}^1)$ ,  
 $\text{NHSO}_2\text{CH}_2(\text{арил}^1)$ ,  
 $\text{NHCOарил}^1$ ,  
 $\text{NHCONарил}^1$ ,  
 $\text{NHCOгетероарил}^1$ ,  
 $\text{NHCONгетероарил}^1$ ,  
 $\text{NHCO}_2(\text{арил}^1)$ ,  
 $\text{NHCO}_2(\text{гетероарил}^1)$ ,  
 $\text{арил}^2\text{окси,}$   
 $\text{гетероарил}^1\text{окси,}$   
 $\text{C}_{1-6}\text{алкоксикарбоніл, заміщений C}_{1-6}\text{алкілом, арилом, C}_{1-6}\text{алкоксигрупою, CH}_2(\text{арилом}^1), \text{C}_{1-4}\text{галогеналкілом,}$   
 $\text{галогеном, OH, CN або NR}^{25}\text{R}^{26}$ ,  
 $\text{C}_{2-6}\text{алканойл, заміщений C}_{1-6}\text{алкілом, арилом, C}_{1-6}\text{алкоксигрупою, CH}_2(\text{арилом}^1), \text{C}_{1-4}\text{галогеналкілом, галогеном,}$   
 $\text{OH, CN або NR}^{25}\text{R}^{26}$ ,  
 $\text{C}_{2-6}\text{алканойлокси-, заміщений C}_{1-6}\text{алкілом, арилом, C}_{1-6}\text{алкоксигрупою, CH}_2(\text{арилом}^1), \text{C}_{1-4}\text{галогеналкілом,}$   
 $\text{галогеном, OH, CN або NR}^{25}\text{R}^{26}$ ,  
 $\text{циклоалкіл}^1\text{окси,}$   
 $\text{Социклоалкіл}^1$ ,  
 $\text{гетероцикл, заміщений одним або декількома замісниками, вибраними з C}_{1-6}\text{алкілу (заміщеного OH), CONR}^{25}\text{R}^{26},$   
 $\text{CH}_2\text{CONR}^{25}\text{R}^{26}, \text{NR}^{25}\text{R}^{26}, \text{NHCONR}^{25}\text{R}^{26}, \text{CO}(\text{C}_{1-6}\text{алкілу}), \text{SO}_2\text{NR}^{25}\text{R}^{26}, \text{SO}_2(\text{C}_{1-6}\text{алкілу}), \text{CO}_2(\text{C}_{1-6}\text{алкілу}), \text{CH}_2\text{CO}_2(\text{C}_{1-6}\text{алкілу}),$   
 $\text{OCH}_2\text{CO}_2(\text{C}_{1-6}\text{алкілу}), \text{арилу, гетероциклілу, арилоксигрупи, арил(CH}_2\text{) оксигрупи, арил(CH}_2\text{)-, CN і C}_{3-7}\text{циклоалкілу,}$   
 $\text{гетероциклілоксигрупа, заміщена одним або декількома замісниками, вибраними з C}_{1-6}\text{алкілу (заміщеного OH),}$   
 $\text{CONR}^{25}\text{R}^{26}, \text{CH}_2\text{CONR}^{25}\text{R}^{26}, \text{NR}^{25}\text{R}^{26}, \text{NHCONR}^{25}\text{R}^{26}, \text{CO}(\text{C}_{1-6}\text{алкілу}), \text{SO}_2\text{NR}^{25}\text{R}^{26}, \text{SO}_2(\text{C}_{1-6}\text{алкілу}), \text{CO}_2(\text{C}_{1-6}\text{алкілу}),$   
 $\text{CH}_2\text{CO}_2(\text{C}_{1-6}\text{ алкілу}), \text{OCH}_2\text{CO}_2(\text{C}_{1-6}\text{алкілу}), \text{арилу, гетероциклілу, арилоксигрупи, арил(CH}_2\text{) оксигрупи, арил(CH}_2\text{)-,}$   
 $\text{CN і C}_{3-7}\text{циклоалкілу,}$   
 $\text{де арил}^1\text{ являє собою феніл, необов'язково конденсований з C}_{5-7}\text{карбоциклічним кільцем, і зазначена група є}$   
 $\text{необов'язково заміщеною одним або декількома замісниками, вибраними з C}_{1-6}\text{алкілу (необов'язково заміщеного}$   
 $\text{OH, CN або галогеном), C}_{1-6}\text{галогеналкоксигрупи, OH, =O, NY}^2\text{WY}^1, \text{галогену, C}_{1-6}\text{алкоксигрупи, CONR}^{25}\text{R}^{26},$   
 $\text{CH}_2\text{CONR}^{25}\text{R}^{26}, \text{NR}^{25}\text{R}^{26}, \text{NHCONR}^{25}\text{R}^{26}, \text{CO}(\text{C}_{1-6}\text{алкілу}), \text{CO-арилу, CO-гетероарилу, SO}_2\text{NR}^{25}\text{R}^{26}, \text{S}(\text{O})_n(\text{C}_{1-6}\text{алкілу}),$   
 $\text{S}(\text{O})_n(\text{арилу}), \text{S}(\text{O})_n(\text{гетероарилу}), \text{CO}_2(\text{C}_{1-6}\text{алкілу}), \text{CO}_2(\text{арилу}), \text{CO}_2(\text{гетероарилу}), \text{CO}_2\text{H, (CH}_2\text{)}_{1-4}\text{CO}_2(\text{C}_{1-6}\text{алкілу}),$   
 $\text{(CH}_2\text{)}_{1-4}\text{CO}_2\text{H, (CH}_2\text{)}_{1-4}\text{CO}_2(\text{арилу}), \text{(CH}_2\text{)}_{1-4}\text{CO}_2(\text{гетероарилу}), \text{O(CH}_2\text{)}_{1-4}\text{CO}_2(\text{C}_{1-6}\text{алкілу}), \text{O(CH}_2\text{)}_{1-4}\text{CO}_2\text{H,}$   
 $\text{O(CH}_2\text{)}_{1-4}\text{CO}_2(\text{арилу}), \text{O(CH}_2\text{)}_{1-4}\text{CO}_2(\text{гетероарилу}), \text{арилу, гетероциклілу, арилоксигрупи, арил(CH}_2\text{)оксигрупи,}$   
 $\text{арил(CH}_2\text{), CN, O(CH}_2\text{)}_{1-4}\text{CONR}^{25}\text{R}^{26} \text{ і C}_{3-7}\text{циклоалкілу,}$   
 $\text{арил}^2\text{ являє собою феніл, необов'язково конденсований з C}_{5-7}\text{карбоциклічним кільцем, зазначена група є}$   
 $\text{необов'язково заміщеною одним або декількома замісниками, вибраними з C}_{1-6}\text{алкілу (заміщеного OH),}$   
 $\text{CONR}^{25}\text{R}^{26}, \text{CH}_2\text{CONR}^{25}\text{R}^{26}, \text{NR}^{25}\text{R}^{26}, \text{NHCONR}^{25}\text{R}^{26}, \text{CO}(\text{C}_{1-6}\text{алкілу}), \text{CO-арилу, CO-гетероарилу, SO}_2\text{NR}^{25}\text{R}^{26},$   
 $\text{S}(\text{O})_n(\text{C}_{1-6}\text{алкілу}), \text{S}(\text{O})_n(\text{арилу}), \text{S}(\text{O})_n(\text{гетероарилу}), \text{CO}_2(\text{C}_{1-6}\text{алкілу}), \text{CO}_2(\text{арилу}), \text{CO}_2(\text{гетероарилу}), \text{CO}_2\text{H, (CH}_2\text{)}_{1-4}\text{CO}_2(\text{C}_{1-6}\text{алкілу}),$   
 $\text{(CH}_2\text{)}_{1-4}\text{CO}_2\text{H, (CH}_2\text{)}_{1-4}\text{CO}_2(\text{арилу}), \text{(CH}_2\text{)}_{1-4}\text{CO}_2(\text{гетероарилу}), \text{O(CH}_2\text{)}_{1-4}\text{CO}_2(\text{C}_{1-6}\text{алкілу}), \text{O(CH}_2\text{)}_{1-4}\text{CO}_2\text{H,}$   
 $\text{O(CH}_2\text{)}_{1-4}\text{CO}_2(\text{арилу}), \text{O(CH}_2\text{)}_{1-4}\text{CO}_2(\text{гетероарилу}), \text{арилу, гетероциклілу, арилоксигрупи, арил(CH}_2\text{)оксигрупи, арил(CH}_2\text{),}$   
 $\text{CN, O(CH}_2\text{)}_{1-4}\text{CONR}^{25}\text{R}^{26} \text{ і C}_{3-7}\text{циклоалкілу,}$   
 $\text{гетероарил}^1\text{ являє собою гетероарил, необов'язково конденсований з C}_{5-7}\text{карбоциклічним кільцем, зазначена}$   
 $\text{група є необов'язково заміщеною одним або декількома замісниками, вибраними з C}_{1-6}\text{алкілу (необов'язково}$   
 $\text{заміщеного OH, CN або галогеном), C}_{1-6}\text{галогеналкоксигрупи, OH, =O, NY}^2\text{WY}^1, \text{галогену, C}_{1-6}\text{алкоксигрупи,}$   
 $\text{CONR}^{25}\text{R}^{26}, \text{CH}_2\text{CONR}^{25}\text{R}^{26}, \text{NR}^{25}\text{R}^{26}, \text{NHCONR}^{25}\text{R}^{26}, \text{CO}(\text{C}_{1-6}\text{алкілу}), \text{CO-арилу, CO-гетероарилу, SO}_2\text{NR}^{25}\text{R}^{26},$   
 $\text{S}(\text{O})_n(\text{C}_{1-6}\text{алкілу}), \text{S}(\text{O})_n(\text{арилу}), \text{S}(\text{O})_n(\text{гетероарилу}), \text{CO}_2(\text{C}_{1-6}\text{алкілу}), \text{CO}_2(\text{арилу}), \text{CO}_2(\text{гетероарилу}), \text{CO}_2\text{H, (CH}_2\text{)}_{1-4}\text{CO}_2(\text{C}_{1-6}\text{алкілу}),$   
 $\text{(CH}_2\text{)}_{1-4}\text{CO}_2\text{H, (CH}_2\text{)}_{1-4}\text{CO}_2(\text{арилу}), \text{(CH}_2\text{)}_{1-4}\text{CO}_2(\text{гетероарилу}), \text{O(CH}_2\text{)}_{1-4}\text{CO}_2(\text{C}_{1-6}\text{алкілу}), \text{O(CH}_2\text{)}_{1-4}\text{CO}_2\text{H,}$   
 $\text{O(CH}_2\text{)}_{1-4}\text{CO}_2(\text{арилу}), \text{O(CH}_2\text{)}_{1-4}\text{CO}_2(\text{гетероарилу}), \text{арилу, гетероциклілу, арилоксигрупи, арил(CH}_2\text{)оксигрупи, арил(CH}_2\text{),}$   
 $\text{CN, O(CH}_2\text{)}_{1-4}\text{CONR}^{25}\text{R}^{26} \text{ і C}_{3-7}\text{циклоалкілу,}$

циклоалкіл<sup>1</sup> являє собою C<sub>3-10</sub>карбоциклічну систему з одним або трьома кільцями, що заміщена C<sub>1-6</sub>алкілом, арилом, C<sub>1-6</sub>алкоксигрупою, CH<sub>2</sub>(арилом<sup>1</sup>), C<sub>1-4</sub>галогеналкілом, галогеном, OH, CN або NR<sup>25</sup>R<sup>26</sup>, за умови, що відсутні N-R<sup>4</sup>-групи, в яких гетероатом з'єднаний з іншим гетероатомом С через один sp<sup>3</sup>-вуглець R<sup>12</sup> і R<sup>13</sup> кожен незалежно, являють собою Н або C<sub>1-4</sub>алкіл, або R<sup>12</sup> і R<sup>13</sup> разом з атомом N, до якого приєднані, можуть утворювати 4-7-членний гетероцикл, що необов'язково включає додаткову гетерогрупу, вибрану з NR<sup>16</sup>, O і/або S, і зазначений гетероцикл необов'язково заміщений одним або декількома C<sub>1-4</sub>алкілами, R<sup>5</sup> і R<sup>8</sup>, коли розглядаються окремо, кожен незалежно, являють собою Н, C<sub>1-6</sub>алкіл, R<sup>5</sup> і R<sup>8</sup> разом з атомами вуглецю, до яких вони приєднані, можуть утворювати C<sub>3-8</sub>циклоалкільне кільце, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>9</sup> і R<sup>10</sup>, коли розглядаються окремо, являють собою Н, R<sup>5</sup> і R<sup>6</sup> або R<sup>7</sup> разом з атомами вуглецю, до яких вони приєднані, можуть утворювати C<sub>3-8</sub>циклоалкільне кільце, Х являє собою галоген, C<sub>1-4</sub>алкіл, C<sub>1-4</sub>алкоксигрупу, C<sub>1-4</sub>галогеналкіл або C<sub>1-4</sub>галогеналкоксигрупу, m дорівнює 1 або 2; n дорівнює 0, 1 або 2; q дорівнює 0 або 1;

термін "природний амінокислотний замісник" означає α-замісник, що зустрічається в кожній з наступних природних амінокислот: гліцин, аланін, валін, лейцин, ізолейцин, фенілаланін, триптофан, тирозин, гістидин, серин, треонін, метіонін, цистеїн, аспарагінова кислота, глутамінова кислота, аспарагін, глутамін, лізин, аргінін або пролін;

термін «гетероарил» означає ароматичне кільце, що містить до чотирьох гетероатомів, незалежно вибраних з N, O і S, і, якщо атом S є присутнім у кільці, він може бути представлений як частина груп -S-, S(O)- або -S(O)<sub>2</sub>-, зазначена група може з'єднуватися з залишком сполуки через будь-який(і) доступний(і) атом(и);

термін «гетероцикл» означає групу з 1, 2 або 3 кілець, що містить до 4 кільцевих гетероатомів, вибраних з N, O і S, і до 18 кільцевих атомів вуглецю;

термін «арил», що входить у визначення «арилокси» і т.д., означає групу, що включає фенільне кільце, може містити додаткове карбоциклічне кільце, конденсоване з зазначеним фенільним кільцем, і може з'єднуватися з залишком сполуки через будь-який(і) доступний(і) атом(и) (прикладами таких груп є нафтил, інданіл і т.д.);

«алкільна», «алкенільна» і «алкінільна» групи можуть бути лінійними або, якщо кількість атомів вуглецю дозволяє, розгалуженими групами;

«циклоалкільні» групи можуть бути поліциклічними, якщо кількість атомів вуглецю дозволяє;

або її фармацевтично прийнятна сіль;

за умови, що один або декілька замісників групи R<sup>4</sup> включає щонайменше одну групу, яка не є ні однією із наступних груп:

(i) C<sub>2-6</sub>алкокси (заміщений єдиним замісником, який являє собою незаміщену арильну<sup>1</sup> групу);

(ii) арил<sup>2</sup>окси, арил<sup>2</sup>, гетероарилокси, гетероцикл (кожний з яких заміщений одним або декількома замісниками, які являють собою NHCONR<sup>25</sup>R<sup>26</sup>, де R<sup>25</sup> R<sup>26</sup> незалежно являють собою Н або C<sub>1-3</sub>алкіл, або R<sup>25</sup> та R<sup>26</sup>, разом з N-атомом, до якого вони приєднані, являють собою 4-7-членне гетероциклічне кільце);

(iii) CO(гетероцикл<sup>1</sup>), COCH<sub>2</sub>(гетероарил<sup>1</sup>), S(O)<sub>n</sub>(гетероарил<sup>1</sup>), S(O)<sub>n</sub>CH<sub>2</sub>(гетероарил<sup>1</sup>), (в кожному з яких гетероарил<sup>1</sup> являє собою 4-7-членне гетероциклічне кільце, яке містить N-атом (за допомогою якого приєднана гетероарильна<sup>1</sup> група), і яке необов'язково містить ще гетерогрупу, вибрану з NH, N(C<sub>1-6</sub>алкілу), NH(C<sub>3-7</sub>циклоалкілу), O або S, де гетероцикл необов'язково заміщений однією або декількома C<sub>1-4</sub>алкільними групами);

(iv) гетероарил<sup>1</sup>окси, де гетероарил<sup>1</sup> незаміщений або заміщений одним або декількома замісниками, які являють собою C<sub>1-6</sub>алкіл (необов'язково заміщений одним або декількома замісниками, які являють собою CN і/або галоген, C<sub>1-4</sub>алкокси, C<sub>1-4</sub>галогеналкокси, OH, =O, NY<sup>2</sup>WY<sup>1</sup> і/або NHCONR<sup>25</sup>R<sup>26</sup> (де R<sup>25</sup> та R<sup>26</sup> незалежно являють собою Н або C<sub>1-3</sub>алкіл або R<sup>25</sup> та R<sup>26</sup>, разом з N-атомом, до якого вони приєднані, являють собою 4-7-членне гетероциклічне кільце);

(v) NHS(O)<sub>2</sub>(арил<sup>1</sup>), NHCO(арил<sup>1</sup>), NHCO<sub>2</sub>(арил<sup>1</sup>) (в кожному з яких арил<sup>1</sup> незаміщений або заміщений одним або декількома замісниками, які являють собою C<sub>1-4</sub>алкіл, C<sub>1-4</sub>галогеналкіл і/або галоген);

(vi) NHS(O)<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>(арил<sup>1</sup>), в якому арил є незаміщеним;

(vii) NHCO(гетероарил<sup>1</sup>), NHCO<sub>2</sub>, NHS(O)<sub>2</sub>(гетероарил<sup>1</sup>), NHS(O)<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>(гетероарил<sup>1</sup>), (в кожному з яких гетероарил незаміщений або заміщений одним або декількома замісниками, які являють собою C<sub>1-6</sub>алкіл, C<sub>1-6</sub>галогеналкіл, C<sub>1-6</sub>алкокси, C<sub>3-6</sub>циклоалкіл, C<sub>1-6</sub>галогеналкокси, =O, OH, галоген, S(арил), S(C<sub>1-6</sub>алкіл), CONR<sup>25</sup>R<sup>26</sup> і/або NR<sup>25</sup>R<sup>26</sup> (в обох останніх групах групи R<sup>25</sup> та R<sup>26</sup>, кожна незалежно, являють собою Н, C<sub>1-3</sub>алкіл, арил, C<sub>1-4</sub>алкілфеніл (де кожна з груп C<sub>1-3</sub>алкіл, арил, C<sub>1-4</sub>алкілфеніл незалежно заміщена одним або декількома замісниками, які являють собою NO<sub>2</sub>, галоген, C<sub>1-4</sub>алкіл і C<sub>1-4</sub>алкокси), або R<sup>25</sup> та R<sup>26</sup>, разом з N-атомом, до якого вони приєднані, являють собою 4-6-членне гетероциклічне кільце, яке необов'язково заміщене одним або декількома C<sub>1-4</sub>алкілом, OH, =O, NO<sub>2</sub>, NH<sub>2</sub> і/або галогеном).

2. Сполука за п. 1, де кільце «Ar» являє собою феніл або піридил.

3. Сполука за будь-яким попереднім пунктом, де R<sup>1</sup>, узятий окремо, являє собою OH, CN, галоген, NO<sub>2</sub>, NH<sub>2</sub>, NY<sup>2</sup>WY<sup>x</sup> або Het<sup>1</sup>.

4. Сполука за будь-яким попереднім пунктом, де R<sup>2</sup>, узятий окремо, являє собою Н.

5. Сполука за п. 1 або 2, де R<sup>1</sup> і R<sup>2</sup> разом з атомами вуглецю, до яких вони приєднані, утворюють необов'язково конденсоване 5-7-членне гетероарильне кільце, необов'язково заміщене C<sub>1-4</sub> або C<sub>1-4</sub>галогеналкілом.

6. Сполука за будь-яким попереднім пунктом, де Х являє собою Cl.

7. Сполука за будь-яким попереднім пунктом, де n дорівнює 0 і q дорівнює 0.

8. Сполука за будь-яким попереднім пунктом, де R<sup>3</sup> являє собою Н, CN або C<sub>1-6</sub>алкіл (необов'язково заміщений одним або декількома галогеном, OH, C<sub>1-6</sub>алкоксигрупою, C<sub>1-6</sub>алкоксикарбонілом, C<sub>2-6</sub>алканойлом, C<sub>2-6</sub>алканойлоксигрупою, C<sub>2-6</sub>алкілоксикарбонілоксигрупою, NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>, CONR<sup>12</sup>R<sup>13</sup> і/або NY<sup>2</sup>WY<sup>1</sup>).

9. Сполука за будь-яким попереднім пунктом, де R<sup>4</sup> являє собою C<sub>1-10</sub>алкіл, заміщений одним або декількома замісниками, вибраними з наступних груп:

C<sub>1-6</sub>алкоксигрупа [заміщена однією або декількома групами, вибраними з OH, NR<sup>25</sup>R<sup>26</sup>, CONR<sup>25</sup>R<sup>26</sup>, галогену, C<sub>1-6</sub>алкоксигрупи, C<sub>2-4</sub>алкінілу, C<sub>2-4</sub>алкенілу, гетероарилу<sup>1</sup>, арилу<sup>1</sup>, COCH<sub>2</sub>CN, CO(гетероарилу<sup>1</sup>), CO(арилу<sup>1</sup>), CO<sub>2</sub>(гетероарилу<sup>1</sup>), COCH<sub>2</sub>(арилу<sup>1</sup>), COCH<sub>2</sub>(гетероарилу<sup>1</sup>), CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>(арилу<sup>1</sup>), CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>(гетероарилу<sup>1</sup>), S(O)<sub>n</sub>(C<sub>1-6</sub>алкілу), S(O)<sub>n</sub>(арилу<sup>1</sup>), S(O)<sub>n</sub>(гетероарилу<sup>1</sup>), SO<sub>2</sub>NR<sup>25</sup>R<sup>26</sup> і циклоалкілу<sup>1</sup>],  
S(O)<sub>n</sub>C<sub>1-6</sub>алкіл [необов'язково заміщений однією або декількома групами, вибраними з OH, NR<sup>25</sup>R<sup>26</sup>, CONR<sup>25</sup>R<sup>26</sup>, галогену, C<sub>1-6</sub>алкоксигрупи, C<sub>2-4</sub>алкінілу, C<sub>2-4</sub>алкенілу, гетероарилу<sup>1</sup>, арилу<sup>1</sup>, COCH<sub>2</sub>CN, CO(гетероарилу<sup>1</sup>), CO(арилу<sup>1</sup>), CO<sub>2</sub>(гетероарилу<sup>1</sup>), COCH<sub>2</sub>(арилу<sup>1</sup>), COCH<sub>2</sub>(гетероарилу<sup>1</sup>), CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>(арилу<sup>1</sup>), CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>(гетероарилу<sup>1</sup>), S(O)<sub>n</sub>(C<sub>1-6</sub>алкілу), S(O)<sub>n</sub>(арилу<sup>1</sup>), S(O)<sub>n</sub>(гетероарилу<sup>1</sup>), SO<sub>2</sub>NR<sup>25</sup>R<sup>26</sup> і циклоалкілу<sup>1</sup>],  
арил<sup>2</sup>,

CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>(гетероарил<sup>1</sup>),  
CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>(арил<sup>1</sup>),  
циклоалкіл<sup>1</sup>,  
CO(гетероарил<sup>1</sup>),  
CO(арил<sup>1</sup>),  
OSO(арил<sup>1</sup>),  
OSO(гетероарил<sup>1</sup>),  
OSO(C<sub>1-6</sub>алкіл),  
OSCOCH<sub>2</sub>CN,  
CO<sub>2</sub>(гетероарил<sup>1</sup>),  
CO<sub>2</sub>(арил<sup>1</sup>),  
COCH<sub>2</sub>(гетероарил<sup>1</sup>),  
S(O)<sub>n</sub>арил<sup>1</sup>,  
S(O)<sub>n</sub>CH<sub>2</sub>арил<sup>1</sup>,  
S(O)<sub>n</sub>(гетероарил<sup>1</sup>),  
S(O)<sub>n</sub>CH<sub>2</sub>(гетероарил<sup>1</sup>),  
NHSO<sub>2</sub>арил<sup>1</sup>,  
NHSO<sub>2</sub>(гетероарил<sup>1</sup>),  
NHSO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>(гетероарил<sup>1</sup>),  
NHSO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>(арил<sup>1</sup>),  
NHCOарил<sup>1</sup>,  
NHCONарил<sup>1</sup>,  
NHCOгетероарил<sup>1</sup>,  
NHCONгетероарил<sup>1</sup>,  
NHCO<sub>2</sub>(арил<sup>1</sup>),  
NHCO<sub>2</sub>(гетероарил<sup>1</sup>),  
арил<sup>2</sup>окси,  
гетероарил<sup>1</sup>окси,

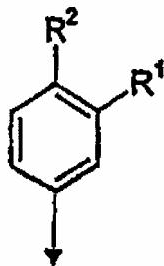
C<sub>1-6</sub>алкоксикарбоніл, заміщений C<sub>1-6</sub>алкілом, арилом, C<sub>1-6</sub>алкоксигрупою, CH<sub>2</sub>(арилом<sup>1</sup>), C<sub>1-4</sub>галогеналкілом, галогеном, OH, CN або NR<sup>25</sup>R<sup>26</sup>,  
C<sub>2-6</sub>алканол, заміщений C<sub>1-6</sub>алкілом, арилом, C<sub>1-6</sub>алкоксигрупою, CH<sub>2</sub>(арилом<sup>1</sup>), C<sub>1-4</sub>галогеналкілом, галогеном, OH, CN або NR<sup>25</sup>R<sup>26</sup>,  
C<sub>2-6</sub>алканоліокси-, заміщений C<sub>1-6</sub>алкілом, арилом, C<sub>1-6</sub>алкоксигрупою, CH<sub>2</sub>(арилом<sup>1</sup>), C<sub>1-4</sub>галогеналкілом, галогеном, OH, CN або NR<sup>25</sup>R<sup>26</sup>,  
циклоалкіл<sup>1</sup>оксигрупа,  
Социклоалкіл<sup>1</sup>,

гетероцикл, заміщений одним або декількома замісниками, вибраними з C<sub>1-6</sub>алкілу (заміщеного OH), CONR<sup>25</sup>R<sup>26</sup>, CH<sub>2</sub>CONR<sup>25</sup>R<sup>26</sup>, NR<sup>25</sup>R<sup>26</sup>, NHCONR<sup>25</sup>R<sup>26</sup>, CO(C<sub>1-6</sub>алкілу), SO<sub>2</sub>NR<sup>25</sup>R<sup>26</sup>, SO<sub>2</sub>(C<sub>1-6</sub>алкілу), CO<sub>2</sub>(C<sub>1-6</sub>алкілу), CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>(C<sub>1-6</sub>алкілу), OCH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>(C<sub>1-6</sub>алкілу), арилу, гетероциклілу, арилоксигрупи, арил(CH<sub>2</sub>)оксигрупи, арил(CH<sub>2</sub>), CN і C<sub>3-7</sub>циклоалкілу,

гетероциклілоксигрупа, заміщена одним або декількома замісниками, вибраними з C<sub>1-6</sub>алкілу (заміщеного OH), CONR<sup>25</sup>R<sup>26</sup>, CH<sub>2</sub>CONR<sup>25</sup>R<sup>26</sup>, NR<sup>25</sup>R<sup>26</sup>, NHCONR<sup>25</sup>R<sup>26</sup>, CO(C<sub>1-6</sub>алкілу), SO<sub>2</sub>NR<sup>25</sup>R<sup>26</sup>, SO<sub>2</sub>(C<sub>1-6</sub>алкілу), CO<sub>2</sub>(C<sub>1-6</sub>алкілу), CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>(C<sub>1-6</sub>алкілу), OCH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>(C<sub>1-6</sub>алкілу), арилу, гетероциклілу, арилоксигрупи, арил(CH<sub>2</sub>)оксигрупи, арил(CH<sub>2</sub>), CN і C<sub>3-7</sub>циклоалкілу.

10. Сполука за будь-яким попереднім пунктом, де R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>8</sup>, R<sup>9</sup> і R<sup>10</sup>, кожний окремо, являють собою H.

11. Сполука за будь-яким попереднім пунктом, де кільце «Ar» являє собою групу формули



12. Сполука за будь-яким попереднім пунктом, де R<sup>3</sup> являє собою H, CH<sub>3</sub>, C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, ізо-C<sub>3</sub>H<sub>7</sub>, н-C<sub>3</sub>H<sub>7</sub> або CH<sub>2</sub>OCH<sub>3</sub>.

13. Сполука за будь-яким попереднім пунктом крім п. 5, де R<sup>1</sup> являє собою OH, CN, I, Cl, NH<sub>2</sub>, NO<sub>2</sub>, гетероарил, необов'язково конденсований з бензольним кільцем, NHSO<sub>2</sub>Y<sup>1</sup>, NHCOY<sup>1</sup> або NHCO<sub>2</sub>Y<sup>1</sup>.

14. Сполука за будь-яким попереднім пунктом, де R<sup>4</sup> являє собою C<sub>1-10</sub>алкіл, заміщений циклоалкілом<sup>1</sup>.

15. Сполука за будь-яким попереднім пунктом крім пп. 3, 4 і 13, де R<sup>1</sup> і R<sup>2</sup> разом з атомами вуглецю, до яких вони приєднані, утворюють 5-членну гетероарильну групу, необов'язково заміщену C<sub>1-4</sub>алкілом або C<sub>1-4</sub>галогеналкілом.

16. Сполука за будь-яким попереднім пунктом, де  $R^3$  являє собою  $CH_3$  або  $C_2H_5$ .

17. Сполука за будь-яким попереднім пунктом крім пп. 5 і 15, де  $R^1$ , узятий окремо, являє собою  $OH$ ,  $CN$ ,  $I$ ,  $Cl$ ,  $NH_2$ ,  $NO_2$ , 1,2,3-триазоліл, 1,2,4-триазоліл, імідазол-2-іл, піридин-2-іл, тієн-2-іл, імідазол-4-іл, бензімідазол-2-іл,  $NHSO_2(C_{1-6}алкіл)$ ,  $NHSO_2(C_{1-6}алкіл)$ , заміщений метоксигрупою,  $CONH_2$ ,  $OH$ ,  $CO_2(C_{2-6}алкілом)$ , фталімідогрупою,  $NH_2$  або галогеном),  $NHSO_2NH_2$ ,  $NHSO_2NH(C_{1-6}алкіл)$ ,  $NHSO_2N(C_{1-6}алкіл)_2$ ,  $NHSO_2Het_{1a}$ ,  $NHCO(C_{1-6}алкіл)$  або  $NHCO_2(C_{1-6}алкіл)$ .

18. Сполука за п. 17, де  $R^1$  являє собою  $OH$ ,  $NHSO_2CH_3$ ,  $NHSO_2C_2H_5$ ,  $NHSO_2(n-C_3H_7)$ ,  $NHSO_2(i-C_3H_7)$ ,  $NHSO_2(n-C_4H_7)$ ,  $NHSO_2NH(ізо-C_3H_7)$ ,  $NHSO_2(N-метилімідазол-4-іл)$ ,  $NHSO_2(CH_2)_2OCH_3$ ,  $NHSO_2(CH_2)_2OH$ , 1,2,4-триазоліл або імідазол-2-іл.

19. Сполука за п. 18, де  $R^1$  являє собою  $OH$ ,  $NHSO_2CH_3$ ,  $NHSO_2C_2H_5$  або імідазол-2-іл.

20. Сполука за п. 15, де  $R^1$  і  $R^2$  разом з атомами вуглецю, до яких вони приєднані, утворюють імідазольну групу, необов'язково 2-заміщену  $CF_3$ .

21. Сполука за будь-яким попереднім пунктом, де  $R^4$  являє собою  $C_{2-4}алкіл$ , заміщений циклоалкілом<sup>1</sup>.

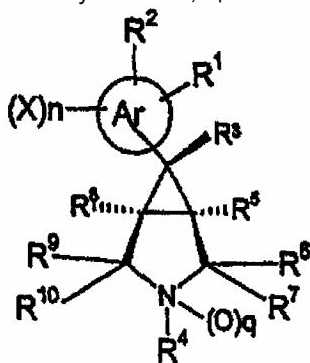
22. Сполука за будь-яким попереднім пунктом, де  $R^4$  являє собою пропіл, заміщений циклоалкілом<sup>1</sup>.

23. Сполука за будь-яким попереднім пунктом, де  $R^4$  являє собою пропіл, заміщений  $C_{3-10}$ карбоциклічною системою з одним або двома кільцями, що заміщена  $OH$ .

24. Сполука за будь-яким попереднім пунктом, де  $R^4$  являє собою пропіл, що заміщений циклогексиллом, заміщеним  $OH$ .

25. Сполука за будь-яким попереднім пунктом, де  $R^4$  являє собою (1-гідроксициклогексил)проп-3-іл.

26. Сполука за п. 1, що має наступну стереохімічну структуру:



27. Сполука за п. 1, вибрана з групи, що включає наступні сполуки:

$N$ -[3-{6-етил-3-[2-(2-гідроксietоксі)етил]-3-азабіцикло[3.1.0]гекс-6-ил}феніл]метансульфонамід,  
 $N$ -[3-{3-[2-[2-(диметиламіно)етоксі]етил]-6-етил-3-азабіцикло[3.1.0]гекс-6-ил}феніл]метансульфонамід,  
2-[2-(6-етил-6-{3-[(метилсульфоніл)аміно]феніл}-3-азабіцикло[3.1.0]гекс-3-ил)етоксі]ацетамід,  
 $N$ -[3-{6-етил-3-[2-(2-піридинілметоксі)етил]-3-азабіцикло[3.1.0]гекс-6-ил}феніл]метансульфонамід,  
 $N$ -[3-{6-етил-3-[2-(2,2,2-трифторетоксі)етил]-3-азабіцикло[3.1.0]гекс-6-ил}феніл]метансульфонамід,  
 $N$ -[3-{6-етил-3-[2-(2-пропілокси)етил]-3-азабіцикло[3.1.0]гекс-6-ил}феніл]метансульфонамід,  
 $N$ -[3-{3-[2-(алілокси)етил]-6-етил-3-азабіцикло[3.1.0]гекс-6-ил}феніл]метансульфонамід,  
 $N$ -[3-{6-етил-3-[2-(2-метоксietоксі)етил]-3-азабіцикло[3.1.0]гекс-6-ил}феніл]метансульфонамід,  
 $N$ -[3-{3-[2-(циклогексилметоксі)етил]-6-етил-3-азабіцикло[3.1.0]гекс-6-ил}феніл]метансульфонамід,  
 $N$ -[3-{3-[2-[(4-хлорбензил)оксі]етил]-6-етил-3-азабіцикло[3.1.0]гекс-6-ил}феніл]метансульфонамід,  
 $N$ -[3-{6-етил-3-[2-[(4-метоксибензил)оксі]етил]-3-азабіцикло[3.1.0]гекс-6-ил}феніл]метансульфонамід,  
2-[2-(6-етил-6-{3-[(метилсульфоніл)аміно]феніл}-3-азабіцикло[3.1.0]гекс-3-ил)етоксі]бензиламід,  
2-[4-[2-(6-етил-6-{3-[(метилсульфоніл)аміно]феніл}-3-азабіцикло[3.1.0]гекс-3-ил)етоксі]феніл]ацетамід,  
 $N$ -[3-{3-[2-(4-амінофенокси)етил]-6-етил-3-азабіцикло[3.1.0]гекс-6-ил}феніл]метансульфонамід,  
 $N$ -[3-{3-[2-(4-[(амінокарбоніл)аміно]фенокси)етил]-6-етил-3-азабіцикло[3.1.0]гекс-6-ил}феніл]метансульфонамід,  
 $N$ -[3-{3-[3-(4-ацетилфеніл)пропіл]-6-етил-3-азабіцикло[3.1.0]гекс-6-ил}феніл]метансульфонамід,  
4-[2-(6-етил-6-{3-[(метилсульфоніл)аміно]феніл}-3-азабіцикло[3.1.0]гекс-3-ил)етоксі]бензолсульфонамід,  
 $N$ -[3-{6-етил-3-[2-[4-(метилсульфоніл)фенокси]етил]-3-азабіцикло[3.1.0]гекс-6-ил}феніл]метансульфонамід,  
метил 4-[2-(6-етил-6-{3-[(метилсульфоніл)аміно]феніл}-3-азабіцикло[3.1.0]гекс-3-ил)етоксі]бензоат,  
етил {2-[2-(6-етил-6-{3-[(метилсульфоніл)аміно]феніл}-3-азабіцикло[3.1.0]гекс-3-ил)етоксі]феніл}ацетат,  
метил {4-[2-(6-етил-6-{3-[(метилсульфоніл)аміно]феніл}-3-азабіцикло[3.1.0]гекс-3-ил)етоксі]фенокси}ацетат,  
 $N$ -[3-{6-етил-3-[2-[4-(гідроксиметил)фенокси]етил]-3-азабіцикло[3.1.0]гекс-6-ил}феніл]метансульфонамід,  
 $N$ -[3-{3-[2-[(1,1'-біфеніл)-4-ілокси]етил]-6-етил-3-азабіцикло[3.1.0]гекс-6-ил}феніл]метансульфонамід,  
 $N$ -[3-{3-[2-[4-(4,5-дигідро-1,3-оксазол-2-іл)фенокси]етил]-6-етил-3-азабіцикло[3.1.0]гекс-6-ил}феніл]метансульфонамід,  
 $N$ -[3-{6-етил-3-[2-(4-феноксифенокси)етил]-3-азабіцикло[3.1.0]гекс-6-ил}феніл]метансульфонамід,  
 $N$ -[3-{3-[2-(бензілокси)бензил]-6-етил-3-азабіцикло[3.1.0]гекс-6-ил}феніл]метансульфонамід,  
 $N$ -[3-{3-[2-(4-бензилфенокси)етил]-6-етил-3-азабіцикло[3.1.0]гекс-6-ил}феніл]метансульфонамід,  
 $N$ -[3-{3-[4-ціанобензил]-6-етил-3-азабіцикло[3.1.0]гекс-6-ил}феніл]метансульфонамід,  
 $N$ -[3-{3-[2-(4-циклопропілфенокси)етил]-6-етил-3-азабіцикло[3.1.0]гекс-6-ил}феніл]метансульфонамід,  
феніл 3-(6-етил-6-{3-[(метилсульфоніл)аміно]феніл}-3-азабіцикло[3.1.0]гекс-3-ил)пропаноат,  
бензил 4-(6-етил-6-{3-[(метилсульфоніл)аміно]феніл}-3-азабіцикло[3.1.0]гекс-3-ил)бутаноат,  
 $N$ -[3-{6-етил-3-(3-оксо-3-фенілпропіл)-3-азабіцикло[3.1.0]гекс-6-ил}феніл]метансульфонамід,  
 $N$ -[3-{3-[3-(2,3-дигідро-1Н-інден-5-іл)-3-оксопропіл]-6-етил-3-азабіцикло[3.1.0]гекс-6-ил}феніл]метансульфонамід,  
2-(6-етил-6-{3-[(метилсульфоніл)аміно]феніл}-3-азабіцикло[3.1.0]гекс-3-ил)етилбензоат,  
2-(6-етил-6-{3-[(метилсульфоніл)аміно]феніл}-3-азабіцикло[3.1.0]гекс-3-ил)етилціаноацетат,

2-(6-етил-6-{3-[(метилсульфоніл)аміно]феніл}-3-азабіцикло[3.1.0]гекс-3-ил)етил-1,5-диметил-3-оксо-2-феніл-2,3-дигідро-1H-піразол-4-карбоксилат,  
 N-(3-{3-[(4-трет-бутилциклогексил)метил]-6-етил-3-азабіцикло[3.1.0]гекс-6-ил}феніл)метансульфонамід,  
 N-(3-{6-етил-3-[(4-метоксициклогексил)метил]-3-азабіцикло[3.1.0]гекс-6-ил}феніл)метилметансульфонамід,  
 N-(3-{3-[(2-бензилциклогексил)метил]-6-етил-3-азабіцикло[3.1.0]гекс-6-ил}феніл)метансульфонамід,  
 N-(3-{6-етил-3-(октагідро-1H-інден-2-ілметил)-3-азабіцикло[3.1.0]гекс-6-ил}феніл)метансульфонамід,  
 N-(3-{6-етил-3-[(2-фенілциклопропіл)метил]-3-азабіцикло[3.1.0]гекс-6-ил}феніл)метансульфонамід,  
 N-(3-{6-етил-3-[2-(фенілсульфоніл)етил]-3-азабіцикло[3.1.0]гекс-6-ил}феніл)метансульфонамід,  
 N-(3-{6-етил-3-[2-(етилсульфоніл)етил]-3-азабіцикло[3.1.0]гекс-6-ил}феніл)метансульфонамід,  
 N-(3-{3-[2-(бензилсульфоніл)етил]-6-етил-3-азабіцикло[3.1.0]гекс-6-ил}феніл)метансульфонамід,  
 N-[2-(6-етил-6-{3-[(метилсульфоніл)аміно]феніл}-3-азабіцикло[3.1.0]гекс-3-ил)етил]бензолсульфонамід,  
 N-[3-(6-етил-3-{2-[(метилсульфоніл)аміно]етил}-3-азабіцикло[3.1.0]гекс-6-ил}феніл)метансульфонамід,  
 N-[2-(6-етил-6-{3-[(метилсульфоніл)аміно]феніл}-3-азабіцикло[3.1.0]гекс-6-ил)етил]ацетамід,  
 N-[2-(6-етил-6-{3-[(метилсульфоніл)аміно]феніл}-3-азабіцикло[3.1.0]гекс-3-ил)етил]бензамід,  
 N-[2-(6-етил-6-{3-[(метилсульфоніл)аміно]феніл}-3-азабіцикло[3.1.0]гекс-3-ил)етил]ізонікотинамід,  
 N-[3-{3-[2-(анілінокарбоніл)аміно]етил]-6-етил-3-азабіцикло[3.1.0]гекс-6-ил}феніл)метансульфонамід,  
 етил 2-(6-етил-6-{3-[(метилсульфоніл)аміно]феніл}-3-азабіцикло[3.1.0]гекс-3-ил)етилкарбамат,  
 N-(3-{6-етил-3-[2-(фенілсульфоніл)етил]-3-азабіцикло[3.1.0]гекс-6-ил}феніл)метансульфонамід,  
 N-(3-{6-етил-3-[2-(2-піридинсульфаніл)етил]-3-азабіцикло[3.1.0]гекс-6-ил}феніл)метансульфонамід,  
 N-(3-{3-[3-(4-ацетилфеніл)пропіл]-6-етил-3-азабіцикло[3.1.0]гекс-6-ил}феніл)метансульфонамід,  
 N-(3-{3-[2-(бензилокси)бензил]-6-етил-3-азабіцикло[3.1.0]гекс-6-ил}феніл)метансульфонамід,  
 N-(3-{3-[4-ціанобензил]-6-етил-3-азабіцикло[3.1.0]гекс-6-ил}феніл)метансульфонамід,  
 N-(3-{3-[2-(4-циклопропілфеноксі)етил]-6-етил-3-азабіцикло[3.1.0]гекс-6-ил}феніл)метансульфонамід,  
 N-(3-{6-етил-3-[(2-фенілциклопропіл)метил]-3-азабіцикло[3.1.0]гекс-6-ил}феніл)метансульфонамід,  
 і їх солі.

28. Сполука за будь-яким з пп. 1-26 для застосування в медицині.

29. Сполука за будь-яким з пп. 1-26 для застосування як лікарський засіб для лікування опіатпровідного захворювання або стану.

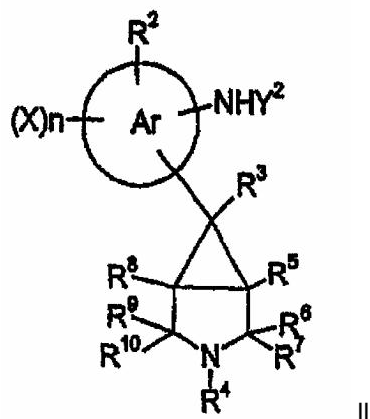
30. Сполука за будь-яким з пп. 1-26 як активний інгредієнт при одержанні лікарського засобу для лікування захворювання або стану, опосередкованого опіатними рецепторами.

31. Фармацевтична або ветеринарна композиція, що містить ефективну кількість сполуки за будь-яким з попередніх пунктів, і фармацевтично або ветеринарно прийнятний носій.

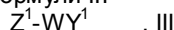
32. Спосіб лікування стану, опосередкованого опіатним рецептором або рецепторами, який включає введення терапевтично активної кількості сполуки за будь-яким з пп. 1-26.

33. Спосіб одержання сполуки за п. 1, що включає

(а) для сполук формули I, у яких q дорівнює 0 і R<sup>1</sup> являє собою NY<sup>2</sup>WY<sup>1</sup>, взаємодію сполуки формули II

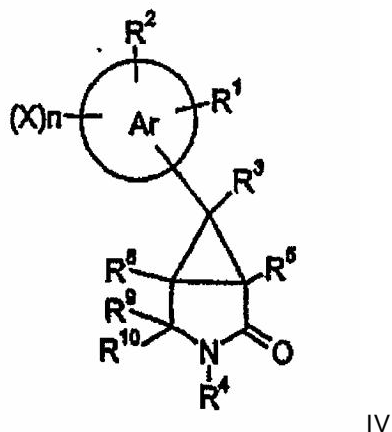


із сполукою формули III



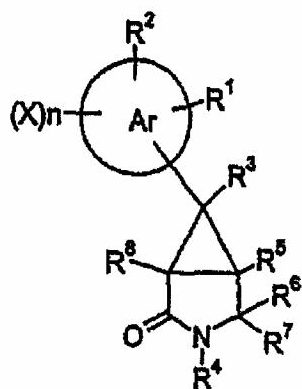
де Z<sup>1</sup> являє собою придатну групу, що видаляється, таку як галоген або Y<sup>1</sup>SO<sub>2</sub>O-;

(b) для сполук формули I, у яких q дорівнює 0 і R<sup>6</sup> і R<sup>7</sup> являють собою H, відновлення сполуки формули IV



з використанням придатного відновника;

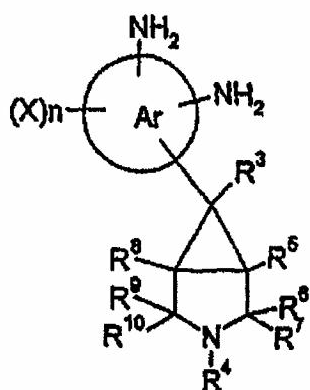
(с) для сполук формули I, у яких  $q$  дорівнює 0 і  $R^9$  і  $R^{10}$  являють собою H, відновлення сполуки формули V



V

з використанням придатного відновника;

(d) для сполук формули I, у яких  $q$  дорівнює 0, а  $R^1$  і  $R^2$  приєднані до сусідніх атомів вуглецю і разом з атомами вуглецю, до яких приєднані, утворюють Het<sup>1a</sup>, де Het<sup>1a</sup> являє собою імідазольний фрагмент, взаємодію відповідної сполуки формули VI



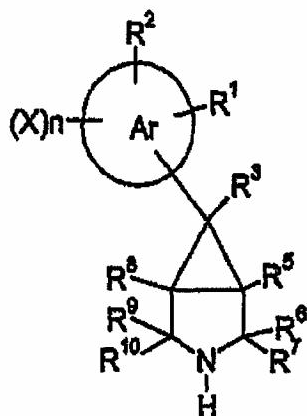
VI

з сполукою формули VII

$RYCO_2H$ , VII

де RY являє собою H або будь-які необов'язкові замісники на Het<sup>1a</sup> (які визначені вище), переважно H, C<sub>1</sub>-алкіл або C<sub>1</sub>-галогеналкіл;

(е) коли  $q$  дорівнює 0, взаємодію сполуки формули VIII



VIII

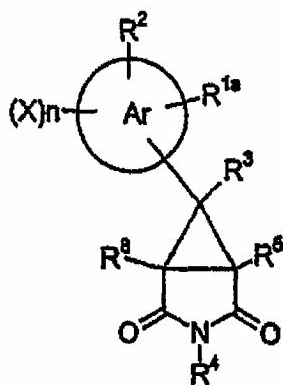
з сполукою формули IX,

$R^4-Lg$ , IX

де Lg являє собою групу, що видаляється;

(f) для сполук формули I, у яких  $q$  дорівнює 0 і  $R^6$ ,  $R^7$ ,  $R^9$  і  $R^{10}$  являють собою H, відновлення сполуки формули X





X

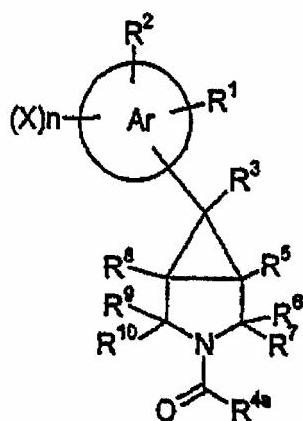
придатним відновником;

(g) для сполук формули I, у яких q дорівнює 0 і R<sup>1</sup> являє собою OH, взаємодію сполуки формули II, де Y<sup>2</sup> являє собою H, як визначено вище, із фторборною кислотою і ізоамілітритом;

(h) для сполук формули I, у яких q дорівнює 0 і R<sup>1</sup> являє собою Cl, взаємодію сполуки формули II, де Y<sup>2</sup> являє собою H, як визначено вище, з нітритом натрію в присутності розведеної кислоти з наступною взаємодією з хлоридом міді (I) у присутності концентрованої кислоти;

(i) для сполук формули I, у яких q дорівнює 1, взаємодію сполуки формули I, де q дорівнює 0, із придатним окислювачем, таким як водний пероксид водню;

(j) для сполук формули I, де q дорівнює 0, відновлення відповідної сполуки формули XXXI

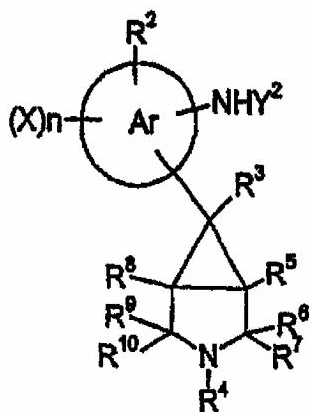


, XXXI

де R<sup>4a</sup>CH<sub>2</sub> приймає ті ж значення, що і R<sup>4</sup>, описаний вище;

(k) для сполук формули (I), де q дорівнює 0, реакцію відновлювального амінування аміну формули VII, представленій вище, з альдегідом формули R<sup>4a</sup>-CHO, де R<sup>4a</sup>CH<sub>2</sub> приймає ті ж значення, що і R<sup>4</sup>, описаний вище, і де бажане або необхідне перетворення одержаної сполуки формули I у фармацевтично прийнятну сіль або навпаки.

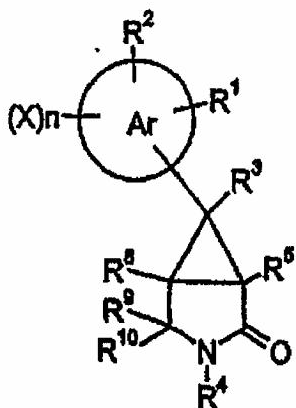
34. Сполука формули II:



, II

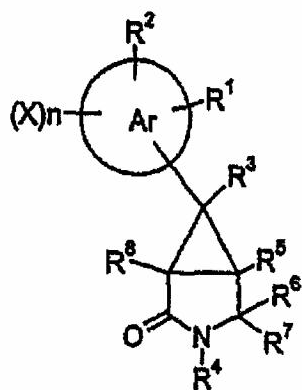
де R<sup>2</sup>-R<sup>10</sup>, Y<sup>2</sup>, X та n є такими, як вказано в п.1, або її сіль.

35. Сполука формули IV:



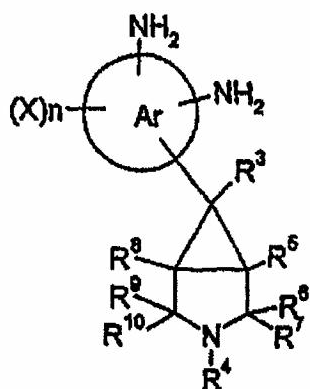
, IV

де  $R^1$ - $R^5$ ,  $R^8$ - $R^{10}$ , X та n є такими, як вказано в п.1, або її сіль.  
36. Сполука формули V:



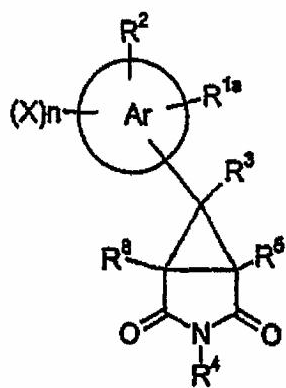
, V

де  $R^1$ - $R^8$ , X та n є такими, як вказано в п.1, або її сіль.  
37. Сполука формули VI:



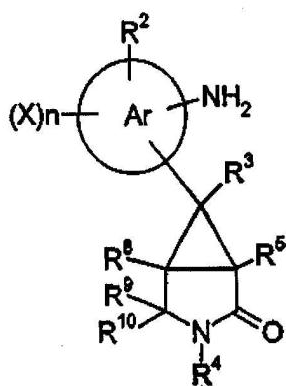
, VI

де  $R^3$ - $R^{10}$ , X та n є такими, як вказано в п.1, або її сіль.  
38. Сполука формули X:



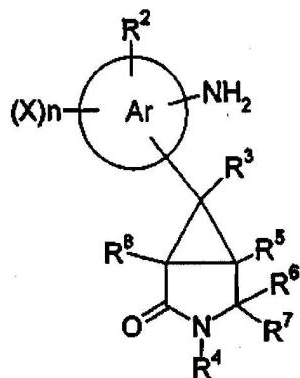
, X

де  $R^1$ - $R^5$ ,  $R^8$ , X та n є такими, як вказано в п.1, або її сіль.  
39. Сполука формули XI:



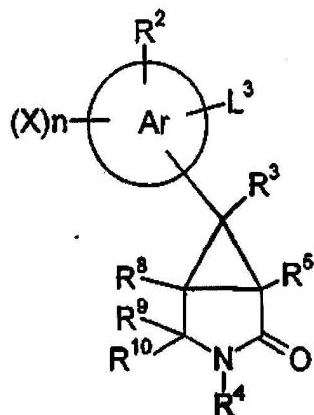
, XI

де  $R^2$ - $R^5$ ,  $R^8$ - $R^{10}$ , X та n є такими, як вказано в п.1, або її сіль.  
40. Сполука формули XII:



, XII

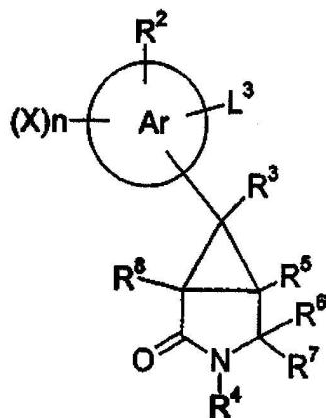
де  $R^2$ - $R^8$ , X та n є такими, як вказано в п.1, або її сіль.  
41. Сполука формули XXI:



, XXI

де  $L^3$  являє собою групу, яка може піддаватися перетворенням функціональних груп за допомогою звичайних методів заміщення або перетворення функціональних груп, і  $R^2$ - $R^5$ ,  $R^8$ - $R^{10}$ , X та n є такими, як вказано в п.1, або її сіль.

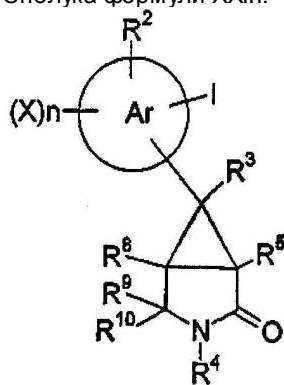
42. Сполука формули XXII:



, XXII

де  $L^3$  є таким, як вказано вище, і де  $R^2$ - $R^8$ ,  $X$  та  $n$  є такими, як вказано в п.1, або її сіль.

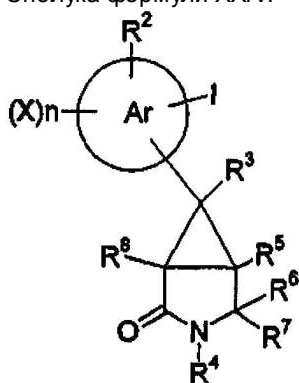
43. Сполука формули XXIII:



, XXIII

де  $R^2$ ,  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^8$ - $R^{10}$ ,  $X$  та  $n$  є такими, як вказано в п.1, або її сіль.

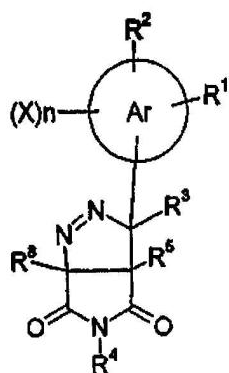
44. Сполука формули XXIV:



, XXIV

де  $R^2$ - $R^8$ ,  $X$  та  $n$  є такими, як вказано в п.1, або її сіль.

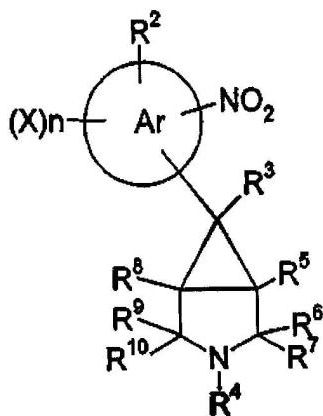
45. Сполука формули XXIXa



, XXIXa

де  $R^1$ - $R^5$ ,  $R^8$ ,  $X$  та  $n$  є такими, як вказано в п.1, або її сіль.

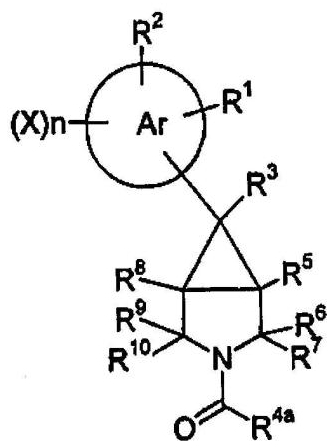
46. Сполука формули XXX:



, XXX

де  $R^2$ - $R^{10}$ ,  $X$  та  $n$  є такими, як вказано в п.1, або її сіль.

47. Сполука формули XXXI:



, XXXI

де  $R^{4a}CH_2$  приймає ті ж значення, що і  $R^4$ , як вказано в п.1, та  $R^1-R^3$ ,  $R^5-R^{10}$ , X та n є такими, як вказано в п.1, або її сіль.