



УКРАЇНА

(19) UA (11) 95978 (13) C2

(51) МПК (2011.01)

C07D 317/58 (2006.01)

C07D 405/12 (2006.01)

A61K 31/435 (2006.01)

A61P 25/00

A61P 35/00

A61P 37/00

ДЕРЖАВНА СЛУЖБА  
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ  
ВЛАСНОСТІ  
УКРАЇНИОПИС  
ДО ПАТЕНТУ НА ВИНАХІД

(54) ІНГІБІТОР АКТИВАЦІЇ STAT3/5

1

(21) а200904059

(22) 02.10.2007

(24) 26.09.2011

(86) PCT/JP2007/069645, 02.10.2007

(31) 2006-271172

(32) 02.10.2006

(33) JP

(46) 26.09.2011, Бюл.№ 18, 2011 р.

(72) СЕКІГУТІ КАЗУО, JP, СУЗУКІ ТАКАСІ, JP, ОБУЧІ ЮТАКА, JP, ОКУНО МІЦУХІРО, JP, ОХІ НАОТО, JP, ОНІШІ КЕНЗІ, JP, МОТОЯМА МАСААКІ, JP, ЙОШІДА КЕНЗІ, JP, КОДАМА ТАКЕСІ, JP, СУГІЯМА КАЗУХІСА, JP, АКАМАЦУ СЕЙДЖІ, JP, КІЙОНО КУНІХІКО, JP, ЯНАГІХАРА ЯСУО, JP, ВАТАНАБЕ ТАКАСІ, JP, ХАЯСІ КАЗУХІКО, JP, ТАНАКА ХІДЕО, JP, СУМІДА ТАКУМІ, JP

(73) ОЦУКА ФАРМАС'ЮТИКЕЛ КО., ЛТД., JP

(56) US3182085 A 04.05.1965

WO03076406 A 18.09.2003

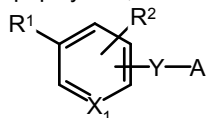
FR2289489 A 28.05.1976

EP1211235 A 05.06.2002

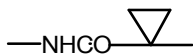
US4978672 A 18.12.1990

WO2006014012 A 09.02.2006

(57) 1. Інгібітор активації STAT3/5, що містить ароматичні сполуки, представлені загальною формулою, або їх солі як діючий інгредієнт:



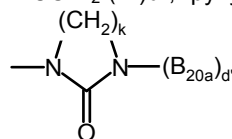
[Формула 1]

де X<sub>1</sub> представляє атом азоту або групу -CH=,R<sup>1</sup> представляє групу -Z-R<sup>6</sup>,Z представляє групу -N(R<sup>8</sup>)-B-, групу -B-N(R<sup>8</sup>)-,групу -B<sub>0</sub>-O-, групу

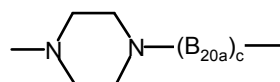
[Формула 2]

2

групу -CO-, групу -CH(OH)-, групу -N(R<sup>9a</sup>)-CO-N-(R<sup>9b</sup>)-, групу -N=CH-, групу -N(R<sup>10a</sup>)-SO<sub>2</sub>-(B<sub>22a</sub>)e-, нижчу алкеніленову групу, групу -NHCO-B<sub>1</sub>-, групу -NHCO-B<sub>2</sub>-(W)u-, групу -B<sub>0</sub>-O-B<sub>19a</sub>-, групу



[Формула 3]  
групу



[Формула 4]

групу -SO<sub>2</sub>-N(R<sup>10b</sup>)-, групу -S-, нижчу алкініленову групу, нижчу алкіленову групу, групу -N(R<sup>8d</sup>)- або групу -CO-NH-B<sub>18a</sub>-,

R<sup>8</sup> представляє атом водню, нижчу алкілну групу, що може мати нижчу алкоксигрупу як замісник, нижчу алканойлну групу, нижчу алкілсульфонільну групу або фенільну групу нижчого алкілу, B представляє групу -CO- або нижчу алкіленову групу,

B<sub>0</sub> представляє нижчу алкіленову групу,B<sub>1</sub> представляє нижчу алкеніленову групу, що може мати фенільну групу як замісник,B<sub>2</sub> представляє нижчу алкіленову групу, що може бути заміщена групою, що вибрана з групи, що містить нижчу алкоксигрупу та фенільну групу,R<sup>9a</sup> представляє атом водню або нижчу алкілну групу,R<sup>9b</sup> представляє атом водню або нижчу алкілну групу,R<sup>10a</sup> представляє атом водню або нижчу алкілну групу,B<sub>22a</sub> представляє нижчу алкіленову групу або нижчу алкеніленову групу,

e представляє 0 або 1,

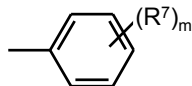
B<sub>18a</sub> представляє нижчу алкіленову групу,

(13) C2

(11) 95978

(19) UA

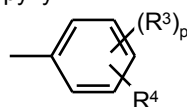
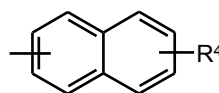
B<sub>19a</sub> представляє нижчу алкіленову групу,  
 B<sub>20a</sub> представляє нижчу алкіленову групу,  
 B<sub>21a</sub> представляє нижчу алкіленову групу,  
 k представляє 2 або 3,  
 c представляє 0 або 1,  
 d' представляє 0 або 1,  
 R<sup>10b</sup> представляє атом водню або нижчу алкілну групу,  
 R<sup>8d</sup> представляє атом водню або нижчу алкілну групу,  
 W представляє атом кисню, групу -NH- або атом сірки,  
 u представляє 0 або 1,  
 R<sup>6</sup> представляє 5-15-членну моноциклічну, дициклічну або трициклічну насичену або ненасичену гетероциклічну групу, що має 1-4 атоми азоту, атоми кисню або атоми сірки (що може мати 1-3 замісники, що вибрані з групи, яка містить оксогрупу; нижчу алкоксигрупу, що може мати атом галогену як замісник; нижчу алкілну групу, що може мати атом галогену як замісник; атом галогену; нижчу алкілсульфонільну групу; фенільну групу, що може бути заміщена нижчою алкільною групою, що може мати атом галогену у фенільному кільці; нижчу алкілтіогрупу, піролілну групу, бензоїлну групу; нижчу алканойлну групу; нижчу алкоксикарбонільну групу та аміногрупу, що може мати групу, вибрану з групи, яка містить нижчу алкілну групу та нижчу алканойлну групу як замісник, у гетероциклічному кільці), адамантильну групу, нафтильну групу (що може мати 1-3 групи, вибрані з групи, що містить нижчу алкілну групу, атом галогену та аміногрупу, що може мати групу, вибрану з групи, яка містить нижчу алкілну групу та нижчу алканойлну групу як замісник, у нафталеновому кільці), алкілну групу, що може мати нижчу алкоксигрупу як замісник, циклоалкілну групу, що може бути заміщена групою, що вибрана з групи, що містить амінозаміщену нижчу алкілну групу, що може мати нижчу алкілну групу та нижчу алкілну групу, що може мати атом галогену як замісник у циклоалкільному кільці, нижчу алкенільну групу, що може мати атом галогену як замісник, нижчу алканойлну групу, бензоїлну групу (що може мати 1-3 групи, вибрані з групи, що містить нижчу алкілну групу, що може мати атом галогену та атом галогену як замісники, у фенільному кільці), нижчу алкілну групу, заміщену атомом галогену, циклоалкілніжчу алкілну групу або групу



[Формула 5]

R<sup>7</sup> представляє атом водню, фенільну групу, карбоксигрупу, гідроксильну групу, атом галогену, нижчу алкілну групу, що може мати атом галогену як замісник, феноксигрупу, нижчу алкоксигрупу, що може мати атом галогену як замісник, нижчу алкілендіоксигрупу, аміногрупу, що може мати як замісник групу, вибрану з групи, що містить нижчу алкілну групу, нижчу алканойлну групу, бензоїлну групу та циклоалкілну групу, ціаногрупу, нижчу алканойлну групу, що може

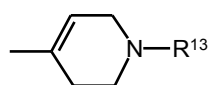
мати атом галогену як замісник, нижчу алкілсульфонільну групу, аміносульфонільну групу, нижчу алкоксикарбонільну групу, нижчу алканойлоксигрупу, нижчу алкоксикарбонільну нижчу алкілну групу або 5- або 6-членну насичену або ненасичену гетероциклічну групу, що має 1-4 атоми азоту, атоми кисню або атоми сірки (що може мати оксогрупу у гетероциклічному кільці), m представляє ціле число від 1 до 5(коли m представляє 2-5, два-п'ять з R<sup>7</sup> можуть бути ідентичними або різними) та R<sup>2</sup> представляє атом водню, атом галогену або нижчу алкілну групу, Y представляє групу -O-, групу -N(R<sup>5</sup>)-, групу -CO-, групу -CH(OH)-, нижчу алкіленову групу, групу -S(O)n- або групу -C(=N-OH)-, R<sup>5</sup> представляє атом водню, нижчу алкілну групу, нижчу алканойлну групу, бензоїлну групу, фенільну групу нижчого алкілу або циклоалкілну групу, n представляє 0, 1 або 2, A представляє групу

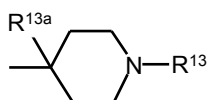
[Формула 6]  
або групу

[Формула 7]

p представляє 1 або 2,

R<sup>3</sup> представляє атом водню, нижчу алкоксигрупу, атом галогену, нижчу алкілну групу, що може мати атом галогену як замісник, нижчу алкоксикарбонільну групу, карбоксигрупу, групу -CONR<sup>11</sup>R<sup>12</sup> або ціаногрупу, де R<sup>11</sup> та R<sup>12</sup> можуть бути ідентичними або різними та кожний представляє атом водню, нижчу алкілну групу, циклоалкілну групу або фенільну групу, та R<sup>11</sup> та R<sup>12</sup>, разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, можуть приєднуватись один до одного, безпосередньо або за допомогою атома азоту, атома кисню або атома сірки, утворюючи 5-7-членне насичене гетероциклічне кільце, R<sup>4</sup> представляє імідазоліл-нижчу алкілну групу, 1,2,4-триазоліл-нижчу алкілну групу, 1,2,3-триазоліл-нижчу алкілну групу, 1,2,5-триазоліл-нижчу алкілну групу, піразоліл-нижчу алкілну групу, піримідиніл-нижчу алкілну групу, що може мати оксогрупу як замісник у піримідиновому кільці, 3,5-діоксоізооксазолідин-4-іліден-нижчу алкілну групу, 1,2,4-оксадіазоліл-нижчу алкілну групу, що може мати нижчу алкілну групу як замісник у 1,2,4-оксадіазольному кільці, тіазолідиніл-нижчу алкілну групу, що може мати оксогрупу як замісник у тіазолідиновому кільці, групу

[Формула 8]  
групу



[Формула 9]

або групу  $-(T)-N(R^{14})R^{15}$ ,

$R^{13}$  представляє атом водню, нижчу алкілну групу, що може мати атом галогену як замісник, нижчу алканойлну групу, що може мати атом галогену як замісник, нижчу алкоксикарбонільну групу, фенільну групу нижчого алкілу, що може мати нижчу алкілендіоксигрупу як замісник у фенільному кільці, імідазоліл-нижчу алкілну групу, нижчу алкоксикарбоніл-нижчу алкілну групу, карбокси-нижчу алкілну групу, бензоїлну групу, морфолінозаміщену нижчу алканойлну групу, піперазинілкарбоніл-нижчу алкілну групу, що може бути заміщена у піперазиновому кільці фенільною групою нижчого алкілу, що може мати нижчу алкілендіоксигрупу як замісник у фенільному кільці, піперазиніл-нижчу алканойлну групу, що може бути заміщена у піперазиновому кільці фенільною групою нижчого алкілу, що може мати нижчу алкілендіоксигрупу як замісник у фенільному кільці, морфолінокарбонілзаміщену нижчу алкілну групу або імідазоліл-нижчу алканойлну групу,  $R^{13a}$  представляє атом водню або гідроксильну групу,

$T$  представляє нижчу алкіленову групу, групу  $-N(R^{17})-B_3-CO-$ , групу  $-B_{19}-N(R^{18})-CO-$ , групу  $-B_4-CO-$ , групу  $-Q-B_5-CO-$ , групу  $-B_6-N(R^{19})-B_7-CO-$ , групу  $-CO-B_8-$ , групу  $-CH(OH)-B_9-$ , групу  $-CO-B_{10}-CO-$ , групу  $-CH(OH)-B_{11}-CO-$ , групу  $-CO-$ , групу  $-SO_2-$  або групу  $-B_{23a}-CO-CO-$ , де  $R^{17}$  представляє атом водню, нижчу алкілну групу, циклоалкілну групу, циклоалкілкарбонільну групу, нижчу алканойлну групу, що може мати атом галогену як замісник, нижчу алкенільну групу, амінозаміщену нижчу алканойлну групу, що може мати нижчу алкілну групу як замісник або нижчу алкілсульфонільну групу,

$B_3$  представляє нижчу алкіленову групу,

$B_{19}$  представляє нижчу алкіленову групу,

$R^{18}$  представляє атом водню або нижчу алкілну групу,

$B_4$  представляє нижчу алкеніленову групу або нижчу алкіленову групу, що може мати гідроксильну групу як замісник,

$Q$  представляє атом кисню або групу  $-S(O)n-$  (де  $n$  є таким, як визначено вище),

$B_5$  представляє нижчу алкіленову групу,

$B_6$  представляє нижчу алкіленову групу,

$R^{19}$  представляє атом водню або нижчу алканойлну групу,

$B_7$  представляє нижчу алкіленову групу,

$B_8$  представляє нижчу алкіленову групу,

$B_9$  представляє нижчу алкіленову групу,

$B_{10}$  представляє нижчу алкіленову групу,

$B_{11}$  представляє нижчу алкіленову групу,

$B_{23a}$  представляє нижчу алкіленову групу,

$l$  представляє 0 або 1,

$R^{14}$  представляє атом водню або алкілну групу, що може мати гідроксильну групу як замісник,

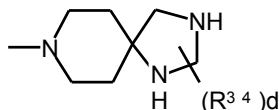
$R^{15}$  представляє (2) гідроксильну групу-заміщену алкілну групу, (3) циклоалкілну групу, що може

мати групу, вибрану з групи, яка містить гідроксильну групу та нижчу алкілну групу як замісник, (4) фенокси-нижчу алкілну групу, (5) фенільну групу, що може бути заміщена, у фенільному кільці, 1-3 групами, вибраними з групи, що містить нижчу алкілну групу; нижчу алкоксигрупу, що може мати атом галогену як замісник; атом галогену; аміно-нижчу алкоксигрупу, що може мати нижчу алкілну групу як замісник; гідроксильну групу-заміщену нижчу алкілну групу; фенільну групу нижчого алкілу; нижчу алкокінілну групу; аміногрупу, що може мати нижчу алкілсульфонільну групу як замісник; нижчу алкілтіогрупу; циклоалкілну групу; фенілтіогрупу; адамантильну групу; анілінову групу, що може мати атом галогену як замісник у фенільному кільці; нижчу алкоксикарбонільну групу; піперазинільну групу, що може мати нижчу алкілну групу як замісник у піперазиновому кільці; піролідінільну групу, що може мати оксогрупу як замісник у піролідіновому кільці; нижчу алканойламіногрупу; ціаногрупу та феноксигрупу, (6) феноксигрупу, (7) фенільну групу нижчого алкілу, що може бути заміщена, у фенільному кільці, 1-3 групами, вибраними з групи, що містить атом галогену, нижчу алкоксигрупу, що може мати атом галогену як замісник, та нижчу алкілну групу, (8) фенільну групу нижчого алкілу, що має нижчу алкілендіоксигрупу як замісник у фенільному кільці, (10) нижчу алкоксикарбонілзаміщену нижчу алкілну групу, (11) карбоксизаміщену нижчу алкілну групу, (12) аміногрупу, що може мати нижчу алканойлну групу як замісник, (13) 1,2,3,4-тетрагідрохінолілну групу, що може мати 1-3 групи, вибрані з групи, що містить оксогрупу, нижчу алкоксигрупу та нижчу алкілендіоксигрупу як замісник(и) у тетрагідрохіноліновому кільці, (14) циклоалкіл-нижчу алкілну групу, (15) піперазиніл-нижчу алканойлну групу, що може бути заміщена у піперазиновому кільці фенільною групою нижчого алкілу, що може мати нижчу алкілендіоксигрупу як замісник у фенільному кільці, (16) прідил-нижчу алкілну групу, (17) аміногрупу-заміщену нижчу алкілну групу, що може мати групу, вибрану з групи, яка містить нижчу алкілну групу та нижчу алканойлну групу як замісник, (18) нижчу алкокси-нижчу алкілну групу, (19) імідазолільну групу, (20) імідазоліл-нижчу алкілну групу, (21) 1,2,3,4-тетрагідроізохінолілкарбонілзаміщену нижчу алкілну групу, (22) піперидинілкарбонільну групу, що може мати групу, вибрану з групи, яка містить нижчу алкоксикарбонільну групу, фенільну групу нижчого алкілу та фурил-нижчу алкілну групу як замісник у піперидиновому кільці, (23) тіазолідиніл-нижчу алканойлну групу, що може мати оксогрупу як замісник у тіазолідиновому кільці, (24) піперидинільну групу, що може бути заміщена у піперидиновому кільці групою, що вибрана з групи, що містить нижчу алкоксикарбонільну групу, фенільну групу нижчого алкілу, нижчу алкілну групу, бензоїлну групу та фурил-нижчу алкілну групу, (25) карбоніл-нижчу алкілну групу, заміщену групою



[Формула 10]

(26) карбоніл-нижчу алкільну групу, заміщену групою



[Формула 11]

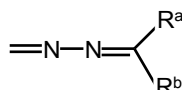
(27) групу  $-\text{CO}-\text{B}_{20}-\text{N}(\text{R}^{36})\text{R}^{37}$ , (26a) піролідініл-нижчу алкільну групу, (27a) морфоліно-нижчу алкільну групу, (28a) феніл-нижчу алкільну групу, (29a) анілінокарбоніл-нижчу алкільну групу, що може мати нижчу алкільну групу як замісник у фенільному кільці, (30a) індолільну групу, (31a) піперазиніл-нижчу алкільну групу, що може мати як замісник у піперазиновому кільці групу, вибрану з групи, що містить нижчу алкільну групу, та фенільну групу нижчого алкілу, що може мати нижчу алкілендіоксигрупу як замісник у фенільному кільці, (32a) амідіно-нижчу алкільну групу, що може мати нижчу алкільну групу як замісник, (33a) флуоренільну групу, (34a) карбазолільну групу, що може мати нижчу алкільну групу як замісник у карбазольному кільці, (35a) амідіногрупу, що може мати нижчу алкільну групу як замісник, (36a) піперазинілзаміщену оксалільну групу, що може мати 1-3 групи, вибрані з групи, що містить фенільну групу нижчого алкілу (що може мати 1-3 групи, вибрані з групи, що містить нижчу алкілендіоксигрупу та нижчу алкоксигрупу як замісник(и) у фенільному кільці) та піридил-нижчу алкільну групу як замісник(и) у піперазиновому кільці, або (37a) ціанозаміщену нижчу алкільну групу,  $\text{R}^{34}$  представляє оксогрупу або фенільну групу,  $d$  представляє ціле число від 0 до 3,  $\text{B}_{20}$  представляє нижчу алкіленову групу,  $\text{R}^{36}$  та  $\text{R}^{37}$ , разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, можуть приєднуватись один до одного, безпосередньо або за допомогою атома азоту, атома кисню або атома сірки, утворюючи 5-7-членну гетероциклічну групу, де, у гетероциклічному кільці, 1-3 феніл-нижчі алкільні групи, що можуть мати нижчу алкілендіоксигрупу у фенільному кільці, можуть бути присутні як замісники,  $\text{R}^{14}$  та  $\text{R}^{15}$ , разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, можуть приєднуватись один до одного, безпосередньо або за допомогою атома азоту, атома кисню або атома сірки, утворюючи 5-10-членне насичене або ненасичене гетероциклічне кільце або групу



[Формула 12]

де, у гетероциклічному кільці, можуть бути присутні 1-3 замісники, що вибрані з групи, яка містить (28) фенілзаміщену нижчу алкільну групу, що має 1-2 фенільні групи, що можуть бути заміщені 1-3 групами у фенільному кільці, які

вибрані з групи, що містить нижчу алканойльну групу, аміногрупу, що може мати нижчу алканойльну групу як замісник, нижчу алкоксикарбонільну групу, ціаногрупу, нітрогрупу, фенільну групу, атом галогену, нижчу алкільну групу, що може мати атом галогену як замісник, нижчу алкоксигрупу, що може мати атом галогену як замісник, феніл-нижчу алкоксигрупу, гідроксильну групу та нижчу алкілендіоксигрупу, та що може мати піридилільну групу у нижчій алкільній групі, (29) карбамоільну групу, (30) піридил-нижчу алкільну групу, що може мати як замісник(и) у піридиновому кільці 1-3 групи, вибрані з групи, що містить гідроксильну групу та нижчу алкільну групу, що може мати гідроксильну групу як замісник, (31) піролід-нижчу алкільну групу, що може мати 1-3 нижчі алкільні групи як замісники у пірольному кільці, (32) бензоксазоліл-нижчу алкільну групу, (33) бензотіазоліл-нижчу алкільну групу, (34) фурил-нижчу алкільну групу, (35) бензоільну групу, що може бути заміщена, у фенільному кільці, 1-3 групами, вибраними з групи, що містить ціаногрупу, аміногрупу, що може мати нижчу алкілсульфонільну групу як замісник, атом галогену, нижчу алкоксигрупу, нижчу алкільну групу, що може мати атом галогену як замісник, тіазолідініл-нижчу алкільну групу, що може мати оксогрупу як замісник у тіазолідиновому кільці, тіазолідініліден-нижчу алкільну групу, що може мати оксогрупу як замісник у тіазолідиновому кільці, та нижчу алкілендіоксигрупу, (36) прімідинільну групу, (37) піразинільну групу, (38) піридилільну групу, (39) нижчу алкоксикарбонільну групу, (40) тіазолідініл-нижчу алканойльну групу, що може бути заміщена у тіазолідиновому кільці групою, що вибрана з групи, що містить оксогрупу та групу



[Формула 13]

(де  $\text{R}^a$  та  $\text{R}^b$  кожний представляють нижчу алкільну групу), (41) нижчу алкільну групу, що може мати групу, вибрану з групи, яка містить гідроксильну групу та атом галогену як замісник, (42) нижчу алканойльну групу, що може мати атом галогену як замісник, (43) фенільну групу, що може бути заміщена, у фенільному кільці, 1-3 групами, вибраними з групи, що містить карбамоільну групу, що може мати групу, вибрану з групи, яка містить нижчу алкокси-нижчу алкільну групу та нижчу алкільну групу, нижчу алкоксикарбонільну групу, карбоксигрупу, ціаногрупу, фенільну групу, атом галогену, нижчу алкільну групу, що може мати атом галогену як замісник, нижчу алкоксигрупу, що може мати атом галогену як замісник, бензоільну групу, що може мати атом галогену як замісник у фенільному кільці, фенільну групу нижчого алкілу, що може мати атом галогену як замісник у фенільному кільці, та гідроксильну групу, (44) фенільну групу, що може мати нижчу алкілендіоксигрупу як замісник у фенільному кільці, (45) нафтил-нижчу алкільну групу, (46) феноксигрупу, що може бути заміщена, у

фенільному кільці, 1-3 групами, вибраними з групи, що містить ціаногрупу, нижчу алкільну групу, що може мати атом галогену як замісник, та нижчу алкоксигрупу, що може мати атом галогену як замісник, (47) фенокси-нижчу алкільну групу, (48) феніл-нижчу алкоксигрупу, що може бути заміщена, у фенільному кільці, 1-3 групами, вибраними з групи, що містить атом галогену, нижчу алкільну групу, що може мати атом галогену як замісник, та нижчу алкоксигрупу, що може мати атом галогену як замісник, (49) групу  $-(B_{12}CO)t-N(R^{20})R^{21}$ , (50) групу  $-(CO)_0-B_{13}-N(R^{22})R^{23}$ , (51) а 1,2,3,4-тетрагідронафтил-заміщену нижчу алкільну групу, що може бути заміщена, у 1,2,3,4-тетрагідронафталеновому кільці, 1-5 нижчими алкільними групами як замісниками, (52) циклоалкільну групу, що може мати гідроксильну групу як замісник, (53) піперидинільну групу, що може бути заміщена, у піперидиновому кільці, 1-3 нижчими алкільними групами як замісниками, (54) хіноліл-нижчу алкільну групу, (55) 1,2,3,4-тетразоліл-нижчу алкільну групу, що може мати групу, вибрану з групи, яка містить нижчу алкільну групу та фенільну групу нижчого алкілу як замісник у тетразоліновому кільці, (56) тіазоліл-нижчу алкільну групу, що може мати фенільну групу як замісник у тіазольному кільці, (57) бензоіл-нижчу алкільну групу, що може мати 1-3 групи, вибрані з групи, що містить нижчу алкоксигрупу та атом галогену як замісник(и) у фенільному кільці, (58) піперидиніл-нижчу алкільну групу, що може мати нижчу алкільну групу як замісник у піперидиновому кільці, (59) імідазолільну групу, що може мати 1-3 фенільні групи як замісники у імідазоліновому кільці, (60) бензімідазолільну групу, що може мати 1-3 нижчі алкільні групи як замісники у бензімідазоліновому кільці, (61) піридил-нижчу алкоксигрупу, (62) 1,2,3,4-тетрагідрохіноліл-нижчу алкільну групу, що може мати оксогрупу як замісник у тетрагідрохіноліновому кільці, (63) 1,3,4-оксадіазоліл-нижчу алкільну групу, що може мати оксогрупу як замісник у 1,3,4-у оксадізоліновому кільці, (64) циклоалкіл-нижчу алкільну групу, (65) тетрагідропіранільну групу, (66) тієніл-нижчу алкільну групу, (67) піримідинілкарбонільну групу, що може мати оксогрупу як замісник у піримідиновому кільці, (68) гідроксильну групу, (69) карбоксигрупу, (70) нижчу алкокси-нижчу алкільну групу, (71) нижчу алкокси-нижчу алкоксигрупу, (72) бензоїлоксигрупу, (73) нижчу алкоксикарбоніл-нижчу алкоксигрупу, (74) карбокси-нижчу алкоксигрупу, (75) фенокси-нижчу алканойльну групу, (76) 1,2,3,4-тетрагідрохінолілкарбонільну групу, що може мати оксогрупу як замісник у тетрагідрохіноліновому кільці, (77) фенілсульфонільну групу, (78) імідазоліл-нижчу алканойльну групу, (79) імідазоліл-нижчу алкільну групу, (80) піридилкарбонільну групу, (81) імідазолілкарбонільну групу, (82) нижчу алкоксикарбоніл-нижчу алкільну групу, (83) карбокси-нижчу алкільну групу, (84) групу  $-(O-B_{15})s-CO-N(R^{26})R^{27}$ , (85) групу  $-N(R^{28})-CO-B_{16}-N(R^{29})R^{30}$ , (86) групу  $-N(R^{31})-B_{17}-CO-N(R^{32})R^{33}$ , (87) бензоксазолільну групу, (88a) бензотієнільну групу, (89a) оксогрупу, та (90a) 1,2,3,4-

тетрагідрохінолільну групу, що може мати оксогрупу як замісник у тетрагідрохіноліновому кільці,

$B_{12}$  представляє нижчу алкіленову групу,  $t$  представляє 0 або 1,

$R^{20}$  та  $R^{21}$  можуть бути ідентичними або різними та кожний представляє атом водню; аміногрупу, що може мати нижчу алкоксикарбонільну групу як замісник; бензоїльну групу, що може мати 1-3 нижчі алкоксигрупи як замісники у фенільному кільці; нижчу алкільну групу; нижчу алкільну групу, що має 1-2 фенільні групи, що може бути заміщена, у фенільному кільці, 1-3 групами, вибраними з групи, що містить нижчу алкоксикарбонільну групу, ціаногрупу, нітрогрупу, фенільну групу, атом галогену, нижчу алкільну групу, що може мати атом галогену як замісник, нижчу алкоксигрупу, що може мати атом галогену як замісник, та нижчу алкілтіогрупу; фенільну групу, що може бути заміщена, у фенільному кільці, 1-3 групами, вибраними з групи, що містить нижчу алкоксигрупу, що може мати атом галогену як замісник, та нижчу алкільну групу, що може мати атом галогену як замісник; нижчу алкоксикарбонільну групу; циклоалкіл-нижчу алкільну групу; піролідініл-нижчу алкільну групу, що може мати 1-3 нижчі алкільні групи, що може мати гідроксильну групу як замісник у піролідиновому кільці; амінозаміщену нижчу алкільну групу, що може мати групу, вибрану з групи, яка містить фенільну групу та нижчу алкільну групу як замісник; 1,2,3,4-тетрагідронафтилзаміщену нижчу алкільну групу, що може мати 1-5 нижчих алкільних груп як замісників у 1,2,3,4-тетрагідронафталеновому кільці; нафтил-нижчу алкільну групу; піридил-нижчу алкільну групу; хіноліл-нижчу алкільну групу; 1,2,3,4-тетразоліл-нижчу алкільну групу, що може мати 1-3 групи, вибрані з групи, що містить нижчу алкільну групу та фенільну групу нижчого алкілу як замісник(и) у тетразоліновому кільці; 1,2,4-триазоліл-нижчу алкільну групу; тетрагідрофурил-нижчу алкільну групу, що може мати гідроксильну групу як замісник у нижчій алкільній групі; фенокси-нижчу алкільну групу, що може мати 1-3 групи, вибрані з групи, що містить нижчу алкільну групу та нітрогрупу як замісник(и) у фенільному кільці; феніл-нижчу алканойльну групу; нижчу алканойльну групу, що може мати атом галогену як замісник; імідазоліл-нижчу алканойльну групу; нижчу алкоксикарбоніл-нижчу алкільну групу; піридилну групу або карбокси-нижчу алкільну групу, або циклоалкільну групу; та  $R^{20}$  та  $R^{21}$ , разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, можуть приєднуватись один до одного, безпосередньо або за допомогою атома азоту, атома кисню або атома сірки, утворюючи 5-7-членне насичене гетероциклічне кільце (де, у гетероциклічному кільці, можуть бути присутні 1-3 замісники, що вибрані з групи, яка містить нижчу алкільну групу, фенільну групу, що може мати 1-3 групи, вибрані з групи, що містить атом галогену та нижчу алкільну групу, що може мати атом галогену як замісник у фенільному кільці, та фенільну групу нижчого алкілу, що може мати нижчу

алкілендіоксигрупу як замісник у фенільному кільці), о представляє 0 або 1,  $V_{13}$  представляє нижчу алкіленову групу,  $R^{22}$  та  $R^{23}$  можуть бути ідентичними або різними та кожний представляє атом водню, нижчу алкільну групу, бензоїльну групу, що може мати 1-3 нижчі алкоксигрупи як замісники у фенільному кільці, фенокси-нижчу алкільну групу, що може мати нижчу алкільну групу як замісник у фенільному кільці, фенільну групу нижчого алкілу або фенільну групу, або  $R^{22}$  та  $R^{23}$ , разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, можуть приєднуватись один до одного, безпосередньо або за допомогою атома азоту, атома кисню або атома сірки, утворюючи 5-7-членне насичене гетероциклічне кільце (де, у гетероциклічному кільці, можуть бути присутні 1-3 замісники, що вибрані з групи, яка містить нижчу алкільну групу та фенільну групу нижчого алкілу, що може мати нижчу алкілендіоксигрупу як замісник у фенільному кільці),

$V_{15}$  представляє нижчу алкіленову групу, s представляє 0 або 1,  $R^{26}$  та  $R^{27}$  можуть бути ідентичними або різними та кожний представляє атом водню, нижчу алкільну групу, фенільну групу нижчого алкілу або імідазоліл-нижчу алкільну групу, та  $R^{26}$  та  $R^{27}$ , разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, можуть приєднуватись один до одного, безпосередньо або за допомогою атома азоту, атома кисню або атома сірки, утворюючи 5-7-членне насичене гетероциклічне кільце (де, у гетероциклічному кільці, 1-3 феніл-нижчі алкільні групи, що можуть мати нижчу алкілендіоксигрупу як замісник у фенільному кільці, можуть бути присутні як замісники),  $R^{28}$  представляє атом водню або нижчу алкільну групу,  $V_{16}$  представляє нижчу алкіленову групу,  $R^{29}$  та  $R^{30}$ , разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, можуть приєднуватись один до одного, безпосередньо або за допомогою атома азоту, атома кисню або атома сірки, утворюючи 5-7-членну гетероциклічну групу, де, у гетероциклічному кільці, можуть бути присутні 1-3 замісники, що вибрані з групи, яка містить нижчу алкільну групу, фенільну групу та фенільну групу нижчого алкілу, що може мати нижчу алкілендіоксигрупу як замісник у фенільному кільці,  $R^{31}$  представляє атом водню або нижчу алкільну групу,  $V_{17}$  представляє нижчу алкіленову групу,  $R^{32}$  та  $R^{33}$ , разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, можуть приєднуватись один до одного, безпосередньо або за допомогою атома азоту, атома кисню або атома сірки,

утворюючи 5-7-членну гетероциклічну групу (де, у гетероциклічному кільці, можуть бути присутні 1-3 замісники, що вибрані з групи, яка містить нижчу алкільну групу, фенільну групу та фенільну групу нижчого алкілу, що може мати нижчу алкілендіоксигрупу як замісник у фенільному кільці),

за умови, що вищевказана сполука або її солі відповідають наступним вимогам (i)-(v):

(i) коли  $X_1$  представляє групу  $-CH=$ , то  $R^3$  представляє атом водню;

(ii) коли  $X_1$  представляє групу  $-CH=$ , I представляє 1, T представляє  $-CO-$ , та  $R^{14}$  представляє атом водню або алкільну групу, що може мати гідроксильну групу як замісник,  $R^{15}$  представляє групу (24);

(iii) коли  $X_1$  представляє групу  $-CH=$ , I представляє 1, та T представляє  $-N(R^{17})-B_3-CO-$ ,  $R^{14}$  та  $R^{15}$ , разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, можуть приєднуватись один до одного, безпосередньо або за допомогою атома азоту, атома кисню або атома сірки, утворюючи 5-10-членне насичене або ненасичене гетероциклічне кільце, де, у гетероциклічному кільці, 1-3 групи з (28) присутні як замісники;

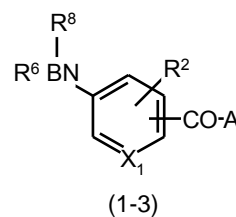
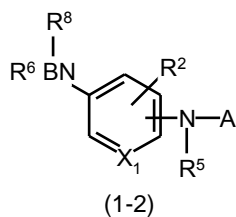
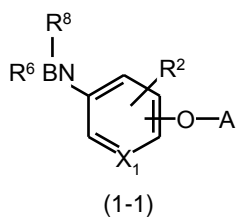
(iv) коли  $X_1$  представляє атом азоту, та I представляє 0, або коли  $X_1$  представляє атом азоту, I представляє 1, та T представляє  $-CO-$  або  $-SO_2$ ,  $R^{15}$  не є група (5), (7), (19) або (20); i

(v) коли  $R^6$  представляє циклоалкільну групу, що може мати у циклоалкільному кільці замісник, вибраний з групи, що містить амінозаміщену нижчу алкільну групу, що може мати нижчу алкільну групу, та нижчу алкільну групу, що може мати атом галогену як замісник,  $R^4$  представляє групу  $-(T)-N(R^{14})R^{15}$  (де T та I є такі, як визначено вище, та  $R^{14}$  та  $R^{15}$ , разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, можуть приєднуватись один до одного, безпосередньо або за допомогою атома азоту, атома кисню або атома сірки, утворюючи 5-10-членне насичене гетероциклічне кільце; або  $R^{14}$  та  $R^{15}$  утворюють групу

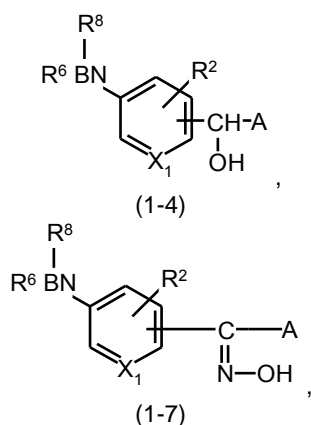


[Формула 14]

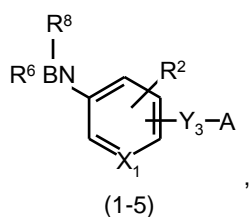
2. Інгібітор згідно з пунктом 1, який містить сполуку, вибрану з групи, що містить сполуки, представлені загальними формулами (1-1)-(1-7) нижче, або її солі як діючий інгредієнт:



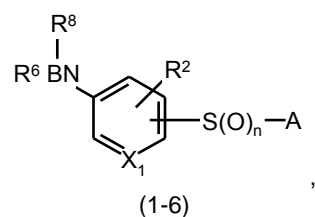
13



95978



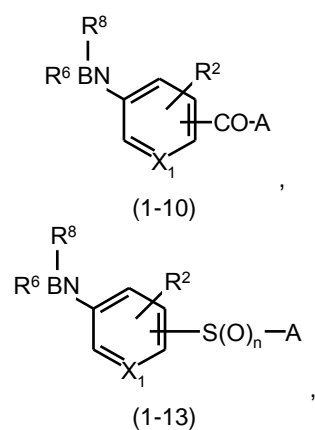
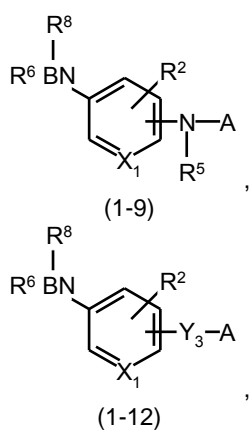
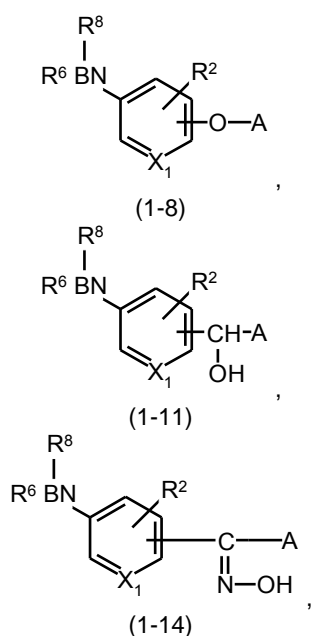
14



де  $Y_3$  представляє нижчу алкіленову групу.

3. Інгібітор згідно з пунктом 1, який містить сполуку, вибрану з групи, що містить сполуки,

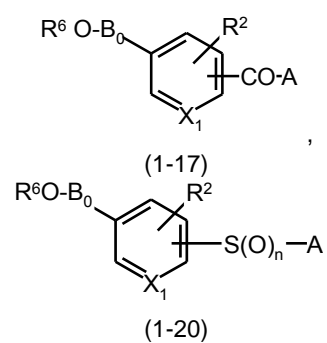
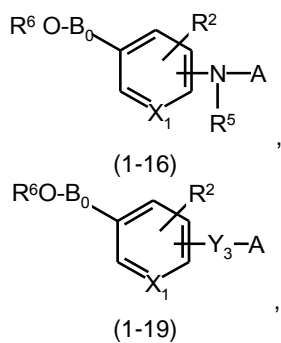
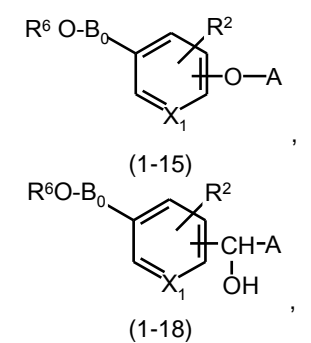
представлені загальними формулами (1-8)-(1-14) нижче, або її солі як діючий інгредієнт:

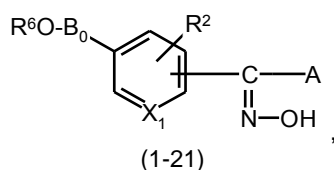


де  $Y_3$  представляє нижчу алкіленову групу.

4. Інгібітор згідно з пунктом 1, який містить сполуку, вибрану з групи, що містить сполуки,

представлені загальними формулами (1-15)-(1-21) нижче, або її солі як діючий інгредієнт:

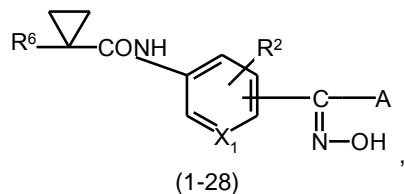
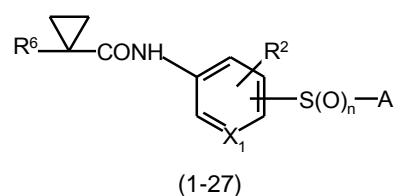
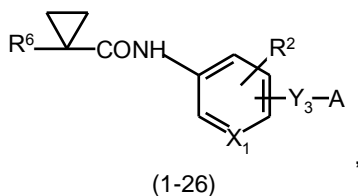
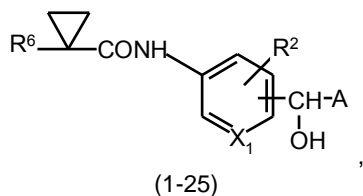
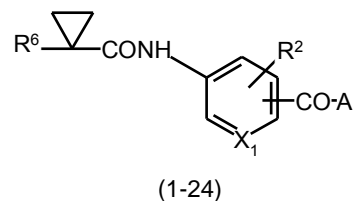
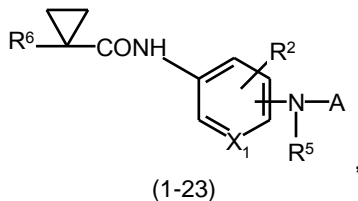
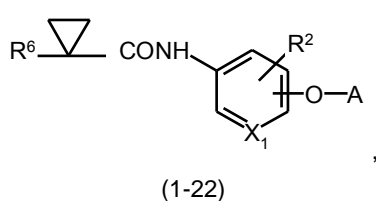




де  $Y_3$  представляє нижчу алкіленову групу.

5. Інгібітор згідно з пунктом 1, який містить сполуку, вибрану з групи, що містить сполуки,

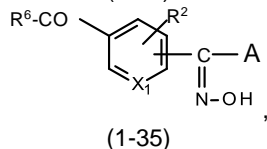
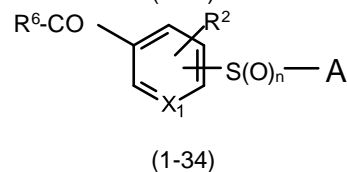
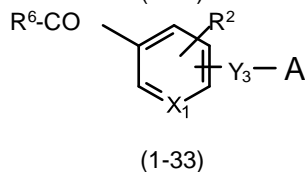
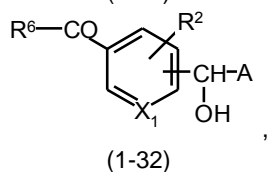
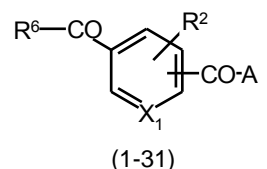
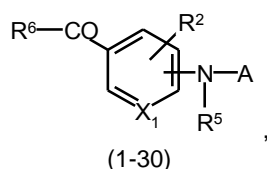
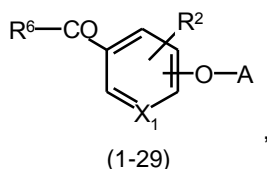
представлені загальними формулами (1-22)-(1-28) нижче, або її солі як діючий інгредієнт:



де  $Y_3$  представляє нижчу алкіленову групу.

6. Інгібітор згідно з пунктом 1, який містить сполуку, вибрану з групи, що містить сполуки,

представлені загальними формулами (1-29)-(1-35) нижче, або її солі як діючий інгредієнт:

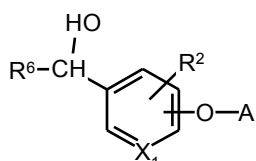


де  $Y_3$  представляє нижчу алкіленову групу.

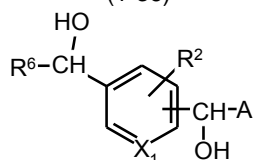
7. Інгібітор згідно з пунктом 1, який містить сполуку, вибрану з групи, що містить сполуки,

представлені загальними формулами (1-36)-(1-42) нижче, або її солі як діючий інгредієнт:

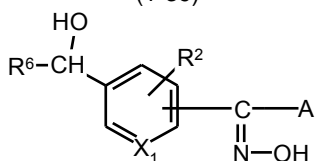




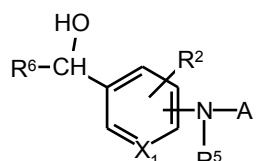
(1-36)



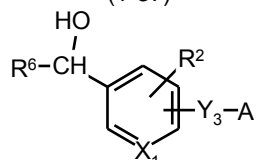
(1-39)



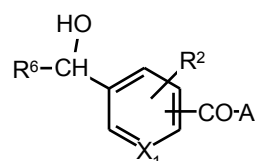
(1-42)



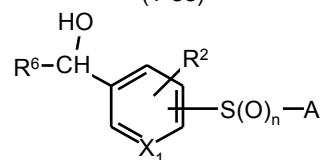
(1-37)



(1-40)



(1-38)

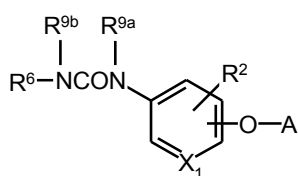


(1-41)

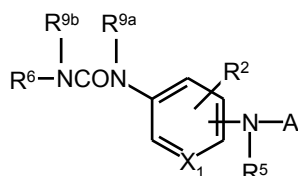
де  $Y_3$  представляє нижчу алкіленову групу.

8. Інгібітор згідно з пунктом 1, який містить сполуку, вибрану з групи, що містить сполуки,

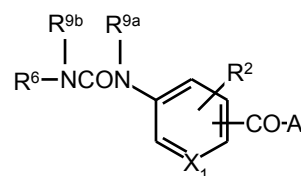
представлені загальними формулами (1-43)-(1-49) нижче, або її солі як діючий інгредієнт:



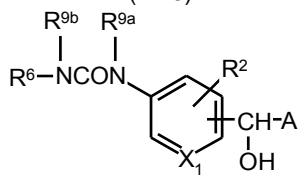
(1-43)



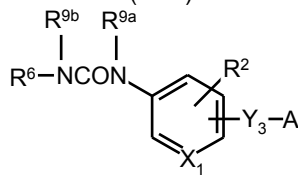
(1-44)



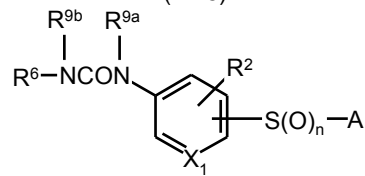
(1-45)



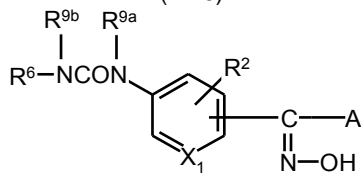
(1-46)



(1-47)



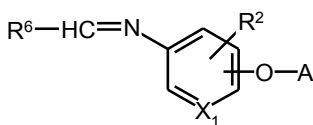
(1-48)



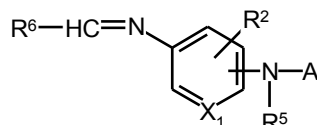
(1-49)

9. Інгібітор згідно з пунктом 1, який містить сполуку, вибрану з групи, що містить сполуки,

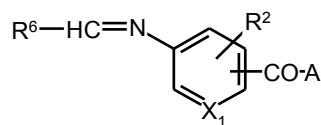
представлені загальними формулами (1-50)-(1-56) нижче, або її солі як діючий інгредієнт:



(1-50)

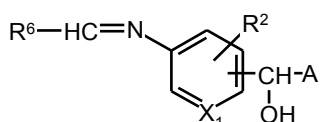


(1-51)

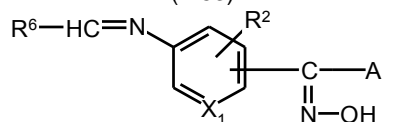


(1-52)

19

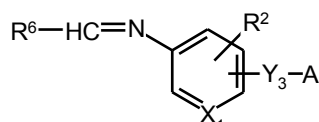


(1-53)



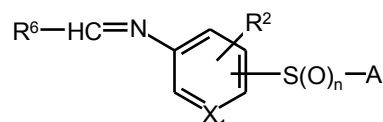
(1-56)

95978



(1-54)

20

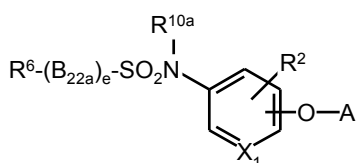


(1-55)

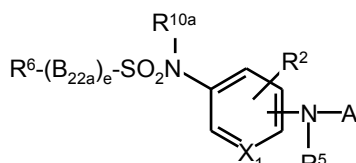
де  $\text{Y}_3$  представляє нижчу алкіленову групу.

10. Інгібітор згідно з пунктом 1, який містить сполуку, вибрану з групи, що містить сполуки,

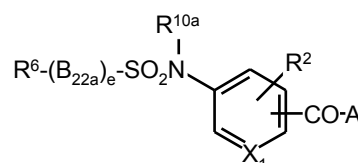
представлені загальними формулами (1-57)-(1-63) нижче, або її солі як діючий інгредієнт:



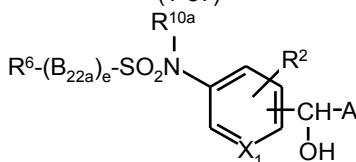
(1-57)



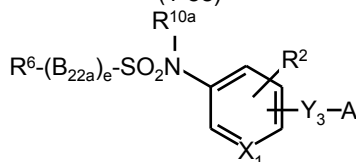
(1-58)



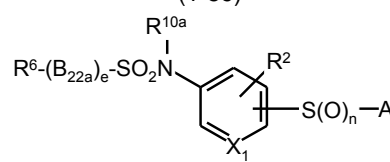
(1-59)



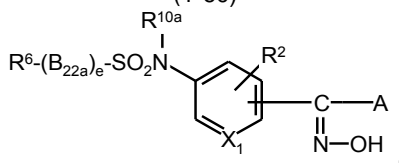
(1-60)



(1-61)



(1-62)

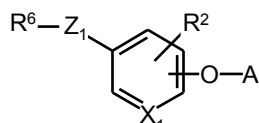


(1-63)

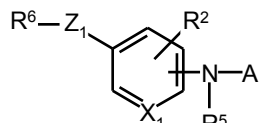
де  $\text{Y}_3$  представляє нижчу алкіленову групу.

11. Інгібітор згідно з пунктом 1, який містить сполуку, вибрану з групи, що містить сполуки,

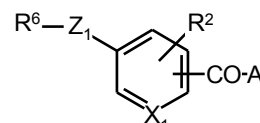
представлені загальними формулами (1-64)-(1-70) нижче, або її солі як діючий інгредієнт:



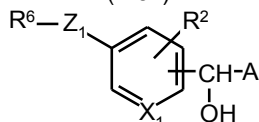
(1-64)



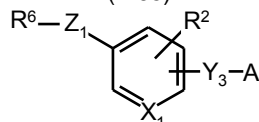
(1-65)



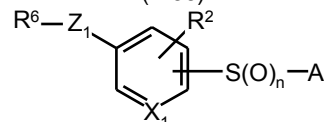
(1-66)



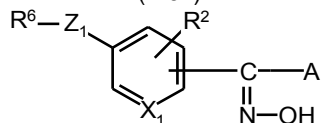
(1-67)



(1-68)



(1-69)



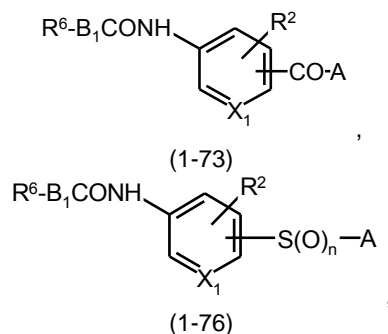
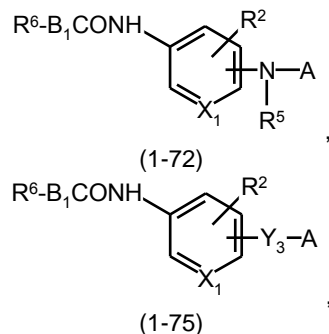
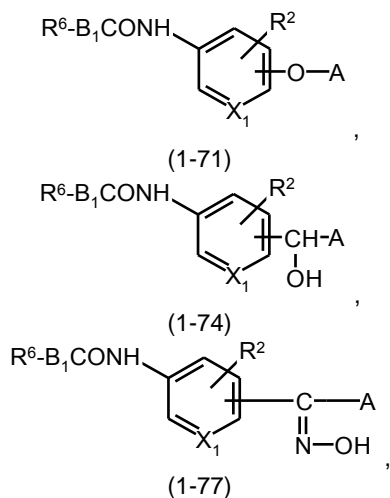
(1-70)

де  $\text{Y}_3$  представляє нижчу алкіленову групу, та  $\text{Z}_1$  представляє нижчу алкеніленову групу.

12. Інгібітор згідно з пунктом 1, який містить сполуку, вибрану з групи, що містить сполуки,

представлені загальними формулами (1-71)-(1-77)

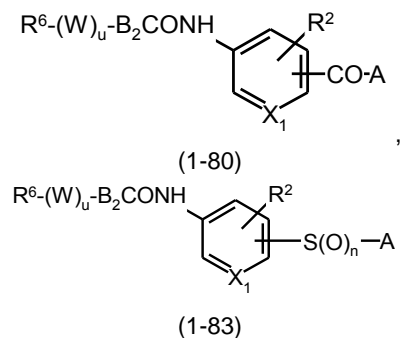
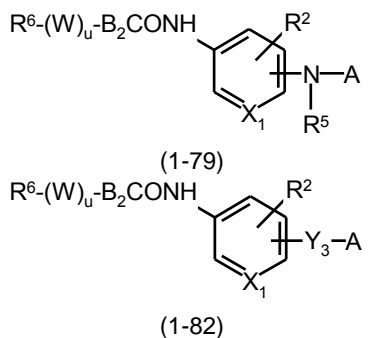
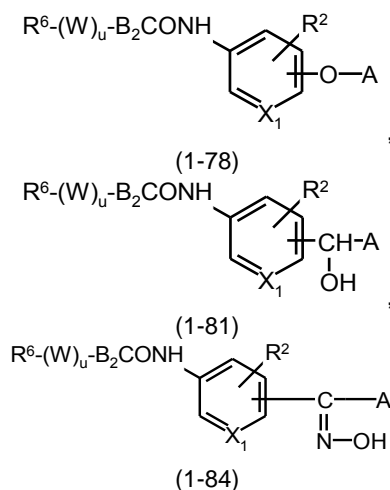
нижче, або її солі як діючий інгредієнт:



де Y<sub>3</sub> представляє нижчу алкіленову групу.

13. Інгібітор згідно з пунктом 1, який містить сполуку, вибрану з групи, що містить сполуки,

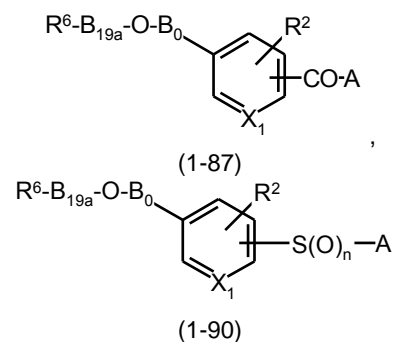
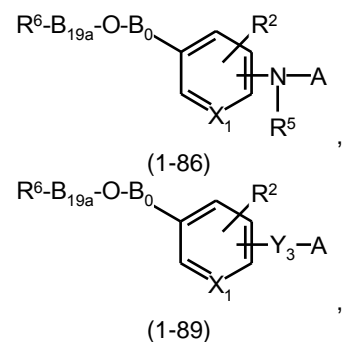
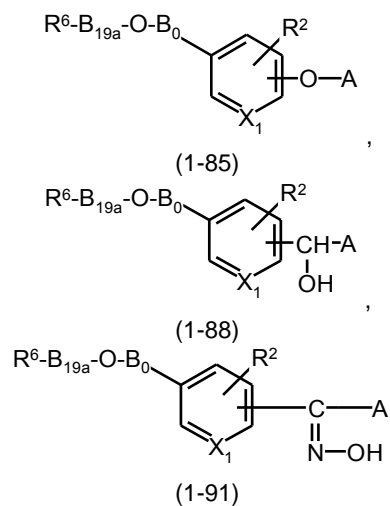
представлені загальними формулами (1-78)-(1-84)  
нижче, або її солі як діючий інгредієнт:



де Y<sub>3</sub> представляє нижчу алкіленову групу.

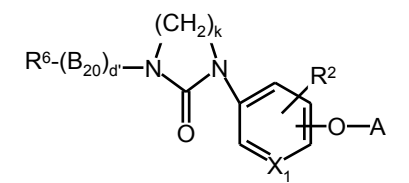
14. Інгібітор згідно з пунктом 1, який містить сполуку, вибрану з групи, що містить сполуки,

представлені загальними формулами (1-85)-(1-91)  
нижче, або її солі як діючий інгредієнт:

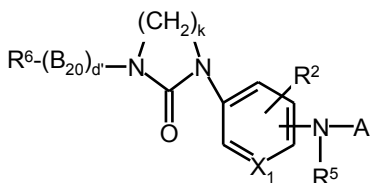


де  $Y_3$  представляє нижчу алкіленову групу.

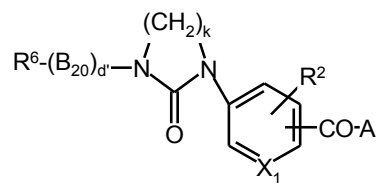
15. Інгібітор згідно з пунктом 1, який містить сполуку, вибрану з групи, що містить сполуки,



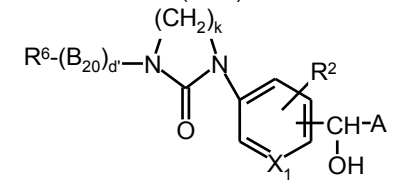
(1-92)



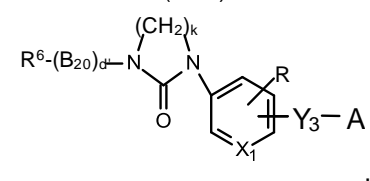
(1-93)



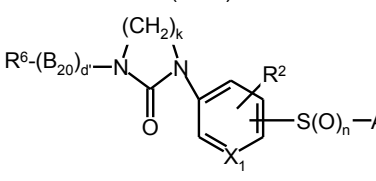
(1-94)



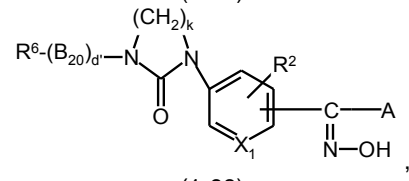
(1-95)



(1-96)



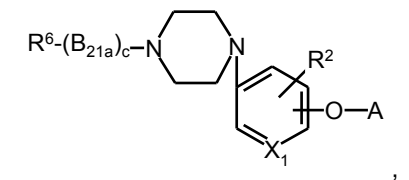
(1-97)



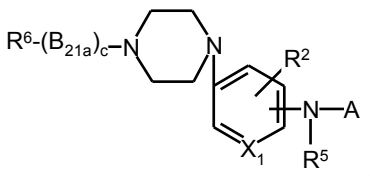
(1-98)

де  $Y_3$  представляє нижчу алкіленову групу.

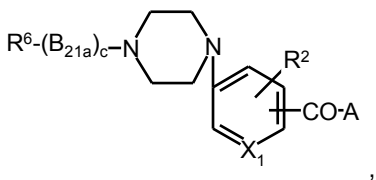
16. Інгібітор згідно з пунктом 1, який містить сполуку, вибрану з групи, що містить сполуки,



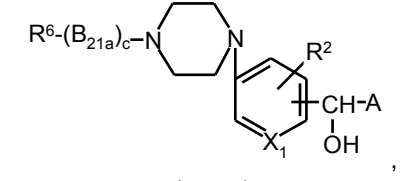
(1-99)



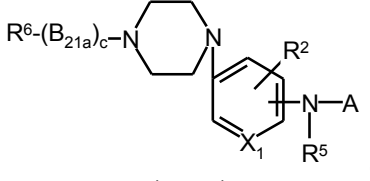
(1-100)



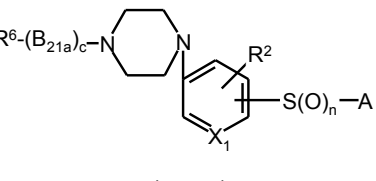
(1-101)



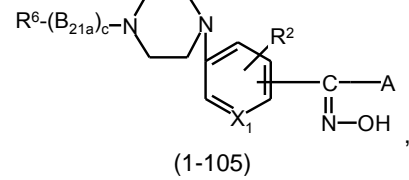
(1-102)



(1-103)



(1-104)



(1-105)

де  $Y_3$  представляє нижчу алкіленову групу.

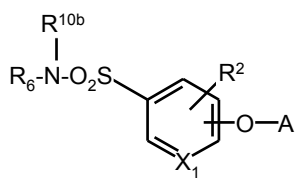
17. Інгібітор згідно з пунктом 1, який містить сполуку, вибрану з групи, що містить сполуки,

представлені загальними формулами (1-92)-(1-98) нижче, або її солі як діючий інгредієнт:

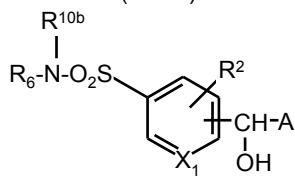
представлені загальними формулами (1-99)-(1-105) нижче, або її солі як діючий інгредієнт:

представлені загальними формулами (1-106)-(1-112) нижче, або її солі як діючий інгредієнт:

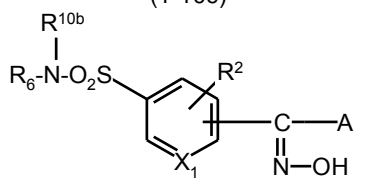
25



(1-106)

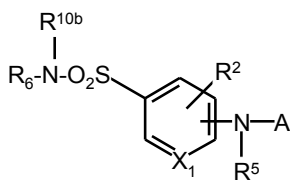


(1-109)

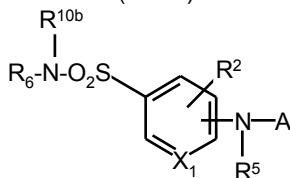


(1-112)

95978

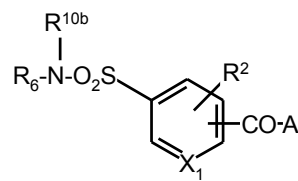


(1-107)

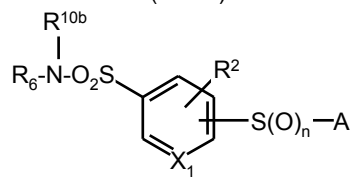


(1-110)

26



(1-108)

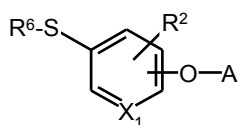


(1-111)

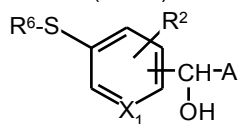
де  $Y_3$  представляє нижчу алкіленову групу.

18. Інгібітор згідно з пунктом 1, який містить сполуку, вибрану з групи, що містить сполуки,

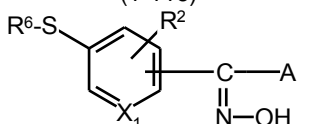
представлені загальними формулами (1-113)-(1-119) нижче, або її солі як діючий інгредієнт:



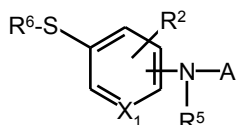
(1-113)



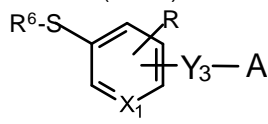
(1-116)



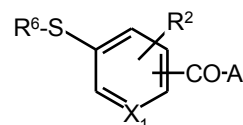
(1-119)



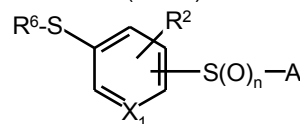
(1-114)



(1-117)



(1-115)

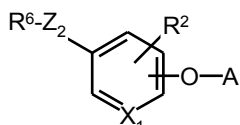


(1-118)

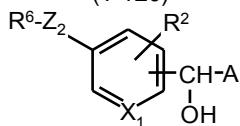
де  $Y_3$  представляє нижчу алкіленову групу.

19. Інгібітор згідно з пунктом 1, який містить сполуку, вибрану з групи, що містить сполуки,

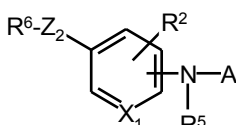
представлені загальними формулами (1-120)-(1-126) нижче, або її солі як діючий інгредієнт:



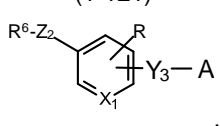
(1-120)



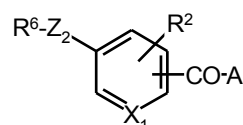
(1-123)



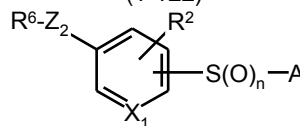
(1-121)



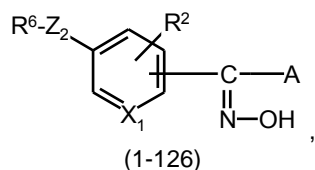
(1-124)



(1-122)

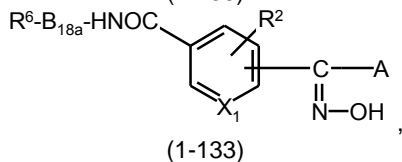
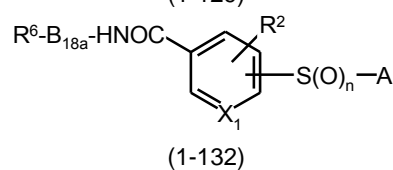
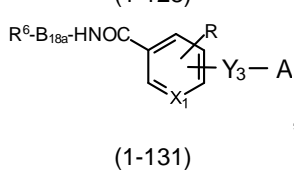
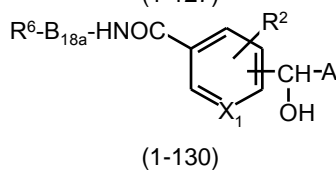
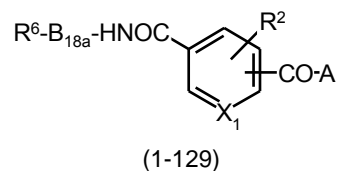
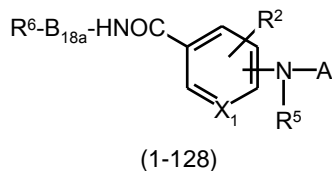
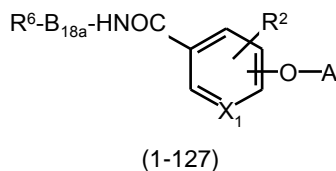


(1-125)



де  $Y_3$  представляє нижчу алкіленову групу, та  $Z_2$  представляє нижчу алкініленову групу.

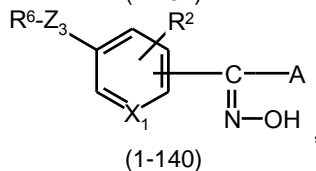
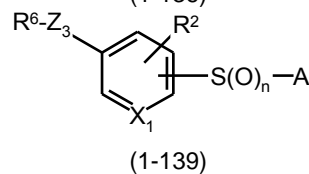
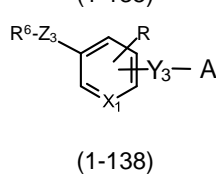
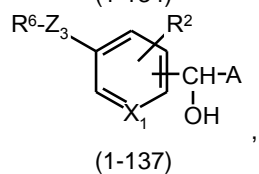
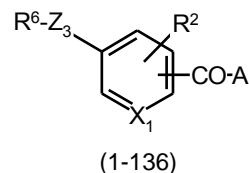
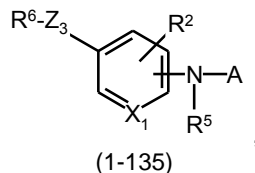
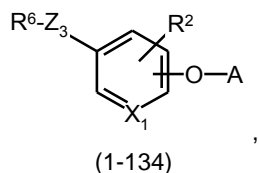
20. Інгібітор згідно з пунктом 1, який містить сполуку, вибрану з групи, що містить сполуки,



де  $Y_3$  представляє нижчу алкіленову групу.

21. Інгібітор згідно з пунктом 1, який містить сполуку, вибрану з групи, що містить сполуки,

представлені загальними формулами (1-134)-(1-140) нижче, або її солі як діючий інгредієнт:



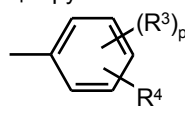
де  $Y_3$  представляє нижчу алкіленову групу, та  $Z_3$  представляє нижчу алкіленову групу або групу - $N(R^{8d})$ -.

22. Інгібітор згідно з будь-яким з пунктів 1-21, де  $Y$  - це група -O-.

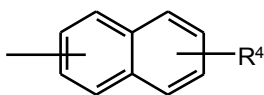
23. Інгібітор згідно з будь-яким з пунктів 1-21, де  $Y$  - це група - $N(R^5)$ -.

24. Інгібітор згідно з будь-яким з пунктів 1-21, де  $Y$  - це група -CO-, група -CH(OH)-, нижча алкіленова група, група -S(O) $_n$ - або група -C(=N-OH)-.

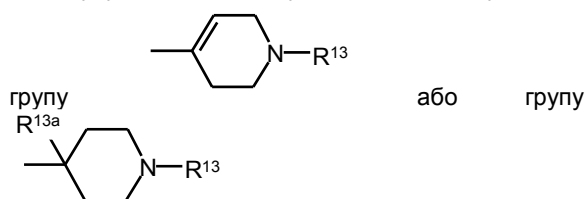
25. Інгібітор згідно з будь-яким з пунктів 1-21, де  $A$  - це група



26. Інгібітор згідно з будь-яким з пунктів 1-21, де  $A$  - це група



27. Інгібітор згідно з будь-яким з пунктів 1-21, де  $R^4$  представляє імідазоліл-нижчу алкільну групу, 1,2,4-триазоліл-нижчу алкільну групу, 1,2,3-триазоліл-нижчу алкільну групу, 1,2,5-триазоліл-нижчу алкільну групу, піразоліл-нижчу алкільну групу, піримідиніл-нижчу алкільну групу, що може мати оксогрупу як замісник у піримідиновому кільці, 3,5-діоксоізооксазолідін-4-іліден-нижчу алкільну групу, 1,2,4-оксадіазоліл-нижчу алкільну групу, що може мати нижчу алкільну групу як замісник у 1,2,4-оксадіазольному кільці, тіазолідиніл-нижчу алкільну групу, що може мати оксогрупу як замісник у тіазолідиновому кільці.



28. Інгібітор згідно з будь-яким з пунктів 1-21, представлений загальною формулою (1), де  $R^4$  представляє групу  $-(T)_1-N(R^{14})R^{15}$  ( $T$ ,  $R^{14}$  та  $R^{15}$  є такі, як визначено вище) та  $I$  представляє 0.

29. Інгібітор згідно з будь-яким з пунктів 1-21, де  $R^4$  - це група  $-(T)_1-N(R^{14})R^{15}$ , та  $l$  - це 1.

30. Інгібітор згідно з будь-яким з пунктів 1-21, де  $R^4$  - це група  $-(T)_1-N(R^{14})R^{15}$ , I - це 1, та T - це група  $-N(R^{17})-B_3-CO-$ .

31. Інгібітор згідно з будь-яким з пунктів 1-21, де  $R^4$  - це група  $-(T)_1-N(R^{14})R^{15}$ ,  $I$  - це 1, та  $T$  - це група  $-B_{19}-N(R^{18})-CO-$ .

32. Інгібітор згідно з будь-яким з пунктів 1-21, де  $R^4$  - це група  $-(T)_1-N(R^{14})R^{15}$ ,  $I$  - це 1, та  $T$  - це група  $-B_4-CO-$ .

33. Інгібітор згідно з будь-яким з пунктів 1-21, де  $R^4$  - це група  $-(T)_1-N(R^{14})R^{15}$ , I - це 1, та T - це група  $-Q-B_5-CO-$ .

34. Інгібітор згідно з будь-яким з пунктів 1-21, де  $R^4$  - це група  $-(T)_1-N(R^{14})R^{15}$ , I - це 1, та T - це група  $-B_6-N(R^{19})-B_7$ .

35. Інгібітор згідно з будь-яким з пунктів 1-21, де  $R^4$  - це група  $-(T)_1-N(R^{14})R^{15}$ , I - це 1, та T - це група  $-CO-B_{8-}$ .

36. Інгібітор згідно з будь-яким з пунктів 1-21, де  $R^4$  - це група  $-(T)_1-N(R^{14})R^{15}$ , I - це 1, та T - це група  $-CH(OH)-B_9-$ .

37. Інгібітор згідно з будь-яким з пунктів 1 -21, де  $R^4$  - це група  $-(T)_1-N(R^{14})R^{15}$ , I - це 1, та T - це група  $-CO-B_{10}-CO-$ .

38. Інгібітор згідно з будь-яким з пунктів 1-21, де  $R^4$  - це група  $-(T)_1-N(R^{14})R^{15}$ ,  $l$  - це 1, та  $T$  - це група  $-CH(OH)-B_{11}-CO-$ .

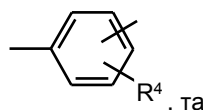
39. Інгібітор згідно з будь-яким з пунктів 1-21, де  $R^4$  - це група  $-(T)_1-N(R^{14})R^{15}$ , I - це 1, та T - це група  $-CO-$ .

40. Інгібітор згідно з будь-яким з пунктів 1-21, де  $R^4$  - це група  $-(T)_1-N(R^{14})R^{15}$ , I - це 1, та T це група  $-SO_2-$ .

41. Інгібітор згідно з будь-яким з пунктів 1 -21, де  $R^4$  - це група  $-(T)_1-N(R^{14})R^{15}$ ,  $I$  - це 1, та  $T$  - це група  $-B_{23a}-CO-CO-$ .

42. Інгібітор згідно з будь-яким з пунктів 1-21, де  $R^4$  - це група  $-(T)_1-N(R^{14})R^{15}$ ,  $I$  - це 1, та  $T$  - це нижча алкіленова група.

43. Інгібітор згідно з пунктом 1, який містить сполуку, вибрану з групи, що містить сполуки, представлені загальними формулами (1-1), (1-2), (1-8), (1-9), (1-15), (1-16), (1-29), (1-30), (1-43), (1-44), (1-57), (1-58), (1-64) та (1-65), або її солі як діючий інгредієнт, де Y - це група -O- або група -N(R<sup>5</sup>)-, A - це група


$$R^4 - \text{це група } -(T)i-N(R^{14})R^{15}.$$

44. Інгібітор згідно з пунктом 43, де І - це 1, та Т - це група  $-N(R^{17})-B_3-CO-$ .

45. Інгібітор згідно з пунктом 43, де І - це 1, та Т - це група  $-B_4-CO-$ .

46. Інгібітор згідно з пунктом 43, де І - це 1, та Т - це група -CO-.

47. Інгібітор згідно з пунктом 43, де  $I$  - це 0.

34. Інгібітор згідно з пунктом 1, який містить сполуку, вибрану з групи, що містить N-[6-(4-[[2-(4-піперонілпіперазин-1-іл)-2-оксоетил]етиламіно]-2-метоксифенокси)піридин-3-іл]-3,4-дихлорбензамід, N-[6-(4-[[2-(4-піперонілпіперазин-1-іл)-2-оксоетил]етиламіно]фенокси)піридин-3-іл]-4-трифторметилбензамід, N-[6-(4-[[2-(4-піперонілпіперазин-1-іл)-2-оксоетил]етиламіно]-2-фторфенокси)піридин-3-іл]-4-трифторметилбензамід, N-[6-(4-[[2-(4-піперонілпіперазин-1-іл)-2-оксоетил]метиламіно]-2-фторфенокси)піридин-3-іл]-4-трифторметилбензамід, N-[6-(4-[[2-(4-піперонілпіперазин-1-іл)-2-оксоетил]метиламіно]-2-метоксифенокси)піридин-3-іл]-4-трифторметилбензамід, N-[6-(4-[[2-(4-піперонілпіперазин-1-іл)-2-оксоетил]етиламіно]-2-метилфенокси)піридин-3-іл]-3,4-дихлорбензамід, N-[6-(4-[[2-(4-піперонілпіперазин-1-іл)-2-оксоетил]метиламіно]-2-метилфенокси)піридин-3-іл]-4-трифторметилбензамід, N-(6-{4-[3-(4-піперонілпіперазин-1-іл)-3-оксопропіл]фенокси)піридин-3-іл}-3,4-дихлорбензолсульфонамід, N-[6-(4-{4-[2-(4-піперонілпіперазин-1-іл)-2-оксоетил]піперазин-1-іл]фенокси)піридин-3-іл]-4-трифторметилбензамід, N-[6-(4-{4-[2-(4-піперонілпіперазин-1-іл)-2-оксоетил]піридин-1-іл}фенокси)піридин-3-іл]-4-трифторметилбензамід, N-(6-{4-{4-[2-(4-піперонілпіперазин-1-іл)-2-оксоетил]піридин-1-іл}фенільна)метиламіно]піридин-3-іл)-4-трифторметилбензамід, N-[6-(4-{4-[2-(4-бензилпіперазин-1-іл)-2-оксоетил]піридин-1-іл}-2-метилфенокси)піридин-3-іл]-4-трифторметилбензамід, N-[6-(4-{4-[2-(4-піперонілпіперазин-1-іл)-2-оксоетил]піридин-1-іл}-2-метилфенокси)піридин-3-іл]-4-

трифторметилбензамід, N-[6-(4-{4-[2-(4-піперонілпіперазин-1-іл)-2-оксоетил]піридин-3-іл}-3,4-дихлорбензамід, N-[6-[4-(4-бензилпіперазин-1-карбоніл)фенокси]піридин-3-іл]-4-трифторметилбензамід, N-[6-[4-(4-бензилпіперазин-1-карбоніл)фенокси]піридин-3-іл]-3,4-дихлорбензамід, N-[6-({4-[3-(4-піперонілпіперазин-1-іл)-3-оксопропіл]феніл}метиламіно)піридин-3-іл]-4-трифторметилбензамід, N-[6-(4-{[2-(4-піперонілпіперазин-1-іл)-2-оксоетил]етиламіно}-2-фторфенокси)піридин-3-іл]-3,4-дихлорбензамід, N-[6-(4-{[2-(4-піперонілпіперазин-1-іл)-2-оксоетил]метиламіно}-2-фторфенокси)піридин-3-іл]-3,4-дихлорбензамід, N-[6-(4-{[2-(4-піперонілпіперазин-1-іл)-2-оксоетил]метиламіно}-2-метоксифенокси)піридин-3-іл]-3,4-дихлорбензамід, N-[6-(4-{[2-(4-піперонілпіперазин-1-іл)-2-оксоетил]метиламіно}фенокси)піридин-3-іл]-3,4-дихлорбензамід, 1-{6-[4-{3-(4-піперонілпіперазин-1-іл)-3-оксопропіл]фенокси}піридин-3-іл)-3-(3,4-дихлорфеніл)-1-етилсечовина, N-[6-(4-[3-(4-піперонілпіперазин-1-іл)-3-оксопропіл]фенокси)піридин-3-іл]-4-трифторметилбензамід, N-[6-(4-{[2-(4-бензилпіперазин-1-іл)-2-оксоетил]метиламіно}-2-метилфенокси)піридин-3-іл]-4-трифторметилбензамід, N-[6-(4-{4-[2-(4-бензилпіперазин-1-іл)-2-оксоетил]піридин-1-іл}фенокси)піридин-3-іл]-3,4-дихлорбензамід, N-[6-(4-[3-(4-піперонілпіперазин-1-карбоніл)піридин-1-іл]фенокси)піридин-3-іл]-3,4-дихлорбензамід, N-[6-(4-{4-[2-(4-бензилпіперазин-1-іл)-2-оксоетил]піридин-1-іл}фенокси)піридин-3-іл]-4-трифторметилбензамід, N-[6-({4-[4-[2-(4-бензилпіперазин-1-іл)-2-оксоетил]піридин-1-іл}феніл]метиламіно)піридин-3-іл]-4-трифторбензоїл]феніл]піперазин-1-іл)-2-оксоетил]метиламіно}-2-метоксифенокси)піридин-3-іл]-4-трифторметилбензамід, 2-(4-піперонілпіперазин-1-іл)-N-(3-метил-4-[5-(4-трифторметилфеноксиметил)піридин-2-ілокси]феніл)-2-оксоацетамід, N-[6-(4-{[2-(4-піперонілпіперазин-1-іл)-2-оксоетил]метиламіно}-2-метилфенокси)піридин-3-іл]-2-фтор-4-трифторметилбензамід, N-[6-(4-{4-[2-(4-піперонілпіперазин-1-іл)-2-оксоетил]піридин-1-іл]-2-метоксифенокси)піридин-3-іл]-4-трифторметилбензамід та етилтер 4-(3-{3-метил-4-[5-(4-трифторметилбензоїламіно)піридин-2-ілокси]феніл}-2-оксогексагідропіримідин-1-

іл)бензойної кислоти, або її солі як діючий інгредієнт.

49. Інгібітор згідно з пунктом 1, де у зазначеній ароматичній сполуці, R<sup>14</sup> та R<sup>15</sup>, разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, зв'язуються один з одним, безпосередньо або за допомогою атома азоту, утворюючи 6-членну насичену гетероциклічну групу, та де як замісник у насиченій гетероциклічній групі присутня фенілзаміщена нижча алкільна група, яка може бути заміщена у фенільному кільці 1-2 групами як замісниками, вибраними з групи, що містить нижчу алканойльну групу, аміногрупу, яка може мати нижчу алканойльну групу як замісник, нижчу алкоксикарбонільну групу, ціаногрупу, нітрогрупу, фенільну групу, атом галогену, нижчу алкільну групу, яка може мати атом галогену як замісник, нижчу алкоксигрупу, яка може мати атом галогену як замісник, феніл-нижчу алкоксигрупу, гідроксильну групу та нижчу алкілендіоксигрупу.

50. Інгібітор згідно з пунктом 49, де фенілзаміщена нижча алкільна група, яка заміщена нижчою алкілендіоксигрупою, присутня як замісник у піперидинільній групі, яка є насиченою гетероциклічною групою.

51. Інгібітор згідно з пунктом 49 або 50, де X<sub>1</sub> - це атом азоту, та Y - це атом кисню.

52. Інгібітор згідно з пунктом 1 для запобігання або лікування симптомів або захворювань, пов'язаних з активацією STAT3.

53. Інгібітор активації STAT3 згідно з пунктом 52, де симптом або захворювання, пов'язане з активацією STAT3, - це аутоімунне захворювання, діабет, інфекція, захворювання центральної нервової системи, захворювання, пов'язані з раком або псоріаз.

54. Спосіб запобігання або лікування симптомів або захворювань, пов'язаних з активацією STAT3, шляхом введення пацієнту ефективної кількості ароматичної сполуки (1) або її солі згідно з пунктом 1.

55. Інгібітор згідно з пунктом 1 для запобігання або лікування симптомів або захворювань, пов'язаних з активацією STAT5.

56. Інгібітор згідно з пунктом 55, де симптом або захворювання, пов'язане з активацією STAT5, - це аутоімунне захворювання, алергія або гіперпролактинемія.

57. Спосіб запобігання або лікування симптомів або захворювань, пов'язаних з активацією STAT5, шляхом введення пацієнту ефективної кількості ароматичної сполуки (1) або її солі згідно з пунктом 1.

Галузь техніки  
[0001]  
Даний винахід стосується інгібітора активації  
STAT3/5.  
Рівень техніки  
[0002]  
Сімейство протеїнів STAT (сигнальні

трансдуктори та активатори транскрипції) є одним із зв'язуючи протеїнів і відіграє роль трансмісії інформації та активації транскрипції. В теперішній час, відомо, що сімейство STAT має 6 різних членів (STAT 1, STAT 2, STAT 3, STAT 4, STAT 5 та STAT 6) і декілька ізо-форм (STAT 1α, STAT 1β, STAT 3α, STAT3β, STAT5α та STAT5b). Активність



STAT регулюється стимуляцією різних цитокінів та мітогенів. Коли цитокін зв'язується з його рецептором, активується протеїн Януса тирозинкінази (JAK) асоційований з рецепторами.

[0003]

STAT 3 має домен SH2 (src гомологія 2), що здатний розпізнавати структуру специфічно фосфорилуючого тирозину. Вважається, що STAT 3 специфічно розпізнає фосфорилуючий тирозин в межах області клітини gp130 та передається у gp130 а тирозин фосфорилує за допомогою JAK. STAT 3, що має фосфорилуючий тирозин, утворює димер STAT 3 (гомодимер) через його домен SH2 або димер (гетеродимер) STAT 3 і STAT1, який переміщується у ядро, і розпізнає специфічну послідовність DNA та зв'язує її. Таким чином, відомо, що STAT3 регулює транскрипцію багатьох.

[0004]

Така роль in-vivo STAT3/5 розкрита у багатьох документах.

[0005]

Наприклад, у непатентному документі 1 описаний взаємозв'язок між активацією STAT 3 та IL-6-сигнальними мітками та між IL-6 та хронічними захворюваннями, як от хвороба Альцгеймера, ревматизм, хвороба Крона та хвороби, пов'язані з анемією та раком, як от кахексія (загальне виснаження).

[0006]

Крім того, у непатентному документі 2 описаний взаємозв'язок між активацією STAT 3 та вірусом Гепатиту С, у непатентному документі 3 окремо описаний взаємозв'язок між активацією STAT 3 та псоріазом. Більш того, непатентний документ 2 далі встановлює взаємозв'язок між STAT 3 та запальними захворюваннями і аутоімунними захворюваннями, а непатентний документ 4 далі встановлює взаємозв'язок між активацією STAT 3 та опистістю, діабетами, безпліддям, та температурними розладами, тощо, окремо. У непатентних документах 5 та 6, і т.д. описано, що STAT 5 - це вирішальний фактор у активації, викликаній IgE MC (мастоцит), та запальних та аутоімунних захворюваннях, і описують роль STAT 5 у виникненні алергій, запальних захворювань, гіперпролактинемії, та злоякісних опухолей.

[0007]

З іншої сторони, відомо, що існує ароматична сполука, що має інгібуючу дію продукування колагену (Патентний документ 1). Але, до цього часу не було відомо, що ароматична сполука, описана у Патентному документі 1, має інгібуючу дію щодо активації STAT 3/5.

[Патентний документ 1] WO2006/014012

[Патентний документ 2] US2001/0029250

[Непатентний документ 1] J. Gerontology; MEDICAL SCIENCES 2006, Vol.61A, No.6, 575-584

[Непатентний документ 2] J. Exp.Med. Vol.196, No. 5, 2002, 641-653

[Непатентний документ 3] Nature Medicine Vol.11, No.1, 2005,43-49

[Непатентний документ 4] PNAS March30, 2004, vol.101, no.13, 4661-4666

[Непатентний документ 5] J. Immunology, 2006, 177:3421-3426,

[Непатентний документ 6] Ann. Rheum. Dis. 2004; 63:67-71

ОПИС ВИНАХОДУ

[0008]

Об'єктом даного винаходу є створення інгібітора активації STAT 3/5.

[0009]

Винахідники даного винаходу провели інтенсивні дослідження ароматичної сполуки, яка описана у Патентному документі 1. В результаті вони встановили, що сполука має інгібуючу дію щодо активації STAT3/5. Даний винахід базується на цьому відкритті.

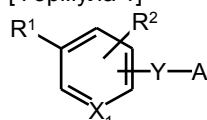
[0010]

Тому, даний винахід забезпечує STAT3/5 інгібітори активації, представлені наступними пунктами А-С.

Пункт А: інгібітор активації STAT3/5 містить ароматичну сполуку (в подальшому інколи називається ароматичною сполукою (1)), представлену загальною формулою або її сіллю у якості діючого інгредієнту:

[0011]

[Формула 1]



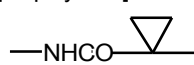
(1)

[0012]

де  $X_1$  представляє атом азоту або групу  $-CH=$ ,  $R^1$  представляє групу  $-Z-R^6$ ,  $Z$  представляє групу  $-N(R^8)-B-$ , групу  $-B-N(R^8)-$ , групу  $-B-O-$ , групу

[0013]

[Формула 2]

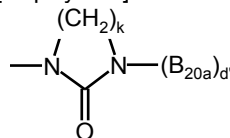


[0014]

групу  $-CO-$ , групу  $-CH(OH)-$ , групу  $-N(R^{9a})-CO-N-(R^{9b})-$ , групу  $-N=CH-$ , групу  $-N(R^{10a})-SO_2-(B_{22a})e-$ , нижчу алкениленову групу, групу  $-NHCO-B_{1-}$ , групу  $-NHCO-B_{2-}(W)u-$ , групу  $-B_0-O-B_{19a}-$ , групу

[0015]

[Формула 3]

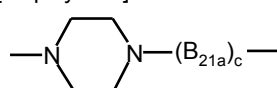


[0016]

групу

[0017]

[Формула 4]



[0018]

групу  $-SO_2-N(R^{10b})-$ , групу  $-S-$ , нижчу алкініленову групу, нижчу алкіленову групу, групу  $-N(R^{8d})-$  або групу  $-CO-NH-B_{18a}-$ ,

$R^8$  представляє атом водню, нижчу алкільну групу, що може мати нижчу алкокси групу у якості замісника, нижчу алканойльну групу, нижчу алкілсульфонільну групу або фенільну нижчу алкільну групу,

$V$  представляє групу  $-CO-$  або нижчу алкіленову групу,

$V_0$  представляє нижчу алкіленову групу,

$V_1$  представляє нижчу алкеніленову групу, що може мати фенільну групу у якості замісника,

$V_2$  представляє нижчу алкіленову групу, що може бути заміщена групою, що обрана з групи, що містить нижчу алкокси групу та фенільну групу,

$R^{9a}$  представляє атом водню або нижчу алкільну групу,

$R^{9b}$  представляє атом водню або нижчу алкільну групу,

$R^{10a}$  представляє атом водню або нижчу алкільну групу,

$V_{22a}$  представляє нижчу алкіленову групу або нижчу алкеніленову групу,

$e$  представляє 0 або 1,

$V_{18a}$  представляє нижчу алкіленову групу,

$V_{19a}$  представляє нижчу алкіленову групу,

$V_{20a}$  представляє нижчу алкіленову групу,

$V_{21a}$  представляє нижчу алкіленову групу,

$k$  представляє 2 або 3,

$c$  представляє 0 або 1,

$d'$  представляє 0 або 1,

$R^{10b}$  представляє атом водню або нижчу алкільну групу,

$R^{9d}$  представляє атом водню або нижчу алкільну групу,

$W$  представляє атом кисню, групу  $-NH-$ , або атом сірки,

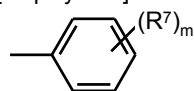
$u$  представляє 0 або 1,

$R^6$  представляє 5-15-членну моноциклічну, дициклічну або трициклічну насичену або ненасичену гетероциклічну групу, що має 1-4 атоми азоту, атоми кисню або атоми сірки (що може мати 1-3 замісники, що обрані з групи, яка містить оксо групу; нижчу алкокси групу, що може мати атом галогену у якості замісника; нижчу алкільну групу, що може мати атом галогену у якості замісника; атом галогену; нижчу алкілсульфонільну групу; фенільну групу, що може бути заміщена нижчою алкільною групою, що може мати атом галогену у фенільному кільці; нижчу алкілтіогрупу, пірролілну групу, бензоїлну групу; нижчу алканойльну групу; нижчу алкоксикарбонільну групу; та аміно групу, що може мати групу, обрану з групи, яка містить нижчу алкільну групу та нижчу алканойльну групу у якості замісника, у гетероциклічному кільці), адамантильну групу, нафтильну групу (що може мати 1-3 групи, обрані з групи, що містить нижчу алкільну групу, атом галогену, та аміно групу, що може мати групу, обрану з групи, яка містить нижчу алкільну групу та нижчу алканойльну групу у якості замісника, у нафталеновому кільці), алкільну групу, що може мати нижчу алкокси групу у якості замісника, циклоалкільну групу, що може бути заміщена групою, що обрана з групи, що містить амінозаміщену нижчу алкільну групу, що може мати нижчу алкільну групу та нижчу алкільну

групу, що може мати атом галогену у якості замісника, у циклоалкільному кільці, нижчу алкенільну групу, що може мати атом галогену у якості замісника, нижчу алканойльну групу, бензоїлну групу (що може мати 1-3 групи, обрані з групи, що містить нижчу алкільну групу, що може мати атом галогену та атом галогену, у якості замісників, у фенільному кільці), заміщену атомом галогену нижчу алкільну групу, циклоалкільну нижчу алкільну групу або групу

[0019]

[Формули 5]



[0020],

$R^7$  представляє атом водню, фенільну групу, карбокси групу, гідроксильну групу, атом галогену, нижчу алкільну групу, що може мати атом галогену у якості замісника, фенокси групу, нижчу алкокси групу, що може мати атом галогену у якості замісника, нижчу алкілендіоксигрупу, аміно групу, що може мати, у якості замісника, групу, обрану з групи, що містить нижчу алкільну групу, нижчу алканойльну групу, бензоїлну групу, та циклоалкільну групу, ціано групу, нижчу алканойльну групу, що може мати атом галогену у якості замісника, нижчу алкілсульфонільну групу, аміноссульфонільну групу, нижчу алкоксикарбонільну групу, нижчу алканойлокси групу, нижчу алкоксикарбонільну нижчу алкільну групу або а 5-або 6-членну насичену або ненасичену гетероциклічну групу, що має 1-4 атоми азоту, атоми кисню, або атоми сірки (що може мати оксо групу у гетероциклічному кільці),

$m$  представляє ціле від 1 до 5(коли  $m$  представляє 2-5, два - п'ять  $R^7$  можуть бути ідентичними або різними) та

$R^2$  представляє атом водню, атом галогену, або нижчу алкільну групу,

$Y$  представляє групу  $-O-$ , групу  $-N(R^5)-$ , групу  $-CO-$ , групу  $-CH(OH)-$ , нижчу алкіленову групу, групу  $-S(O)n-$ , або групу  $-C(=N-OH)-$ ,

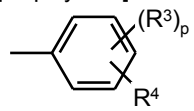
$R^5$  представляє атом водню, нижчу алкільну групу, нижчу алканойльну групу, бензоїлну групу, фенільну групу нижчого алкілу, або циклоалкільну групу,

$n$  представляє 0, 1, або 2,

$A$  представляє групу

[0021]

[Формула 6]

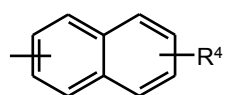


[0022]

або групу

[0023]

[Формула 7]



[0024]

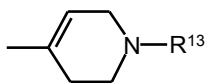
р представляє 1 або 2,

$R^3$  представляє атом водню, нижчу алкокси групу, атом галогену, нижчу алкільну групу, що може мати атом галогену у якості замісника, нижчу алкоксикарбонільну групу, карбокси групу, групу -CONR<sup>11</sup>R<sup>12</sup>, або ціано групу, де  $R^{11}$  and  $R^{12}$  можуть бути ідентичними або різними та кожний представляє атом водню, нижча алкільну групу, циклоалкільну групу, або фенільну групу, і  $R^{11}$  та  $R^{12}$ , разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, можуть приєднуватись один до одного, безпосередньо або за допомогою атому азоту, атому кисню, або атому сірки утворюючи 5-7-членне насичене гетероциклічне кільце,

$R^4$  представляє імідазоліл нижчу алкільну групу, 1,2,4-триазоліл нижчу алкільну групу, 1,2,3-триазоліл нижчу алкільну групу, 1,2,5-триазоліл нижчу алкільну групу, піразоліл нижчу алкільну групу, піримідиніл нижчу алкільну групу, що може мати оксо групу у якості замісника у піримідиновому кільці, 3,5-диоксоізооксазолідін-4-іліден нижчу алкільну групу, 1,2,4-оксадіазоліл нижчу алкільну групу, що може мати нижчу алкільну групу у якості замісника у 1,2,4-оксадіазольному кільці, тіазолідиніл нижчу алкільну групу, що може мати оксо групу у якості замісника у тіазолідиновому кільці, групу

[0025]

[Формула 8]

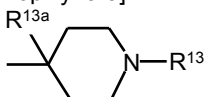


[0026]

, групу

[0027]

[Формула 9]



[0028]

або групу -(T)<sub>1</sub>-N( $R^{14}$ ) $R^{15}$ ,

$R^{13}$  представляє атом водню, нижчу алкільну групу, що може мати атом галогену у якості замісника, нижчу алканойльну групу, що може мати атом галогену у якості замісника, нижча алкоксикарбонільну групу, фенільну групу нижчого алкілу, що може мати нижчу алкілендіоксигрупу у якості замісника у фенільному кільці, імідазоліл нижчу алкільну групу, нижчу алкоксикарбонільну групу, алкільну групу, карбокси нижчу алкільну групу, бензоїльну групу, морфоліно-заміщену нижчу алканойльну групу, піперазиніл карбоніл нижчу алкільну групу, що може бути заміщена, у піперазиновому кільці, фенільною групою нижчого алкілу, що може мати нижча алкілендіоксигрупу у якості замісника у фенільному кільці, піперазиніл нижчу алканойльну групу, що може бути заміщена, у піперазиновому кільці, фенільною групою нижчого алкілу, що може мати нижчу алкілендіоксигрупу у якості замісника у фенільному кільці, морфолінокарбоніл-заміщену нижчу алкільну групу, або імідазоліл нижчу алканойльну групу,  $R^{13a}$  представляє атом водню

або гідроксильну групу, T представляє нижчу алкіленову групу, групу -N( $R^{17}$ )-B<sub>3</sub>-CO-, групу -B<sub>19</sub>-N( $R^{18}$ )-CO-, групу -B<sub>4</sub>-CO-, групу -Q-B<sub>5</sub>-CO-, групу -B<sub>6</sub>-N( $R^{19}$ )-B<sub>7</sub>-CO-, групу -CO-B<sub>8</sub>-, групу -CH(OH)-B<sub>9</sub>-, групу -CO-B<sub>10</sub>-CO-, групу -CH(OH)-B<sub>11</sub>-CO-, групу -CO-, групу -SO<sub>2</sub>-, або групу -B<sub>23a</sub>-CO-CO-, де  $R^{17}$  представляє атом водню, нижчу алкільну групу, циклоалкільну групу, циклоалкілкарбонільну групу, нижчу алканойльну групу, що може мати атом галогену у якості замісника, нижчу алкенільну групу, аміно-заміщену нижчу алканойльну групу, що може мати нижчу алкільну групу у якості замісника, або нижчу алкілсульфонільну групу,

B<sub>3</sub> представляє нижчу алкіленову групу,

B<sub>19</sub> представляє нижчу алкіленову групу,

$R^{18}$  представляє атом водню або нижчу алкільну групу,

B<sub>4</sub> представляє нижчу алкеніленову групу або нижчу алкіленову групу, що може мати гідроксильну групу у якості замісника,

Q представляє атом кисню або групу -S(O)n- (де n є як визначено вище),

B<sub>5</sub> представляє нижчу алкіленову групу,

B<sub>6</sub> представляє нижчу алкіленову групу,

$R^{19}$  представляє атом водню або нижчу алканойльну групу,

B<sub>7</sub> представляє нижчу алкіленову групу,

B<sub>8</sub> представляє нижчу алкіленову групу,

B<sub>9</sub> представляє нижчу алкіленову групу,

B<sub>10</sub> представляє нижчу алкіленову групу,

B<sub>11</sub> представляє нижчу алкіленову групу,

B<sub>23a</sub> представляє нижчу алкіленову групу,

1 представляє 0 або 1,

$R^{14}$  представляє атом водню або алкільну групу, що може мати гідроксильну групу у якості замісника,

$R^{15}$  представляє (2) гідроксильну групу-заміщену алкільну групу, (3) циклоалкільну групу, що може мати групу, обрану з групи, яка містить гідроксильну групу та нижчу алкільну групу у якості замісника, (4) фенокси нижчу алкільну групу, (5) фенільну групу, що може бути заміщена, у фенільному кільці, 1-3 групами, обраними з групи, що містить нижчу алкільну групу; нижчу алкокси групу, що може мати атом галогену у якості замісника; атом галогену; аміно нижчу алкокси групу, що може мати нижча алкільну групу у якості замісника; гідроксильну групу-заміщену нижчу алкільну групу; фенільну групу нижчого алкілу; нижчу алкокінільну групу; аміно групу, що може мати нижчу алкілсульфонільну групу у якості замісника; нижчу алкілтіогрупу; циклоалкільну групу; фенілтіо групу; адамантільну групу; аніліногрупу, що може мати атом галогену у якості замісника у фенільному кільці; нижчу алкоксикарбонільну групу; піперазинільну групу, що може мати нижчу алкільну групу у якості замісника у піперазиновому кільці; піролідинільну групу, що може мати оксогрупу у якості замісника у піролідіновому кільці; нижчу алканойламіно групу; ціано групу; та фенокси групу, (6) фенокси групу, (7) фенільну групу нижчого алкілу, що може бути заміщена, у фенільному кільці, 1-3 групами, обрані з групи, що містить атом галогену, нижча алкокси групу, що може мати атом галогену у якості

замісника, та нижчу алкільну групу, (8) фенільну групу нижчого алкілу, яка має нижчу алкілендіоксигрупу у якості замісника у фенільному кільці, (10) нижчу алкоксикарбонільну-заміщену нижчу алкільну групу, (11) карбокси-заміщену нижчу алкільну групу, (12) аміно групу, що може мати нижчу алканойльну групу у якості замісника, (13) 1,2,3,4-тетрагідрохінолілну групу, що може мати 1-3 групи, обрані з групи, що містить оксогрупу, нижчу алкокси групу, та нижчу алкілендіоксигрупу у якості замісника(ів) у тетрагідрохіноліновому кільці, (14) циклоалкіл нижчу алкільну групу, (15) піперазиніл нижчу алканойльну групу, що може бути заміщена, у піперазиновому кільці, фенільною групою нижчого алкілу, що може мати нижчу алкілендіоксигрупу у якості замісника у фенільному кільці, (16) піридил нижчу алкільну групу, (17) аміно групу-заміщену нижчу алкільну групу, що може мати групу, обрану з групи, яка містить нижчу алкільну групу та нижчу алканойльну групу у якості замісника, (18) нижчу алкокси нижчу алкільну групу, (19) імідазолільну групу, (20) імідазоліл нижчу алкільну групу, (21) 1,2,3,4-тетрагідрізохінолілкарбоніл-заміщену нижчу алкільну групу, (22) піперидинілкарбонільну групу, що може мати групу, обрану з групи, яка містить нижчу алкоксикарбонільну групу, фенільну групу нижчого алкілу, та фурил нижчу алкільну групу у якості замісника у піперидиновому кільці, (23) тіазолідиніл нижчу алканойльну групу, що може мати оксо групу у якості замісника у тіазолідиновому кільці, (24) піперидинільну групу, що може бути заміщена, у піперидиновому кільці, групою, що обрана з групи, що містить нижчу алкоксикарбонільну групу, фенільну групу нижчого алкілу, нижчу алкільну групу, бензоїльну групу, та фурил нижчу алкільну групу, (25) карбоніл нижчу алкільну групу заміщену групою

[0029]

[Формула 10]

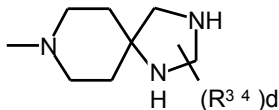


[0030]

(26) карбоніл нижчу алкільну групу, заміщену групою

[0031]

[Формула 11]



[0032]

(27) групу  $-CO-B_{20}-N(R^{36})R^{37}$ , (26a) пірролідиніл нижчу алкільну групу, (27a) морфоліно нижчу алкільну групу, (28a) феніл нижчу алкенільну групу, (29a) анілінокарбоніл нижчу алкільну групу, що може мати нижчу алкільну групу у якості замісника у фенільному кільці, (30a) індолілну групу, (31a) піперазиніл нижчу алкільну групу, що може мати, у якості замісника у піперазиновому кільці, групу, обрану з групи, що містить нижчу алкільну групу та фенільну групу нижчого алкілу,

що може мати нижчу алкілендіоксигрупу у якості замісника у фенільному кільці, (32a) амідино нижчу алкільну групу, що може мати нижчу алкільну групу у якості замісника, (33a) фторенільну групу, (34a) карбазолільну групу, що може мати нижчу алкільну групу у якості замісника у карбазольному кільці, (35a) амідино групу, що може мати нижчу алкільну групу у якості замісника, (36a) піперазиніл-заміщену оксалільну групу, що може мати 1-3 групи, обрані з групи, що містить фенільну групу нижчого алкілу (що може мати 1-3 групи, обрані з групи, що містить нижчу алкілендіоксигрупу та нижчу алкокси групу у якості замісника(ів) у фенільному кільці) та піридил нижчу алкільну групу у якості замісника(ів) у піперазиновому кільці, або (37a) ціано-заміщену нижчу алкільну групу,

$R^{34}$  представляє оксо групу або фенільну групу,

d представляє ціле від 0 до 3,

$B_{20}$  представляє нижчу алкіленову групу,

$R^{36}$  та  $R^{37}$ , разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, можуть приєднуватись один до одного, безпосередньо або за допомогою атому азоту, атому кисню, або атому сірки утворюючи 5-7-членну гетероциклічну групу, де, у гетероциклічному кільці, 1-3 феніл нижчі алкільні групи, що можуть мати нижчу алкілендіоксигрупу у фенільному кільці, можуть бути присутні у якості замісника(s),

$R^{14}$  та  $R^{15}$ , разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, можуть приєднуватись один до одного, безпосередньо або за допомогою атому азоту, атому кисню, або атому сірки утворюючи 5-10-членне насичене або ненасичене гетероциклічне кільце; або групу

[0033]

[Формула 12]



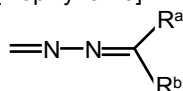
[0034]

де, у гетероциклічному кільці, можуть бути присутні 1-3 замісники, що обрані з групи, яка містить (28) феніл-заміщену нижчу алкільну групу, яка має 1-2 фенільні групи, що можуть бути заміщені 1-3 групами у фенільному кільці, що обрані з групи, що містить нижчу алканойльну групу, аміно групу, що може мати нижчу алканойльну групу у якості замісника, нижчу алкоксикарбонільну групу, ціано групу, нітро групу, фенільну групу, атом галогену, нижчу алкільну групу, що може мати атом галогену у якості замісника, нижчу алкокси групу, що може мати атом галогену у якості замісника, феніл нижчу алкокси групу, гідроксильну групу, та нижчу алкілендіоксигрупу, та що може мати піридилну групу у нижчій алкільній групі, (29) карбамоїльну групу, (30) піридил нижчу алкільну групу, що може мати, у якості замісника(ів) у піридиновому кільці, 1-3 групи, обрані з групи, що містить гідроксильну групу та нижчу алкільну групу, що може мати гідроксильну групу у якості замісника, (31) пірроліділ нижчу алкільну групу, що може мати 1-3 нижчі

алкільні групи у якості замісника(ів) у піррольному кільці, (32) бензоксазоліл нижчу алкільну групу, (33) бензотіазоліл нижчу алкільну групу, (34) фурил нижчу алкільну групу, (35) бензоїльну групу, що може бути заміщена, у фенільному кільці, 1-3 групами, обраними з групи, що містить ціано групу, аміно групу, що може мати нижчу алкілсульфонільну групу у якості замісника, атом галогену, нижчу алкокси групу, нижчу алкільну групу, що може мати атом галогену у якості замісника, тіазолідиніл нижчу алкільну групу, що може мати оксо групу у якості замісника у тіазолідиновому кільці, тіазолідиніліден нижчу алкільну групу, що може мати оксо групу у якості замісника у тіазолідиновому кільці, та нижчу алкілендіоксигрупу, (36) піримідинільну групу, (37) піразинільну групу, (38) піридинільну групу, (39) нижчу алкоксикарбонільну групу, (40) тіазолідиніл нижчу алканойльну групу, що може бути заміщена, у тіазолідиновому кільці, групою, що обрана з групи, що містить оксо групу та групу

[0035]

[Формула 13]



[0036]

(де  $\text{R}^a$  та  $\text{R}^b$  кожний представляють нижчу алкільну групу),

(41) нижчу алкільну групу, що може мати групу, обрану з групи, яка містить гідроксильну групу та атом галогену у якості замісника, (42) нижчу алканойльну групу, що може мати атом галогену у якості замісника, (43) фенільну групу, що може бути заміщена, у фенільному кільці, 1-3 групами, обраними з групи, що містить карбамоїльну групу, що може мати групу, обрану з групи, яка містить нижчу алкокси нижчу алкільну групу та нижчу алкільну групу, нижчу алкоксикарбонільну групу, карбокси групу, ціано групу, фенільну групу, атом галогену, нижчу алкільну групу, що може мати атом галогену у якості замісника, нижчу алкокси групу, що може мати атом галогену у якості замісника, бензоїльну групу, що може мати атом галогену у якості замісника у фенільному кільці, фенільну групу нижчого алкілу, що може мати атом галогену у якості замісника у фенільному кільці, та гідроксильну групу, (44) фенільну групу, що може мати нижчу алкілендіоксигрупу у якості замісника у фенільному кільці, (45) нафтил нижчу алкільну групу, (46) фенокси групу, що може бути заміщена, у фенільному кільці, 1-3 групами, обраними з групи, що містить ціано групу, нижчу алкільну групу, що може мати атом галогену у якості замісника, та нижчу алкокси групу, що може мати атом галогену у якості замісника, (47) фенокси нижчу алкільну групу, (48) феніл нижчу алкокси групу, що може бути заміщена, у фенільному кільці, 1-3 групами, обраними з групи, що містить атом галогену, нижчу алкільну групу, що може мати атом галогену у якості замісника, та нижчу алкокси групу, що може мати атом галогену у якості замісника, (49) групу  $-(\text{B}_{12}\text{CO})\text{t-N}(\text{R}^{20})\text{R}^{21}$ , (50) групу  $-(\text{CO})\text{o-B}_{13}\text{-N}(\text{R}^{22})\text{R}^{23}$ , (51) 1,2,3,4-

тетрагідронафтил-заміщену нижчу алкільну групу, що може бути заміщена, у 1,2,3,4-тетрагідронафталеновому кільці, 1-5 нижчими алкільними групами у якості замісника(ів), (52) циклоалкільну групу, що може мати гідроксильну групу у якості замісника, (53) піперидинільну групу, що може бути заміщена, у піперидиновому кільці, 1-3 нижчими алкільними групами у якості замісника(ів), (54) хіноліл нижчу алкільну групу, (55) 1,2,3,4-тетразоліл нижчу алкільну групу, що може мати групу, обрану з групи, яка містить нижчу алкільну групу та фенільну групу нижчого алкілу у якості замісника у тетразольному кільці, (56) тіазоліл нижчу алкільну групу, що може мати фенільну групу у якості замісника у тіазольному кільці, (57) бензоїл нижчу алкільну групу, що може мати 1-3 групи, обрані з групи, що містить нижчу алкокси групу та атом галогену у якості замісника(ів) у фенільному кільці, (58) піперидиніл нижчу алкільну групу, що може мати нижчу алкільну групу у якості замісника у піперидиновому кільці, (59) імідазолільну групу, що може мати 1-3 фенільні групи у якості замісника(ів) у імідазольному кільці, (60) бензімідазолільну групу, що може мати 1-3 нижчі алкільні групи у якості замісника(ів) у бензімідазольному кільці, (61) піридил нижчу алкокси групу, (62) 1,2,3,4-тетрагідрохіноліл нижчу алкільну групу, що може мати оксо група у якості замісника у тетрагідрохіноліновому кільці, (63) 1,3,4-оксадіазоліл нижчу алкільну групу, що може мати оксо групу у якості замісника у 1,3,4-у оксадізольному кільці, (64) циклоалкіл нижчу алкільну групу, (65) тетрагідропіранільну групу, (66) тієніл нижчу алкільну групу, (67) піримідинілкарбонільну групу, що може мати оксо групу у якості замісника у піримідиновому кільці, (68) гідроксильну групу, (69) карбокси групу, (70) нижчу алкокси нижчу алкільну групу, (71) нижчу алкокси нижчу алкокси групу, (72) а бензоїлокси групу, (73) нижчу алкоксикарбоніл нижчу алкокси групу, (74) карбокси нижчу алкокси групу, (75) фенокси нижчу алканойльну групу, (76) 1,2,3,4-тетрагідрохінолілкарбонільну групу, що може мати оксо групу у якості замісника у тетрагідрохіноліновому кільці, (77) фенілсульфонільну групу, (78) імідазоліл нижчу алканойльну групу, (79) імідазоліл нижчу алкільну групу, (80) піридилкарбонільну групу, (81) імідазолілкарбонільну групу, (82) нижчу алкоксикарбоніл нижчу алкільну групу, (83) карбокси нижчу алкільну групу, (84) групу  $-(\text{O-B}_{15})\text{s-CO-N}(\text{R}^{26})\text{R}^{27}$ , (85) групу  $-\text{N}(\text{R}^{28})\text{-CO-B}_{16}\text{-N}(\text{R}^{29})\text{R}^{30}$ , (86) групу  $-\text{N}(\text{R}^{31})\text{-B}_{17}\text{-CO-N}(\text{R}^{32})\text{R}^{33}$ , (87) бензоксазолільну групу, (88a) бензотієнільну групу, (89a) оксо групу, та (90a) 1,2,3,4-тетрагідрохінолільну групу, що може мати оксо групу у якості замісника у тетрагідрохіноліновому кільці,

$\text{B}_{12}$  представляє нижчу алкіленову групу,

t представляє 0 або 1,

$\text{R}^{20}$  та  $\text{R}^{21}$  можуть бути ідентичними або різними та кожний представляє атом водню; аміно групу, що може мати нижчу алкоксикарбонільну групу у якості замісника; бензоїльну групу, що

може мати 1-3 нижчі алкокси групи у якості замісника(ів) у фенільному кільці; нижчу алکیلну групу; нижчу алکیلну групу, що має 1-2 фенільні групи, що можуть бути заміщені, у фенільному кільці, 1-3 групами, обраними з групи, що містить нижчу алкоксикарбонільну групу, ціано групу, нітро групу, фенільну групу, атом галогену, нижчу алکیلну групу, що може мати атом галогену у якості замісника, нижчу алкокси групу, що може мати атом галогену у якості замісника, та нижчу алкілїогрупу; фенільну групу, що може бути заміщена, у фенільному кільці, 1-3 групами, обраними з групи, що містить нижчу алкокси групу, що може мати атом галогену у якості замісника та нижчу алکیلну групу, що може мати атом галогену у якості замісника; нижчу алкоксикарбонільну групу; циклоалкіл нижчу алکیلну групу; пірролідиніл нижчу алکیلну групу, що може мати 1-3 нижчі алکیلні групи, що можуть мати гідроксильну групу у якості замісника у пірролідиновому кільці; аміно-заміщену нижчу алکیلну групу, що може мати групу, обрану з групи, яка містить фенільну групу та нижчу алکیلну групу у якості замісника; 1,2,3,4-тетрагідронафтил-заміщену нижчу алکیلну групу, що може мати 1-5 нижчі алکیلні групи у якості замісника(ів) у 1,2,3,4-тетрагідронафталеновому кільці; нафтил нижчу алکیلну групу; піридил нижчу алکیلну групу; хіноліл нижчу алکیلну групу; 1,2,3,4-тетразоліл нижчу алکیلну групу, що може мати 1-3 групи, обрані з групи, що містить нижчу алکیلну групу та фенільну групу нижчого алкілу у якості замісника(ів) у тетразольному кільці; 1,2,4-триазоліл нижчу алکیلну групу; тетрагідрофурил нижчу алکیلну групу, що може мати гідроксильну групу у якості замісника у нижчій алکیلній групі; фенокси нижчу алکیلну групу, що може мати 1-3 групи, обрані з групи, що містить нижчу алکیلну групу та нітро групу у якості замісника(ів) у фенільному кільці; феніл нижчу алканоїльну групу; нижчу алканоїльну групу, що може мати атом галогену у якості замісника; імідазоліл нижчу алканоїльну групу; нижчу алкоксикарбонільну нижчу алکیلну групу; піридилну групу; або карбокси нижчу алکیلну групу, або циклоалکیلну групу; та  $R^{20}$  та  $R^{21}$ , разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, можуть приєднуватись один до одного, безпосередньо або за допомогою атому азоту, атому кисню, або атому сірки утворюючи 5-7-членне насичене гетероциклічне кільце (де, у гетероциклічному кільці, 1-3 замісники можуть бути присутні, що обрані з групи, яка містить нижчу алکیلну групу, фенільну групу, що може мати 1-3 групи, обрані з групи, що містить атом галогену та нижчу алکیلну групу, що може мати атом галогену у якості замісника(ів) у фенільному кільці, та фенільну групу нижчого алкілу, що може мати нижчу алкілендіоксигрупу у якості замісника у фенільному кільці),

о представляє 0 або 1,

$V_{13}$  представляє нижчу алкіленову групу,  $R^{22}$  and  $R^{23}$  можуть бути ідентичними або різними та кожний представляє атом водню, нижчу алکیلну групу, бензоїльну групу, що може мати 1-3 нижчі алкокси групи у якості замісника(ів) у

фенільному кільці, фенокси нижчу алکیلну групу, що може мати нижчу алکیلну групу у якості замісника у фенільному кільці, фенільну групу нижчого алкілу, або фенільну групу, або  $R^{22}$  та  $R^{23}$ , разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, можуть приєднуватись один до одного, безпосередньо або за допомогою атому азоту, атому кисню, або атому сірки утворюючи 5-7-членне насичене гетероциклічне кільце (де, у гетероциклічному кільці, можуть бути присутні 1-3 замісники, що обрані з групи, яка містить нижчу алکیلну групу та фенільну групу нижчого алкілу, що може мати нижчу алкілендіоксигрупу у якості замісника у фенільному кільці),

$V_{15}$  представляє нижчу алкіленову групу,

s представляє 0 або 1,

$R^{26}$  та  $R^{27}$  можуть бути ідентичними або різними та кожний представляє атом водню, нижчу алکیلну групу, фенільну групу нижчого алкілу, або імідазоліл нижчу алکیلну групу, і  $R^{26}$  та  $R^{27}$ , разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, можуть приєднуватись один до одного, безпосередньо або за допомогою атому азоту, атому кисню, або атому сірки утворюючи 5-7-членне насичене гетероциклічне кільце (де, у гетероциклічному кільці, 1-3 феніл нижчі алکیلні групи, що можуть мати нижчу алкілендіоксигрупу у якості замісника у фенільному кільці можуть бути присутні у якості замісника(ів)),

$R^{28}$  представляє атом водню або нижчу алکیلну групу,

$V_{16}$  представляє нижчу алкіленову групу,

$R^{29}$  та  $R^{30}$ , разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, можуть приєднуватись один до одного, безпосередньо або за допомогою атому азоту, атому кисню, або атому сірки утворюючи 5-7-членну гетероциклічну групу, де, у гетероциклічному кільці, можуть бути присутні 1-3 замісники, що обрані з групи, яка містить нижчу алکیلну групу, фенільну групу, та фенільну групу нижчого алкілу, що може мати нижчу алкілендіоксигрупу у якості замісника у фенільному кільці,

$R^{31}$  представляє атом водню або нижчу алکیلну групу,

$V_{17}$  представляє нижчу алкіленову групу,

$R^{32}$  and  $R^{33}$ , разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, можуть приєднуватись один до одного, безпосередньо або за допомогою атому азоту, атому кисню, або атому сірки, утворюючи 5-7-членну гетероциклічну групу (де, у гетероциклічному кільці, можуть бути присутні 1-3 замісники, що обрані з групи, яка містить нижчу алکیلну групу, фенільну групу, та фенільну групу нижчого алкілу, що може мати нижчу алкілендіоксигрупу у якості замісника у фенільному кільці).

[0037]

Однак, ця вищевказана сполука або її сіль відповідає наступним вимогам (i) - (v):

[0038]

(i) коли  $X_1$  представляє групу  $-CH=$ , тоді  $R^3$  представляє атом водню;

[0039]

(ii) коли  $X_1$  представляє групу  $-CH=$ , 1

представляє 1, T представляє  $-\text{CO}-$ , та  $\text{R}^{14}$  представляє атом водню або алкільну групу, що може мати гідроксильну групу у якості замісника,  $\text{R}^{15}$  представляє групу (24);

[0040]

(iii) коли  $\text{X}_1$  представляє групу  $-\text{CH}=\text{}$ , 1 представляє 1, та T представляє  $-\text{N}(\text{R}^{17})-\text{B}_3-\text{CO}-$ ,  $\text{R}^{14}$  та  $\text{R}^{15}$ , разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, можуть приєднуватись один до одного, безпосередньо або за допомогою атому азоту, атому кисню, або атому сірки утворюючи 5-10-членне насичене або ненасичене гетероциклічне кільце, де, у гетероциклічному кільці, 1-3 групи з (28) присутні у якості замісника(s);

[0041]

(iv) коли  $\text{X}_1$  представляє атом азоту, та 1 представляє 0, або коли  $\text{X}_1$  представляє атом азоту, 1 представляє 1, та T представляє  $-\text{CO}-$  або  $-\text{SO}_2$ ,  $\text{R}^{15}$  не є група (5), (7), (19), або (20); та

[0042]

(v) коли  $\text{R}^6$  представляє циклоалкільну групу, що може мати у циклоалкільному кільці, замісник, обраний з групи, що містить аміно-заміщену нижчу алкільну групу, що може мати нижчу алкільну групу та нижчу алкільну групу, що може мати атом галогену у якості замісника,  $\text{R}^4$  представляє групу  $-(\text{T})_1-\text{N}(\text{R}^{14})\text{R}^{15}$  (де T та 1 є такі, як визначено вище, і  $\text{R}^{14}$  та  $\text{R}^{15}$ , разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, можуть приєднуватись один до одного, безпосередньо або за допомогою атому азоту, атому кисню, або атому сірки утворюючи 5-10-членне насичене гетероциклічне кільце; або  $\text{R}^{14}$  та  $\text{R}^{15}$  утворюють групу

[0043]

[Формула 14]



[0044]

[0045]

Пункт В: Інгібітор STAT3 активації згідно з пунктом А для запобігання або лікування симптомів або захворювань, пов'язаних з активацією STAT3.

[0046]

Пункт С: Інгібітор активації STAT3 згідно з пунктом В, у якому симптом або захворювання, пов'язане з активацією STAT3, це аутоімунне захворювання, діабет, інфекція, центральні захворювання, захворювання, пов'язані з раком або псоріаз.

[0047]

Даний винахід також охоплює спосіб для запобігання або лікування симптомів або захворювань, пов'язаних з активацією STAT3 шляхом введення, пацієнту, ефективної дози ароматичної сполуки (1) або її солі згідно з пунктом А.

[0048]

Даний винахід також охоплює застосування сполуки (1) або її солі згідно з пунктом А для вироблення інгібітора активації STAT3/5.

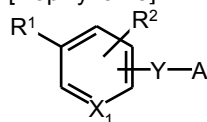
[0049]

Ароматична сполука (1) або її сіль, що слугує у якості діючого інгредієнту інгібітора активації STAT3/5 за даним винаходом - це ароматична сполука (1) або її сіль, представлена нижчеказаним пунктом 1 і переважно ароматичні сполуки або їх солі, представлені пунктами 2-48.

[0050]

Пункт 1: Ароматична сполука або її солі представлені загальною формулою:

[Формула 15]



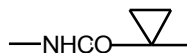
(1)

[0051]

де  $\text{X}_1$  представляє атом азоту або групу  $-\text{CH}=\text{}$ ,  $\text{R}^1$  представляє групу  $-\text{Z}-\text{R}^6$ , Z представляє групу  $-\text{N}(\text{R}^8)-\text{B}-$ , групу  $-\text{B}-\text{N}(\text{R}^8)-$ , групу  $-\text{B}_0-\text{O}-$ , групу

[0052]

[Формула 16]

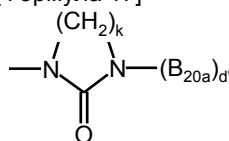


[0053]

групу  $-\text{CO}-$ , групу  $-\text{CH}(\text{OH})-$ , групу  $-\text{N}(\text{R}^{9a})-\text{CO}-\text{N}(\text{R}^{9b})-$ , групу  $-\text{N}=\text{CH}-$ , групу  $-\text{N}(\text{R}^{10a})-\text{SO}_2-(\text{B}_{22a})e-$ , нижчу алкеніленову групу, групу  $-\text{NHCO}-\text{B}_1-$ , групу  $-\text{NHCO}-\text{B}_2-(\text{W})u-$ , групу  $-\text{B}_0-\text{O}-\text{B}_{19a}-$ , групу

[0054]

[Формула 17]

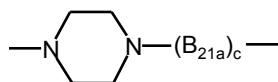


[0055]

групу

[0056]

[Формула 18]



[0057]

групу  $-\text{SO}_2-\text{N}(\text{R}^{10b})-$ , групу  $-\text{S}-$ , нижчу алкініленову групу, нижчу алкіленову групу, групу  $-\text{N}(\text{R}^{8d})-$  або групу  $-\text{CO}-\text{NH}-\text{B}_{18a}-$ ,

$\text{R}^8$  представляє атом водню, нижчу алкільну групу, що може мати нижчу алкокси групу у якості замісника, нижчу алканойльну групу, нижчу алкілсульфонільну групу або фенільну групу нижчого алкілу,

B представляє групу  $-\text{CO}-$  або нижчу алкіленову групу,

$\text{B}_0$  представляє нижчу алкіленову групу,

$\text{B}_1$  представляє нижчу алкеніленову групу, що може мати фенільну групу у якості замісника,

$\text{B}_2$  представляє нижчу алкіленову групу, що може бути заміщена групою, що обрана з групи, що містить нижчу алкокси групу та фенільну групу,

$\text{R}^{9a}$  представляє атом водню або нижчу алкільну групу,

$\text{R}^{9b}$  представляє атом водню або нижчу

алкільну групу,

$R^{10a}$  представляє атом водню або нижчу алкільну групу,

$B_{22a}$  представляє нижчу алкіленову групу або нижчу алкеніленову групу,

e представляє 0 або 1,

$B_{18a}$  представляє нижчу алкіленову групу,

$B_{19a}$  представляє нижчу алкіленову групу,

$B_{20a}$  представляє нижчу алкіленову групу,

$B_{21a}$  представляє нижчу алкіленову групу,

k представляє 2 або 3,

s представляє 0 або 1,

d' представляє 0 або 1,

$R^{10b}$  представляє атом водню або нижчу алкільну групу,

$R^{8d}$  представляє атом водню або нижчу алкільну групу,

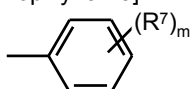
W представляє атом кисню, групу -NH-, або атом сірки,

u представляє 0 або 1,

$R^6$  представляє 5-15-членну моноциклічну, дициклічну або трициклічну насичену або ненасичену гетероциклічну групу, що має 1-4 атоми азоту, атоми кисню або атоми сірки (що може мати 1-3 замісники, що обрані з групи, яка містить оксо групу; нижчу алкокси групу, що може мати атом галогену у якості замісника; нижчу алкільну групу, що може мати атом галогену у якості замісника; атом галогену; нижчу алкілсульфонільну групу; фенільну групу, що може бути заміщена нижчою алкільною групою, що може мати атом галогену у фенільному кільці; нижчу алкілтіогрупу, пірролілну групу, бензоїлну групу; нижчу алканойлну групу; нижчу алкоксикарбонільну групу; та аміно групу що може мати групу, обрану з групи, яка містить нижчу алкільну групу та нижчу алканойлну групу у якості замісника, у гетероциклічному кільці), адамантильну групу, нафтильну групу (що може мати 1-3 групи, обрані з групи, що містить нижчу алкільну групу, атом галогену, та аміно групу що може мати групу, обрану з групи, яка містить нижчу алкільну групу та нижчу алканойлну групу у якості замісника, у нафталеновому кільці), алкільну групу, що може мати нижчу алкокси групу у якості замісника, циклоалкільну групу, що може бути заміщена групою, що обрана з групи, що містить амінозаміщену нижчу алкільну групу, що може мати нижчу алкільну групу та нижчу алкільну групу, що може мати атом галогену у якості замісника, у циклоалкільному кільці, нижчу алкенільну групу, що може мати атом галогену у якості замісника, нижчу алканойлну групу, бензоїлну групу (що може мати 1-3 групи, обрані з групи, що містить нижчу алкільну групу, що може мати атом галогену та атом галогену, у якості замісників, у фенільному кільці), атом галогену заміщена нижчу алкільну групу, циклоалкіл нижчу алкільну групу або групу

[0058]

[Формула 19]



[0059]

$R^7$  представляє атом водню, фенільну групу, карбокси групу, гідроксильну групу, атом галогену, нижчу алкільну групу, що може мати атом галогену у якості замісника, фенокси групу, нижчу алкокси групу, що може мати атом галогену у якості замісника, нижчу алкілендіоксигрупу, аміно групу що може мати, у якості замісника, групу, обрану з групи, що містить нижчу алкільну групу, нижчу алканойлну групу, бензоїлну групу, та циклоалкільну групу, ціано групу, нижчу алканойлну групу, що може мати атом галогену у якості замісника, нижчу алкілсульфонільну групу, аміносудфонільну групу, нижчу алкоксикарбонільну групу, нижчу алканойлокси групу, нижчу алкоксикарбонільна нижчу алкільну групу або 5- або 6-членну насичену або ненасичену гетероциклічну групу, що має 1-4 атоми азоту, атоми кисню, або атоми сірки (що може мати оксо групу у гетероциклічному кільці),

m представляє ціле від 1 до 5(коли m представляє 2-5, два - п'ять  $R^7$  можуть бути ідентичними або різними) та  $R^2$  представляє атом водню, атом галогену, або нижчу алкільну групу,

Y представляє групу -O-, групу -N( $R^5$ )-, групу -CO-, групу -CH(OH)-, нижчу алкіленову групу, групу -S(O)n-, або групу -C(=N-OH)-,

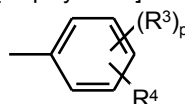
$R^5$  представляє атом водню, нижчу алкільну групу, нижчу алканойлну групу, бензоїлну групу, фенільну групу нижчого алкілу, або циклоалкільну групу,

n представляє 0, 1, або 2,

A представляє групу

[0060]

[Формула 20]

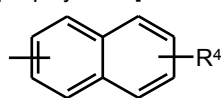


[0061]

або групу

[0062]

[Формула 21]



[0063]

p представляє 1 або 2,

$R^3$  представляє атом водню, нижчу алкокси групу, атом галогену, нижчу алкільну групу, що може мати атом галогену у якості замісника, нижчу алкоксикарбонільну групу, карбокси групу, групу -CONR<sup>11</sup>R<sup>12</sup>, або ціано групу, де  $R^{11}$  та  $R^{12}$  можуть бути ідентичними або різними та кожний представляє атом водню, нижчу алкільну групу, циклоалкільну групу, або фенільну групу, та  $R^{11}$  та  $R^{12}$ , разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, можуть приєднуватись один до одного, безпосередньо або за допомогою атому азоту, атом кисню, або атом сірки утворюючи 5-7-членне насичене гетероциклічне кільце,

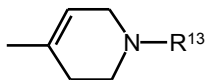
$R^4$  представляє імідазоліл нижчу алкільну групу, 1,2,4-триазоліл нижчу алкільну групу, 1,2,3-триазоліл нижчу алкільну групу, 1,2,5-триазоліл



нижчу алкільну групу, піразоліл нижчу алкільну групу, піримідиніл нижчу алкільну групу, що може мати оксо групу у якості замісника у піримідиновому кільці, 3,5-диоксоізооксазолідин-4-іліден нижчу алкільну групу, 1,2,4-оксадіазоліл нижчу алкільну групу, що може мати нижчу алкільну групу у якості замісника у 1,2,4-оксадіазольному кільці, тiazолідиніл нижчу алкільну групу, що може мати оксо групу у якості замісника у тiazолідиновому кільці, групу

[0064]

(Формула 22)

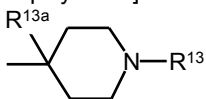


[0065]

групу

[0066]

(Формула 23)



[0067]

або групу  $-(T)_1-N(R^{14})R^{15}$ ,

$R^{13}$  представляє атом водню, нижчу алкільну групу, що може мати атом галогену у якості замісника, нижчу алканойльну групу, що може мати атом галогену у якості замісника, нижчу алкоксикарбонільну групу, фенільну групу нижчого алкілу що може мати нижчу алклендиоксигрупу у якості замісника у фенільному кільці, імідазоліл нижчу алкільну групу, нижчу алкоксикарбонільну групу, карбокси нижчу алкільну групу, бензоїльну групу, морфоліно-заміщену нижчу алканойльну групу, піперазиніл карбоніл нижчу алкільну групу, що може бути заміщена, у піперазиновому кільці, фенільною групою нижчого алкілу що може мати нижчу алклендиоксигрупу у якості замісника у фенільному кільці, піперазиніл нижчу алканойльну групу, що може бути заміщена, у піперазиновому кільці, фенільною групою нижчого алкілу що може мати нижчу алклендиоксигрупу у якості замісника у фенільному кільці, морфолінокарбоніл-заміщену нижчу алкільну групу, або імідазоліл нижчу алканойльну групу,

$R^{13a}$  представляє атом водню або гідроксильну групу,

$T$  представляє нижчу алкіленову групу, групу  $-N(R^{17})-B_3-CO-$ , групу  $-B_{19}-N(R^{18})-CO-$ , групу  $-B_4-CO-$ , групу  $-Q-B_5-CO-$ , групу  $-B_6-N(R^{19})-B_7-CO-$ , групу  $-CO-B_8-$ , групу  $-CH(OH)-B_9-$ , групу  $-CO-B_{10}-CO-$ , групу  $-CH(OH)-B_{11}-CO-$ , групу  $-CO-$ , групу  $-SO_2-$ , або групу  $-B_{23a}-CO-CO-$ ,

де  $R^{17}$  представляє атом водню, нижчу алкільну групу, циклоалкільну групу, циклоалкілкарбонільну групу, нижчу алканойльну групу, що може мати атом галогену у якості замісника, нижчу алкенільну групу, аміно-заміщену нижчу алканойльну групу, що може мати нижчу алкільну групу у якості замісника, або нижчу алкілсульфонільну групу,

$B_3$  представляє нижчу алкіленову групу,

$B_{19}$  представляє нижчу алкіленову групу,

$R^{18}$  представляє атом водню або нижчу алкільну групу,

$B_4$  представляє нижчу алкіленову групу або нижчу алкіленову групу що може мати гідроксильну групу у якості замісника,

$Q$  представляє атом кисню або групу  $-S(O)n-$  (де  $n$  є як визначено вище),

$B_5$  представляє нижчу алкіленову групу,

$B_6$  представляє нижчу алкіленову групу,

$R^{19}$  представляє атом водню або нижчу алканойльну групу,

$B_7$  представляє нижчу алкіленову групу,

$B_8$  представляє нижчу алкіленову групу,

$B_9$  представляє нижчу алкіленову групу,

$B_{10}$  представляє нижчу алкіленову групу,

$B_{11}$  представляє нижчу алкіленову групу,

$B_{23a}$  представляє нижчу алкіленову групу,

$1$  представляє 0 або 1,

$R^{14}$  представляє атом водню або алкільну групу, що може мати гідроксильну групу у якості замісника,

$R^{15}$  представляє (2) гідроксильну групу-заміщену алкільну групу, (3) циклоалкільну групу, що може мати групу, обрану з групи, яка містить гідроксильну групу та нижчу алкільну групу у якості замісника, (4) фенокси нижчу алкільну групу, (5) фенільну групу, що може бути заміщена, у фенільному кільці, 1-3 групами, обраними з групи, що містить нижчу алкільну групу; нижчу алкокси групу, що може мати атом галогену у якості замісника; атом галогену; аміно нижчу алкокси групу, що може мати нижчу алкільну групу у якості замісника; гідроксильну групу-заміщену нижчу алкільну групу; фенільну групу нижчого алкілу; нижчу алкокінільну групу; аміно групу що може мати нижчу алкілсульфонільну групу у якості замісника; нижчу алкілтіогрупу; циклоалкільну групу; фенілтіо групу; адамантільну групу; аніліно групу що може мати атом галогену у якості замісника у фенільному кільці; нижчу алкоксикарбонільну групу; піперазинільну групу, що може мати нижчу алкільну групу у якості замісника у піперазиновому кільці; пірролідинільну групу, що може мати оксо групу у якості замісника у пірролідиновому кільці; нижчу алканойламіно групу; ціано групу; та фенокси групу, (6) фенокси групу, (7) фенільну групу нижчого алкілу що може бути заміщена, у фенільному кільці, 1-3 групами, обраними з групи, що містить атом галогену, нижчу алкокси групу, що може мати атом галогену у якості замісника, та нижчу алкільну групу, (8) фенільну групу нижчого алкілу, що має нижчу алклендиоксигрупу у якості замісника у фенільному кільці, (10) нижчу алкоксикарбонільну-заміщену нижчу алкільну групу, (11) карбокси-заміщену нижчу алкільну групу, (12) аміно групу що може мати нижчу алканойльну групу у якості замісника, (13) 1,2,3,4-тетрагідрохінолільну групу, що може мати 1-3 групи, обрані з групи, що містить оксо групу, нижчу алкокси групу, та нижчу алклендиоксигрупу у якості замісника(ів) у тетрагідрохіноліновому кільці, (14) циклоалкіл нижчу алкільну групу, (15) піперазиніл нижчу алканойльну групу, що може бути заміщена, у

піперазиновому кільці, фенільною групою нижчого алкілу що може мати нижчу алкілендіоксигрупу у якості замісника у фенільному кільці, (16) піридил нижчу алкільну групу, (17) аміно групу-заміщену нижчу алкільну групу, що може мати групу, обрану з групи, яка містить нижчу алкільну групу та нижчу алканоїльну групу у якості замісника, (18) нижчу алкокси нижчу алкільну групу, (19) імідазолільну групу, (20) імідазоліл нижчу алкільну групу, (21) 1,2,3,4-тетрагідроізохінолілкарбоніл-заміщену нижчу алкільну групу, (22) піперидинілкарбонільну групу, що може мати групу, обрану з групи, яка містить нижчу алкоксикарбонільну групу, фенільну групу нижчого алкілу, та фурил нижчу алкільну групу у якості замісника у піперидиновому кільці, (23) тіазолідиніл нижчу алканоїльну групу, що може мати оксо групу у якості замісника у тіазолідиновому кільці, (24) піперидинільну групу, що може бути заміщена, у піперидиновому кільці, групою, що обрана з групи, що містить нижчу алкоксикарбонільну групу, фенільну групу нижчого алкілу, нижчу алкільну групу, бензоїльну групу, та а фурил нижчу алкільну групу, (25) а карбоніл нижчу алкільну групу заміщену групою

[0068]

[Формула 24]

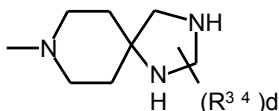


[0069]

(26) карбоніл нижчу алкільну групу заміщену групою

[0070]

[Формула 25]



[0071]

(27) групу  $-CO-B_{20}-N(R^{36})R^{37}$ , (26a) пірролідиніл нижчу алкільну групу, (27a) морфоліно нижчу алкільну групу, (28a) феніл нижчу алкенільну групу, (29a) анілінокарбоніл нижчу алкільну групу, що може мати нижчу алкільну групу у якості замісника у фенільному кільці, (30a) індоільну групу, (31a) піперазиніл нижчу алкільну групу, що може мати, у якості замісника у піперазиновому кільці, групу, обрана з групи, що містить нижчу алкільну групу та фенільну групу нижчого алкілу що може мати нижчу алкілендіоксигрупу у якості замісника у фенільному кільці, (32a) амідіно нижчу алкільну групу, що може мати нижчу алкільну групу у якості замісника, (33a) фторенільну групу, (34a) карбазолільну групу, що може мати нижчу алкільну групу у якості замісника у карбазольному кільці, (35a) амідіно групу що може мати нижчу алкільну групу у якості замісника, (36a) піперазиніл-заміщену оксалільну групу, що може мати 1-3 групи, обрані з групи, що містить фенільну групу нижчого алкілу (що може мати 1-3 групи, обрані з групи, що містить нижчу алкілендіоксигрупу та нижчу алкокси групу у якості замісника(ів) у фенільному кільці) та а

піридил нижчу алкільну групу у якості замісника(ів) у піперазиновому кільці, або (37a) ціано-заміщену нижчу алкільну групу,

$R^{34}$  представляє оксо групу або фенільну групу,

d представляє ціле від 0 до 3,

$B_{20}$  представляє нижчу алкіленову групу,

$R^{36}$  та  $R^{37}$ , разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, можуть приєднуватись один до одного, безпосередньо або за допомогою атому азоту, атому кисню, або атому сірки утворюючи 5-7-членну гетероциклічну групу, де, у гетероциклічному кільці, 1-3 феніл нижчі алкільні групи, що можуть мати нижчу алкілендіоксигрупу у фенільному кільці, можуть бути присутні у якості замісника(ів),

$R^{14}$  та  $R^{15}$ , разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, можуть приєднуватись один до одного, безпосередньо або за допомогою атому азоту, атому кисню, або атому сірки утворюючи 5-10-членне насичене або ненасичене гетероциклічне кільце; або групу

[0072]

[Формула 26]



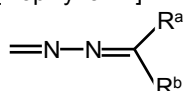
[0073]

де, у гетероциклічному кільці, можуть бути присутні 1-3 замісники, що обрані з групи, яка містить (28) феніл-заміщену нижчу алкільну групу, що має 1-2 фенільні групи що може бути заміщена 1-3 групами у фенільному кільці, обрані з групи, що містить нижчу алканоїльну групу, аміно групу що може мати нижчу алканоїльну групу у якості замісника, нижчу алкоксикарбонільну групу, ціано групу, нітро групу, фенільну групу, атом галогену, нижчу алкільну групу, що може мати атом галогену у якості замісника, нижчу алкокси групу, що може мати атом галогену у якості замісника, феніл нижчу алкокси групу, гідроксильну групу, та нижчу алкілендіоксигрупу, та що може мати піридилільну групу у нижчій алкільній групі, (29) карбамоїльну групу, (30) піридил нижчу алкільну групу, що може мати, у якості замісника(ів) у піридиновому кільці, 1-3 групи, обрані з групи, що містить гідроксильну групу та нижчу алкільну групу, що може мати гідроксильну групу у якості замісника, (31) пірроліл нижчу алкільну групу, що може мати 1-3 нижча алкільні групи у якості замісника(ів) у піррольовому кільці, (32) бензоксазоліл нижчу алкільну групу, (33) бензотіазоліл нижчу алкільну групу, (34) фурил нижчу алкільну групу, (35) бензоїльну групу, що може бути заміщена, у фенільному кільці, 1-3 групами, обраними з групи, що містить ціано групу, аміно групу що може мати нижчу алкілсульфонільну групу у якості замісника, атом галогену, нижчу алкокси групу, нижчу алкільну групу, що може мати атом галогену у якості замісника, тіазолідиніл нижчу алкільну групу, що може мати оксо групу у якості замісника у тіазолідиновому кільці, тіазолідиніліден нижчу алкільну групу, що може мати оксо групу у якості замісника у тіазолідиновому кільці, та нижчу

алкілендіоксигрупу, (36) піримідинільну групу, (37) піразинільну групу, (38) піридинільну групу, (39) нижчу алкоксикарбонільну групу, (40) тiazолідиніл нижчу алканойльну групу, що може бути заміщена, у тiazолідиновому кільці, групою, що обрана з групи, що містить оксо групу та групу

[0074]

[Формула 27]



[0075]

(де  $\text{R}^a$  та  $\text{R}^b$  кожний представляють нижчу алкільну групу),

(41) нижчу алкільну групу, що може мати групу, обрану з групи, яка містить гідроксильну групу та атом галогену у якості замісника, (42) нижчу алканойльну групу, що може мати атом галогену у якості замісника, (43) фенільну групу, що може бути заміщена, у фенільному кільці, 1-3 групами, обраними з групи, що містить карбамоїльну групу, що може мати групу, обрану з групи, яка містить нижчу алкокси нижчу алкільну групу та нижчу алкільну групу, нижчу алкоксикарбонільну групу, карбокси групу, ціано групу, фенільну групу, атом галогену, нижчу алкільну групу, що може мати атом галогену у якості замісника, нижчу алкокси групу, що може мати атом галогену у якості замісника, бензоїльну групу, що може мати атом галогену у якості замісника у фенільному кільці, фенільну групу нижчого алкілу що може мати атом галогену у якості замісника у фенільному кільці, та гідроксильну групу, (44) фенільну групу, що може мати нижчу алкілендіоксигрупу у якості замісника у фенільному кільці, (45) нафтил нижчу алкільну групу, (46) фенокси групу, що може бути заміщена, у фенільному кільці, 1-3 групами, обраними з групи, що містить ціано групу, нижчу алкільну групу, що може мати атом галогену у якості замісника, та нижчу алкокси групу, що може мати атом галогену у якості замісника, (47) фенокси нижчу алкільну групу, (48) феніл нижчу алкокси групу, що може бути заміщена, у фенільному кільці, 1-3 групами, обраними з групи, що містить атом галогену, нижчу алкільну групу, що може мати атом галогену у якості замісника, та нижчу алкокси групу, що може мати атом галогену у якості замісника, (49) групу  $-(\text{B}_{12}\text{CO})\text{t-N}(\text{R}^{20})\text{R}^{21}$ , (50) групу  $-(\text{CO})\text{o-B}_{13}\text{-N}(\text{R}^{22})\text{R}^{23}$ , (51) 1,2,3,4-тетрагідронафтил-заміщену нижчу алкільну групу, що може бути заміщена, у 1,2,3,4-тетрагідронафталеновому кільці, 1-5 нижчими алкільними групами у якості замісника(ів), (52) циклоалкільну групу, що може мати гідроксильну групу у якості замісника, (53) піперидинільну групу, що може бути заміщена, у піперидиновому кільці, 1-3 нижчими алкільними групами у якості замісника(ів), (54) хіноліл нижчу алкільну групу, (55) 1,2,3,4-тетразоліл нижчу алкільну групу, що може мати групу, обрану з групи, яка містить нижчу алкільну групу та фенільну групу нижчого алкілу у якості замісника у тетразольному кільці, (56) тiazоліл нижчу алкільну групу, що може мати фенільну групу у якості замісника у тiazольному

кільці, (57) бензоїл нижчу алкільну групу, що може мати 1-3 групи, обрані з групи, що містить нижчу алкокси групу та атом галогену у якості замісника(ів) у фенільному кільці, (58) піперидиніл нижчу алкільну групу, що може мати нижчу алкільну групу у якості замісника у піперидиновому кільці, (59) імідазолільну групу, що може мати 1-3 фенільні групи у якості замісника(ів) у імідазольному кільці, (60) бензімідазолільну групу, що може мати 1-3 нижчі алкільні групи у якості замісника(ів) у бензімідазольному кільці, (61) піридил нижчу алкокси групу, (62) 1,2,3,4-тетрагідрохіноліл нижчу алкільну групу, що може мати оксо групу у якості замісника у тетрагідрохіноліновому кільці, (63) 1,3,4-оксадіазоліл нижчу алкільну групу, що може мати оксо групу у якості замісника у 1,3,4-у оксадізольному кільці, (64) циклоалкіл нижчу алкільну групу, (65) тетрагідропіранільну групу, (66) тієніл нижчу алкільну групу, (67) піримідинілкарбонільну групу, що може мати оксо групу у якості замісника у піримідиновому кільці, (68) гідроксильну групу, (69) карбокси групу, (70) нижчу алкокси нижчу алкільну групу, (71) нижчу алкокси нижчу алкокси групу, (72) бензоїлокси групу, (73) нижчу алкоксикарбонільну нижчу алкокси групу, (74) карбокси нижчу алкокси групу, (75) фенокси нижчу алканойльну групу, (76) 1,2,3,4-тетрагідрохінолілкарбонільну групу, що може мати оксо групу у якості замісника у тетрагідрохіноліновому кільці, (77) фенілсульфонільну групу, (78) імідазоліл нижчу алканойльну групу, (79) імідазоліл нижчу алкільну групу, (80) піридилкарбонільну групу, (81) імідазолілкарбонільну групу, (82) нижчу алкоксикарбонільну нижчу алкільну групу, (83) карбокси нижчу алкільну групу, (84) групу  $-(\text{O-B}_{15})\text{s-CO-N}(\text{R}^{26})\text{R}^{27}$ , (85) групу  $-\text{N}(\text{R}^{28})\text{-CO-B}_{16}\text{-N}(\text{R}^{29})\text{R}^{30}$ , (86) групу  $-\text{N}(\text{R}^{31})\text{-B}_{17}\text{-CO-N}(\text{R}^{32})\text{R}^{33}$ , (87) бензоксазолільну групу, (88a) бензотієнільну групу, (89a) оксо групу, та (90a) 1,2,3,4-тетрагідрохінолільну групу, що може мати оксо групу у якості замісника у тетрагідрохіноліновому кільці,

$\text{B}_{12}$  представляє нижчу алкіленову групу,

t представляє 0 або 1,

$\text{R}^{20}$  та  $\text{R}^{21}$  можуть бути ідентичними або різними та кожний представляє атом водню; аміно групу що може мати нижчу алкоксикарбонільну групу у якості замісника; бензоїльну групу, що може мати 1-3 нижчі алкокси групи у якості замісника(ів) у фенільному кільці; нижчу алкільну групу; нижчу алкільну групу що має 1-2 фенільні групи, що може бути заміщена, у фенільному кільці, 1-3 групами, обраними з групи, що містить нижчу алкоксикарбонільну групу, ціано групу, нітро групу, фенільну групу, атом галогену, нижчу алкільну групу, що може мати атом галогену у якості замісника, нижчу алкокси групу, що може мати атом галогену у якості замісника, та нижчу алкілтіогрупу; фенільну групу, що може бути заміщена, у фенільному кільці, 1-3 групами, обраними з групи, що містить нижчу алкокси групу, що може мати атом галогену у якості замісника та нижчу алкільну групу, що може мати атом галогену

у якості замісника; нижчу алкоксикарбонільну групу; циклоалкіл нижчу алкільну групу; пірролідиніл нижчу алкільну групу, що може мати 1-3 нижчі алкільні групи, що може мати гідроксильну групу у якості замісника у пірролідиновому кільці; аміно-заміщену нижчу алкільну групу, що може мати групу, обрану з групи, яка містить фенільну групу та нижчу алкільну групу у якості замісника; 1,2,3,4-тетрагідронафтил-заміщену нижчу алкільну групу, що може мати 1-5 нижчі алкільні групи у якості замісника(ів) у 1,2,3,4-тетрагідронафталеновому кільці; нафтил нижчу алкільну групу; піридил нижчу алкільну групу; хіноліл нижчу алкільну групу; 1,2,3,4-тетразоліл нижчу алкільну групу, що може мати 1-3 групи, обрані з групи, що містить нижчу алкільну групу та фенільну групу нижчого алкілу у якості замісника(ів) у тетразоліновому кільці; 1,2,4-триазоліл нижчу алкільну групу; тетрагідрофурил нижчу алкільну групу, що може мати гідроксильну групу у якості замісника у нижчій алкільній групі; фенокси нижчу алкільну групу, що може мати 1-3 групи, обрані з групи, що містить нижчу алкільну групу та нітро групу у якості замісника(ів) у фенільному кільці; феніл нижчу алканоїльну групу; нижчу алканоїльну групу, що може мати атом галогену у якості замісника; імідазоліл нижчу алканоїльну групу; нижчу алкоксикарбонільна нижчу алкільну групу; піридилну групу; або карбокси нижчу алкільну групу, або циклоалкільну групу; та  $R^{20}$  та  $R^{21}$ , разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, можуть приєднуватись один до одного, безпосередньо або за допомогою атому азоту, атому кисню, або атому сірки утворюючи 5-7-членне насичене гетероциклічне кільце(де, у гетероциклічному кільці, можуть бути присутні 1-3 замісники, що обрані з групи, яка містить нижчу алкільну групу, фенільну групу, що може мати 1-3 групи, обрані з групи, що містить атом галогену та нижчу алкільну групу, що може мати атом галогену у якості замісника(ів) у фенільному кільці, та фенільну групу нижчого алкілу що може мати нижчу алкілендіоксигрупу у якості замісника у фенільному кільці),

о представляє 0 або 1,

$B_{13}$  представляє нижчу алкіленову групу,  $R^{22}$  та  $R^{23}$  можуть бути ідентичними або різними та кожний представляє атом водню, нижчу алкільну групу, бензоїльну групу, що може мати 1-3 нижчі алкокси групи у якості замісника(ів) у фенільному кільці, фенокси нижчу алкільну групу, що може мати нижчу алкільну групу у якості замісника у фенільному кільці, фенільну групу нижчого алкілу, або фенільну групу, або  $R^{22}$  та  $R^{23}$ , разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, можуть приєднуватись один до одного, безпосередньо або за допомогою атому азоту, атому кисню, або атому сірки утворюючи 5-7-членне насичене гетероциклічне кільце (де, у гетероциклічному кільці, 1-3 замісники можуть бути присутні, що обрані з групи, яка містить нижчу алкільну групу та фенільну групу нижчого алкілу що може мати нижчу алкілендіоксигрупу у якості замісника у фенільному кільці),

$B_{15}$  представляє нижчу алкіленову групу,

s представляє 0 або 1,

$R^{26}$  та  $R^{27}$  можуть бути ідентичними або різними та кожний представляє атом водню, нижчу алкільну групу, фенільну групу нижчого алкілу, або імідазоліл нижчу алкільну групу, та  $R^{26}$  та  $R^{27}$ , разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, можуть приєднуватись один до одного, безпосередньо або за допомогою атому азоту, атом кисню, або атом сірки утворюючи 5-7-членне насичене гетероциклічне кільце, (де, у гетероциклічному кільці, 1-3 феніл нижча алкільні групи що може мати нижчу алкілендіоксигрупу у якості замісника, можуть бути присутні у фенільному кільці, у якості замісника(ів)),

$R^{28}$  представляє атом водню або нижчу алкільну групу,

$B_{16}$  представляє нижчу алкіленову групу,

$R^{29}$  та  $R^{30}$ , разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, можуть приєднуватись один до одного, безпосередньо або за допомогою атому азоту, атом кисню, або атом сірки утворюючи 5-7-членну гетероциклічну групу, де, у гетероциклічному кільці, 1-3 замісники можуть бути присутні, що обрані з групи, яка містить нижчу алкільну групу, фенільну групу, та фенільну групу нижчого алкілу що може мати нижчу алкілендіоксигрупу у якості замісника у фенільному кільці,

$R^{31}$  представляє атом водню або нижчу алкільну групу,

$B_{17}$  представляє нижчу алкіленову групу,

$R^{32}$  та  $R^{33}$ , разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, можуть приєднуватись один до одного, безпосередньо або за допомогою атому азоту, атом кисню, або атом сірки утворюючи 5-7-членну гетероциклічну групу, (де, у гетероциклічному кільці, 1-3 замісники можуть бути присутні, що обрані з групи, яка містить нижчу алкільну групу, фенільну групу, та фенільну групу нижчого алкілу що може мати нижчу алкілендіоксигрупу у якості замісника у фенільному кільці).

[0076]

Однак, ця вищевказана сполука або її солі відповідають наступним вимогам (i) - (v):

[0077]

(i) коли  $X_1$  представляє групу  $-CH=$ , тоді  $R^3$  представляє атом водню;

[0078]

(ii) коли  $X_1$  представляє групу  $-CH=$ , 1 представляє 1, T представляє  $-CO-$ , та  $R^{14}$  представляє атом водню або алкільну групу, що може мати гідроксильну групу у якості замісника,  $R^{15}$  представляє групу (24);

[0079]

(iii) коли  $X_1$  представляє групу  $-CH=$ , I представляє 1, та T представляє  $-N(R^{17})-B_3-CO-$ ,  $R^{14}$  та  $R^{15}$ , разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, можуть приєднуватись один до одного, безпосередньо або за допомогою атому азоту, атом кисню, або атом сірки утворюючи 5-10-членне насичене або ненасичене гетероциклічне кільце, де, у гетероциклічному кільці, 1-3 групи з (28) присутні у якості замісника(ів);

[0080]

(iv) коли  $X_1$  представляє атом азоту, та  $I$  представляє  $O$ , або коли  $X_1$  представляє атом азоту,  $I$  представляє  $1$ , та  $T$  представляє  $-CO-$  або  $-SO_2$ ,  $R^{15}$  не є група (5), (7), (19), або (20); та

[0081]

(v) коли  $R^6$  представляє циклоалکیلну групу, що може мати у циклоалкільному кільці, замісник обраний з групи, що містить аміно-заміщену нижчу алکیلну групу, що може мати нижчу алکیلну групу, що може мати атом галогену у якості замісника,  $R^4$  представляє групу  $-(T)_1-N(R^{14})R^{15}$  (де  $T$  та  $1$  є такі, як визначено вище, та  $R^{14}$  та  $R^{15}$ , разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, можуть приєднуватись один до одного, безпосередньо або за допомогою атому азоту, атому кисню, або атому сірки, утворюючи 5-10-членне насичене гетероциклічне кільце; або  $R^{14}$  та  $R^{15}$  утворюють групу

[0082]

[Формула 28]



[0083]

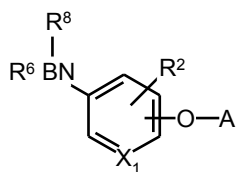
.

[0084]

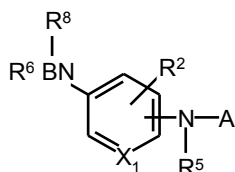
Пункт 2: Ароматична сполука або її солі згідно з пунктом 1, що містять сполуки обрані з групи, що містить сполуки представлені загальними формулами (1-1) - (1-7) нижче або їх солі у якості діючого інгредієнту:

[0085]

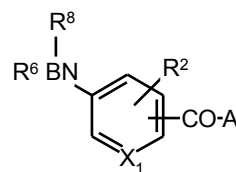
[Формула 29]



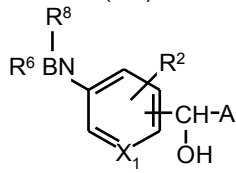
(1-1)



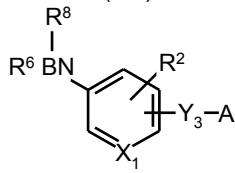
(1-2)



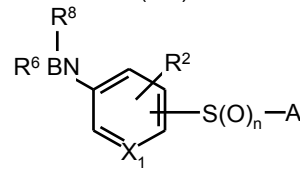
(1-3)



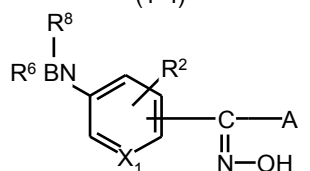
(1-4)



(1-5)



(1-6)



(1-7)

[0086]

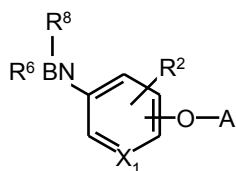
де  $Y_3$  представляє нижчу алкіленову групу.

Пункт 3: Ароматична сполука або її солі згідно з пунктом 1, що містять сполуку обрану з групи, що містить сполуки представлені загальними

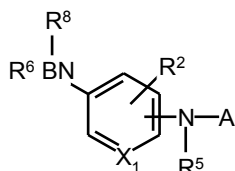
формулами (1-8) - (1-14) нижче або їх солі у якості діючого інгредієнту:

[0087]

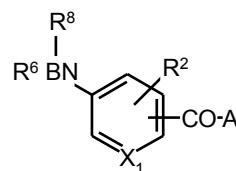
[Формула 30]



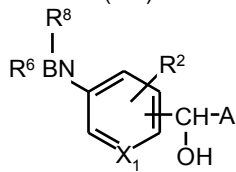
(1-8)



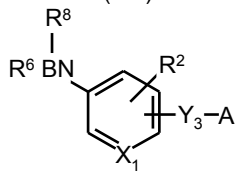
(1-9)



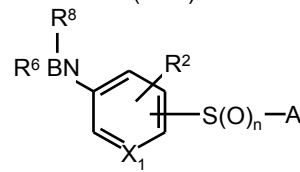
(1-10)



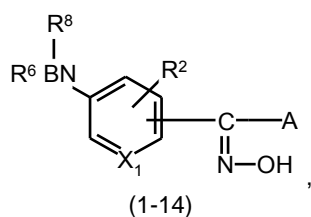
(1-11)



(1-12)



(1-13)



[0088]

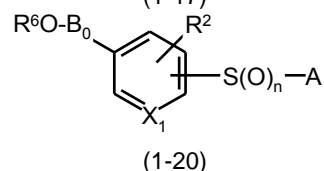
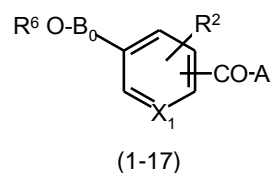
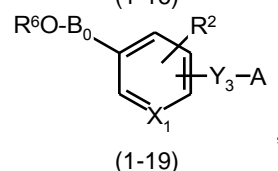
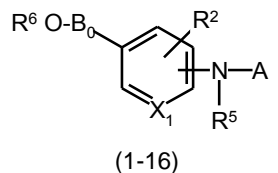
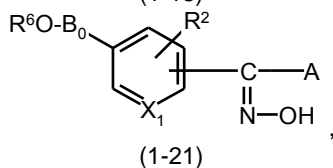
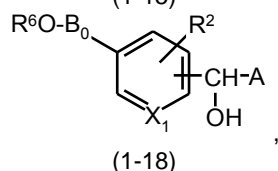
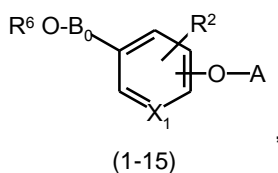
де  $Y_3$  представляє нижчу алкіленову групу.

Пункт 4: Ароматична сполука або її солі згідно з пунктом 1, що містить сполуки обрані з групи, що містить сполуки представлені загальними

формулами (1-15) - (1-21) нижче або їх солі у якості діючого інгредієнту:

[0089]

[Формула 31]



[0090]

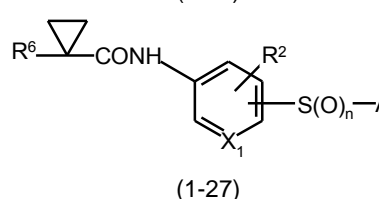
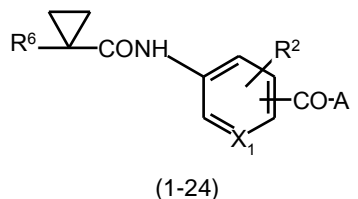
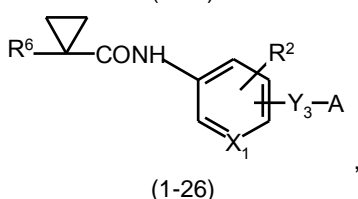
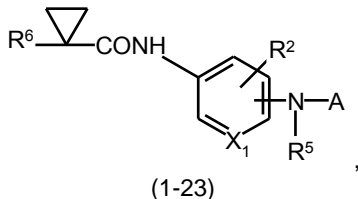
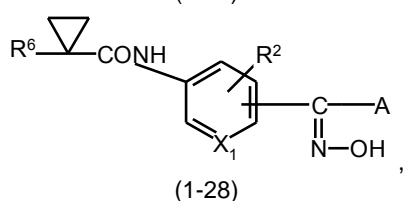
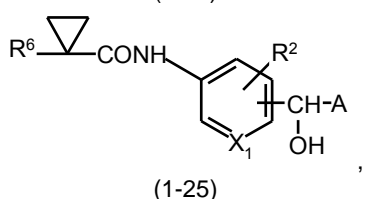
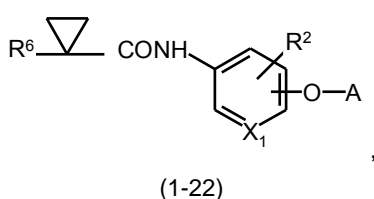
де  $Y_3$  представляє нижчу алкіленову групу.

Пункт 5: Ароматична сполука або її солі згідно з пунктом 1, що містить сполуки обрані з групи, що містить сполуки представлені загальними

формулами (1-22) - (1-28) нижче або їх солі у якості діючого інгредієнту:

[0091]

[Формула 32]



[0092]

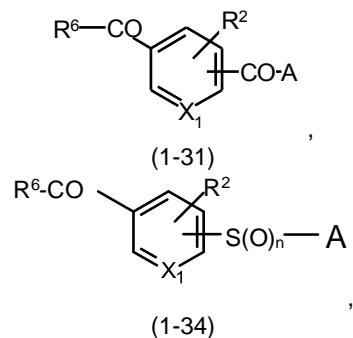
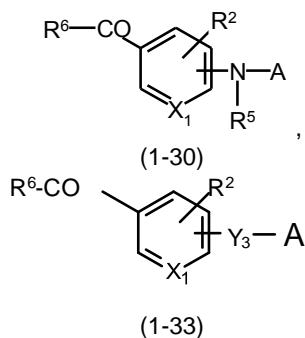
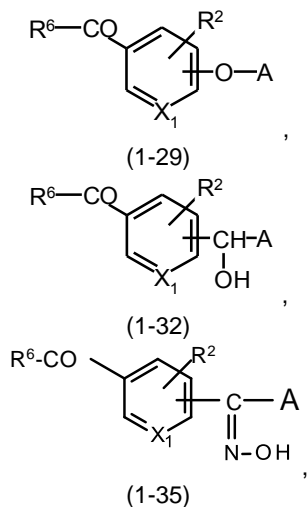
де  $Y_3$  представляє нижчу алкіленову групу.

Пункт 6: Ароматична сполука або її солі згідно з пунктом 1, що містить сполуки обрані з групи, що містить сполуки представлені загальними

формулами (1-29) - (1-35) нижче або їх солі у якості діючого інгредієнту:

якості діючого інгредієнту:  
[0093]

[Формула 33]



[0094]

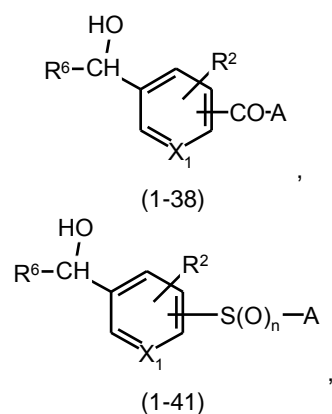
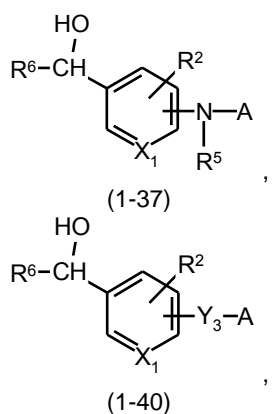
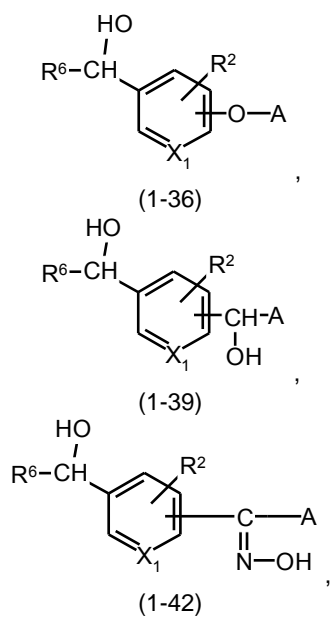
де Y<sub>3</sub> представляє нижчу алкіленову групу.

Пункт 7: Ароматична сполука або її солі згідно з пунктом 1, що містить сполуки обрані з групи, що містить сполуки представлені загальними

формулами (1-36) - (1-42) нижче або їх солі у якості діючого інгредієнту:

[0095]

[Формула 34]



[0096]

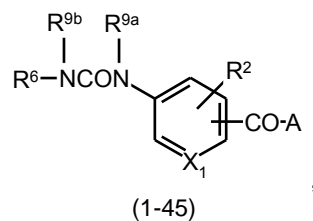
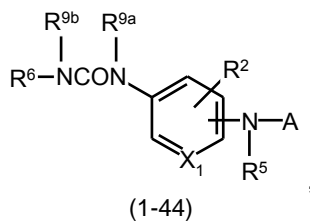
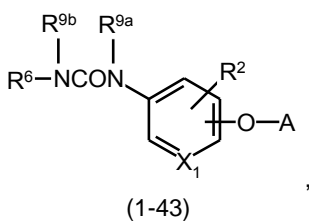
де Y<sub>3</sub> представляє нижчу алкіленову групу.

Пункт 8: Ароматична сполука або її солі згідно з пунктом 1, що містить сполуки обрані з групи, що містить сполуки представлені загальними

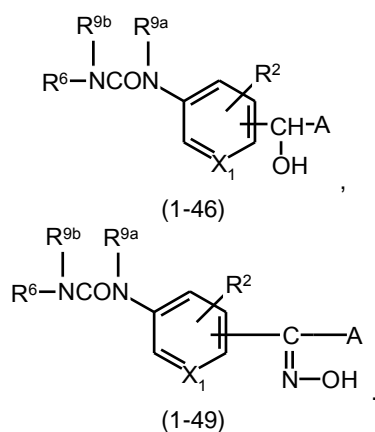
формулами (1-43) - (1-49) нижче або їх солі у якості діючого інгредієнту:

[0097]

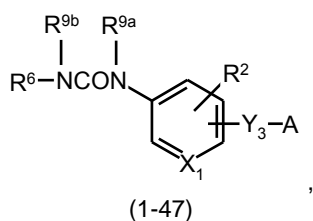
[Формула 35]



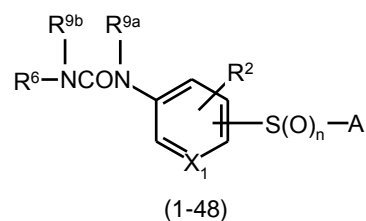
63



95978



64



[0098]

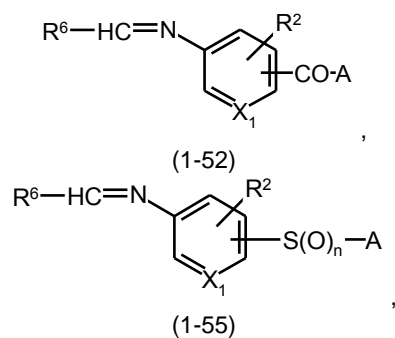
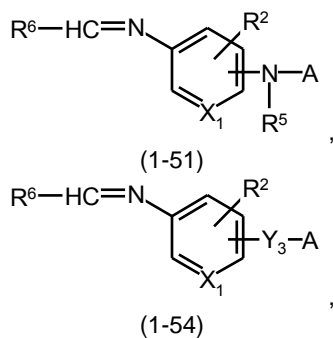
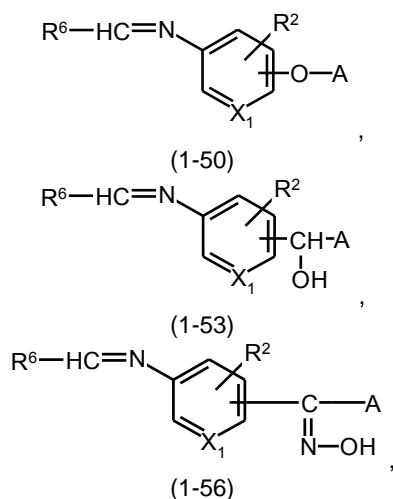
де Y<sub>3</sub> представляє нижчу алкіленову групу.

Пункт 9: Ароматична сполука або її солі згідно з пунктом 1, що містить сполуки обрані з групи, що містить сполуки представлені загальними

формулами (1-50) - (1-56) нижче або їх солі у якості діючого інгредієнту:

[0099]

[Формула 36]



[0100]

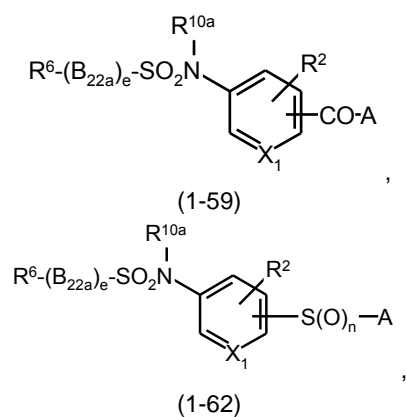
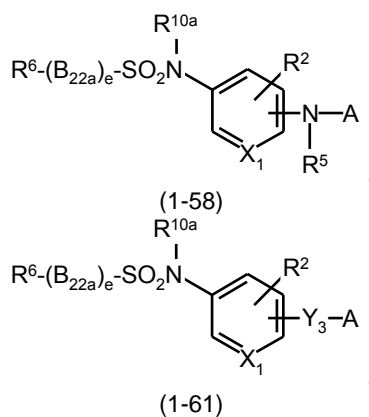
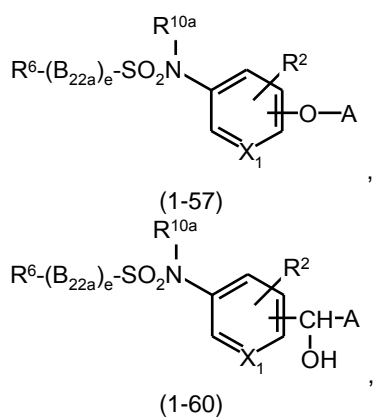
де Y<sub>3</sub> представляє нижчу алкіленову групу.

Пункт 10: Ароматична сполука або її солі згідно з пунктом 1, що містить сполуки обрані з групи, що містить сполуки представлені

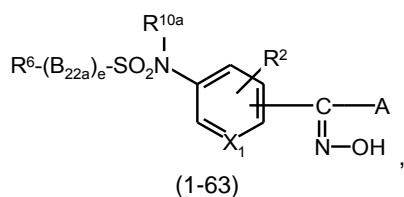
загальними формулами (1-57) - (1-63) нижче або їх солі у якості діючого інгредієнту:

[0101]

[Формула 37]







[0102]

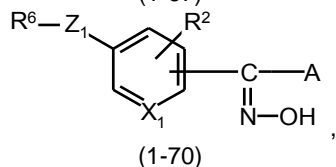
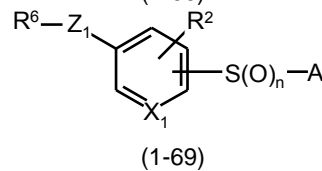
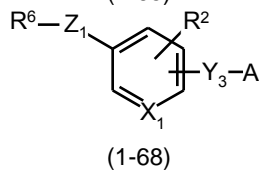
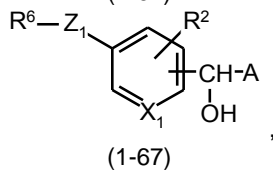
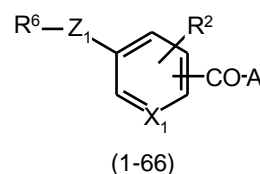
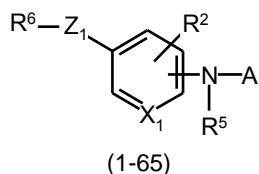
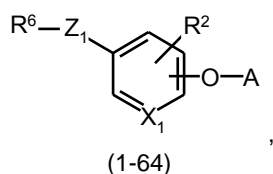
де  $Y_3$  представляє нижчу алкіленову групу.

Пункт 11: Ароматична сполука або її солі згідно з пунктом 1, що містить сполуки обрані з групи, що містить сполуки представлені

загальними формулами (1-64) - (1-70) нижче або їх солі у якості діючого інгредієнту:

[0103]

[Формула 38]



[0104]

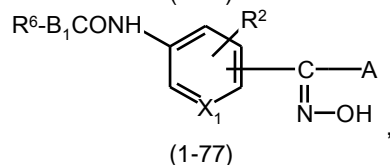
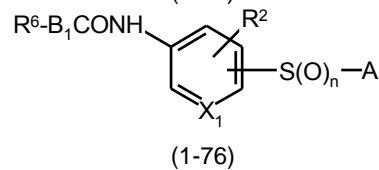
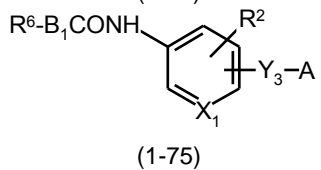
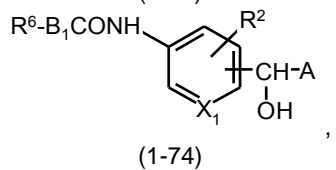
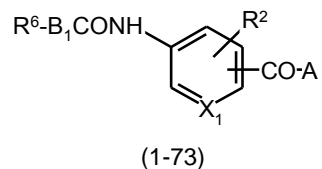
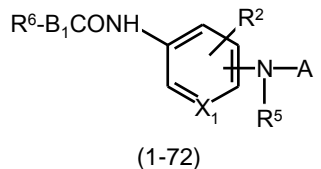
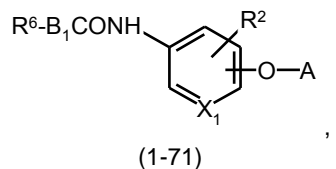
де  $Y_3$  представляє нижчу алкіленову групу, та  $Z_1$  представляє нижчу алкеніленову групу.

Пункт 12: Ароматична сполука або її солі згідно з пунктом 1, що містить сполуки обрані з

групи, що містить сполуки представлені загальними формулами (1-71) - (1-77) нижче або їх солі у якості діючого інгредієнту:

[0105]

[Формула 39]



[0106]

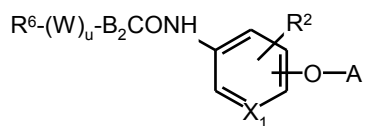
де  $Y_3$  представляє нижчу алкіленову групу.

Пункт 13: Ароматична сполука або її солі згідно з пунктом 1, що містить сполуки обрані з групи, що містить сполуки представлені

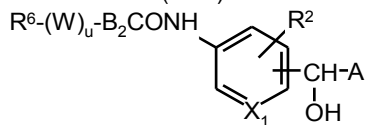
загальними формулами (1-78) - (1-84) нижче або їх солі у якості діючого інгредієнту:

[0107]

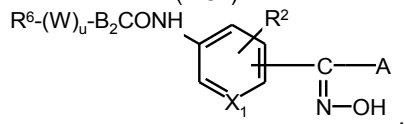
[Формула 40]



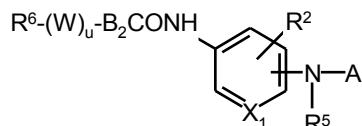
(1-78)



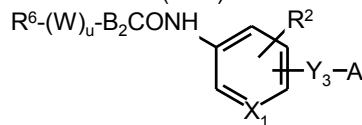
(1-81)



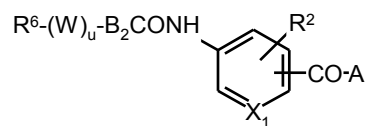
(1-84)



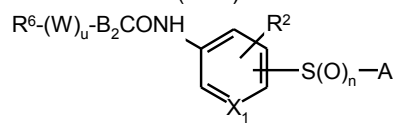
(1-79)



(1-82)



(1-80)



(1-83)

[0108]

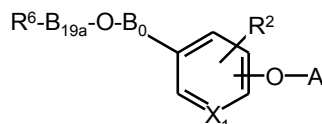
де  $\text{Y}_3$  представляє нижчу алкіленову групу.

Пункт 14: Ароматична сполука або її солі згідно з пунктом 1, що містить сполуки обрані з групи, що містить сполуки представлені

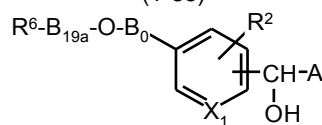
загальними формулами (1-85) - (1-91) нижче або її солі у якості діючого інгредієнту:

[0109]

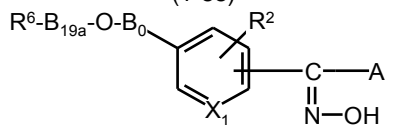
[Формула 41]



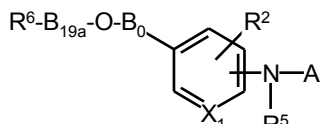
(1-85)



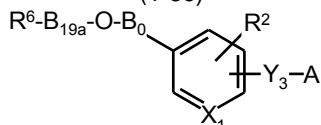
(1-88)



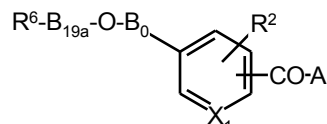
(1-91)



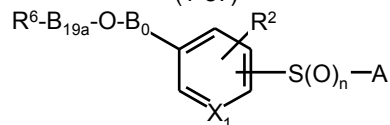
(1-86)



(1-89)



(1-87)



(1-90)

[0110]

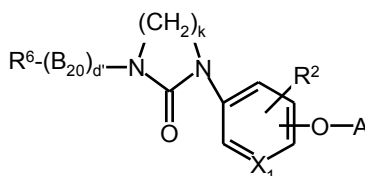
де  $\text{Y}_3$  представляє нижчу алкіленову групу.

Пункт 15: Ароматична сполука або її солі згідно з пунктом 1, що містить сполуки обрані з групи, що містить сполуки представлені

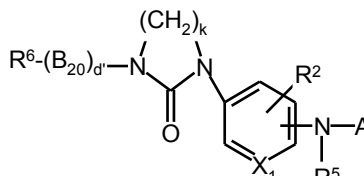
загальними формулами (1-92) - (1-98) нижче або їх солі у якості діючого інгредієнту:

[0111]

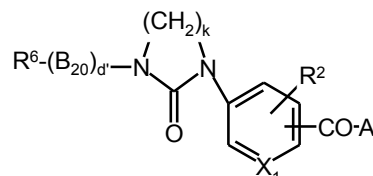
[Формула 42]



(1-92)

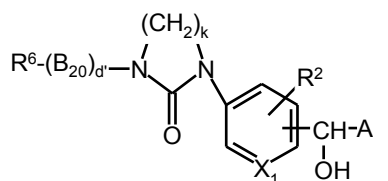


(1-93)

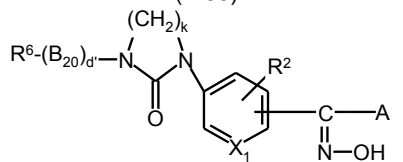


(1-94)

69

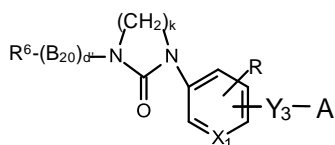


(1-95)



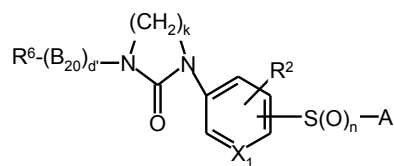
(1-98)

95978



(1-96)

70



(1-97)

[0112]

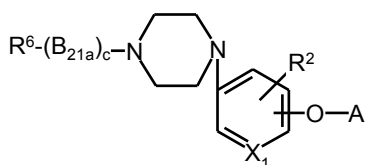
де Y<sub>3</sub> представляє нижчу алкіленову групу.

Пункт 16: Ароматична сполука або її солі згідно з пунктом 1, що містить сполуки обрані з групи, що містить сполуки представлені

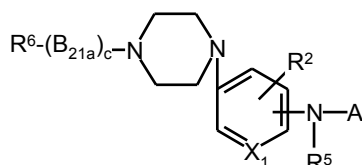
загальними формулами (1-99) - (1-105) нижче або їх солі у якості діючого інгредієнту:

[0113]

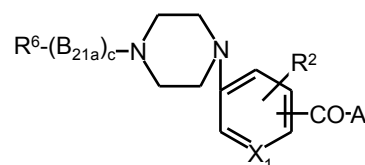
[Формула 43]



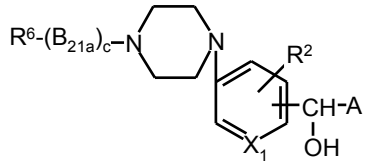
(1-99)



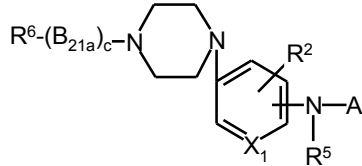
(1-100)



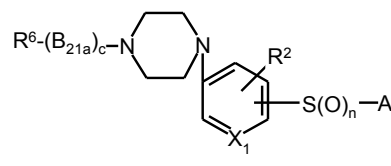
(1-101)



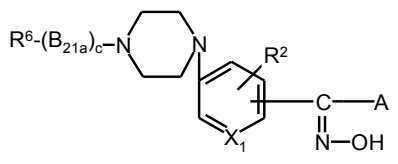
(1-102)



(1-103)



(1-104)



(1-105)

[0114]

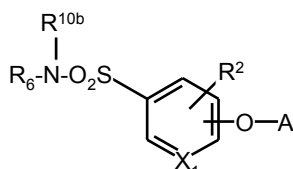
де Y<sub>3</sub> представляє нижчу алкіленову групу.

Пункт 17: Ароматична сполука або її солі згідно з пунктом 1, що містить сполуки обрані з групи, що містить сполуки представлені

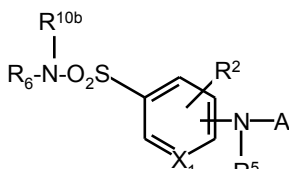
загальними формулами (1-106) - (1-112) нижче або їх солі у якості діючого інгредієнту:

[0115]

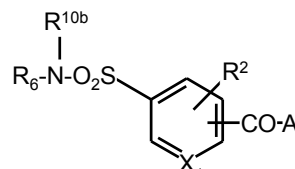
[Формула 44]



(1-106)

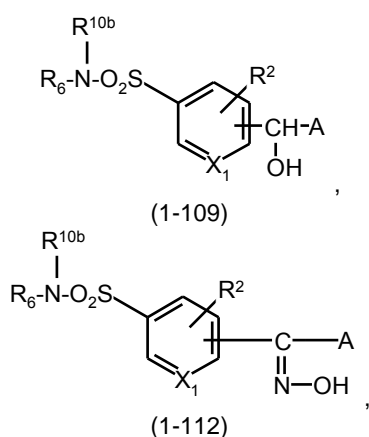


(1-107)

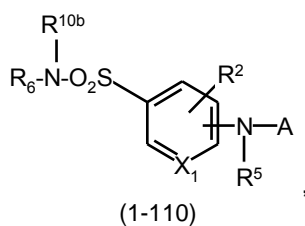


(1-108)

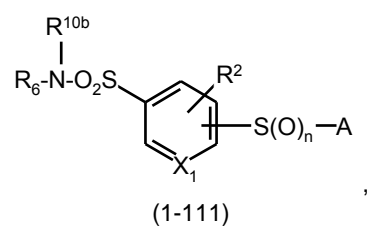
71



95978



72



[0116]

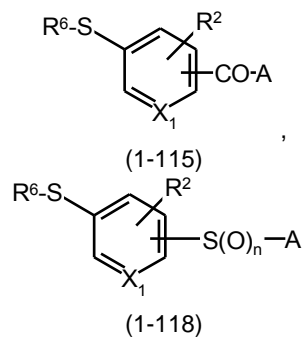
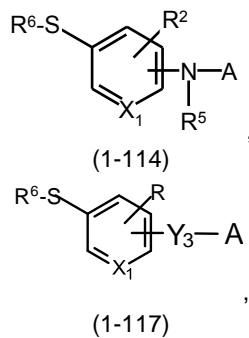
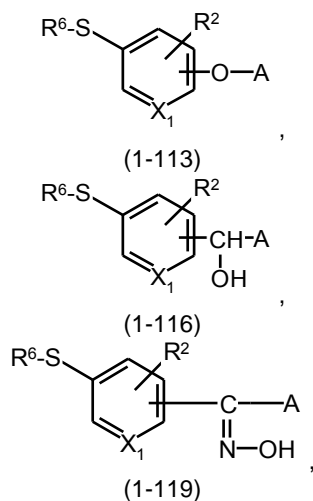
де Y<sub>3</sub> представляє нижчу алкіленову групу.

Пункт 18: Ароматична сполука або її солі згідно з пунктом 1, що містить сполуки обрані з групи, що містить сполуки представлені

загальними формулами (1-113) - (1-119) нижче або їх солі у якості діючого інгредієнту:

[0117]

[Формула 45]



[0118]

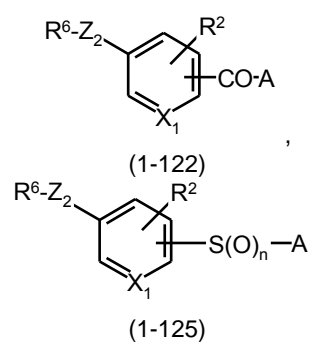
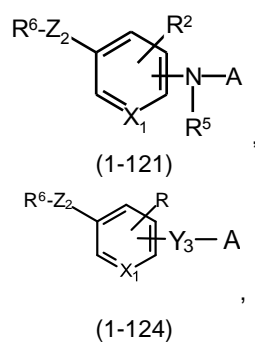
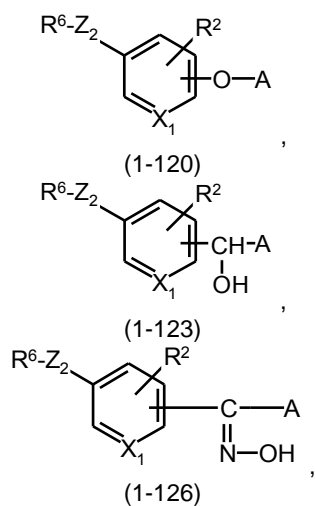
де Y<sub>3</sub> представляє нижчу алкіленову групу.

Пункт 19: Ароматична сполука або її солі згідно з пунктом 1, що містить сполуки обрані з групи, що містить сполуки представлені

загальними формулами (1-120) - (1-126) нижче або їх солі у якості діючого інгредієнту:

[0119]

[Формула 46]



[0120]

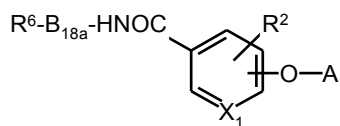
де  $Y_3$  представляє нижчу алкіленову групу, та  $Z_2$  представляє нижчу алкініленову групу.

Пункт 20: Ароматична сполука або її солі згідно з пунктом 1, що містить сполуки, обрані з

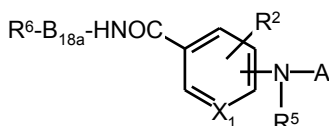
групи, що містить сполуки представлені загальними формулами (1-127) - (1-133) нижче або їх солі у якості діючого інгредієнту:

[0121]

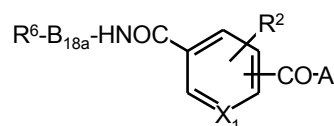
[Формула 47]



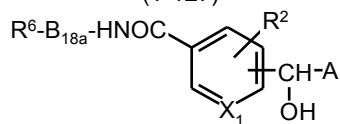
(1-127)



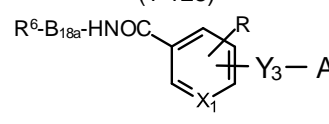
(1-128)



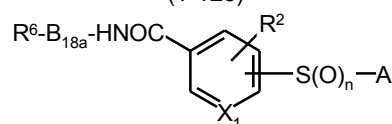
(1-129)



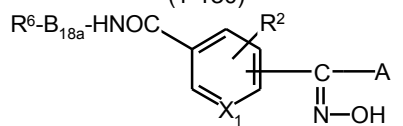
(1-130)



(1-131)



(1-132)



(1-133)

[0122]

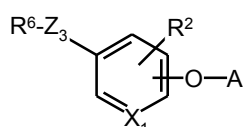
де  $Y_3$  представляє нижчу алкіленову групу.

Пункт 21: Ароматична сполука або її солі згідно з пунктом 1, що містить сполуки, обрані з групи, що містить сполуки представлені

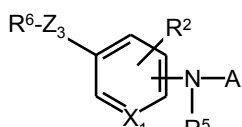
загальними формулами (1-134) - (1-140) нижче або їх солі у якості діючого інгредієнту:

[0123]

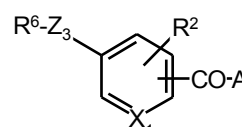
[Формула 48]



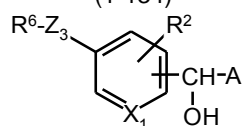
(1-134)



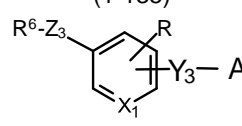
(1-135)



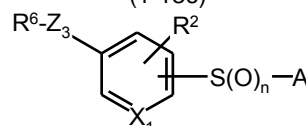
(1-136)



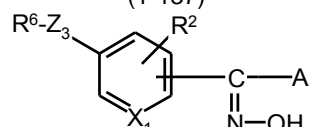
(1-137)



(1-138)



(1-139)



(1-140)

[0124]

де  $Y_3$  представляє нижчу алкіленову групу, та  $Z_3$  представляє нижчу алкіленову групу або групу -N(R<sup>8d</sup>)-.

Пункт 22: Ароматична сполука або її солі згідно з будь-яким з пунктів 1-21, де  $Y$  це група -O-.

[0125]

Пункт 23: Ароматична сполука або її солі згідно з будь-яким з пунктів 1-21, де  $Y$  це група -N(R<sup>5</sup>)-.

[0126]

Пункт 24: Ароматична сполука або її солі згідно з будь-яким з пунктів 1-21, де  $Y$  це група -CO-, група -CH(OH)-, нижча алкіленова група,

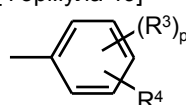
група -S(O)<sub>n</sub>-, або група -C(=N-OH)-.

[0127]

Пункт 25: Ароматична сполука або її солі згідно з будь-яким з пунктів 1-21, де  $A$  це група

[0128]

[Формула 49]



[0129]

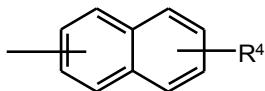
[0130]

Пункт 26: Ароматична сполука або її солі

згідно з будь-яким з пунктів 1-21, де А це група

[0131]

[Формула 50]



[0132]

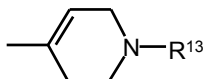
.

[0133]

Пункт 27: Ароматична сполука або її солі згідно з будь-яким з пунктів 1-21, де  $R^4$  представляє імідазоліл нижчу алкільну групу, 1,2,4-триазоліл нижчу алкільну групу, 1,2,3-триазоліл нижчу алкільну групу, 1,2,5-триазоліл нижчу алкільну групу, піразоліл нижчу алкільну групу, піримідиніл нижчу алкільну групу, що може мати оксо групу у якості замісника у піримідиновому кільці, 3,5-диоксоізооксазолідін-4-іліден нижчу алкільну групу, 1,2,4-оксадіазоліл нижчу алкільну групу, що може мати нижчу алкільну групу у якості замісника у 1,2,4-оксадіазольовому кільці, тіазолідиніл нижчу алкільну групу, що може мати оксо групу у якості замісника у тіазолідиновому кільці, групу

[0134]

[Формула 51]

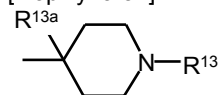


[0135]

або групу

[0136]

[Формула 52]



[0137]

.

[0138]

Пункт 28: Ароматична сполука або її солі згідно з будь-яким з пунктів 1-21, представлені загальною формулою (1) де  $R^4$  представляє групу  $-(T)_1-N(R^{14})R^{15}$  ( $T$ ,  $R^{14}$ , та  $R^{15}$  є такі, як визначено вище) та 1 представляє 0.

[0139]

Пункт 29: Ароматична сполука або її солі згідно з будь-яким з пунктів 1-21, де  $R^4$  це група  $-(T)_1-N(R^{14})R^{15}$ , та 1 це 1.

[0140]

Пункт 30: Ароматична сполука або її солі згідно з будь-яким з пунктів 1-21, де  $R^4$  це група  $-(T)_1-N(R^{14})R^{15}$ , 1 це 1, та  $T$  це група  $-N(R^{17})-B_3-CO-$ .

[0141]

Пункт 31: Ароматична сполука або її солі згідно з будь-яким з пунктів 1-21, де  $R^4$  це група  $-(T)_1-N(R^{14})R^{15}$ , 1 це 1, та  $T$  це група  $-B_{19}-N(R^{18})-CO-$ .

[0142]

Пункт 32: Ароматична сполука або її солі згідно з будь-яким з пунктів 1-21, де  $R^4$  це група  $-(T)_1-N(R^{14})R^{15}$ , 1 це 1, та  $T$  це група  $-B_4-CO-$ .

[0143]

Пункт 33: Ароматична сполука або її солі

згідно з будь-яким з пунктів 1-21, де  $R^4$  це група  $-(T)_1-N(R^{14})R^{15}$ , 1 це 1, та  $T$  це група  $-Q-B_5-CO-$ .

[0144]

Пункт 34: Ароматична сполука або її солі згідно з будь-яким з пунктів 1-21, де  $R^4$  це група  $-(T)_1-N(R^{14})R^{15}$ , 1 це 1, та  $T$  це група  $-B_6-N(R^{19})-B_7-$ .

[0145]

Пункт 35: Ароматична сполука або її солі згідно з будь-яким з пунктів 1-21, де  $R^4$  це група  $-(T)_1-N(R^{14})R^{15}$ , 1 це 1, та  $T$  це група  $-CO-B_8-$ .

[0146]

Пункт 36: Ароматична сполука або її солі згідно з будь-яким з пунктів 1-21, де  $R^4$  це група  $-(T)_1-N(R^{14})R^{15}$ , 1 це 1, та  $T$  це група  $-CH(OH)-B_9-$ .

[0147]

Пункт 37: Ароматична сполука або її солі згідно з будь-яким з пунктів 1-21, де  $R^4$  це група  $-(T)_1-N(R^{14})R^{15}$ , 1 це 1, та  $T$  це група  $-CO-B_{10}-CO-$ .

[0148]

Пункт 38: Ароматична сполука або її солі згідно з будь-яким з пунктів 1-21, де  $R^4$  це група  $-(T)_1-N(R^{14})R^{15}$ , 1 це 1, та  $T$  це група  $-CH(OH)-B_{11}-CO-$ .

[0149]

Пункт 39: Ароматична сполука або її солі згідно з будь-яким з пунктів 1-21, де  $R^4$  це група  $-(T)_1-N(R^{14})R^{15}$ , 1 це 1, та  $T$  це група  $-CO-$ .

[0150]

Пункт 40: Ароматична сполука або її солі згідно з будь-яким з пунктів 1-21, де  $R^4$  це група  $-(T)_1-N(R^{14})R^{15}$ , 1 це 1, та  $T$  це група  $-SO_2-$ .

[0151]

Пункт 41: Ароматична сполука або її солі згідно з будь-яким з пунктів 1-21, де  $R^4$  це група  $-(T)_1-N(R^{14})R^{15}$ , 1 це 1, та  $T$  це група  $-B_{23a}-CO-CO-$ .

[0152]

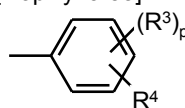
Пункт 42: Ароматична сполука або її солі згідно з будь-яким з пунктів 1-21, де  $R^4$  це група  $-(T)_1-N(R^{14})R^{15}$ , 1 це 1, та  $T$  це нижча алкіленова групу.

[0153]

Пункт 43: Ароматична сполука або її солі згідно з пунктом 1, що містить сполуки обрані з групи, що містить сполуки представлені загальними формулами (1-1), (1-2), (1-8), (1-9), (1-15), (1-16), (1-29), (1-30), (1-43), (1-44), (1-57), (1-58), (1-64) та (1-65) або їх солі у якості діючого інгредієнту, де  $Y$  це група  $-O-$  або група  $-N(R^5)-$ ,  $A$  це група

[0154]

[Формула 53]



[0155]

та

$R^4$  це група  $-(T)_1-N(R^{14})R^{15}$ .

[0156]

Пункт 44: Ароматична сполука або її солі згідно з пунктом 43, де 1 це 1, та  $T$  це група  $-N(R^{17})-B_3-CO-$ .

[0157]

Пункт 45: Ароматична сполука або її солі згідно з пунктом 43, де 1 це 1, та  $T$  це група  $-B_4-CO-$ .



мають 2-6 атомів вуглецю та 1-3 потрібні зв'язки як от етиніленова, 1-пропиніленова, 1-метил-1-пропиніленова, 2-метил-1-пропиніленова, 2-пропиніленова, 2-бутиніленова, 1-бутиніленова, 3-бутиніленова, 2-пентиніленова, 1-пентиніленова, 3-пентиніленова, 4-пентиніленова, 2-пентин-4-ініленова, 2-гексініленова, 1-гексініленова, 5-гексініленова, 3-гексініленова, 4-гексініленова, 3,3-диетил-1-пропиніленова, та 2-етил-1-пропиніленова групи.

[0163]

Прикладами нижчої алкокси групи є лінійна або розгалужена алкокси групи що мають 1-6 атомів вуглецю як от метокси, етокси, пропокси, ізопропокси, бутокси, трет-бутоксил, пентилокси, та гексилокси групи.

[0164]

Прикладами нижчої алкільної групи є лінійна або розгалужена алкільні групи що мають 1-6 атомів вуглецю як от метильна, етильна, пропильна, ізопропильна, 2,2-диметилпропильна, 1-етилпропильна, бутильна, ізобутильна, трет-бутильна, ізопентильна, пентильна, та гексильна групи.

[0165]

Прикладами нижчої алкільної групи, яка може мати нижчу алкокси групу у якості замісника є, додатково до вище описаних нижчих алкільних груп, лінійна або розгалужена алкільні групи що мають 1-6 атомів вуглецю яка може мати лінійну або розгалужену алкокси групу що має 1-6 атомів вуглецю у якості замісника як от метоксиметильна, 1-етоксietiльна, 2-метоксietiльна, 2-пропоксиетильна, 3-ізопропоксиетильна, 4-бутоксietiльна, 5-пентилоксietiльна, 6-гексилоксietiльна, 1,1-диметил-2-метоксietiльна, 2-метил-3-етоксипропильна, та 3-метоксипропильна групи.

[0166]

Прикладами нижчої алканойльної групи є лінійна або розгалужена алканойльні групи що мають 1-6 атомів вуглецю як от формильна, ацетильна, пропіонильна, бутирильна, ізобутирильна, пентаноїльна, трет-бутилкарбонільна, та гексаноїльна групи.

[0167]

Прикладами феніл нижчої алкільної групи є фенілалкільні групи алкільна частина яких - це лінійна або розгалужена алкільна група що має 1-6 атомів вуглецю як от бензильна, 2-фенілетильна, 1-фенілетильна, 3-фенілпропильна, 4-фенілбутильна, 5-феніlpентильна, 6-фенілгексильна, 1,1-диметил-2-фенілетильна, та 2-метил-3-фенілпропильна групи.

[0168]

Прикладами нижчої алкіленової групи є лінійна або розгалужена алкіленові групи що мають 1-6 атомів вуглецю як от метиленова, етиленова, триметиленова, 2-метилтриметиленова, 2,2-диметилетиленова, 2,2-диметилтриметиленова, 1-метилтриметиленова, метилметиленова, етилметиленова, тетраметиленова, пентаметиленова, та гексаметиленова групи.

[0169]

Прикладами нижчої алкеніленової групи, яка

може мати фенільну групу у якості замісника, є лінійна або розгалужена алкеніленові групи, які мають 2-6 атомів вуглецю та 1-3 подвійні зв'язки, та яка може мати фенільну групу у якості замісника як от вініленова, 1-пропеніленова, 1-метил-1-пропеніленова, 2-метил-1-пропеніленова, 2-пропеніленова, 2-бутеніленова, 1-бутеніленова, 3-бутеніленова, 2-пентеніленова, 1-пентеніленова, 3-пентеніленова, 4-пентеніленова, 1,3-бутадієніленова, 1,3-пентадієніленова, 2-пентене-4-ініленова, 2-гексеніленова, 1-гексеніленова, 5-гексеніленова, 3-гексеніленова, 4-гексеніленова, 3,3-диметил-1-пропеніленова, 2-етил-1-пропеніленова, 1,3,5-гексатриєніленова, 1,3-гексадиєніленова, 1,4-гексадиєніленова, 1-фенілвініленова, 3-феніл-1-пропеніленова, 3-феніл-1-метил-1-пропеніленова, 3-феніл-2-метил-1-пропеніленова, 1-феніл-2-пропеніленова, 1-феніл-2-бутеніленова, 3-феніл-1-бутеніленова, 1-феніл-3-бутеніленова, 5-феніл-2-пентеніленова, 4-феніл-1-пентеніленова, 2-феніл-3-пентеніленова, 1-феніл-4-пентеніленова, 1-феніл-1,3-бутадієніленова, 1-феніл-1,3-пентадієніленова, 1-феніл-2-пентен-4-ініленова, 1-феніл-2-гексеніленова, 3-феніл-1-гексеніленова, 4-феніл-5-гексеніленова, 6-феніл-3-гексеніленова, 5-феніл-4-гексеніленова, 1-феніл-3,3-диметил-1-пропеніленова, 1-феніл-2-етил-1-пропеніленова, 6-феніл-1,3,5-гексатриєніленова, 1-феніл-1,3-гексадиєніленова, та 2-феніл-1,4-гексадиєніленова групи.

[0170]

Прикладами нижчої алкіленової групи, яка може бути заміщена групою, що обрана з групи, що містить нижчу алкокси групу та фенільну групу включає, додатково до вище описаних нижчих алкіленових груп, лінійну або розгалужену алкіленові групи що мають 1-6 атомів вуглецю які можуть бути заміщені 1 або 2 групами, що обрані з групи, що містить лінійну або розгалужену алкокси групу що має 1-6 атомів вуглецю та фенільну групу як от метоксиметиленова, 2-фенілетиленова, 3-етокситриметиленова, 1-пропокси-2-метилтриметиленова, 1-феніл-2,2-диметилетиленова, 3-феніл-2,2-диметилтриметиленова, 2-бутокси-1-метилтриметиленова, фенілметилметиленова, 2-пентилоксиетилметиленова, 4-феніл-2-гексикокситетраметиленова, 3-фенілпентаметиленова, 5-фенілгексаметиленова, етоксиметиленова, 1-фенілетиленова, 3-фенілтриметиленова, та 2-феніл-1-метоксietiленова групи.

[0171]

Прикладами 5-15-членної моноциклічної, біциклічної або трициклічної насиченої або ненасиченої гетероциклічної групи, що має 1-4 атоми азоту, атоми кисню або атоми сірки є пірролідинильна, піперидинильна, піперазинильна, морфолінова, піридинильна, 1,2,5,6-тетрагідропіридинильна, 1,2,4-триазоліньна, 1,2,3-триазоліньна, 1,2,5-триазоліньна, тіазолідинильна, 1,2,3,4-тетразоліньна, тієніньна, хіноліньна, 1,4-дигідрохіноліньна, бензотіазоліньна, піразильна, піримідинильна, піридазинильна, 2H-пірроліньна,



пірролільна, 1,3,4-оксадіазолільна, тетрагідропіранільна, тетрагідрофурильна, фуразанільна, карбостирильна, 3,4-дигідрокарбостирильна, 1,2,3,4-тетрагідрохінолільна, 1,2,3,4-тетрагідроізохінолільна, індолільна, ізоіндолільна, індолінільна, бензоімідазолільна, бензооксазолільна, імідазолідинільна, ізохінолільна, хіназолідинільна, хіноксалінільна, циннолінільна, фталазінільна, карбазолільна, акридинільна, хроманільна, ізоіндолінільна, ізохроманільна, піразолільна, імідазолільна, піразолідинільна, фенотіазінільна, бензофурильна, 2,3-дигідробензо[b]фурильна, бензотієнільна, феноксатієнільна, феноксазінільна, 4Н-хроменільна, 1Н-індазолільна, феназінільна, ксантенільна, тіантренільна, 2-імідазолінільна, 2-пірролінільна, фурильна, оксазолільна, ізооксазолільна, ізооксазолідинільна, тіазолільна, ізотіазолільна, піранільна, 2-тіазолінільна, 2-піразолінільна, хінуклідінільна, 1,4-бензооксадинільна, 3,4-дигідро-2Н-1,4-бензооксадинільна, 3,4-дигідро-2Н-1,4-бензотіазінільна, 1,4-бензотіазінільна, 1,2,3,4-тетрагідрохіноксалінільна, 1,3-дитіа-2,4-дигідронафталеніл, фенантридинільна, 1,4-дитіанафталенільна, дибенз[b,e]азепінова, та 6,11-дигідро-5Н-добенз[b,e]азепінова групи.

[0172]

Прикладами атому галогену є атом фтору, атом хлору, атом бром та атом йоду.

[0173]

Прикладами нижчої алкокси групи, що може мати атом галогену у якості замісника є лінійна або розгалужена алкокси групи що мають 1-6 атомів вуглецю яка може мати 1-3 атоми галогенів як замісники як от метокси, етокси, пропокси, ізопропокси, бутокси, трет-бутокси, пентилокси, гексилокси, трифторметокси, трихлорметокси, хлорметокси, бромметокси, фторметокси, йодметокси, дифторметокси, дибромметокси, 2-хлоретокси, 2,2,2-трифторетокси, 2,2,2-трихлоретокси, 3-хлорпропокси, 2,3-дихлорпропокси, 4,4,4-трихлорбутокси, 4-фторбутокси, 5-хлорпентилокси, 3-хлор-2-метилпропокси, 6-бромгексилокси, та 5,6-дихлоргексилокси групи.

[0174]

Прикладами нижчої алкільної групи що може мати атом галогену у якості замісника є, додатково до вище описаних нижчих алкільних груп, лінійна або розгалужена алкільні групи що мають 1-6 атомів вуглецю яка може мати 1-3 атоми галогенів як замісники як от трифторметильна, трихлорметильна, хлорметильна, бромметильна, фторметильна, йодметильна, дифторметильна, дибромметильна, дихлорметильна, 2-хлоретильна, 2,2,2-трифторетильна, 2,2,2-трихлоретильна, 3-хлорпропильна, 2,3-дихлорпропильна, 4,4,4-трихлорбутильна, 4-фторбутильна, 5-хлорпентильна, 3-хлор-2-метилпропильна, 5-бромгексильна, та 5,6-дибромгексильна групи.

[0175]

Прикладами нижчої алкілсульфонільної групи

є лінійна або розгалужена алкілсульфонільні групи що мають 1-6 атомів вуглецю як от метилсульфонільні, етилсульфонільні, пропилсульфонільні, ізопропилсульфонільні, бутилсульфонільні, трет-бутилсульфонільні, пентилсульфонільні, та гексилсульфонільні групи.

[0176]

Прикладами фенільної групи яка може бути заміщена, у фенільному кільці, нижчою алкільною групою, яка може мати атом галогену, є фенільні групи які можуть бути заміщені, у фенільному кільці, 1-3 лінійними або розгалуженими алкільними групами що мають 1-6 атомів вуглецю яка може мати 1-3 атоми галогенів як от фенільна, 2-метилфенільна, 3-метилфенільна, 4-метилфенільна, 2-етилфенільна, 3-етилфенільна, 4-етилфенільна, 4-ізопропилфенільна, 3-бутилфенільна, 4-пентилфенільна, 4-гексилфенільна, 3,4-диметилфенільна, 3,4-диетилфенільна, 2,4-диметилфенільна, 2,5-диметилфенільна, 2,6-диметилфенільна, 3,4,5-триметилфенільна, 2-трифторметилфенільна, 3-трифторметилфенільна, 4-трифторметилфенільна, 2-(бромметил)фенільна, 3-(2-хлоретил)фенільна, 4-(2,3-дихлорпропил)фенільна, 4-(4-фторбутил)фенільна, 3-(5-хлорпентил)фенільна, 4-(5-бромгексил)фенільна, 4-(5,6-дибромгексил)фенільна, 3,4-ди(трифторметил)фенільна, 3,4-ди(4,4,4-трихлорбутил)фенільна, 2,4-ди(3-хлор-2-метилпропил)фенільна, 2,5-ди(3-хлорпропил)фенільна, 2,6-ди(2,2,2-трифторетил)фенільна, 3,4,5-три(трифторметил)фенільна, 4-(2,2,2-трихлоретил)фенільна, 2-метил-4-трифторметилфенільна, та 3-етил-4-трихлорметильна групи.

[0177]

Прикладами нижчої алкілтіо групи є лінійна або розгалужена алкілтіо групи що мають 1-6 атомів вуглецю як от метилтіо, етилтіо, пропилтіо, ізопропилтіо, бутилтіо, трет-бутилтіо, пентилтіо, та гексилтіо групи.

[0178]

Прикладами аміно групи, яка може мати групу, обрану з групи, що містить нижчу алкільну групу та нижчу алканойльну групу у якості замісника, є аміно групи яка може мати 1 або 2 групи, обрані з групи, що містить лінійну або розгалужену алкільні групи що мають 1-6 атомів вуглецю та лінійну або розгалужену алканойльні групи що мають 1-6 атомів вуглецю як замісники, як от аміно, метиламіно, етиламіно, пропиламіно, ізопропиламіно, бутиламіно, трет-бутиламіно, пентиламіно, гексиламіно, диметиламіно, диетиламіно, дипропиламіно, дибутиламіно, дипентиламіно, дигексиламіно, N-метил-N-етиламіно, N-етил-N-пропиламіно, N-метил-N-бутиламіно, N-метил-N-гексиламіно, N-ацетиламіно, N-формиламіно, N-пропіонаміно, N-бутириламіно, N-ізобутириламіно, N-пентаноїламіно, N-трет-бутилкарбонаміно, N-гексаноїламіно, диацетиламіно, N-ацетил-N-метиламіно, та N-ацетил-N-етиламіно групи.

[0179]

Прикладами нафтильної групи, яка може бути замінена у нафталеновому кільці 1-3 замісниками обраними з групи, що містить нижчу алкільну групу, атом галогену, та аміно групу, яка може мати групу, обрану з групи, що містить нижчу алкільну групу та нижчу алканоїлну групу, є нафтильні групи які можуть мати, у нафталеновому кільці, 1-3 замісники обрані з групи, що містить лінійну або розгалужену алкільну групу що має 1-6 атомів вуглецю, атом галогену, та аміно групу яка може мати 1 або 2 замісники обрані з групи, що містить лінійну або розгалужену алкільну групу що має 1-6 атомів вуглецю, як от (1- або 2-)нафтильна, 1-метил-(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- або 8-)нафтильна, 2-етил-(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- або 8-)нафтильна, 3-п-пропил-(1-, 2-, 4-, 5-, 6-, 7- або 8-)нафтильна, 4-п-бутил-(1-, 2-, 3-, 5-, 6-, 7- або 8-)нафтильна, 4-метил-(1-, 2-, 3-, 5-, 6-, 7- або 8-)нафтильна, 5-п-пентил-(1-, 2-, 3-, 4-, 6-, 7- або 8-)нафтильна, 6-п-гексил-(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 7- або 8-)нафтильна, 1,7-диметил-(2-, 3-, 4-, 5-, 6- або 8-)нафтильна, 1,2,8-триметил-(3-, 4-, 5-, 6- або 7-)нафтильна, 1-диметиламіно-(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- або 8-)нафтильна, 2-диметиламіно-(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- або 8-)нафтильна, 3-метиламіно-(1-, 2-, 4-, 5-, 6-, 7- або 8-)нафтильна, 5-аміно-(1-, 2-, 3-, 4-, 6-, 7- або 8-)нафтильна, 5-диметиламіно-(1-, 2-, 3-, 4-, 6-, 7- або 8-)нафтильна, 4-(N-метил-N-етиламіно)-(1-, 2-, 3-, 5-, 6-, 7- або 8-)нафтильна, 1-метил-2-диметиламіно-(3-, 4-, 5-, 6-, 7- або 8-)нафтильна, 1-хлор-(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- або 8-)нафтильна, та 1-ацетиламіно-(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- або 8-)нафтильна групи.

[0180]

Прикладами алкільної групи, яка може мати нижчу алкокси групу у якості замісника є, додатково до вищеописаних нижчих алкільних груп, які можуть мати нижчу алкокси групу у якості замісника, лінійна або розгалужена алкільні групи що мають 1-8 атомів вуглецю, яка може мати лінійну або розгалужену алкокси групу що має 1-6 атомів вуглецю у якості замісника, як от гептильна, 1-етилпентильна, октильна, 7-метоксигептильна, 1-етоксигептильна, 2-пропоксил-1-етилпентильна, 3-ізопропоксиоктильна, 7-бутоксигептильна, 8-пентилоксиоктильна, та 5-гексилокси-1-етилпентильна групи.

[0181]

Прикладами аміно заміщеної нижчої алкільної групи, яка може мати нижчу алкільну групу є лінійна або розгалужена алкільні групи, що мають 1-6 атомів вуглецю заміщених аміно групою яка може мати 1 або 2 лінійні або розгалужені алкільні групи що мають 1-6 атомів вуглецю як от амінометильна, 2-аміноетильна, 1-аміноетильна, 3-амінопропильна, 4-амінобутильна, 5-амінопентильна, 6-аміногексильна, 1,1-диметил-2-аміноетильна, 2-метил-3-амінопропильна, метиламінометильна, 1-етиламіноетильна, 2-пропиламіноетильна, 3-ізопропиламінопропильна, 4-бутиламінобутильна, 5-пентиламінопентильна, 6-гексиламіногексильна, диметиламінометильна,

2-диетиламіноетильна, 2-диізопропиламіноетильна, (N-етил-N-пропиламіно)метильна, та 2-(N-метил-N-гексиламіно)етильна групи.

[0182]

Прикладами циклоалкільної групи є циклоалкільні групи що мають 3-16 атомів вуглецю як от циклопропил, циклобутил, циклопентил, циклогексил, циклогептил, циклооктил, циклононил, циклодецил, циклоундецил, циклотридецил, циклотридецил, циклотетрадецил, циклопентадецил, та циклогексадецил групи.

[0183]

Прикладами циклоалкільної групи яка може бути замінена групою, що обрана з групи, що містить амінозаміщену нижчу алкільну групу, яка може мати нижчу алкільну групу та нижча алкільна група, яка може мати атом галогену у якості замісника у циклоалкільному кільці є, додатково до вище описаних циклоалкільних груп, циклоалкільні групи що мають 3-16 атомів вуглецю які можуть бути заміщені, у циклоалкільному кільці, 1-3 групами, обраними з групи, що містить лінійну або розгалужену алкільну групу що має 1-6 атомів вуглецю заміщену аміно групою яка може мати 1 або 2 лінійну або розгалужену алкільні групи що мають 1-6 атомів вуглецю та лінійну або розгалужену алкільну групу що має 1-6 атомів вуглецю яка може мати 1-3 атомів галогенів як замісники, як от 4-диметиламінометилциклогексильна, 2-(амінометил)циклопропильна, 3-(2-амінометил)циклобутильна, 2-(1-аміноетил)циклопентильна, 3-(3-амінопропил)циклогексильна, 3-(4-амінобутил)циклогептильна, 4-(5-амінопентил)циклооктильна, 4-(6-аміногексил)циклогексильна, 2-(1,1-диметил-2-аміноетил)циклогептильна, 3-(2-метил-3-амінопропил)циклопентильна, 3-(метиламінометил)циклогексильна, 2-(1-етиламіноетил)циклооктильна, 2-(2-пропиламіноетил)циклогексильна, 3-(3-ізопропиламінопропил)циклопентильна, 4-(4-бутиламінобутил)циклогептильна, 2-(5-пентиламінопентил)циклогексильна, 2-(6-гексиламіногексил)циклопентильна, 3-(диметиламінометил)циклогексильна, 3-[(N-етил-N-пропиламіно)метил]циклогептильна, 4-[2-(N-метил-N-гексиламіно)етил]циклооктильна, 4-диметиламінометилциклононильна, 2-(амінометил)циклодецильна, 3-(2-амінометил)циклоундецильна, 2-(1-аміноетил)циклододецильна, 3-(3-амінопропил)циклотридецильна, 3-(4-амінобутил)циклотетрадецильна, 4-(5-амінопентил)циклопентадецильна, 4-(6-аміногексил)циклогексадецильна, 2-(1,1-диметил-2-аміноетил)циклононильна, 3-(2-метил-3-амінопропил)циклодецильна, 3-(метиламінометил)циклоундецильна, 2-(1-етиламіноетил)циклододецильна, 2-(2-пропиламіноетил)циклотридецильна, 3-(3-ізопропиламінопропил)циклотетрадецильна, 4-(4-бутиламінобутил)циклопентадецильна, 2-(5-

пентиламінопентил)циклогексадецильна, 2-(6-гексиламіногексил)циклононильна, 3-(диметиламінометил)циклододецильна, 3-[(N-етил-N-пропиламіно)метил]циклодецильна, 4-[2-(N-метил-N-гексиламіно)етил]циклогексадецильна, 2,2-диметилциклопропильна, та 2-трифторметилциклопропильна групи.

[0184]

Прикладами нижчої алкенільної групи є лінійна або розгалужена алкенільні групи що мають 2-6 атомів вуглецю та 1-3 подвійні зв'язки як от вінільна, 1-пропенільна, 1-метил-1-пропенільна, 2-метил-1-пропенільна, 2-пропенільна, 2-бутенільна, 1-бутенільна, 3-бутенільна, 2-пентенільна, 1-пентенільна, 3-пентенільна, 4-пентенільна, 1,3-бутадієнільна, 1,3-пентадієнільна, 2-пентен-4-інільна, 2-гексенільна, 1-гексенільна, 5-гексенільна, 3-гексенільна, 4-гексенільна, 3,3-диметил-1-пропенільна, 2-етил-1-пропенільна, 1,3,5-гексатриєнільна, 1,3-гексадієнільна, та 1,4-гексадієнільна групи.

Прикладами нижчої алкенільної групи, яка може мати атом галогену у якості замісника є, додатково до вищеписаної нижчої алкенільної групи, лінійна або розгалужена алкенільні групи що мають 2-6 атомів вуглецю, які можуть мати 1-3 атоми галогенів як замісники та які мають 1-3 подвійні зв'язки як от 3,3,3-трифтор-1-пропенільна, 2-бромвінільна, 3-хлор-1-пропенільна, 3-йод-1-метил-1-пропенільна, 3-фтор-2-метил-1-пропенільна, 2-бутенільна, 4,4,3-трихлор-1-бутенільна, 4,4-дифтор-3-бутенільна, 5-фтор-2-пентенільна, 5,5,3-трибром-1-пентенільна, 5-хлор-3-пентенільна, 5,5,5-трифтор-4-пентенільна, 4-хлор-1,3-бутадієнільна, 5-фтор-1,3-пентадієнільна, 5-бром-2-пентен-4-інільна, 6-фтор-2-гексенільна, 6,6,5-трифтор-1-гексенільна, 6-хлор-5-гексенільна, 5-бром-3-гексенільна, 6-хлор-4-гексенільна, 3,3-диметил-2-хлор-1-пропенільна, 3-фтор-2-етил-1-пропенільна, 6-хлор-1,3,5-гексатриєнільна, 6-бром-1,3-гексадієнільна, та 6-фтор-1,4-гексадієнільна групи.

Прикладами бензоїльної групи (яка може мати, у фенільному кільці, 1-3 замісники обрані з групи, що містить нижчу алکیلну групу, яка може мати атом галогену у якості замісника та атом галогену) є бензоїльні групи (яка може мати, у фенільному кільці, 1-3 замісники обрані з групи, що містить лінійну або розгалужену алکیلну групу що має 1-6 атомів вуглецю та яка може мати 1-3 атоми галогенів як замісники та атом галогену) як от бензоїльна, 3,4-дифторбензоїльна, 2-фторбензоїльна, 3-бромбензоїльна, 4-йодбензоїльна, 4-метилбензоїльна, 2-метилбензоїльна, 3-метилбензоїльна, 2-етилбензоїльна, 3-етилбензоїльна, 4-етилбензоїльна, 4-ізопропилбензоїльна, 3-бутилбензоїльна, 4-пентилбензоїльна, 4-гексилбензоїльна, 3,4-диметилбензоїльна, 3,4-диетилбензоїльна, 2,4-диметилбензоїльна, 2,5-диметилбензоїльна, 2,6-диметилбензоїльна, 3,4,5-триметилбензоїльна, 2-трифторметилбензоїльна, 3-трифторметилбензоїльна, 4-трифторметилбензоїльна, 2-(бромметил)бензоїльна, 3-(2-хлоретил)бензоїльна,

4-(2,3-дихлорпропил)бензоїльна, 4-(4-фторбутил)бензоїльна, 3-(5-хлорпентил)бензоїльна, 4-(5-бромгексил)бензоїльна, 4-(5,6-дибромгексил)бензоїльна, 3,4-ди(трифторметил)бензоїльна, 3,4-ди(4,4,4-трихлорбутил)бензоїльна, 2,4-ди(3-хлор-2-метилпропил)бензоїльна, 2,5-ди(3-хлорпропил)бензоїльна, 2,6-ди(2,2,2-трифторетил)бензоїльна, 3,4,5-три(трифторметил)бензоїльна, 4-(2,2,2-трихлоретил)бензоїльна, 2-метил-4-трифторметилбензоїльна, 3-етил-4-трихлорметилбензоїльна, 2-хлор-4-трифторметилбензоїльна, 3-етил-4-фторбензоїльна, 3-фтор-4-трихлорметилбензоїльна, 2-метил-3-трифторметил-4-трифторметилбензоїльна, 3-фторбензоїльна, 4-фторбензоїльна, 2-бромбензоїльна, 4-бромбензоїльна, 2-йодбензоїльна, 3-йодбензоїльна, 2,3-дибромбензоїльна, 2,4-дидйодбензоїльна, 2,5-дифторбензоїльна, 2,6-дихлорбензоїльна, 2,4,6-трихлорбензоїльна, 2,4-дифторбензоїльна, 3,5-дифторбензоїльна, 2,6-дифторбензоїльна, 2-хлорбензоїльна, 3-хлорбензоїльна, 4-хлорбензоїльна, 2,3-дихлорбензоїльна, 2,4-дихлорбензоїльна, 2,5-дихлорбензоїльна, 3,4-дихлорбензоїльна, 2,6-дихлорбензоїльна, 3,5-дихлорбензоїльна, 2,4,6-трифторбензоїльна, та 2,4-дифторбензоїльна групи.

Прикладами галоген заміщеної нижчої алکیلної групи є лінійна або розгалужена алکیلні групи, що мають 1-6 атомів вуглецю, які можуть мати 1-3 атом галогенів, як замісники як от трифторметил, трихлорметил, хлорметил, бромметил, фторметил, йодметил, дифторметил, дибромметил, 2-хлоретил, 2,2,2-трифторетил, 2,2,2-трихлоретил, 3-хлорпропил, 2,3-дихлорпропил, 4,4,4-трихлорбутил, 4-фторбутил, 5-хлорпентил, 3-хлор-2-метилпропил, 5-бромгексил, та 5,6-дибромгексил групи.

[0185]

Прикладами нижчої алкілендіокси групи є лінійна або розгалужена алкіленові групи що мають 1-4 атомів вуглецю як от метилендіокси, етилендіокси, триметилендіокси, та тетраметилендіокси групи.

[0186]

Прикладами аміно групи яка може мати замісник обраний з групи, що містить нижчу алکیلну групу, нижчу алканойльну групу, бензоїльну групу та циклоалکیلну групу є аміно група, яка може мати 1 або 2 замісники обрані з групи, що містить лінійну або розгалужену алکیلну групу що має 1-6 атомів вуглецю, лінійну або розгалужену алканойльну групу що має 1-6 атомів вуглецю, бензоїльну групу, та циклоалکیلну групу що має 3-16 атомів вуглецю як от аміно, метиламіно, етиламіно, пропиламіно, ізопропиламіно, бутиламіно, трет-бутиламіно, пентиламіно, гексиламіно, диметиламіно, диетиламіно, дипропиламіно, дибутиламіно, дипентиламіно, дигексиламіно, N-метил-N-етиламіно, N-етил-N-пропиламіно, N-метил-N-

бутиламіно, N-метил-N-гексиламіно, N-метил-N-ацетиламіно, N-ацетиламіно, N-формиламіно, N-пропіонаміно, N-бутириламіно, N-ізобутириламіно, N-пентаноїламіно, N-трет-бутилкарбоніламіно, N-гексаноїламіно, N-етил-N-ацетиламіно, N-бензоїламіно, N-етил-N-бензоїламіно, N-метил-N-бензоїламіно, N-ацетил-N-бензоїламіно, циклопропиламіно, циклобутиламіно, циклопентиламіно, циклогексиламіно, циклогептиламіно, циклооктиламіно, N-метил-N-циклогексиламіно, N-метил-N-циклопентиламіно, N-метил-N-циклогептиламіно, N-циклогексил-N-ацетиламіно, N-циклопентил-N-бензоїламіно, циклонониламіно, циклодециламіно, циклододециламіно, циклотридециламіно, циклотетрадециламіно, циклопентадециламіно, N-метил-N-циклогексадециламіно, N-метил-N-циклонониламіно, N-метил-N-циклодециламіно, N-циклоундецил-N-ацетиламіно, та N-циклогексадецил-N-бензоїлну групи.

[0187]

Прикладами нижчої алканойльної групи, яка може мати атом галогену у якості замісника є, додатково до вищеписаної нижчої алканойльної групи, лінійна або розгалужена алканойльна групи, що має 2-6 атомів вуглецю, яка може мати 1-3 атомів галогенів як замісники, як от 2,2,2-трифторацетильна, 2,2,2-трихлорацетильна, 2-хлорацетильна, 2-бромацетильна, 2-фторацетильна, 2-йодацетильна, 2,2-дифторацетильна, 2,2-дибромацетильна, 3,3,3-трифторпропіонільна, 3,3,3-трихлорпропіонільна, 3-хлорпропіонільна, 2,3-дихлорпропіонільна, 4,4,4-трихлорбутирильна, 4-фторбутирильна, 5-хлорпентаноїл, 3-хлор-2-метилпропіонільна, 6-бромгексаноїльна, та 5,6-дибромгексаноїльна групи.

[0188]

Прикладами нижчої алкоксикарбонільної групи є алкоксикарбонільні групи алкокси частина яких є лінійна або розгалужена алкокси група що має 1-6 атомів вуглецю як от метоксикарбонілілні, етоксикарбонілілні, пропоксикарбонілілні, ізопроксикарбонілілні, бутоксикарбонілілні, трет-бутоксикарбонілілні, пентилоксикарбонілілні, та гексилоксикарбонілілні групи.

[0189]

Прикладами нижчої алканойлокси групи є лінійна або розгалужена алканойлокси групи що мають 2-6 атомів вуглецю як от ацетилокси, пропіонілокси, бутирилокси, ізобутирилокси, пентаноїлокси, трет-бутилкарбонілокси, та гексаноїлокси групи.

[0190]

Прикладами 5- або 6-членної насиченої або ненасиченої гетероциклічної групи, що має 1-4 атоми азоту, атоми кисню або атоми сірки є пірролідинільна, піперидинільна, піперазинільна, морфолінова, тіоморфолінова, піридилна, 1,2,5,6-тетрагідропіридилна, тієнільна, піразильна, піримідилна, піридазильна, пірролільна, 2H-пірролільна, імідазолідинільна, піразолільна, імідазолільна, піразолідинільна, фуразанільна, 2-

імідазолінільна, імідазолідинільна, 2-пірролінільна, фурильна, оксазолільна, ізооксазолідинільна, ізооксазолільна, тіазолільна, ізотіазолільна, піранільна, 2-піразолідинільна, 1,2,4-триазолільна, 1,2,3-триазолільна, 1,2,5-триазолільна, тіазолідинільна, 2-тіазолінільна, 1,2,3,4-тетразолільна, 1,3,4-оксадіазолільна, тетрагідропіранільна, та тетрагідрофурильна групи.

[0191]

Приклади 5-7-членного насиченого гетероциклічного кільця, утвореного зв'язуванням R<sup>11</sup> та R<sup>12</sup> один з одним, разом з атоми азоту прив'язаними до них, за допомогою або без допомоги атому азоту, атому сірки або атому кисню, є пірролідинільна, піперидинільна, піперазинільна, морфолінова, тіоморфолінова, та гомопіперазинільна групи.

[0192]

Прикладами імідазолільної нижчої алкільної групи є імідазолільнаалкільні групи алкільна частина яких є лінійна або розгалужена алкільні групи що мають 1-6 атомів вуглецю, як от (1,2,4 або 5-)імідазолільнаметильна, 2-[(1,2,4 або 5-)імідазолільна]етильна, 1-[(1,2,4 або 5-)імідазолільна]етильна, 3-[(1,2,4 або 5-)імідазолільна]пропильна, 4-[(1,2,4 або 5-)імідазолільна]бутильна, 5-[(1,2,4 або 5-)імідазолільна]пентильна, 6-[(1,2,4 або 5-)імідазолільна]гексильна, 1,1-диметил-2-[(1,2,4 або 5-)імідазолільна]етильна, та 2-метил-3-[(1,2,4 або 5-)імідазолільна]пропильна групи.

[0193]

Прикладами 1,2,4-триазолільної нижчої алкільної групи є 1,2,4-триазолільнаалкільні групи алкільна частина яких є лінійна або розгалужена алкільна група що має 1-6 атомів вуглецю, як от (1,3 або 5-)1,2,4-триазолільнаметильна, 2-[(1,3 або 5-)1,2,4-триазолільна]етильна, 1-[(1,3 або 5-)1,2,4-триазолільна]етильна, 3-[(1,3 або 5-)1,2,4-триазолільна]пропильна, 4-[(1,3 або 5-)1,2,4-триазолільна]бутильна, 5-[(1,3 або 5-)1,2,4-триазолільна]пентильна, 6-[(1,3 або 5-)1,2,4-триазолільна]гексильна, 1,1-диметил-2-[(1,3 або 5-)1,2,4-триазолільна]етильна, та 2-метил-3-[(1,3 або 5-)1,2,4-триазолільна]пропильна групи.

[0194]

Прикладами 1,2,3-триазолільної нижчої алкільної групи є 1,2,3-триазолільнаалкільні групи алкільна частина яких є лінійна або розгалужена алкільна група що має 1-6 атомів вуглецю, як от (1,4 або 5-)1,2,3-триазолільнаметильна, 2-[(1,4 або 5-)1,2,3-триазолільна]етильна, 1-[(1,4 або 5-)1,2,3-триазолільна]етильна, 3-[(1,4 або 5-)1,2,3-триазолільна]пропильна, 4-[(1,4 або 5-)1,2,3-триазолільна]бутильна, 5-[(1,4 або 5-)1,2,3-триазолільна]пентильна, 6-[(1,4 або 5-)1,2,3-триазолільна]гексильна, 1,1-диметил-2-[(1,4 або 5-)1,2,3-триазолільна]етильна, та 2-метил-3-[(1,4 або 5-)1,2,3-триазолільна]пропильна групи.

[0195]

Прикладами 1,2,5-триазолільної нижчої алкільної групи є 1,2,5-триазолільнаалкільні групи алкільна частина є лінійна або розгалужена алкільна групи що має 1-6 атомів вуглецю, як от

(1,3 або 4-)-1,2,5-триазолільнаметильна, 2-[(1,3 або 4-)-1,2,5-триазоліль]етильна, 1-[(1,3 або 4-)-1,2,5-триазоліль]етильна, 3-[(1,3 або 4-)-1,2,5-триазоліль]пропильна, 4-[(1,3 або 4-)-1,2,5-триазоліль]бутильна, 5-[(1,3 або 4-)-1,2,5-триазоліль]пентильна, 6-[(1,3 або 4-)-1,2,5-триазоліль]гексильна, 1,1-диметил-2-[(1,3 або 4-)-1,2,5-триазоліль]етильна, та 2-метил-3-[(1,3 або 4-)-1,2,5-триазоліль]пропильна групи.

[0196]

Прикладами піразоліл нижчої алкільної групи є піразолільнаалкільні групи алкільна частина яких є лінійна або розгалужена алкільна група, що має 1-6 атомів вуглецю, як от (1,3, 4 або 5-)піразоліл]метильна, 2-[(1,3, 4 або 5-)піразоліл]етильна, 1-[(1,3, 4 або 5-)піразоліл]етильна, 3-[(1,3, 4 або 5-)піразоліл]пропильна, 4-[(1,3, 4 або 5-)піразоліл]бутильна, 5-[(1,3, 4 або 5-)піразоліл]пентильна, 6-[(1,3, 4 або 5-)піразоліл]гексильна, 1,1-диметил-2-[(1,3, 4 або 5-)піразоліл]етильна, та 2-метил-3-[(1,3, 4 або 5-)піразоліл]пропильна групи.

[0197]

Прикладами піримідинільної нижчої алкільної групи, яка може мати оксо групу у якості замісника у піримідиновому кільці є піримідинілалкільні групи, які можуть мати 1-3 оксо групи як замісники у піримідиновому кільці та алкільна частина яких є лінійна або розгалужена алкільна група що має 1-6 атомів вуглецю, як от (2,4,5 або 6-)піримідинілметильна, 2-[(2,4,5 або 6-)піримідиніл]етильна, 1-[(2,4,5 або 6-)піримідиніл]етильна, 3-[(2,4,5 або 6-)піримідиніл]пропильна, 4-[(2,4,5 або 6-)піримідиніл]бутильна, 5-[(2,4,5 або 6-)піримідиніл]пентильна, 6-[(2,4,5 або 6-)піримідиніл]гексильна, 1,1-диметил-2-[(2,4, 5 або 6-)піримідиніл]етил, 2-метил-3-[(2,4,5 або 6-)піримідиніл]пропил, [(1,3,4 або 5-)2,6-диоксопіримідиніл]метил, [(1,3,4,5 або 6-)2-оксопіримідиніл]метил, [(1,2,4 або 5-)6-оксопіримідиніл]метил, [(1,2, 5 або 6-)4-оксопіримідиніл]метил, [(1,3,5 або 6-)2,4-диоксопіримідиніл]метил, 2-[(4 або 6-)2,5-диоксопіримідиніл]етил, 1-[(1,3,4 або 5-)2,6-диоксопіримідиніл]етил, 3-[(1,3 або 5-)2,4,6-триоксопіримідиніл]пропил, 4-[(1,3,4 або 5-)2,6-диоксопіримідиніл]бутил, 5-[(4 або 6-)2,5-диоксопіримідиніл]пентил, 6-[(1,3, 5 або 6-)2,4-диоксопіримідиніл]гексил, 1,1-диметил-[(1,3,4 або 5-)2,6-диоксопіримідиніл]етил, та 2-метил-3-[(1,3,4 або 5-)2,6-диоксопіримідиніл]пропил групи.

[0198]

Прикладами 3,5-диоксоізооксазолідин-4-іліден нижчої алкільної групи є 3,5-диоксоізооксазолідин-4-іліденалкільні групи алкільна частина яких є лінійна або розгалужена алкільну групу having 1-6 атомів вуглецю як от 3,5-диоксоізооксазолідин-4-іліденметил, 3,5-диоксоізооксазолідин-4-іліденетил, 3,5-диоксоізооксазолідин-4-іліденпропил, 3,5-диоксоізооксазолідин-4-іліденізопропил, 3,5-диоксоізооксазолідин-4-іліденбутил, 3,5-диоксоізооксазолідин-4-іліденпентил, та 3,5-диоксоізооксазолідин-4-іліденгексил групи.

[0199]

Прикладами 1,2,4-оксадіазолільної нижчої алкільної групи, яка може мати нижчу алкільну групу у якості замісника у 1,2,4-оксадіазольному кільці є 1,2,4-оксадіазолілалкільні групи, які можуть мати лінійну або розгалужену алкільну групу що має 1-6 атомів вуглецю у якості замісника у 1,2,4-оксадіазольному кільці та алкільна частина яких є лінійна або розгалужена алкільна група, що має 1-6 атомів вуглецю, як от (3 або 5-)1,2,4-оксадіазолілметильна, 2-[(3 або 5-)1,2,4-оксадіазоліл]етильна, 1-[(3 або 5-)1,2,4-оксадіазоліл]етильна, 3-[(3 або 5-)1,2,4-оксадіазоліл]пропильна, 4-[(3 або 5-)1,2,4-оксадіазоліл]бутильна, 5-[(3 або 5-)1,2,4-оксадіазоліл]пентильна, 6-[(3 або 5-)1,2,4-оксадіазоліл]гексильна, 1,1-диметил-2-[(3 або 5-)1,2,4-оксадіазоліл]етильна, 2-метил-3-[(3 або 5-)1,2,4-оксадіазоліл]пропильна, 5-метил-3-(1,2,4-оксадіазоліл)метильна, 3-етил-2-[5-(1,2,4-оксадіазоліл)]етильна, 1-[3-пропил-5-(1,2,4-оксадіазоліл)]етильна, 3-[5-бутил-3-(1,2,4-оксадіазоліл)]пропильна, 4-[3-пентил-5-(1,2,4-оксадіазоліл)]бутильна, 5-[5-гексил-3-(1,2,4-оксадіазоліл)]пентильна, 6-[3-метил-5-(1,2,4-оксадіазоліл)]гексильна, 1,1-диметил-2-[5-ізопропил-3-(1,2,4-оксадіазоліл)]етильна, та 2-метил-3-[3-ізобутил-5-(1,2,4-оксадіазоліл)]пропильна групи.

[0200]

Прикладами тіазолідиніл нижчої алкільної групи, яка може мати оксо групу у якості замісника у тіазолідиновому кільці є тіазолідинілалкільні групи які можуть мати 1-3 оксо групи як замісники у тіазолідиновому кільці та алкільна частина яких є лінійна або розгалужена алкільна група що має 1-6 атомів вуглецю, як от (2,3, 4 або 5-)тіазолідинілметильна, 2-[(2,3,4 або 5-)тіазолідиніл]етильна, 1-[(2,3,4 або 5-)тіазолідиніл]етильна, 3-[(2,3,4 або 5-)тіазолідиніл]пропильна, 4-[(2,3,4 або 5-)тіазолідиніл]бутильна, 5-[(2,3,4 або 5-)тіазолідиніл]пентильна, 6-[(2,3,4 або 5-)тіазолідиніл]гексильна, 1,1-диметил-2-[(2,3,4 або 5-)тіазолідиніл]етильна, 2-метил-3-[(2,3,4 або 5-)тіазолідиніл]пропильна, 2,4-диоксо-5-тіазолідинілметильна, 2-[2-оксо-(3,4 або 5-)тіазолідиніл]етильна, 1-[4-оксо-(2,3 або 5-)тіазолідиніл]етильна, 3-[5-оксо-(2,3 або 4-)тіазолідиніл]пропильна, 4-[2,5-диоксо-(3 або 4-)тіазолідиніл]бутильна, 5-[2,4,5-триоксо-3-тіазолідиніл]пентильна, 6-[4,5-диоксо-(2 або 3-)тіазолідиніл]гексильна, 1,1-диметил-2-[2,4-диоксо-(3 або 5-)тіазолідиніл]етильна, 2-метил-3-[2,4-диоксо-(3 або 5-)тіазолідиніл]пропильна, та 3-[2,4-диоксо-(3 або 5-)тіазолідиніл]пропильна групи.

[0201]

Прикладами феніл нижчої алкільної групи, яка може мати нижчу алкілендіоксигрупу у якості замісника у фенільному кільці є, додатково до вищеописаної феніл нижчих алкільних груп, фенілалкільні групи які можуть мати лінійну або розгалужену алкілендіоксигрупу що має 1-4 атомів вуглецю у якості замісника у фенільному кільці та алкільна частина яких є лінійна або розгалужена алкільна група, що має 1-6 атомів

вуглецю як от 3,4-метилендіоксибензилна, 3,4-триметилендіоксибензилна, 2-(2,3-етилендіоксифеніл)етильна, 1-(3,4-триметилендіоксифеніл)етильна, 3-(2,3-тетраметилендіоксифеніл)пропильна, 4-(3,4-метилендіоксифеніл)бутильна, 5-(2,3-етилендіоксифеніл)пентильна, 6-(3,4-триметилендіоксифеніл)гексильна, 1,1-диметил-2-(2,3-метилендіоксифеніл)етильна, та 2-метил-3-(3,4-етилендіоксифеніл)пропильна групи.

[0202]

Прикладами нижчої алкоксикарбоніл нижчої алкільної групи є алкоксикарбонілалкільні групи алкокси частина яких є лінійна або розгалужена алкокси група що має 1-6 атомів вуглецю та алкільна частина яких є лінійна або розгалужена алкільна група що має 1-6 атомів вуглецю, як от метоксикарбонілметильна, 2-етоксикарбонілметильна, 2-етоксикарбонілетильна, 1-етоксикарбонілетильна, 3-метоксикарбонілпропильна, 3-етоксикарбонілпропильна, 4-етоксикарбонілбутильна, 5-ізопропоксикарбонілпентильна, 6-пропоксикарбонілгексильна, 1,1-диметил-2-бутоксикарбонілетильна, 2-метил-3-трет-бутоксикарбонілпропильна, 2-пентилоксикарбонілетильна, та гексилоксикарбонілметильна групи.

[0203]

Прикладами карбокси нижчої алкільної групи є карбоксиалкільні групи алкільна частина яких є лінійна або розгалужена алкільна група що має 1-6 атомів вуглецю, як от карбоксиметильна, 2-карбоксиетильна, 1-карбоксиетильна, 3-карбоксипропильна, 4-карбоксибутильна, 5-карбоксипентильна, 6-карбоксигексильна, 1,1-диметил-2-карбоксиетильна, та 2-метил-3-карбоксипропильна групи.

[0204]

Прикладами морфоліно заміщеної нижчої алканойльної групи є морфоліно заміщені алканойльні групи, алканойльна частина яких є лінійна або розгалужена алканойльна група, що має 2-6 атомів вуглецю, як от 2-[(2,3 або 4-)морфоліно]ацетильна група, 3-[(2,3 або 4-)морфоліно]пропіонильна, 2-[(2,3 або 4-)морфоліно]пропіонильна, 4-[(2,3 або 4-)морфоліно]бутирильна, 5-[(2,3 або 4-)морфоліно]пентаноїл, 6-[(2,3 або 4-)морфоліно]гексаноїл, 2,2-диметил-2-[(2,3 або 4-)морфоліно]пропіонильна, та 2-метил-3-[(2,3 або 4-)морфоліно]пропіонильна групи.

[0205]

Прикладами піперазинілкарбоніл нижчої алкільної групи, яка може бути заміщена у піперазиновому кільці фенільною групою нижчого алкілу, яка може мати нижчу алкілендіоксигрупу у якості замісника у фенільному кільці, є піперазинілкарбонілалкільні групи, алкіл частина яких є лінійна або розгалужена алкільна група, що має 1-6 атомів вуглецю та яка може бути заміщена у піперазиновому кільці 1-3 фенілалкільними групами, яка може мати лінійну або розгалужену

алкілендіокси групу, що має 1-4 атомів вуглецю у якості замісника у фенільній групі та алкільна частина яких є лінійна або розгалужена алкільна група, що має 1-6 атомів вуглецю, як от [(1,2 або 3-)піперазиніл]карбонілметильна, 2-[(1,2 або 3-)піперазиніл]карбонілетильна, 1-[(1,2 або 3-)піперазиніл]карбонілетильна, 3-[(1,2 або 3-)піперазиніл]карбонілпропильна, 4-[(1,2 або 3-)піперазиніл]карбонілбутильна, 5-[(1,2 або 3-)піперазиніл]карбонілпентильна, 6-[(1,2 або 3-)піперазиніл]карбонілгексильна, 1,1-диметил-2-[(1,2 або 3-)піперазиніл]карбонілетильна, 2-метил-3-[(1,2 або 3-)піперазиніл]карбонілпропильна, (4-бензил-1-піперазинілкарбоніл)метильна, 2-[4-(2-фенілетил)-1-піперазинілкарбоніл]етильна, 1-[4-(3-фенілпропил)-1-піперазинілкарбоніл]етильна, 3-[4-(4-фенілбутил)-1-піперазинілкарбоніл]пропильна, 4-[4-(5-фенілпентил)-1-піперазинілкарбоніл]бутильна, 5-[4-(6-фенілпропил)-1-піперазинілкарбоніл]пентильна, 6-(4-бензил-1-піперазинілкарбоніл)гексильна, 1,1-диметил-2-(4-бензил-1-піперазинілкарбоніл)етильна, 2-метил-3-(4-бензил-1-піперазинілкарбоніл)пропильна, 4-[4-(3,4-метилендіоксибензил)-1-піперазинілкарбоніл]метильна, 2-[4-[2-(2,3-етилендіоксифеніл)етил]-1-піперазинілкарбоніл]етильна, 1-[4-[3-(3,4-триметилендіоксифеніл)пропил]-1-піперазинілкарбоніл]етильна, 3-[4-[4-(2,3-тетраметилендіоксифеніл)бутил]-1-піперазинілкарбоніл]пропильна, 4-[4-[5-(3,4-метилендіоксифеніл)пентил]-1-піперазинілкарбоніл]бутильна, 5-[4-[3-(2,3-етилендіоксифеніл)пропил]-1-піперазинілкарбоніл]пентильна, 6-[4-(3,4-триметилендіоксибензил)-1-піперазинілкарбоніл]гексильна, 1,1-диметил-2-[4-(2,3-тетраметилендіоксибензил)-1-піперазинілкарбоніл]етильна, 2-метил-3-[4-(3,4-метилендіоксибензил)-1-піперазинілкарбоніл]пропильна, (3,4-добензил-1-піперазинілкарбоніл)метильна, (3,4,5-трибензил-1-піперазинілкарбоніл)метильна, [2,4-ди(3,4-метилендіоксибензил)-1-піперазинілкарбоніл]метильна, [2,4,6-три(3,4-метилендіоксибензил)-1-піперазинілкарбоніл]метильна, та [3-бензил-4-(3,4-метилендіоксибензил)-1-піперазинілкарбоніл]метильна групи.

[0206]

Прикладами піперазиніл нижчої алканойльної групи яка може бути заміщена у піперазиновому кільці фенільною групою нижчого алкілу, яка може мати нижчу алкілендіоксигрупу у якості замісника у фенільному кільці, є піперазинілалканоїльні групи алканойльна частина яких є лінійна або розгалужена алканойльна група, що має 2-6 атомів вуглецю та яка може бути заміщена у піперазиновому кільці 1-3 фенілалкільними групами, яка може мати лінійну або розгалужену алкілендіокси групу, що має 1-4 атомів вуглецю у якості замісника у фенільному кільці та алкільна частина яких є лінійна або розгалужена алкільна група, що має 1-6 атомів вуглецю, як от 2-[(1,2 або

3-)піперазиніл]ацетильна, 3-[(1,2 або 3-)  
 піперазиніл]пропіонільна, 2-[(1,2 або 3-)  
 піперазиніл]пропіонільна, 4-[(1,2 або 3-)  
 піперазиніл]бутирільна, 5-[(1,2 або 3-)  
 піперазиніл]пентаноїльна, 6-[(1,2 або 3-)  
 піперазиніл]гексаноїльна, 2,2-диметил-3-[(1,2 або 3-)  
 піперазиніл]пропіонільна, 2-метил-3-[(1,2 або 3-)  
 піперазиніл]пропіонільна, 2-(4-бензил-1-  
 піперазиніл]ацетильна, 3-[4-(2-фенілетил)-1-  
 піперазиніл]пропіонільна, 2-[4-(3-фенілпропил)-1-  
 піперазиніл]пропіонільна, 4-[4-(4-фенілбутил)-1-  
 піперазиніл]бутирільна, 5-[4-(5-фенілпентил)-1-  
 піперазиніл]пентаноїльна, 6-[4-(6-фенілпропил)-1-  
 піперазиніл]гексаноїльна, 6-(4-бензил-1-  
 піперазиніл]гексаноїльна, 2,2-диметил-3-(4-  
 бензил-1-піперазиніл]пропіонільна, 2-метил-3-(4-  
 бензил-1-піперазиніл]пропіонільна, 2-[4-(3,4-  
 метилендиоксибензил)-1-піперазиніл]ацетильна,  
 3-[4-[2-(2,3-етилендиоксибензил)етил]-1-  
 піперазиніл]пропіонільна, 2-[4-[3-(3,4-  
 триметилендиоксибензил)пропил]-1-  
 піперазиніл]пропіонільна, 4-[4-[4-(2,3-  
 тетраметилендиоксибензил)бутил]-1-  
 піперазиніл]бутирільна, 5-[4-[5-(3,4-  
 метилендиоксибензил)пентил]-1-  
 піперазиніл]пентаноїльна, 5-[4-[3-(2,3-  
 етилендиоксибензил)пропил]-1-  
 піперазиніл]пентаноїльна, 6-[4-(3,4-  
 триметилендиоксибензил)-1-  
 піперазиніл]гексаноїльна, 2,2-диметил-3-[4-(2,3-  
 тетраметилендиоксибензил)-1-  
 піперазиніл]пропіонільна, 2-метил-3-[4-(3,4-  
 метилендиоксибензил)-1-піперазиніл]пропіонільна,  
 2-(3,4-добензил-1-піперазиніл]ацетильна, 2-(3,4,5-  
 трибензил-1-піперазиніл]ацетильна, 2-[2,4-ди(3,4-  
 метилендиоксибензил)-1-піперазиніл]ацетильна,  
 2-[2,4,6-три(3,4-метилендиоксибензил)-1-  
 піперазиніл]ацетильна, та 2-[3-бензил-4-(3,4-  
 метилендиоксибензил)-1-піперазиніл]ацетильна  
 групи.

[0207]

Прикладами морфолінокарбоніл заміщеної  
 нижчої алкільної групи є морфолінокарбонілалкільні групи алкільна частина  
 яких є лінійна або розгалужена алкільна група, що  
 має 1-6 атомів вуглецю, як от [(2,3 або 4-)  
 морфоліно]карбонілметильна, 2-[(2,3 або 4-)  
 морфоліно]карбонілетильна, 1-[(2,3 або 4-)  
 морфоліно]карбонілетильна, 3-[(2,3 або 4-)  
 морфоліно]карбонілпропильна, 4-[(2,3 або 4-)  
 морфоліно]карбонілбутильна, 5-[(2,3 або 4-)  
 морфоліно]карбонілпентильна, 6-[(2,3 або 4-)  
 морфоліно]карбонілгексильна, 1,1-диметил-2-[(2,3  
 або 4-)морфоліно]карбонілетильна, та 2-метил-3-  
 [(2,3 або 4-)морфоліно]карбонілпропильна групи.

[0208]

Прикладами імідазоліл нижчої алканоїльної  
 групи є імідазолілалканоїльні групи алканоїльна  
 частина яких є лінійна або розгалужена  
 алканоїльна група, що має 2-6 атомів вуглецю як  
 от 2-[(1,2,4 або 5-)імідазоліл]ацетильна, 3-[(1,2,4  
 або 5-)імідазоліл]пропіонільна, 2-[(1,2,4 або 5-)  
 імідазоліл]пропіонільна, 4-[(1,2,4 або 5-)  
 імідазоліл]бутирільна, 5-[(1,2,4 або 5-)  
 імідазоліл]пентаноїльна, 6-[(1,2,4 або 5-)

імідазоліл]гексаноїльна, 2,2-диметил-3-[(1,2,4 або  
 5-)імідазоліл]пропіонільна, та 2-метил-3-[(1,2, 4  
 або 5-)імідазоліл]пропіонільна групи.

[0209]

Прикладами циклоалкілкарбонільної групи є  
 циклоалкілкарбонільні групи, циклоалкіл частина  
 яких є циклоалкільної групи, що має 3-16 атомів  
 вуглецю як от циклопропилкарбонільна,  
 циклобутилкарбонільна, циклопентилкарбонільна,  
 циклогексилкарбонільна, циклогептилкарбонільна,  
 циклооктилкарбонільна, циклононилкарбонільна,  
 циклодецилкарбонільна,  
 циклоундецилкарбонільна,  
 циклододецилкарбонільна,  
 циклотридецилкарбонільна,  
 циклотетрадецилкарбонільна,  
 циклопентадецилкарбонільна, та  
 циклогексадецилкарбонільні групи.

[0210]

Прикладами аміно заміщеної нижчої  
 алканоїльної групи, яка може мати нижчу алкільну  
 групу у якості замісника, є лінійна або розгалужена  
 алканоїльні групи що має 2-6 атомів вуглецю,  
 заміщені аміно групою, яка може мати 1 або 2  
 лінійні або розгалужені алкільні групи, що мають 1-  
 6 атомів вуглецю як замісники, як от  
 аміноацетильна, 2-амінопропіонільна, 3-  
 амінопропіонільна, 4-амінобутирільна, 5-  
 амінопентаноїльна, 6-аміногексаноїльна, 2,2-  
 диметил-3-амінопропіонільна, 2-метил-3-  
 амінопропіонільна, метиламіноацетильна, 2-  
 етиламінопропіонільна, 3-  
 пропиламінопропіонільна, 3-  
 ізопропиламінопропіонільна, 4-  
 бутиламінобутирільна, 5-  
 пентиламінопентаноїльна, 6-  
 гексиламіногексаноїльна, диметиламіноацетильна,  
 3-діізопропиламінопропіонільна, (N-етил-N-  
 пропиламіно)ацетильна, та 2-(N-метил-N-  
 гексиламіно)ацетильна групи.

[0211]

Прикладами нижчої алкіленової групи, яка  
 може мати гідроксильну групу у якості замісника є,  
 додатково до вищеприписаної нижчої алкіленової  
 групи, лінійна або розгалужена алкіленові групи,  
 що мають 1-6 атомів вуглецю, яка може мати 1-3  
 гідроксильні групи як замісники, як от 1-  
 гідроксиметиленова, 2-гідроксиетиленова, 1-  
 гідроксиетиленова, 2-гідрокситриметиленова, 3-  
 гідрокситриметиленова, 1-гідрокситриметиленова,  
 3-гідрокси-2-метилтриметиленова, 1-гідрокси-2-  
 метилтриметиленова, 3-гідрокси-2,2-  
 диметилтриметиленова, 1-гідрокси-2,2-  
 диметилтриметиленова, 3-гідрокси-1-  
 метилтриметиленова, 2-гідрокси-1-  
 метилтриметиленова, 1-  
 гідроксиметилметиленова,  
 гідроксиметилметиленова, 2-  
 гідроксиметилтриметиленова, 2-гідроксиметил-2-  
 метилтриметиленова, (2-гідроксиетил)метиленова,  
 (1-гідроксиетил)метиленова, 4-  
 гідрокситетраметиленова, 2-  
 гідрокситетраметиленова, 3-  
 гідрокситетраметиленова, 1-  
 гідрокситетраметиленова, 5-

гідроксипентаметиленова, 4-  
 гідроксипентаметиленова, 3-  
 гідроксипентаметиленова, 2-  
 гідроксипентаметиленова, 1-  
 гідроксипентаметиленова, 6-  
 гідроксигексаметиленова, 5-  
 гідроксигексаметиленова, 4-  
 гідроксигексаметиленова, 3-  
 гідроксигексаметиленова, 2-  
 гідроксигексаметиленова, 1-  
 гідроксигексаметиленова, 1,2-  
 дигідрокситриметиленова, 2,2,4-  
 тригідрокситетраметиленова, 1,2,6-  
 тригідроксигексаметиленова, та 3,4,5-  
 тригідроксипентаметиленова групи.

[0212]

Прикладами алкільної групи, яка може мати гідроксильну групу у якості замісника є, додатково до вищеописаної нижчої алкільної групи, лінійна або розгалужена алкільні групи що мають 1-16 атомів вуглецю, яка може мати 1-3 гідроксильні групи як замісники, як от гептильна, октильна, нонильна, децильна, ундецильна, додецильна, тридецильна, тетрадецильна, пентадецильна, 1-метилгексильна, гексадецильна, гідроксиметильна, 2-гідроксиетильна, 1-гідроксиетильна, 3-гідроксипропильна, 2,3-дигідроксипропильна, 4-гідроксибутильна, 1,1-диметил-2-гідроксиетильна, 5,5,4-тригідроксипентильна, 5-гідроксипентильна, 6-гідроксигексильна, 1-гідроксиізопропильна, та 2-метил-3-гідроксипропильна групи.

[0213]

Прикладами гідроксильної групи, заміщеної алкільною групою є лінійна або розгалужена алкільні групи що мають 1-16 атомів вуглецю та 1-3 гідроксильні групи як замісники, як от гідроксиметильна, 2-гідроксиетильна, 1-гідроксиетильна, 3-гідроксипропильна, 2,3-дигідроксипропильна, 4-гідроксибутильна, 1,1-диметил-2-гідроксиетильна, 5,5,4-тригідроксипентильна, 5-гідроксипентильна, 6-гідроксигексильна, 1-гідроксиізопропильна, та 2-метил-3-гідроксипропильна групи.

[0214]

Прикладами циклоалкільної групи, яка може мати замісник обраний з групи, що містить гідроксильну групу та нижчу алкільну групу є, додатково до вищеописаних циклоалкільних груп, циклоалкільні групи що мають 3-16 атомів вуглецю, які можуть мати 1-3 замісники обрані з групи, що містить гідроксильну групу та лінійну або розгалужену алкільну групу, що має 1-6 атомів вуглецю, як от 2-гідроксициклопропильна, 3-гідроксициклобутильна, 3-гідроксициклопентильна, 2-гідроксициклогексильна, 4-гідроксициклогексильна, 3-гідроксициклогептильна, 4-гідроксициклооктильна, 5-гідроксициклононильна, 3-гідроксициклодецильна, 4-гідроксициклодецильна, 5-гідроксициклоундецильна, 6-гідроксициклодецильна, 7-гідроксициклотридецильна, 6-гідроксициклотетрадецильна, 8-гідроксициклопентадецильна,

гідроксициклогексадецильна, 2,4-  
 дигідроксициклогексильна, 2,4,6-  
 тригідроксициклогексильна, 1-  
 метилциклопентильна, 2-етилциклопропильна, 3-  
 n-пропилциклобутильна, 2-n-бутилциклогексильна,  
 4-n-пентилциклогептильна, 4-n-  
 гексилциклооктильна, 2,3-диметилциклогексильна,  
 2,3,4-триметилциклогексильна, та 2-метил-4-  
 гідроксициклогексильна групи.

[0215]

Прикладами фенокси нижчої алкільної групи є феноксиалкільні групи алкільна частина якої є лінійна або розгалужена алкільна група, що має 1-6 атомів вуглецю як от феноксиметильна, 2-феноксиетильна, 1-феноксиетильна, 3-феноксипропильна, 4-феноксибутильна, 1,1-диметил-2-феноксиетильна, 5-феноксипентильна, 6-феноксигексильна, 1-феноксиізопропильна, та 2-метил-3-феноксипропильна групи.

[0216]

Прикладами аміно нижчої алкокси групи, яка може мати нижчу алкільну групу у якості замісника, є лінійна або розгалужена алкокси групи, що мають 1-6 атомів вуглецю, заміщені аміно групою, яка може мати 1 або 2 лінійні або розгалужені алкільні групи, що мають 1-6 атомів вуглецю, як от амінометокси, 2-аміноетокси, 1-аміноетокси, 3-амінопропокси, 4-амінобутокси, 5-амінопентилокси, 6-аміногексилокси, 1,1-диметил-2-аміноетокси, 2-метил-3-амінопропокси, метиламінометокси, 1-етиламіноетокси, 2-пропиламіноетокси, 3-ізопропиламінопропокси, 4-бутиламінобутокси, 5-пентиламінопентилокси, 6-гексиламіногексилокси, диметиламінометокси, 2-диетиламіноетокси, 2-диізопропиламіноетокси, (N-етил-N-пропиламіно)метокси, та 2-(N-метил-N-гексиламіно)етокси групи.

[0217]

Прикладами гідроксильної групи заміщеної нижчою алкільною групою, є лінійна або розгалужена алкільні групи, що мають 1-6 атомів вуглецю, які мають 1-3 гідроксильні групи як замісники, як от гідроксиметильна, 1-гідроксиетильна, 2-гідроксиетильна, 3-гідроксипропильна, 2,3-дигідроксипропильна, 4-гідроксибутильна, 1,1-диметил-2-гідроксиетильна, 5,5,4-тригідроксипентильна, 5-гідроксипентильна, 6-гідроксигексильна, 1-гідроксиізопропильна, та 2-метил-3-гідроксипропильна групи.

[0218]

Прикладами аміно групи, яка може мати нижчий алкілсульфоніл у якості замісника, є аміно групи які можуть мати 1 або 2 лінійні або розгалужені алкілсульфонільні групи, що мають 1-6 атомів вуглецю як замісники, як от аміно, метилсульфоніламіно, етилсульфоніламіно, пропилсульфоніламіно, ізопропилсульфоніламіно, бутилсульфоніламіно, трет-бутилсульфоніламіно, пентилсульфоніламіно, гексилсульфоніламіно, диметилсульфоніламіно, диетилсульфоніламіно, дипропилсульфоніламіно, дибутилсульфоніламіно, дипентилсульфоніламіно, дигексилсульфоніламіно, N-метилсульфоніл-N-етилсульфоніламіно, N-етилсульфоніл-N-пропилсульфоніламіно, N-метилсульфоніл-N-



бутилсульфоніламіно, та N-метилсульфоніл-N-гексилсульфоніламіно групи.

[0219]

Прикладами нижчої алкінільної групи є лінійна або розгалужена алкінільна групи що мають 2-6 атомів вуглецю, як от етинільна, 2-пропінільна, 2-бутинільна, 3-бутинільна, 1-метил-2-пропінільна, 2-пентинільна, та 2-гексінільна групи.

[0220]

Прикладами анілінової групи, яка може мати атом галогену у якості замісника у фенільному кільці, є аніліно групи, які можуть мати 1-3 атоми галогену як замісники у фенільному кільці, як от аніліно, 2-фтораніліно, 3-фтораніліно, 4-фтораніліно, 2-броманіліно, 3-броманіліно, 4-броманіліно, 2-йоданіліно, 3-йоданіліно, 4-йоданіліно, 2,3-диброманіліно, 2,4-дидіоданіліно, 2,5-дифтораніліно, 2,6-дихлораніліно, 2,4,6-трихлораніліно, 2,6-дифтораніліно, 3,5-дифтораніліно, 2,6-дифтораніліно, 2-хлораніліно, 3-хлораніліно, 4-хлораніліно, 2,3-дихлораніліно, 2,4-дихлораніліно, 2,5-дихлораніліно, 3,4-дихлораніліно, 2,6-дихлораніліно, 3,5-дихлораніліно, 2,4,6-трифтораніліно, 2,4-дифтораніліно, та 3,4-дифтораніліно групи.

[0221]

Прикладами піперазинільної групи, яка може мати нижчу алکیلну групу у якості замісника у піперазиновому кільці, є піперазинільні групи, які можуть мати 1-3 лінійні або розгалужені алکیلні групи, що мають 1-6 атомів вуглецю як замісники у піперазиновому кільці, як от (1-, 2- або 3-) піперазинільна, 4-метил-(1-, 2- або 3-) піперазинільна, 2,3-диметил-(1- або 5-) піперазинільна, та 2,3,4-триметил-(1-, 5- або 6-) піперазинільна групи.

[0222]

Прикладами пірролідинільної групи, яка може мати оксо групу у якості замісника у пірролідиніновому кільці, є пірролідинільні групи, які можуть мати 1 або 2 оксо групи як замісники у пірролідиніновому кільці, як от (1-, 2- або 3-) пірролідинільна, 2-оксо-(1-, 3-, 4- або 5-) пірролідинільна, 3-оксо-(1-, 2-, 4- або 5-) пірролідинільна, 2,3-диоксо-(1-, 4- або 5-) пірролідинільна, та 2,5-диоксо-(1-, 3- або 4-) пірролідинільна групи.

Прикладами нижчої алканойл аміно групи є лінійна або розгалужена алканойл аміно групи, що мають 2-6 атомів вуглецю, які мають 1-3 атоми галогену як замісники, як от ацетил аміно, пропіоніл аміно, бутирил аміно, пентаноїл аміно, 2-метилпропіоніл аміно, та гексаноїл аміно групи.

[0223]

Прикладами фенільної групи, яка може бути заміщена у фенільному кільці 1-3 групами, обраними з групи, що містить нижчу алکیلну групу; нижчу алкокси групу, яка може мати атом галогену у якості замісника; атом галогену; аміно нижчу алкокси групу, яка може мати нижчу алکیلну групу у якості замісника; нижчу алکیلну групу заміщену гідроксильною групою; фенільну групу нижчого алкілу; нижчу алкокінільну групу; аміно групу, яка може мати нижчу алкілсульфонільну групу у якості замісника; нижчу

алкілтіогрупу; циклоалکیلну групу; фенілтіо групу; адамантільну групу; аніліно групу, яка може мати атом галогену у якості замісника у фенільному кільці; нижчу алкоксикарбонільну групу; піперазинільну групу, яка може мати нижчу алکیلну групу у якості замісника у піперазиновому кільці; нижчу алканойламіно групу; ціано групу; пірролідинільну групу, яка може мати оксо групу у якості замісника у пірролідиніновому кільці; та фенокси групу, є фенільні групи, які можуть бути заміщені у фенільному кільці 1-3 групами, обраними з групи, що містить лінійну або розгалужену алکیلну групу, що має 1-6 атомів вуглецю; лінійну або розгалужену алкокси групу що має 1-6 атомів вуглецю, яка може мати 1-3 атоми галогену; атом галогену; аміноалкокси групу алкокси частина якої є лінійна або розгалужена алкокси група, що має 1-6 атомів вуглецю та яка може мати 1 або 2 лінійні або розгалужені алکیلні групи що мають 1-6 атоми вуглецю як замісники; лінійна або розгалужена алکیلна група що має 1-6 атомів вуглецю та 1-3 гідроксильні групи як замісники; фенілалکیلна група алکیلна частина якої є лінійна або розгалужена алکیلна група що має 1-6 атомів вуглецю; лінійна або розгалужена алкінільна група що має 2-6 атомів вуглецю; аміно група, яка може мати 1 або 2 лінійні або розгалужені алкілсульфонільні групи що мають 1-6 атомів вуглецю як замісники; лінійна або розгалужена алкілтіо група, що має 1-6 атомів вуглецю; циклоалکیلна група що має 3-16 атомів вуглецю; фенілтіо група; адамантільна група; аніліно група яка може мати 1-3 атомів галогену як замісники у фенільному кільці; алкоксикарбонільна група алкокси частина якої є лінійна або розгалужена алкокси група що має 1-6 атомів вуглецю; аміно група яка може мати 1 або 2 лінійні або розгалужені алканойльні групи що мають 2-6 атомів вуглецю; ціано група; піперазинільна група яка може мати 1-3 лінійні або розгалужені алکیلні групи що мають 1-6 атомів вуглецю як замісники у піперазиновому кільці; пірролідинільна група яка може мати 1 або 2 оксо групи як замісники у пірролідиніновому кільці; та фенокси група, як от фенільна, 2-метилфенільна, 3-метилфенільна, 4-метилфенільна, 2-етилфенільна, 3-етилфенільна, 4-етилфенільна, 2-ізопропилфенільна, 4-ізопропилфенільна, 3-бутилфенільна, 4-пентилфенільна, 4-гексилфенільна, 3,4-диметилфенільна, 3,4-диетилфенільна, 2,4-диметилфенільна, 2,5-диметилфенільна, 2,6-диметилфенільна, 3,4,5-триметилфенільна, 2-метоксифенільна, 3-метоксифенільна, 4-метоксифенільна, 2-етоксифенільна, 3-етоксифенільна, 4-етоксифенільна, 4-ізопропоксифенільна, 3-бутоксифенільна, 4-пентилоксифенільна, 4-гексилоксифенільна, 3,4-диметоксифенільна, 3,4-диетоксифенільна, 2,4-диметоксифенільна, 2,5-диметоксифенільна, 2,6-диметоксифенільна, 3,4,5-триметоксифенільна, 2-трифторметоксифенільна, 3-трифторметоксифенільна, 4-трифторметоксифенільна, 2-(бромметокси)фенільна, 3-(2-хлоретокси)фенільна, 4-(2,3-

дихлорпропокси)фенільна, 4-(4-  
фторбутоксифенільна, 3-(5-  
хлорпентилокси)фенільна, 4-(5-  
бромгексилокси)фенільна, 4-(5,6-  
дибромгексилокси)фенільна, 3,4-  
ди(трифторметокси)фенільна, 3,4-ди(4,4,4-  
трихлорбутоксифенільна, 2,4-ди(3-хлор-2-  
метоксипропил)фенільна, 2,5-ди(3-  
хлорпропокси)фенільна, 2,6-ди(2,2,2-  
трифторетокси)фенільна, 3,4,5-  
три(трифторметокси)фенільна, 4-(2,2,2-  
трихлоретокси)фенільна, 2-метил-4-  
трифторметоксифенільна, 3-етил-4-  
трихлорметоксифенільна, 2-метокси-4-  
трифторметоксифенільна, 3-етокси-4-  
трихлорметоксифенільна, 2-метил-3-  
трифторметокси-4-трифторметоксифенільна, 2-  
феноксифенільна, 3-феноксифенільна, 4-  
феноксифенільна, 2,3-дифеноксифенільна, 3,4-  
дифеноксифенільна, 2,6-дифеноксифенільна, 3,4,5-трифеноксифенільна, 2-метил-4-  
феноксифенільна, 3-етил-4-феноксифенільна, 2-  
метокси-4-феноксифенільна, 3-етокси-4-  
феноксифенільна, 2-метил-3-феноксифенільна, 2-хлорфенільна, 3-  
хлорфенільна, 4-хлорфенільна, 2,3-  
дихлорфенільна, 2,4-дихлорфенільна, 2,5-  
дихлорфенільна, 3,4-дихлорфенільна, 2,6-  
дихлорфенільна, 3,5-дихлорфенільна, 2,4,6-  
трихлорфенільна, 2-фторфенільна, 3-  
фторфенільна, 4-фторфенільна, 2,5-  
дифторфенільна, 2,4-дифторфенільна, 3,4-  
дифторфенільна, 3,5-дифторфенільна, 2,6-  
дифторфенільна, 2,4,6-трифторфенільна, 2-  
бромфенільна, 3-бромфенільна, 4-бромфенільна, 2-йодфенільна, 3-йодфенільна, 4-йодфенільна, 2,3-дибромфенільна, 2,4-дидіодфенільна, 4-  
метилтіофенільна, 4-циклогексилфенільна, 4-  
хлор-2-анілінофенільна, 2-(4-хлор аніліно)-5-  
етокси карбонілфенільна, 4-[2-(N,N-  
диетиламіно)етокси]фенільна, 4-(4-метил-1-  
піперазиніл)фенільна, 4-(2-оксо-1-  
пірролідинільна)фенільна, 4-  
метилсульфоніламінофенільна, 4-(2-  
гідроксиетил)фенільна, 4-бензилфенільна, 4-  
етинілфенільна, 4-фенілтіофенільна, 4-(1-  
адамантил)фенільна, 5-ацетиламіно-2-  
хлорфенільна, 2-пропаноїламінофенільна, 3-  
ціанофенільна, 2-ціанофенільна, 4-ціанофенільна, 3,4-диціанофенільна, та 3,4,5-триціанофенільна групи.

[0224]

Прикладами феніл нижчої алкільної групи, яка може бути заміщена у фенільному кільці 1-3 групами, обраними з групи, що містить атом галогену, нижчу алкокси групу, яка може мати атом галогену у якості замісника, та нижчу алкільну групу є, додатково до вищеописаних феніл нижчих алкільних груп, фенілалкільні групи алкільна частина яких є лінійна або розгалужена алкільна група, що має 1-6 атомів вуглецю та яка може бути заміщена у фенільному кільці 1-3 групами, обраними з групи, що містить атом галогену, лінійну або розгалужену алкокси групу, що має 1-6 атомів вуглецю, яка може мати 1-3

атоми галогену як замісники, та лінійна або розгалужена алкільна група що має 1-6 атомів вуглецю, як от 4-фторбензильна, 2-хлорбензильна, 3-хлорбензильна, 4-хлорбензильна, 2-(2-фторфеніл)етильна, 2-(4-фторфеніл)етильна, 2-(4-хлорфеніл)етильна, 3,4-дибромбензильна, 3,4-дидіодбензильна, 2,4-дифторбензильна, 2,5-дихлорбензильна, 2,6-дихлорбензильна, 3,4,5-трифторбензильна, 3-(4-хлорфеніл)пропильна, 1-(2-бромфеніл)етильна, 4-(3-фторфеніл)бутильна, 5-(4-йодфеніл)пентильна, 6-(4-хлорфеніл)гексильна, 1,1-диметильна-2-(3-фторфеніл)етильна, 2-метил-3-(4-хлорфеніл)пропильна, 2-метилбензильна, 2-(3-метилфеніл)етильна, 3-(4-метилфеніл)пропильна, 1-(2-етилфеніл)етильна, 4-(3-етилфеніл)бутильна, 5-(4-етилфеніл)пентильна, 6-(4-ізопропилфеніл)гексильна, 1,1-диметил-2-(3-бутилфеніл)етильна, 2-метил-3-(4-пентилфеніл)пропильна, 4-гексилбензильна, 3,4-диметилбензильна, 3,4-диетилбензильна, 2,4-диметилбензильна, 2,5-диметилбензильна, 2,6-диметилбензильна, 3,4,5-триметилбензильна, 2-метоксибензильна, 2-(2-метоксифеніл)етильна, 2-(3-метоксифеніл)етильна, 2-(4-метоксифеніл)етильна, 4-метоксибензильна, 1-(2-етоксифеніл)етильна, 3-(3-етоксифеніл)пропильна, 4-(4-етоксифеніл)бутильна, 5-(4-ізопропоксифеніл)пентильна, 6-(3-бутоксифеніл)гексильна, 1,1-диметил-2-(4-трихлоретоксифеніл)етильна, 2-метил-3-(4-гексилоксифеніл)пропильна, 3,4-диметоксибензильна, 3,4-диетоксибензильна, 2,4-диметоксибензильна, 2,5-диметоксибензильна, 2,6-диметоксибензильна, 3,4,5-триметоксибензильна, 2-трифторметоксибензильна, 3-трифторметоксибензильна, 4-трифторметоксибензильна, 2-[2-(бромметокси)феніл]етильна, 1-[3-(2-хлоретокси)феніл]етильна, 3-[4-(2,3-дихлорпропокси)феніл]пропильна, 4-[4-(4-фторбутоксифеніл)бутильна, 5-[3-(5-хлорпентилокси)феніл]пентильна, 6-[4-(5-бромгексилокси)феніл]гексильна, 1,1-диметил-2-[4-(5,6-дибромгексилокси)феніл]етильна, 3,4-ди(трифторметокси)бензильна, 3,4-ди(4,4,4-трихлорбутоксифеніл)бензильна, 2,4-ди(3-хлор-2-метоксипропил)бензильна, 2,5-ди(3-хлорпропокси)бензильна, 2,6-ди(2,2,2-трифторетокси)бензильна, 3,4,5-три(трифторметокси)бензильна, 4-(2,2,2-трихлоретокси)бензильна, 2-метил-4-трифторметоксибензильна, 3-етил-4-трихлорметоксибензильна, 2-метокси-4-трифторметоксибензильна, 3-етокси-4-трихлорметоксибензильна, 2-метил-3-трифторметокси-4-трифторметоксибензильна, 2-хлор-3-метилбензильна, 4-фтор-2-трифторметоксибензильна, та 3-хлор-2-метил-4-метоксибензильна групи.

[0225]

Прикладами феніл нижчої алкільної групи, що має нижчу алкілендіоксигрупу у якості замісника у

фенільному кільці, є фенілалкільні групи, які мають лінійну або розгалужену алкілендіокси групу, що має 1-4 атомів вуглецю у якості замісника у фенільному кільці та алкільна частина яких є лінійна або розгалужена алкільна група, що має 1-6 атомів вуглецю, як от 3,4-метилендіоксибензильна, 3,4-триметилендіоксибензильна, 2-(2,3-етилендіоксифеніл)етильна, 1-(3,4-триметилендіоксифеніл)етильна, 3-(2,3-тетраметилендіоксифеніл)пропильна, 4-(3,4-метилендіоксифеніл)бутильна, 5-(2,3-етилендіоксифеніл)пентильна, 6-(3,4-триметилендіоксифеніл)гексильна, 1,1-диметил-2-(2,3-метилендіоксифеніл)етильна, та 2-метил-3-(3,4-етилендіоксифеніл)пропильна групи.

[0226]

Прикладами аміно групи, яка може мати нижчу алканойльну групу у якості замісника, є аміно групи, які можуть мати лінійну або розгалужену алканойльну групу, що має 1-6 атомів вуглецю у якості замісника, як от аміно, N-ацетиламіно, N-формиламіно, N-пропіонаміно, N-бутириламіно, N-ізобутириламіно, N-пентаноїламіно, N-трет-бутилкарбонаміно, та N-гексаноїламіно групи.

[0227]

Прикладами 1,2,3,4-тетрагідрохінолінової групи, яка може мати, у тетрагідрохіноліновому кільці, 1-3 замісники обрані з групи, що містить оксо групу, нижчу алкокси групу, та нижчу алкілендіоксигрупу, є 1,2,3,4-тетрагідрохінолінової групи, які можуть мати, у тетрагідрохіноліновому кільці, 1-3 замісники обрані з групи, що містить оксо групу, лінійну або розгалужену алкокси групу що має 1-6 атомів вуглецю, та лінійну або розгалужену алкілендіокси групу, що має 1-4 атомів вуглецю, як от (1,2,3,4,5,6,7 або 8-)1,2,3,4-тетрагідрохінолінової, 2-оксо-(1,3,4,5,6,7 або 8-)1,2,3,4-тетрагідрохінолінової, 2-оксо-6,7-метилендіокси-(1,3,4,5 або 8-)1,2,3,4-тетрагідрохінолінової, 4-оксо-(1,2,3,5,6,7 або 8-)1,2,3,4-тетрагідрохінолінової, 2,4-діоксо-(1,3,5,6,7 або 8-)1,2,3,4-тетрагідрохінолінової, 2,4-діоксо-6,7-метилендіокси-(1,3,5 або 8-)1,2,3,4-тетрагідрохінолінової, 5,6-етилендіокси-(1,2,3,4,7 або 8-)1,2,3,4-тетрагідрохінолінової, 7,8-триметилендіокси-(1,2,3,4,5 або 6-)1,2,3,4-тетрагідрохінолінової, 6,7-тетраметилендіокси-(1,2,3,4,5 або 8-)1,2,3,4-тетрагідрохінолінової, 5-метокси-2-оксо-(1,3,4,6,7 або 8-)1,2,3,4-тетрагідрохінолінової, та 2-оксо-6,7-етилендіокси-(1,3, 4,5 або 8-)1,2,3,4-тетрагідрохінолінової групи.

[0228]

Прикладами циклоалкіл нижчої алкільної групи є циклоалкілалкільні групи, що мають 3-16 атомів вуглецю, алкільна частина яких є лінійна або розгалужена алкільна група, що має 1-6 атомів вуглецю, як от циклопропилметильна, циклогексилметильна, 2-циклопропилетильна, 1-циклобутилетильна, 3-циклопентилпропильна, 4-циклогексилбутильна, 5-циклогептилпентильна, 6-циклооктилгексильна, 1,1-диметил-2-циклононметильна, 2-метил-3-циклодецилпропильна, циклоундецилметильна, 2-циклододецилетильна, 1-циклотридецилетильна,

3-циклотетрадецилпропильна, 4-циклопентадецилбутильна, та 5-циклогексадецилпентильна групи.

[0229]

Прикладами піридил нижчої алкільної групи є піридилалкільні групи, алкільна частина яких є лінійна або розгалужена алкільна група що має 1-6 атомів вуглецю, як от (2,3 або 4-)піридилметильна, 2-[(2,3 або 4-)піридил]етильна, 1-[(2,3 або 4-)піридил]етильна, 3-[(2,3 або 4-)піридил]пропильна, 4-[(2,3 або 4-)піридил]бутильна, 1,1-диметил-2-[(2,3 або 4-)піридил]етильна, 5-[(2,3 або 4-)піридил]пентильна, 6-[(2,3 або 4-)піридил]гексильна, 1-[(2,3 або 4-)піридил]ізопропильна, та 2-метил-3-[(2,3 або 4-)піридил]пропильна групи.

[0230]

Прикладами аміно групи заміщеної нижчою алкільною групою, яка може мати замісник, обраний з групи, що містить нижчу алкільну групу та нижчу алканойльну групу є лінійна або розгалужена алкільні групи, що мають 1-6 атомів вуглецю та аміно групу, яка може мати 1 або 2 замісники обрані з групи, що містить лінійну або розгалужену алкільну групу, що має 1-6 атомів вуглецю та лінійну або розгалужену алканойльну групу, що має 1-6 атомів вуглецю, як от амінометильна, 2-аміноетильна, 1-аміноетильна, 3-амінопропильна, 4-амінобутильна, 5-амінопентильна, 6-аміногексильна, 1,1-диметил-2-аміноетильна, 2-метил-3-амінопропильна, метиламінометильна, 1-етиламіноетильна, 2-пропиламіноетильна, 3-ізопропиламінопропильна, 4-бутиламінобутильна, 5-пентиламінопентильна, 6-гексиламіногексильна, диметиламінометильна, 2-діізопропиламіноетильна, (N-етил-N-пропиламіно)метильна, 2-(N,N-диметиламіно)етильна, 2-(N-метил-N-гексиламіно)етильна, формиламінометильна, ацетиламінометильна, 1-пропіонаміноетильна, 2-ацетиламіноетильна, 3-бутириламінопропильна, 4-пентаноїламінобутил, 5-гексаноїламінопентильна, 6-ацетиламіногексильна, N-метил-N-ацетиламінометильна, 2-(N-етил-N-пропаноїламіно)етильна, (N-етил-N-бутириламіно)метильна, 2-(N-метил-N-гексаноїламіно)етильна, та 3-(N,N-диметиламіно)пропильна групи.

[0231]

Прикладами нижчої алкокси нижчої алкільної групи є лінійна або розгалужена алкільні групи, що мають 1-6 атомів вуглецю, які мають лінійну або розгалужену алкокси групу, що має 1-6 атомів вуглецю, у якості замісника як от метоксиметильна, 1-етоксиетильна, 2-метоксиетильна, 2-пропоксиетильна, 3-ізопропоксипропильна, 4-бутоксibuтильна, 5-пентилоксипентильна, 6-гексилоксигексильна, 1,1-диметил-2-метоксиетильна, 2-метил-3-етоксипропильна, та 3-метоксипропильна групи.

[0232]

Прикладами 1,2,3,4-тетрагідроізохінолілнакарбоніл заміщеної нижчої алкільної групи є 1,2,3,4-тетрагідроізохінолілнакарбонілалкільні групи,

алкільна частина яких - це лінійна або розгалужена алкільна група, що має 1-6 атомів вуглецю, як от (1,2,3,4, 5,6,7 або 8-)1,2,3,4-тетрагідроізохінолілкарбонілметильна, 2-[(1,2,3,4,5,6,7 або 8-)1,2,3,4-тетрагідроізохінолілкарбоніл]етильна, 1-[[[(1,2,3,4,5,6,7 або 8-)1,2,3,4-тетрагідроізохінолілкарбоніл]етильна, 3-[(1,2,3,4,5,6,7 або 8-)1,2,3,4-тетрагідроізохінолілкарбоніл]пропильна, 4-[(1,2,3,4,5,6,7 або 8-)1,2,3,4-тетрагідроізохінолілкарбоніл]бутильна, 1,1-диметил-2-[(1,2,3,4,5,6,7 або 8-)1,2,3,4-тетрагідроізохінолілкарбоніл]етильна, 5-[(1,2,3,4,5,6,7 або 8-)1,2,3,4-тетрагідроізохінолілкарбоніл]пентильна, 6-[(1,2,3,4,5,6,7 або 8-)1,2,3,4-тетрагідроізохінолілкарбоніл]гексильна, 1-[(1,2,3,4,5,6,7 або 8-)1,2,3,4-тетрагідроізохінолілкарбоніл]ізопропильна, та 2-метил-3-[(1,2,3,4,5,6,7 або 8-)1,2,3,4-тетрагідроізохінолілкарбоніл]пропильна групи.

[0233]

Прикладами піперидинільнакарбонільної групи, яка може мати, у піперидиновому кільці, замісник обраний з групи, що містить нижчу алкоксикарбонільну групу, фенільну групу нижчого алкілу, та фурил нижчу алкільну групу, є піперидинілкарбонільні групи, які можуть мати, у піперидиновому кільці, 1-3 замісники обрані з групи, що містить алкоксикарбонільну групу, алкокси частина якої - це лінійна або розгалужена алкокси група, що має 1-6 атомів вуглецю, фенілалкільна група, алкільна частина якої - це лінійна або розгалужена алкільна група, що має 1-6 атомів вуглецю, та фурилалкільна група, алкільна частина якої - це лінійна або розгалужена алкільна група, що має 1-6 атомів вуглецю, як от (1,2,3 або 4-)піперидинілкарбонільна, 1-бензил-(2,3 або 4-)піперидинілкарбонільна, 1-(2 або 3-)фурилметил-(2,3 або 4-)піперидинілкарбонільна, 1-(2-фенілетил)-(2,3 або 4-)піперидинілкарбонільна, 1-{2-[(1 або 2-)фурил]етил}-(2,3 або 4-)піперидинілкарбонільна, 1-(1-фенілетил)-(2,3 або 4-)піперидинілкарбонільна, 1-{3-[(1 або 2-)фурил]пропил}-(2,3 або 4-)піперидинілкарбонільна, 1-(3-фенілпропил)-(2,3 або 4-)піперидинілкарбонільна, 1-{1-[(1 або 2-)фурил]етил}-(2,3 або 4-)піперидинілкарбонільна, 1-(4-фенілбутил)-(2,3 або 4-)піперидинілкарбонільна, 1-{4-[(1 або 2-)фурил]бутил}-(2,3 або 4-)піперидинілкарбонільна, 1-(5-фенілпентил)-(2,3 або 4-)піперидинілкарбонільна, 1-{5-[(1 або 2-)фурил]пентил}-(2,3 або 4-)піперидинілкарбонільна, 1-(6-фенілгексил)-(2,3 або 4-)піперидинілкарбонільна, 1-{6-[(1 або 2-)фурил]гексил}-(2,3 або 4-)піперидинілкарбонільна, 1,2-дибензил-(3,4, 5 або 6-)піперидинілкарбонільна, 1,3-ди(1 або 2-)фурилметил-(2,4, 5 або 6-)піперидинілкарбонільна, 1,3,5-трибензил-(2,4 або 6-)піперидинілкарбонільна, 1,2,6-три(1 або 2-)фурилметил-(3,4 або 5-)піперидинілкарбонільна, 1-бензил-3-(1 або 2-)фурилметил-(2,4,5 або 6-)

піперидинілкарбонільна, 1-{1-[(1 або 2-)фурил]етил}-(2,3 або 4-)піперидинілкарбонільна, 1-метоксикарбоніл-(2,3 або 4-)піперидинілкарбонільна, 1-етоксикарбоніл-(2,3 або 4-)піперидинілкарбонільна, 1-пропоксикарбоніл-(2,3 або 4-)піперидинілкарбонільна, 1-бутоксикарбоніл-(2,3 або 4-)піперидинілкарбонільна, 1-трет-бутоксикарбоніл-(2,3 або 4-)піперидинілкарбонільна, 1-пентилоксикарбоніл-(2,3 або 4-)піперидинілкарбонільна, 1-гексилоксикарбоніл-(2,3 або 4-)піперидинілкарбонільна, 1,2-диметоксикарбоніл-(3,4,5 або 6-)піперидинілкарбонільна, 1,2,6-триетоксикарбоніл-(3,4 або 5-)піперидинілкарбонільна, 1-(1 або 2-)фурилметил-3-трет-бутоксикарбоніл-(3,4,5 або 6-)піперидинілкарбонільна, 1-бензил-2-метоксикарбоніл-(2,4, 5 або 6-)піперидинілкарбонільна, та 1-(1 або 2-)фурилметил-2,4-диметоксикарбоніл-(3,5 або 6-)піперидинілкарбонільна групи.

[0234]

Прикладами тіазолідиніл нижчої алканойльної групи, яка може мати оксо групу у якості замісника у тіазолідиновому кільці, є тіазолідинілалканойльні групи, які можуть мати 1-3 оксо групи як замісники у тіазолідиновому кільці та алканойльна частина яких - це лінійна або розгалужена алканойльна група, що має 2-6 атомів вуглецю, як от 2-[(2,3,4 або 5-)тіазолідиніл]ацетильна, 3-[(2,3,4 або 5-)тіазолідиніл]пропіонильна, 2-[(2,3,4 або 5-)тіазолідиніл]пропіонильна, 4-[(2,3,4 або 5-)тіазолідиніл]бутирильна, 5-[(2,3,4 або 5-)1,2,4-тіазолідиніл]пентанойльна, 6-[(2,3,4 або 5-)тіазолідиніл]гексанойльна, 2,2-диметил-3-[(2,3,4 або 5-)тіазолідиніл]пропіонильна, 2-метил-3-[(2,3,4 або 5-)тіазолідиніл]пропіонильна, 2,4-диоксо-(3 або 5-)тіазолідинілацетильна, 3-[2-оксо-(3,4 або 5-)тіазолідиніл]пропіонильна, 2-[4-оксо-(2,3 або 5-)тіазолідиніл]пропіонильна, 4-[5-оксо-(2,3 або 4-)тіазолідиніл]бутирильна, 5-[2,5-диоксо-(3 або 4-)тіазолідиніл]пентанойльна, 6-[2,4,5-триоксо-3-тіазолідиніл]гексанойльна, 2-[4,5-диоксо-(2 або 3-)тіазолідиніл]ацетильна, 2,2-диметил-3-[2,4-диоксо-(3 або 5-)тіазолідиніл]пропіонильна, та 2-метил-3-[2,4-диоксо-(3 або 5-)тіазолідиніл]пропіонильна групи.

[0235]

Прикладами піперидинільної групи, яка може бути заміщена у піперидиновому кільці групою, обраною з групи, що містить нижчу алкоксикарбонільну групу, фенільну групу нижчого алкілу, нижчу алкільну групу, бензоїльну групу та фурил нижчу алкільну групу, є піперидинільні групи, які можуть бути заміщені у піперидиновому кільці 1-3 групами, обраними з групи, що містить алкоксикарбонільну групу, алкокси частина якої - це лінійна або розгалужена алкокси група, що має 1-6 атомів вуглецю, фенілалкільну групу алкільна частина якої - це лінійна або розгалужена алкільна група, що має 1-6 атомів вуглецю, бензоїльну групу, та фурилалкільну групу алкільна частина якої - це лінійна або розгалужена алкільна група, що має 1-6 атомів вуглецю, як от

1,(2, 3 або 4-)піперидинільна, 1-бензил-(2,3 або 4-)піперидинільна, 1-(2 або 3-)фурилметил-(2,3 або 4-)піперидинільна, 1-(2-фенілетил)-(2,3 або 4-)піперидинільна, 1-{2-[(1 або 2-)фурил]етил}-(2,3 або 4-)піперидинільна, 1-(1-фенілетил)-(2,3 або 4-)піперидинільна, 1-{3-[(1 або 2-)фурил]пропил}-(2,3 або 4-)піперидинільна, 1-(3-фенілпропіл)-(2,3 або 4-)піперидинільна, 1-{1-[(1 або 2-)фурил]етил}-(2,3 або 4-)піперидинільна, 1-(4-фенілбутил)-(2,3 або 4-)піперидинільна, 1-4-[(1 або 2-)фурил]бутил}-(2,3 або 4-)піперидинільна, 1-(5-фенілпентил)-(2,3 або 4-)піперидинільна, 1-{5-[(1 або 2-)фурил]пентил}-(2,3 або 4-)піперидинільна, 1-(6-фенілгексил)-(2,3 або 4-)піперидинільна, 1-6-[(1 або 2-)фурил]гексил}-(2,3 або 4-)піперидинільна, 1,2-добензил-(3,4,5 або 6-)піперидинільна, 1,3-ди(1 або 2-)фурилметил-(2,4,5 або 6-)піперидинільна, 1,3,5-трибензил-(2,4 або 6-)піперидинільна, 1,2,6-три(1 або 2-)фурилметил-(3,4 або 5-)піперидинільна, 1-бензил-3-(1 або 2-)фурилметил-(2,4,5 або 6-)піперидинільна, 1-{1-[(1 або 2-)фурил]етил}-(2,3 або 4-)піперидинільна, 1-бензоіл-(2,3 або 4-)піперидинільна, 1,2-добензоіл-(3,4,5 або 6-)піперидинільна, 1,3,5-трибензоіл-(2,4 або 6-)піперидинільна, 1-метил-(2,3 або 4-)піперидинільна, 1-етил-(2,3 або 4-)піперидинільна, 1-пропіл-(2,3 або 4-)піперидинільна, 1-ізопропіл-(2,3 або 4-)піперидинільна, 1-бутил-(2,3 або 4-)піперидинільна, 1-ізобутил-(2,3 або 4-)піперидинільна, 1-трет-бутил-(2,3 або 4-)піперидинільна, 1-пентил-(2,3 або 4-)піперидинільна, 1-гексил-(2,3 або 4-)піперидинільна, 1,2-диметил-(3,4,5 або 6-)піперидинільна, 1,2,6-триметил-(3,4 або 5-)піперидинільна, 1-метил-3-бензил-(3,4, 5 або 6-)піперидинільна, 1-бензоіл-2-метил-(2,4,5 або 6-)піперидинільна, 1-(1 або 2-)фурилметил-2,4-диметил-(3,5 або 6-)піперидинільна, 1-метоксикарбоніл-(2,3 або 4-)піперидинільна, 1-етоксикарбоніл-(2,3 або 4-)піперидинільна, 1-пропоксикарбоніл-(2,3 або 4-)піперидинільна, 1-бутоксикарбоніл-(2,3 або 4-)піперидинільна, 1-трет-бутоксикарбоніл-(2,3 або 4-)піперидинільна, 1-пентилоксикарбоніл-(2,3 або 4-)піперидинільна, 1-гексилоксикарбоніл-(2,3 або 4-)піперидинільна, 1,2-диметоксикарбоніл-(3,4, 5 або 6-)піперидинільна, 1,2,6-триетоксикарбоніл-(3,4 або 5-)піперидинільна, 1-метил-3-трет-бутоксикарбоніл-(3,4, 5 або 6-)піперидинільна, 1-бензоіл-2-метоксикарбоніл-(2,4, 5 або 6-)піперидинільна, 1-(1 або 2-)фурилметил-2,4-диметоксикарбоніл-(3,5 або 6-)піперидинільна, та 1-бензил-2,4-диметоксикарбоніл-(3,5 або 6-)піперидинільна групи.

[0236]

Прикладами карбоніл нижчої алкільної групи, заміщеної групою:

[0237]

[Формула 54]



[0238]

(в подальшому "Група А") є Група, заміщена

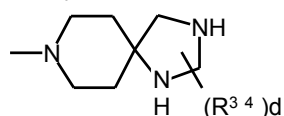
карбоніалалкільною групою, алкільна частина якої - це лінійна або розгалужена алкільна група, що має 1-6 атомів вуглецю, як от Група А заміщена карбонілметильна, 2-А Група заміщена карбонілетильна, 1-А Група заміщена карбонілетильна, 3-А Група заміщена карбонілпропильна, 4-А Група заміщена карбонілбутильна, 1,1-диметил-2-А Група заміщена карбонілетильна, 5-А Група заміщена карбонілпентильна, 6-А Група заміщена карбонілгексильна, 1-А Група заміщена карбонілізопропильна, та 2-метил-3-А Група заміщена карбонілпропильна групи.

[0239]

Прикладами карбоніл нижчої алкільної групи, заміщеної групою:

[0240]

[Формула 55]



[0241]

де  $R^{34}$  - це оксо група або фенільна група, та d - це ціле від 0 до 3 (в подальшому "В група"), є В група, заміщена карбонілалкільними групами, алкільна частина яких - це лінійна або розгалужена алкільна група, що має 1-6 атомів вуглецю, як от В група, заміщена карбонілметильними, 2-В група заміщена карбонілетильними, 1-В група заміщена карбонілетильними, 3-В група заміщена карбонілпропильними, 4-В група заміщена карбонілбутильними, 1,1-диметил-2-В група заміщена карбонілетильними, 5-В група заміщена карбонілпентильними, 6-В група заміщена карбонілгексильними, 1-В група заміщена карбонілізопропильними, та 2-метил-3-В група заміщена карбонілпропильними групами.

[0242]

Прикладами пірролідинільної нижчої алкільної групи є пірролідиніалкільні групи алкільна частина яких - це лінійна або розгалужена алкільна група що має 1-6 атомів вуглецю, як от (1-, 2-, або 3-)пірролідинільнаметильна, 2-[(1-, 2-, або 3-)пірролідинільна]етильна, 1-[(1-, 2-, або 3-)пірролідинільна]етильна, 3-[(1-, 2-, або 3-)пірролідинільна]пропильна, 4-[(1-, 2-, або 3-)пірролідинільна]бутильна, 5-[(1-, 2-, або 3-)пірролідинільна]пентильна, 6-[(1-, 2-, або 3-)пірролідинільна]гексильна, 1,1-диметил-2-[(1-, 2-, або 3-)пірролідинільна]етильна, та 2-метил-3-[(1-, 2-, або 3-)пірролідинільна]пропильна групи.

[0243]

Прикладами морфоліно нижчої алкільної групи є морфоліноалкільні групи, алкільна частина яких - це лінійна або розгалужена алкільна група, що має 1-6 атомів вуглецю, як от (2-, 3- або 4-) морфолінометильна, 2-[(2-, 3- або 4-) морфоліно]етильна, 1-[(2-, 3- або 4-) морфоліно]етильна, 3-[(2-, 3- або 4-) морфоліно]пропильна, 4-[(2-, 3- або 4-) морфоліно]бутильна, 5-[(2-, 3- або 4-) морфоліно]пентильна, 6-[(2-, 3- або 4-) морфоліно]гексильна, 1,1-диметил-2-[(2-, 3- або 4-)

морфоліно]етильна, та 2-метил-3-[(2-, 3- або 4-) морфоліно]пропильна групи.

[0244]

Прикладами феніл нижчої алкенільної групи є фенілалкенільні групи, алкенільна частина яких - це лінійна або розгалужена алкенільна група, що має 2-6 атомів вуглецю та яка має 1-3 подвійні зв'язки, як от стирильна, 3-феніл-2-пропенільна група (просте найменування: циннамільна група), 4-феніл-2-бутенільна, 4-феніл-3-бутенільна, 5-феніл-4-пентенільна, 5-феніл-3-пентенільна, 6-феніл-5-гексенільна, 6-феніл-4-гексенільна, 6-феніл-3-гексенільна, 4-феніл-1,3-бутадієнільна, та 6-феніл-1,3,5-гексатриєнільна групи.

[0245]

Прикладами анілінокарбонільної нижчої алкільної групи, яка може мати нижчу алкільну групу у якості замісника у фенільному кільці є анілінокарбонілалкільні групи, алкільна частина яких - це лінійна або розгалужена алкільна група, що має 1-6 атомів вуглецю та яка може мати 1-3 лінійні або розгалужені алкільні групи, що мають 1-6 атомів вуглецю як замісники у фенільному кільці, як от анілінокарбонілметильна, 2-анілінокарбонілетильна, 1-анілінокарбонілетильна, 3-анілінокарбонілпропильна, 4-анілінокарбонілбутильна, 5-анілінокарбонілпентильна, 6-анілінокарбонілгексильна, 1,1-диметил-2-анілінокарбонілетильна, 2-метил-3-анілінокарбонілпропильна, (4-метиланілінокарбоніл)етильна, 2-(3-метиланілінокарбоніл)етильна, 3-(4-метиланілінокарбоніл)пропильна, 1-(2-етиланілінокарбоніл)етильна, 4-(3-етиланілінокарбоніл)бутильна, 5-(4-етиланілінокарбоніл)пентильна, 6-(4-ізопропиланілінокарбоніл)гексильна, 1,1-диметил-2-(3-бутиланілінокарбоніл)етильна, 2-метил-3-(4-пентиланілінокарбоніл)пропильна, 4-гексиланілінокарбонілметильна, 3,4-диметиланілінокарбонілметильна, 3,4-диетиланілінокарбонілметильна, 2,4-диметиланілінокарбонілметильна, 2,5-диметиланілінокарбонілметильна, 2,6-диметиланілінокарбонілметильна, та 3,4,5-триметиланілінокарбонілметильна групи.

[0246]

Прикладами піперазиніл нижчої алкільної групи, яка може мати, у піперазиновому кільці, замісник обраний з групи, що містить нижчу алкільну групу та фенільну групу нижчого алкілу, яка може мати нижчу алкілендіоксигрупу у якості замісника у фенільному кільці, є піперазинілалкільні групи алкільна частина яких - це лінійна або розгалужена алкільна група, що має 1-6 атомів вуглецю та яка може мати, у піперазиновому кільці, 1-3 замісники обрані з групи, що містить лінійну або розгалужену алкільну групу, що має 1-6 атомів вуглецю та фенілалкільну групу, яка може мати лінійну або розгалужену алкілендіокси групу, що має 1-4 атомів вуглецю у якості замісника у фенільному кільці та алкільна частина яких - це лінійна або розгалужена алкільна група, що має 1-6 атомів

вуглецю, як от [(1-, 2- або 3-)піперазиніл]метильна, 2-[(1-, 2- або 3-)піперазиніл]етильна, 1-[(1-, 2- або 3-)піперазиніл]пропильна, 3-[(1-, 2- або 3-)піперазиніл]бутильна, 5-[(1-, 2- або 3-)піперазиніл]пентильна, 6-[(1-, 2- або 3-)піперазиніл]гексильна, 1,1-диметил-2-[(1-, 2- або 3-)піперазиніл]етильна, 2-метил-3-[(1-, 2- або 3-)піперазиніл]пропильна, [1-метил-(2-, 3- або 4-)піперазиніл]метильна, 2-[1-етил-(2-, 3- або 4-)піперазиніл]етильна, 1-[4-пропил-(1-, 2- або 3-)піперазиніл]етильна, 3-[3-ізопропил-(1-, 2-, 4-, 5- або 6-)піперазиніл]пропильна, 4-[2-бутил-(1-, 3-, 4-, 5- або 6-)піперазиніл]бутильна, 5-[1-ізобутил-(2-, 3- або 4-)піперазиніл]пентильна, 3-[4-метил-(1-, 2- або 3-)піперазиніл]пропильна, 6-[1-трет-бутил-(2-, 3- або 4-)піперазиніл]гексильна, 1,1-диметил-2-[4-пентил-(1-, 2- або 3-)піперазиніл]етильна, [1,2-диметил-(3-, 4-, 5- або 6-)піперазиніл]метильна, [1,2,6-триметил-(3-, 4- або 5-)піперазиніл]метильна, та 2-[4-(3,4-метилендіоксибензил)-(1-, 2- або 3-)піперазиніл]етильна групи.

[0247]

Прикладами амідино нижчої алкільної групи, яка може мати нижчу алкільну групу у якості замісника, є амідиноалкільні групи алкільна частина яких - це лінійна або розгалужена алкільна група, що має 1-6 атомів вуглецю та яка може мати 1 або 2 лінійні або розгалужені алкільні групи що мають 1-6 атомів вуглецю, як от амідинометильна, 2-амідиноетильна, 1-амідиноетильна, 3-амідинопропильна, 4-амідинобутильна, 5-амідінопентильна, 6-амідіногексильна, 1,1-диметил-2-амідиноетильна, 2-метил-3-амідинопропильна, N,N-диметиламідінометильна, 2-(N,N-диметиламідіно)етильна, 1-(N-метиламідіно)етильна, 3-(N-етиламідіно)пропильна, 4-(N-n-пропиламідіно)пропильна, 5-(N-n-пентиламідіно)пентильна, 6-(N-n-гексиламідіно)гексильна, та (N-метил-N-етиламідіно)метильна групи.

[0248]

Прикладами карбазолільної групи, яка може мати нижчу алкільну групу у якості замісника у карбазольному кільці, є карбазолільні групи, які можуть мати 1-3 лінійні або розгалужені алкільні групи, що мають 1-6 атомів вуглецю як замісники у карбазольному кільці, як от (1-, 2-, 3- або 4-)карбазолільна, 9-метил-(1-, 2-, 3- або 4-)карбазолільна, 9-етил-(1-, 2-, 3- або 4-)карбазолільна, 1-етил-(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8- або 9-)карбазолільна, 2-n-пропил-(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 8- або 9-)карбазолільна, 3-n-бутил-(1-, 2-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8- або 9-)карбазолільна, 4-n-пентил-(1-, 2-, 3-, 5-, 6-, 7-, 8- або 9-)карбазолільна, 5-n-гексил-(1-, 2-, 3-, 4-, 6-, 7-, 8- або 9-)карбазолільна, 6,9-диметил-(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 7- або 8-)карбазолільна, та 1,7,8-триметил-(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8- або 9-)карбазолільна групи.

[0249]

Прикладами амідино групи, яка може мати нижчу алкільну групу у якості замісника, є амідино

групи, які можуть мати 1 або 2 лінійні або розгалужені алкільні групи, що мають 1-6 атомів вуглецю як замісники, як от амідіно, N,N-диметиламідіно, N-метиламідіно, N-етиламідіно, N-n-пропиламідіно, N-n-бутиламідіно, N-n-пентиламідіно, N-n-гексиламідіно, N,N-диетиламідіно, та N-метил-N-етиламідіно групи.

Прикладами феніл нижчої алкільної групи (яка може мати, у фенільному кільці, 1-3 замісники, обрані з групи, що містить нижчу алкілендіоксигрупу та нижчу алкокси групу), є, додатково до вищеписаних феніл нижчих алкільних груп, фенілалкільні групи, алкільна частина яких - це лінійна або розгалужена алкільна група, що має 1-6 атомів вуглецю (і яка може мати, у фенільному кільці, 1-3 замісники обрані з групи, що містить лінійну або розгалужену алкілендіоксигрупу, що має 1-4 атомів вуглецю та лінійну або розгалужену алкокси групу, що має 1-6 атомів вуглецю), як от 3,4-метилендіоксибензильна, 3,4-триметилендіоксибензильна, 2-(2,3-етилендіоксифеніл)етильна, 1-(3,4-триметилендіоксифеніл)етильна, 3-(2,3-тетраметилендіоксифеніл)пропильна, 4-(3,4-метилендіоксифеніл)бутильна, 5-(2,3-етилендіоксифеніл)пентильна, 6-(3,4-триметилендіоксифеніл)гексильна, 1,1-диметил-2-(2,3-метилендіоксифеніл)етильна, 2-метил-3-(3,4-етилендіоксифеніл)пропильна, 2-метоксибензильна, 2-(2-метоксифеніл)етильна, 2-(3-метоксифеніл)етильна, 2-(4-метоксифеніл)етильна, 4-метоксибензильна, 1-(2-етоксифеніл)етильна, 3-(3-етоксифеніл)пропильна, 4-(4-етоксифеніл)бутильна, 5-(4-ізопропоксифеніл)пентильна, 6-(3-бутоксифеніл)гексильна, 1,1-диметил-2-(4-пентилоксифеніл)етильна, 2-метил-3-(4-гексилоксифеніл)пропильна, 3,4-диметоксибензильна, 3,4-диетоксибензильна, 2,4-диметоксибензильна, 2,5-диметоксибензильна, 2,6-диметоксибензильна, та 3,4,5-триметоксибензильна групи.

[0250]

Прикладами піперазиніл заміщеної оксалільної групи, яка може мати, у піперазиновому кільці, 1-3 замісники обрані з групи, що містить фенільну групу нижчого алкілу (яка може мати, у фенільному кільці, 1-3 замісники обрані з групи, що містить нижчу алкілендіоксигрупу та нижчу алкокси групу) та піридил нижчу алкільну групу, є піперазиніл заміщені оксалільні групи які можуть мати, у піперазиновому кільці, 1-3 замісники обрані з групи, що містить фенілалкільну групу, алкільнаа частина яких - це лінійна або розгалужена алкільна група, що має 1-6 атомів вуглецю (і яка може мати, у фенільному кільці, 1-3 замісники обрані з групи, що містить лінійну або розгалужену алкілендіоксигрупу, що має 1-4 атомів вуглецю та лінійну або розгалужену алкокси групу, що має 1-6 атомів вуглецю) та піридилалкільну групу, алкільна частина якої - це лінійна або розгалужена алкільна група, що має 1-6 атомів вуглецю, як от 4-(3,4-метилендіоксибензил)-(1-, 2- або 3)

піперазинілоксалільна, 4-(2-, 3- або 4-піридилметил)-(1-, 2- або 3-) піперазинілоксалільна, 4-(3,4-диметоксибензил)-(1-, 2- або 3-)піперазинілоксалільна, 4-(2,3-метилендіоксибензил)-(1-, 2- або 3-)піперазинілоксалільна, 4-(3,4-етилендіоксибензил)-(1-, 2- або 3-)піперазинілоксалільна, 4-[2-(2-, 3- або 4-піридил)етил)-(1-, 2- або 3-)піперазинілоксалільна, 4-[3-(2-, 3- або 4-піридил)пропил-(1-, 2- або 3-)піперазинілоксалільна, 2,4-біс(2-, 3- або 4-піридилметил)-(1-, 2- або 3-) піперазинілоксалільна, 2-(3,4-метилендіоксибензил)-4-(2-, 3- або 4-піридилметил)-(1-, 2- або 3-) піперазинілоксалільна, та 2,3,4-три(2-, 3- або 4-піридилметил)-(1-, 2- або 3-)піперазинілоксалільна групи.

[0251]

Прикладами ціано заміщеної нижчої алкільної групи є ціаноалкільні групи, алкільна частина яких - це лінійна або розгалужена алкільна група, що має 1-6 атомів вуглецю, як от ціанометильна, 2-ціаноетильна, 1-ціаноетильна, 3-ціанопропильна, 4-ціанобутильна, 5-ціанопентильна, 6-ціаногексильна, 1,1-диметил-2-ціаноетильна, та 2-метил-3-ціанопропильна групи.

[0252]

Прикладами 5-7-членного насиченого гетероциклічного кільця, утвореного зв'язуванням R<sup>36</sup> та R<sup>37</sup> один з одним, разом з атомами азоту зв'язують їх, за допомогою або без атому азоту, атому кисню, або атому сірки, є пірролідинільна, піперидинільна, морфоліно, тіоморфоліно, та гомопіперазинільна групи.

[0253]

Прикладами 5-10-членного насиченого або ненасиченого гетероциклічного кільця, утвореного зв'язуванням R<sup>14</sup> та R<sup>15</sup> один з одним, разом з атомами азоту зв'язують їх, за допомогою або без атому азоту, атому кисню, або атому сірки, є 1,2,3,4,5,6-гексагідропіримідинільна, пірролідинільна, піперидинільна, піперазинільна, морфоліно, тіоморфоліно, гомопіперазинільна, гомопіперидинільна, тіазолідинільна, 1,2,5,6-тетрагідропіридинільна, пірроліньна, піразолінільна, імідазолінільна, 2-пірролініньна, 2-імідазолінільна, імідазолідинільна, 2-піразолінільна, піразолідинільна, 1,2-дигідропіридинільна, 1,2-дигідрохіноліньна, 1,2,3,4-тетрагідрохіноліньна, 1,2,3,4-тетрагідроізохіноліньна, 1,2-дигідроізохіноліньна, індоліньна, ізоіндоліньна, індолініньна, ізоіндолініньна, 3,4-дигідро-2H-1,4-бензооксизиніл, 3,4-дигідро-2H-1,4-бензотіазолідинільна, 1,4-бензотіазинільна, 1,2,3,4-тетрагідрохіноксалиніньна, 1,2,3,4-тетрагідроциннолініньна, 1,2,3,4-тетрагідрофалазинільна, 1,2,3,4-тетрагідрохіназолініньна, 1,2-дигідрохіноксалиніньна, 3,4-дигідрохіноксалиніньна, 1,4-дигідрохіноксалиніньна, 1,2-дигідроциннолініньна, 1,2-дигідрофалазинільна, 3,4-дигідрофалазинільна, 1,2-дигідрохіназолініл, 3,4-дигідрохіназолініл, індазолінільна, індазолініньна,

6-азабіцикло[3,2,1]октильна, 3-аза-спіро[5,5]ундецильна, та тіазолідинільні групи. Переважно, R<sup>14</sup> та R<sup>15</sup>, разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, зв'язують - один з одним, безпосередньо або за допомогою атому азоту, утворюючи 6-членну насичену гетероциклічну групу. Більш переважно, вони є піперидинільна та піперазинільна групи.

[0254]

Прикладами феніл нижчої алкокси групи є фенілалкокси групи, алкокси частина яких - це лінійна або розгалужена алкокси група, що має 1-6 атомів вуглецю, як от бензилокси, 2-фенілетокси, 1-фенілетокси, 3-фенілпропокси, 4-фенілбутокси, 5-фенілпентилокси, 6-фенілгексилокси, 1,1-диметил-2-фенілетокси, та 2-метил-3-фенілпропокси групи.

[0255]

Прикладами феніл заміщеної нижчої алкільної групи, що має 1 або 2 фенільні групи, яка може бути заміщена у фенільному кільці 1-3 замісниками обраними з групи, що містить нижчу алканойльну групу, аміно групу, яка може мати нижчу алканойльну групу у якості замісника, нижчу алкоксикарбонільну групу, ціано групу, нітро групу, фенільну групу, атом галогену, нижчу алкільну групу, яка може мати атом галогену у якості замісника, нижчу алкокси групу, яка може мати атом галогену у якості замісника, феніл нижчу алкокси групу, гідроксильну групу, та нижчу алкілендіокси групу; та яка може мати піридинільну групу у нижчій алкільній групі є додатково до вищеописаної феніл нижчої алкільної групи, феніл заміщені алкільні групи, які мають 1 або 2 феніли, які можуть бути заміщені у фенільному кільці 1-3 замісниками обраними з групи, що містить лінійну або розгалужену алканойльну групу, що має 1-6 атомів вуглецю, аміно групу, яка може мати 1 або 2 лінійні або розгалужені алканойльні групи що мають 1-6 атомів вуглецю як замісники, алкоксикарбонільну групу, алкокси частина якої - це лінійна або розгалужена алкокси група, що має 1-6 атомів вуглецю, ціано група, нітро група, фенільна група, атом галогену, лінійна або розгалужена алкільна група, що має 1-6 атомів вуглецю, яка може мати 1-3 атоми галогенів як замісники, лінійна або розгалужена алкокси група, що має 1-6 атомів вуглецю, яка може мати 1-3 атоми галогенів як замісники, фенілалкокси групи, алкокси частина яких - це лінійна або розгалужена алкокси група, що має 1-6 атомів вуглецю, гідрокси група, та лінійна або розгалужена алкілендіокси група, що має 1-4 атомів вуглецю; яка може мати піридинільну групу у алкільній групі, та алкільна частина якої - це лінійна або розгалужена алкільна група, що має 1-6 атомів вуглецю, як от 1-феніл-1-(2,3 або 4-)піридил метильна, 1,1-дифенілметильна, 1,1-ди(4-фторфеніл)метильна, 1-феніл-1-(4-метоксифеніл)метильна, 3,4-метилендіоксибензильна, 3,4-етилендіоксибензильна, 3,4-триметилендіоксибензильна, 2,5-дифторбензильна, 2,4-дифторбензильна, 3,4-дифторбензильна, 3,5-дифторбензильна, 2,6-

дифторбензильна, 3-трифторметилбензильна, 2-трифторметилбензильна, 4-трифторметилбензильна, 3,4-диметоксифенільна, 3,5-диметоксифенільна, 2-хлорбензильна, 3-хлорбензильна, 4-хлорбензильна, 2-метилбензильна, 3-метилбензильна, 4-метилбензильна, 3,4-диметилбензильна, 2,3-диметилбензильна, 2-метоксифенільна, 3-метоксифенільна, 4-ціанобензильна, 2-ціанобензильна, 3-ціанобензильна, 4-метоксифенільна, 2,3-дихлорбензильна, 2,4-дихлорбензильна, 2,5-дихлорбензильна, 3,4-дихлорбензильна, 2,6-дихлорбензильна, 4-фторбензильна, 3-фторбензильна, 2-фторбензильна, 4-нітробензильна, 3-нітробензильна, 2-нітробензильна, 3-трифторметоксифенільна, 4-трифторметоксифенільна, 2-трифторметоксифенільна, 4-метоксикарбонілбензильна, 3-метоксикарбонілбензильна, 4-трет-бутилбензильна, 4-етилбензильна, 4-ізопропилбензильна, 4-метокси-3-хлорбензильна, 2-(4-метоксифеніл)етильна, 2-(4-фторфеніл)етильна, 2-(4-хлорфеніл)етильна, 2-(3-метоксифеніл)етильна, 2-(4-метилфеніл)етильна, 4-фенілбензильна, 3,3-дифенілпропильна, 3-метил-4-нітробензильна, 4-(4-метоксифеніл)бутильна, 2-(4-метилфеніл)етильна, 4-трет-бутоксикарбонілбензильна, 3-хлор-6-метоксифенільна, 4-ацетиламінобензильна, 4-нітро-3-метилбензильна, 4-гідроксифенільна, 3-гідроксифенільна, 2-гідроксифенільна, 4-трет-бутирилбензильна, 4-бензилоксифенільна, 4-півалоїлбензильна, 2-(4-ацетилфеніл)етильна, 1-(3-пропіонілфеніл)етильна, 3-(2-бутирилфеніл)пропильна, 4-(4-пентаноїлфеніл)бутильна, 5-(3-гексаноїлфеніл)пентильна, 6-(2,4-диацетилфеніл)гексильна, 1,1-диметил-2-(2,4,6-триацетилфеніл)етильна, 2-метил-3-(3,4-диацетилфеніл)пропильна, 2-(4-амінофеніл)етильна, 1-(3-пропіоніламінофеніл)етильна, 3-(2-бутириламінофеніл)пропильна, 4-(4-пентамінофеніл)бутильна, 5-(гексаноїламінофеніл)пентильна, 6-(N-ацетил-N-пропіоніламінофеніл)гексильна, 1,1-диметил-2-(3,4-діамінофеніл)етильна, 2-метил-3-(3,4,5-триацетиламінофеніл)пропильна, 2-(2-етоксикарбонілфеніл)етильна, 1-(3-пропоксикарбонілфеніл)етильна, 3-(4-пентилоксикарбонілфеніл)пропильна, 4-(3-гексилоксикарбонілфеніл)бутильна, 5-(3,4-диметоксикарбонілфеніл)пентильна, 6-(3,4,5-триетоксикарбонілфеніл)гексильна, 1,1-диметил-2-(4-бутоксикарбонілфеніл)етильна, 2-метил-3-(4-метоксикарбонілфеніл)пропильна, 2-(2-ціанофеніл)етильна, 1-(3-ціанофеніл)етильна, 3-(4-ціанофеніл)пропильна, 4-(2-ціанофеніл)бутильна, 5-(3-ціанофеніл)пентильна, 6-(4-ціанофеніл)гексильна, 1,1-диметил-2-(2,4-диціанофеніл)етильна, 2-метил-3-(2,4,6-триціанофеніл)пропильна, 2-(2-нітрофеніл)етильна, 1-(3-нітрофеніл)етильна, 3-(4-



нітрофеніл)пропильна, 4-(2-нітрофеніл)бутильна, 5-(3-нітрофеніл)пентильна, 6-(4-нітрофеніл)гексильна, 1,1-диметил-2-(2,4-динітрофеніл)етильна, 2-метил-3-(2,4,6-тринітрофеніл)пропильна, 2-(2-фенілфеніл)етильна, 1-(3-фенілфеніл)етильна, 3-(4-фенілфеніл)пропильна, 4-(2-фенілфеніл)бутильна, 5-(3-фенілфеніл)пентильна, 6-(4-фенілфеніл)гексильна, 1,1-диметил-2-(2,4-дифенілфеніл)етильна, 2-метил-3-(2,4,6-трифенілфеніл)пропильна, 2-(2-фторфеніл)етильна, 1-(3-бромфеніл)етильна, 3-(4-йодфеніл)пропильна, 4-(2-бромфеніл)бутильна, 5-(3-хлорфеніл)пентильна, 6-(4-бромфеніл)гексильна, 1,1-диметил-2-(2,4-дихлорфеніл)етильна, 2-метил-3-(2,4,6-трифторфеніл)пропильна, 2-(2-етилфеніл)етильна, 1-(3-пропилфеніл)етильна, 3-(4-бутилфеніл)пропильна, 4-(2-пентилфеніл)бутильна, 5-(3-гексилфеніл)пентильна, 6-(4-трифторметилфеніл)гексильна, 1,1-диметил-2-(2,4-диметилфеніл)етильна, 2-метил-3-[2,4,6-три(трифторметил)феніл]пропильна, 2-(2-етоксифеніл)етильна, 1-(3-пропоксифеніл)етильна, 3-(4-бутоксифеніл)пропильна, 4-(2-пентилоксифеніл)бутильна, 5-(3-гексилоксифеніл)пентильна, 6-(4-трифторметоксифеніл)гексильна, 1,1-диметил-2-(2,4-диметоксифеніл)етильна, 2-метил-3-[2,4,6-три(трифторметоксифеніл)пропильна, 2-(2-бензилоксифеніл)етильна, 1-[3-(2-фенілетокси)феніл]етильна, 3-[4-(3-фенілпропокси)феніл]пропильна, 4-[2-(4-фенілбутокси)феніл]бутильна, 5-[3-(5-фенілпентилокси)феніл]пентильна, 6-[4-(6-фенілгексилокси)феніл]гексильна, 1,1-диметил-2-(2,4-добензилоксифеніл)етильна, 2-метил-3-(2,4,6-трибензилоксифеніл)пропильна, 2-(2-гідроксифеніл)етильна, 1-(3-гідроксифеніл)етильна, 3-(4-гідроксифеніл)пропильна, 4-(2-гідроксифеніл)бутильна, 5-(3-гідроксифеніл)пентильна, 6-(4-гідроксифеніл)гексильна, 1,1-диметил-2-(2,4-дигідроксифеніл)етильна, 2-метил-3-(2,4,6-тригідроксифеніл)пропильна, 2-(3,4-метилендиоксифеніл)етильна, 1-(2,3-етилендиоксифеніл)етильна, 3-(3,4-триметилендиоксифеніл)пропильна, 4-(3,4-тетраметилендиоксифеніл)бутильна, 5-(3,4-метилендиоксифеніл)пентильна, 6-(3,4-етилендиоксифеніл)гексильна, 1,1-диметил-2-(3,4-метилендиокси)етильна, та 2-метил-3-(3,4-метилендиоксифеніл)пропильна групи. Переважно, вони являють собою феніл заміщені нижчі алкільні групи, які можуть бути заміщені у фенільному кільці групою(ами), як замісник(и), обрані з групи, що містить нижчу алканойльну групу, аміно групу, яка може мати нижчу алканойльну групу у якості замісника, нижчу алкоксикарбонільну групу, ціано групу, нітро групу, фенільну групу, атом галогену, нижчу алкільну групу, яка може мати атом галогену у якості

замісника, нижчу алкокси групу, яка може мати атом галогену у якості замісника, феніл нижчу алкокси групу, гідроксильну групу, та нижчу алкілендіокси групу.

[0256]

Прикладами піридил нижчої алкільної групи, яка може мати, у піридиновому кільці, 1-3 замісники обрані з групи, що містить гідроксильну групу та нижчу алкільну групу, яка може мати гідроксильну групу у якості замісника є, додатково до вищеописаної піридил нижчої алкільної групи, піридилалкільні групи які можуть мати, у піридиновому кільці, 1-3 замісники обрані з групи, що містить гідрокси групу та лінійну або розгалужена алкільну групу, що має 1-6 атомів вуглецю, яка може мати 1-3 гідрокси групи як замісники, та алкільна частина яких - це лінійна або розгалужена алкільна група, що має 1-6 атомів вуглецю як от [2-метил-(3,4, 5 або 6-)піридил]метильна, [2-метил-3-гідрокси-5-гідрокси метил-(4 або 6-)піридил]метильна, 2-[3-етил-(2,4, 5 або 6-)піридил]етильна, 1-[4-пропил-(2,3, 5 або 6-)піридил]етильна, 3-[2-бутил-(3,4, 5 або 6-)піридил]пропильна, 4-[3-пентил-(2,4, 5 або 6-)піридил]бутильна, 1,1-диметил-2-[4-гексил-(2,3, 5 або 6-)піридил]етильна, 5-[2,3-диметил-(4,5 або 6-)піридил]пентильна, 6-[2,4,6-триметил-(3 або 5-)піридил]гексильна, 1-[2-гідрокси-(2,3, 5 або 6-)піридил]ізопропильна, 2-метил-3-[3-гідрокси-(2,4, 5 або 6-)піридил]пропильна, [2-гідрокси-(3,4, 5 або 6-)піридил]метильна, 2-[3-гідрокси-(2,4, 5 або 6-)піридил]етильна, 1-[4-гідрокси-(2,3, 5 або 6-)піридил]етильна, 3-[2-гідрокси-(3,4, 5 або 6-)піридил]пропильна, 4-[3-гідрокси-(2,4, 5 або 6-)піридил]бутильна, 1,1-диметил-2-[4-гідрокси-(2,3, 5 або 6-)піридил]етильна, 5-[2,3-дигідрокси-(4,5 або 6-)піридил]пентильна, 6-[2,4,6-тригідрокси-(3 або 5-)піридил]гексильна, [2-гідроксиметил-(3,4, 5 або 6-)піридил]метильна, 2-[3-(2-гідроксиетил)-(2,4, 5 або 6-)піридил]етильна, 1-[4-(3-гідроксипропил)-(2,3, 5 або 6-)піридил]етильна, 3-[2-(4-гідроксибутил)-(3,4, 5 або 6-)піридил]пропильна, 4-[3-(5-гідроксипентил)-(2,4, 5 або 6-)піридил]бутильна, 1,1-диметил-2-[4-(6-гідроксигексил)-(2,3, 5 або 6-)піридил]етильна, 5-[2,3-ди(гідроксиметил)-(4,5 або 6-)піридил]пентильна, 6-[2,4,6-три(гідроксиметил)-(3 або 5-)піридил]гексильна, 1-[2-гідроксиметил-(2,3, 5 або 6-)піридил]ізопропильна, 2-метил-3-[3-(2,3-дигідроксипропил)-(2,4, 5 або 6-)піридил]пропильна, [2-метил-3-(2,2,4-тригідроксибутил)-(4,5 або 6-)піридил]метильна, та [2-метил-5-гідроксиметил-(3,4 або 6-)піридил]метильна групи.

[0257]

Прикладами пірроліл нижчої алкільної групи, яка може мати 1-3 нижчі алкільні групи як замісники у піррольному кільці, є пірролілалкільні групи, які можуть мати 1-3 лінійні або розгалужені алкільні групи, що мають 1-6 атомів вуглецю у піррольному кільці та алкільна частина яких - це лінійна або розгалужена алкільна група, що має 1-6 атомів вуглецю як от [(1,2 або 3-)пірроліл]метильна, 2-[(1,2 або 3-)пірроліл]етильна, 1-[(1,2 або 3-)пірроліл]етильна, 3-[(1,2 або 3-)

пірроліл]пропильна, 4-[(1,2 або 3-)  
 пірроліл]бутильна, 5-[(1,2 або 3-)  
 пірроліл]пентильна, 6-[(1,2 або 3-)  
 пірроліл]гексильна, 1,1-диметил-2-[(1,2 або 3-)  
 пірроліл]етильна, 2-метил-3-[(1,2 або 3-)  
 пірроліл]пропильна, [1-метил-(2 або 3-)  
 пірроліл]метильна, 2-[2-етил-(1,3, 4 або 5-)  
 пірроліл]етильна, 1-[3-пропил-(1,2, 4 або 5-)  
 пірроліл]етильна, 3-[1-бутил-(2,3 або 4-)  
 пірроліл]пропильна, 4-[2-пентил-(1,3, 4 або 5-)  
 пірроліл]бутильна, 5-[3-гексил-(1,2, 4 або 5-)  
 пірроліл]пентильна, 6-[1,2-диметил-(3,4 або 5-)  
 пірроліл]гексильна, 1,1-диметил-2-[1,2,3-триметил-  
 (4 або 5-)]пірроліл]етильна, та 2-метил-3-[1-етил-2-  
 метил-(3,4 або 5-)]пірроліл]пропильна групи.

[0258]

Прикладами бензоксазолільної нижчої алкільної групи є бензоксазолілалкільні групи, алкільна частина яких - це лінійна або розгалужена алкільна група, що має 1-6 атомів вуглецю, як от [(2,4, 5,6 або 7-)  
 бензооксазоліл]метильна, 2-[(2,4, 5,6 або 7-)  
 бензооксазоліл]етильна, 1-[(2,4, 5,6 або 7-)  
 бензооксазоліл]етильна, 3-[(2,4, 5,6 або 7-)  
 бензооксазоліл]пропильна, 4-[(2,4, 5,6 або 7-)  
 бензооксазоліл]бутильна, 5-[(2,4, 5,6 або 7-)  
 бензооксазоліл]пентильна, 6-[(2,4, 5,6 або 7-)  
 бензооксазоліл]гексильна, 1,1-диметил-2-[(2,4, 5,6  
 або 7-)]бензооксазоліл]етильна, та 2-метил-3-[(2,4,  
 5,6 або 7-)]бензооксазоліл]пропильна групи.

[0259]

Прикладами бензотіазолільної нижчої алкільної групи є бензотіазолілалкільні групи, алкільна частина яких - це лінійна або розгалужена алкільна група, що має 1-6 атомів вуглецю, як от [(2,4, 5,6 або 7-)  
 бензотіазолільна]метильна, 2-[(2,4, 5,6 або 7-)  
 бензотіазолільна]етильна, 1-[(2,4, 5,6 або 7-)  
 бензотіазолільна]етильна, 3-[(2,4, 5,6 або 7-)  
 бензотіазолільна]пропильна, 4-[(2,4, 5,6 або 7-)  
 бензотіазолільна]бутильна, 5-[(2,4, 5,6 або 7-)  
 бензотіазолільна]пентильна, 6-[(2,4, 5,6 або 7-)  
 бензотіазолільна]гексильна, 1,1-диметил-2-[(2,4,  
 5,6 або 7-)]бензотіазолільна]етильна, та 2-метил-3-  
 [(2,4, 5,6 або 7-)]бензотіазолільна]пропильна групи.

[0260]

Прикладами фурил нижчої алкільної групи є фурилалкільні групи, алкільна частина яких - це лінійна або розгалужена алкільна група, що має 1-6 атомів вуглецю, як от [(2 або 3-)]фурил]метильна, 2-[(2 або 3-)]фурил]етильна, 1-[(2 або 3-)]фурил]етильна, 3-[(2 або 3-)]фурил]пропильна, 4-[(2 або 3-)]фурил]бутильна, 5-[(2 або 3-)]фурил]пентильна, 6-[(2 або 3-)]фурил]гексильна, 1,1-диметил-2-[(2 або 3-)]фурил]етильна, та 2-метил-3-[(2 або 3-)]фурил]пропильна групи.

[0261]

Прикладами тіазолідиніл нижчої алкільної групи, яка може мати оксо групу у якості замісника у тіазолідиновому кільці, є тіазолідинілалкільні групи, які можуть мати 1-3 оксо групи як замісники у тіазолідиновому кільці та алкільна частина яких - це лінійна або розгалужена алкільна група, що має 1-6 атомів вуглецю, як от (2,3, 4 або 5-)  
 тіазолідинілметильна, 2-[(2,3, 4 або 5-)

тіазолідиніл]етильна, 1-[(2,3, 4 або 5-)  
 тіазолідиніл]етильна, 3-[(2,3, 4 або 5-)  
 тіазолідиніл]пропильна, 4-[(2,3, 4 або 5-)  
 тіазолідиніл]бутильна, 5-[(2,3, 4 або 5-)  
 тіазолідиніл]пентильна, 6-[(2,3, 4 або 5-)  
 тіазолідиніл]гексильна, 1,1-диметил-2-[(2,3, 4 або 5-)  
 тіазолідиніл]етильна, 2-метил-3-[(2,3, 4 або 5-)  
 тіазолідиніл]пропильна, [2,4-диоксо-(3 або 5-)  
 тіазолідиніл]метильна, 2-[2-оксо-(3,4 або 5-)  
 тіазолідиніл]етильна, 1-[4-оксо-(2,3 або 5-)  
 тіазолідиніл]етильна, 3-[2-оксо-(3,4 або 5-)  
 тіазолідиніл]пропильна, 4-[5-оксо-(2,3 або 4-)  
 тіазолідиніл]бутильна, 5-[2,5-диоксо-(3 або 4-)  
 тіазолідиніл]пентильна, 6-[2,4,5-триоксо-3-  
 тіазолідиніл]гексильна, 1-[4,5-диоксо-(2 або 3-)  
 тіазолідиніл]етильна, 2-[4,5-диоксо-(2- або 3-)  
 тіазолідиніл]етильна, 1,1-диметил-2-[2,4-диоксо-(3  
 або 5-)]тіазолідиніл]етильна, та 2-метил-3-[2,4-  
 диоксо-(3 або 5-)]тіазолідиніл]пропильна групи.

[0262]

Прикладами тіазолідиніліден нижчої алкільної групи, яка може мати оксо групу у якості замісника у тіазолідиновому кільці, є тіазолідиніліденалкільні групи, які можуть мати 1-3 оксо групи як замісники у тіазолідиновому кільці та алкільна частина яких - це лінійна або розгалужена алкільна група, що має 1-6 атомів вуглецю, як от (2,4 або 5-)  
 тіазолідиніліденметильна, (2,4 або 5-)  
 тіазолідиніліденетильна, (2,4 або 5-)  
 тіазолідиніліденпропильна, (2,4 або 5-)  
 тіазолідиніліденізопропильна, (2,4 або 5-)  
 тіазолідиніліденбутильна, (2,4 або 5-)  
 тіазолідиніліденпентильна, (2,4 або 5-)  
 тіазолідиніліденгексильна, 4,5-диоксо-2-  
 тіазолідиніліденметильна, 2,5-диоксо-4-  
 тіазолідиніліденметильна, 2,4-диоксо-5-  
 тіазолідиніліденметильна, 4-оксо-(2 або 5-)  
 тіазолідиніліденетильна, 5-оксо-(2 або 4-)  
 тіазолідиніліденпропильна, та 2-оксо-(4 або 5-)  
 тіазолідиніліденбутильна групи.

[0263]

Прикладами бензоїльної групи, яка може бути заміщена у фенільному кільці 1-3 групами, обраними з групи, що містить ціано групу, аміно групу, яка може мати нижчу алкілсульфонільну групу у якості замісника, атом галогену, нижчу алкокси групу, нижчу алкільну групу, яка може мати атом галогену у якості замісника, тіазолідиніл нижчу алкільну групу, яка може мати оксо групу у якості замісника у тіазолідиновому кільці, тіазолідиніліден нижчу алкільну групу, яка може мати оксо групу у якості замісника у тіазолідиновому кільці, та нижчу алкілендіоксигрупу, є бензоїльні групи, які можуть бути заміщені у фенільному кільці 1-3 групами, обраними з групи, що містить ціано групу; аміно групу, яка може мати 1 або 2 лінійні або розгалужені алкілсульфонільні групи, що мають 1-6 атомів вуглецю як замісники; атом галогену; лінійну або розгалужену алкокси групу, що має 1-6 атомів вуглецю; лінійну або розгалужену алкільну групу, що має 1-6 атомів вуглецю, яка може мати 1-3 атоми галогенів як замісники; тіазолідинілалкільну групу, яка може мати 1-3 оксо групи як замісники у тіазолідиновому кільці та

алкільна частина яких - це лінійна або розгалужена алкільна група, що має 1-6 атомів вуглецю; тiazолідиніліденалкільну групу, яка може мати 1-3 оксо групи як замісники у тiazолідиновому кільці та алкільна частина яких - це лінійна або розгалужена алкільна група, що має 1-6 атомів вуглецю; та лінійну або розгалужену алкілендіокси групу, що має 1-4 атомів вуглецю, як от бензоїльна, 4-ціанобензоїльна, 3,4-метилендіоксibenзоїльна, 2-амінобензоїльна, 3-амінобензоїльна, 4-амінобензоїльна, 3,4-діамінобензоїльна, 2,4,6-триамінобензоїльна, 4-метоксибензоїльна, 4-трифторметилбензоїльна, 4-хлорбензоїльна, 3,4-дифторбензоїльна, 2-фторбензоїльна, 3-бромбензоїльна, 4-йодбензоїльна, 3,4-диметоксибензоїльна, 4-фторбензоїльна, 3-ціанобензоїльна, 2-ціанобензоїльна, 2,3-диціанобензоїльна, 3,4,5-триціанобензоїльна, 4-метилбензоїльна, 4-(2,4-диоксотiazолідинілметил)бензоїльна, 4-(2,4-диоксотiazолідинілденметил)бензоїльна, 2-метилбензоїльна, 3-метилбензоїльна, 2-етилбензоїльна, 3-етилбензоїльна, 4-етилбензоїльна, 4-ізопропилбензоїльна, 3-бутилбензоїльна, 4-пентилбензоїльна, 4-гексилбензоїльна, 3,4-диметилбензоїльна, 3,4-диетилбензоїльна, 2,4-диметилбензоїльна, 2,5-диметилбензоїльна, 2,6-диметилбензоїльна, 3,4,5-триметилбензоїльна, 2-метоксибензоїльна, 3-метоксибензоїльна, 2-етоксибензоїльна, 3-етоксибензоїльна, 4-етоксибензоїльна, 4-ізопропоксибензоїльна, 3-бутоксибензоїльна, 4-пентилоксибензоїльна, 4-гексилоксибензоїльна, 3,4-диетоксибензоїльна, 2,4-диметоксибензоїльна, 2,5-диметоксибензоїльна, 2,6-диметоксибензоїльна, 3,4,5-триметоксибензоїльна, 2-трифторметилбензоїльна, 3-трифторметилбензоїльна, 4-трифторметилбензоїльна, 2-(бромметил)бензоїльна, 3-(2-хлоретил)бензоїльна, 4-(2,3-дихлорпропил)бензоїльна, 4-(4-фторбутил)бензоїльна, 3-(5-хлорпентил)бензоїльна, 4-(5-бромгексил)бензоїльна, 4-(5,6-дибромгексил)бензоїльна, 3,4-ди(трифторметил)бензоїльна, 3,4-ди(4,4,4-трихлорбутил)бензоїльна, 2,4-ди(3-хлор-2-метилпропил)бензоїльна, 2,5-ди(3-хлорпропил)бензоїльна, 2,6-ди(2,2,2-трифторетил)бензоїльна, 3,4,5-три(трифторметил)бензоїльна, 4-(2,2,2-трихлоретил)бензоїльна, 2-метил-4-трифторметилбензоїльна, 3-етил-4-трихлорметилбензоїльна, 2-метокси-4-трифторметилбензоїльна, 3-етил-4-фторбензоїльна, 3-етокси-4-трихлорметилбензоїльна, 2-метил-3-трифторметил-4-трифторметилбензоїльна, 3-фторбензоїльна, 4-фторбензоїльна, 2-бромбензоїльна, 4-бромбензоїльна, 2-йодбензоїльна, 3-йодбензоїльна, 2,3-дибромбензоїльна, 2,4-дйодбензоїльна, 2,5-дифторбензоїльна, 2,6-дихлорбензоїльна, 2,4,6-трихлорбензоїльна, 2,4-дифторбензоїльна, 3,4-

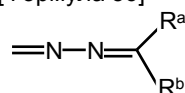
дифторбензоїльна, 3,5-дифторбензоїльна, 2,6-дифторбензоїльна, 2-хлорбензоїльна, 3-хлорбензоїльна, 4-хлорбензоїльна, 2,3-дихлорбензоїльна, 2,4-дихлорбензоїльна, 2,5-дихлорбензоїльна, 3,4-дихлорбензоїльна, 2,6-дихлорбензоїльна, 3,5-дихлорбензоїльна, 2,4,6-трифторбензоїльна, 2,4-дифторбензоїльна, 3,4-дифторбензоїльна, 3,4-метилендіоксibenзоїльна, 3,4-триметилендіоксibenзоїльна, 2,3-етилендіоксibenзоїльна, 3,4-триметилендіоксibenзоїльна, 2,3-тетраметилендіоксibenзоїльна, 2,3-метилендіоксibenзоїльна, 3,4-етилендіоксibenзоїльна, та 2-метансульфоніламінобензоїльна групи.

[0264]

Прикладами тiazолідиніл нижчої алканойльної групи, яка може бути заміщена у тiazолідиновому кільці групою, що обрана з групи, що містить оксо групу та групу формули:

[0265]

[Формула 56]

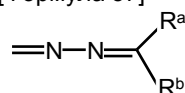


[0266]

де  $R^a$  та  $R^b$  кожний представляють нижчу алкільну групу, є тiazолідинілаканойльні групи, які можуть бути заміщені у тiazолідиновому кільці 1-3 замісниками, що обрані з групи, що містить оксо групу та групу формули:

[0267]

[Формула 57]



[0268]

де  $R^a$  та  $R^b$  кожний представляють лінійну або розгалужену алкільну групу, що має 1-6 атомів вуглецю, та алканойльна частина якої - це лінійна або розгалужена алканойльна група, що має 2-6 атомів вуглецю, як от 2-[(2,3,4 або 5-) тiazолідиніл]ацетильна, 3-[(2,3,4 або 5-) тiazолідиніл]пропіонільна, 2-[(2,3,4 або 5-) тiazолідиніл]пропіонільна, 4-[(2,3,4 або 5-) тiazолідиніл]бутирільна, 5-[(2,3,4 або 5-) тiazолідиніл]пентанойльна, 6-[(2,3,4 або 5-) тiazолідиніл]гексанойльна, 2,2-диметил-3-[(2,3, 4 або 5-) тiazолідиніл]пропіонільна, 2-метил-3-[(2,3, 4 або 5-) тiazолідиніл]пропіонільна, [2,4-диоксо-(3 або 5-) тiazолідиніл]ацетильна, 3-[2-оксо-(3,4 або 5-) тiazолідиніл]пропіонільна, 2-[4-оксо-(2,3 або 5-) тiazолідиніл]пропіонільна, 4-[5-оксо-(2,3 або 4-) тiazолідиніл]бутирільна, 5-[2,5-диоксо-(3 або 4-) тiazолідиніл]пентанойльна, 6-[2,4,5-триоксо-3- тiazолідиніл]гексанойльна, 2-[4,5-диоксо-(2 або 3-) тiazолідиніл]ацетильна, 2,2-диметил-3-[2,4-диоксо-(3 або 5-) тiazолідиніл]пропіонільна, 2-метил-3-[2,4-диоксо-(3 або 5-) тiazолідиніл]пропіонільна, 2-[4-оксо-2-ізопропіліденгідразоно-(3 або 5-) тiazолідиніл]ацетильна, 2-[2-оксо-5-ізопропіліденгідразоно-(3 або 4-) тiazолідиніл]ацетильна, 2-[2,4-ди(ізопропіліденгідразоно)-(3 або 5-)]

тіазолідиніл]ацетильна, 3-[2-метиліденгідразоно-(3,4 або 5-)]тіазолідиніл]пропіонільна, 2-[4-етиліденгідразоно-(2,3 або 5-)]тіазолідиніл]пропіонільна, 4-[5-пропіліденгідразоно-(2,3 або 4-)]тіазолідиніл]бутирильна, 5-[2,5-ди(ізопропіліденгідразоно)-(3 або 4-)]тіазолідиніл]пентаноїльна, 6-[2,4,5-три(ізопропіліденгідразоно)-3-тіазолідиніл]гексаноїльна, 2-[4,5-ди(ізопропіліденгідразоно)-(2 або 3-)]тіазолідиніл]ацетильна, 2,2-диметил-3-[4-бутиліденгідразоно(2,3 або 5-)]тіазолідиніл]пропіонільна, 2-метил-3-[5-пентиліден-(2,3 або 4-)]тіазолідиніл]пропіонільна, та 2-(гексиліденгідразоно)-(3,4 або 5-)]тіазолідинілацетильна групи.

[0269]

Прикладами нижчої алкільної групи, яка може мати замісник обраний з групи, що містить гідроксильну групу та атом галогену є, додатково до вищеописаної нижчої алкільної групи, лінійна або розгалужена алкільні групи що мають 1-6 атомів вуглецю, які можуть мати 1-3 замісники, обрані з групи, що містить гідрокси групу та атом галогену, як от гідроксиметильна, 2-гідроксиетильна, 1-гідроксиетильна, 3-гідроксипропильна, 2,3-дигідроксипропильна, 4-гідроксибутильна, 1,1-диметил-2-гідроксиетильна, 5,5,4-тригідроксипентильна, 5-гідроксипентильна, 6-гідроксигексильна, 1-гідроксиізопропильна, 2-метил-3-гідроксипропильна, трифторметильна, трихлорметильна, хлорметильна, бромметильна, фторметильна, йодметильна, дифторметильна, дибромметильна, 2-хлоретильна, 2,2,2-трифторетильна, 2,2,2-трихлоретильна, 3-хлорпропильна, 2,3-дихлорпропильна, 4,4,4-трихлорбутильна, 4-фторбутильна, 5-хлорпентильна, 3-хлор-2-метилпропильна, 5-бромгексильна, 5,6-дибромгексильна, 2-гідрокси-3-фторпропильна, та 2,2-дихлор-3-гідроксибутильна групи.

Прикладами карбамоїльної групи, яка може мати групу, що обрана з групи, що містить нижчу алкокси нижчу алкільну групу та нижчу алкільну групу, є карбамоїльні групи, які можуть мати 1 або 2 групи, обрані з групи, що містить лінійну або розгалужену алкільну групу, що має 1-6 атомів вуглецю та що має лінійну або розгалужену алкокси групу, що має 1-6 атомів вуглецю та лінійну або розгалужену алкільну групу, що має 1-6 атомів вуглецю як от карбамоїльна, N-(2-метоксиетил)карбамоїльна, метилкарбамоїльна, етилкарбамоїльна, пропилкарбамоїльна, ізопропилкарбамоїльна, бутилкарбамоїльна, трет-бутилкарбамоїльна, пентилкарбамоїльна, гексилкарбамоїльна, диметилкарбамоїльна, диетилкарбамоїльна, дипропилкарбамоїльна, дибутилкарбамоїльна, дипентилкарбамоїльна, дигексилкарбамоїльна, N-метил-N-етилкарбамоїльна, N-етил-N-пропилкарбамоїльна, N-метил-N-бутилкарбамоїльна, N-метил-N-гексилкарбамоїльна, N-(метоксиметил)карбамоїльна, N-(3-пропоксипропил)карбамоїльна,

бутоксibuтил)карбамоїльна, N-(4-етоксибутил)карбамоїльна, N-(5-пентилоксипентил)карбамоїльна, N-(5-метоксипентил)карбамоїльна, N-(6-гексилоксигексил)карбамоїльна, ди(2-метоксиетил)карбамоїльна, N-(2-метоксиетил)-N-метилкарбамоїльна, та N-(2-метоксиетил)-N-етилкарбамоїльна групи.

[0270]

Прикладами фенільної групи, яка може бути заміщена у фенільному кільці 1-3 групами, що обрані з групи, що містить карбамоїльну групу, яка може мати групу, обрана з групи, що містить нижчу алкокси нижчу алкільну групу та нижчу алкільну групу, нижчу алкоксикарбонільну групу, карбокси групу, ціано групу, фенільну групу, атом галогену, нижчу алкільну групу, яка може мати атом галогену у якості замісника, нижчу алкокси групу, яка може мати атом галогену у якості замісника, бензоїльну групу, яка може мати атом галогену у якості замісника у фенільному кільці, фенільну групу нижчого алкілу яка може мати атом галогену у якості замісника у фенільному кільці, та гідроксильну групу, є фенільні групи, які можуть бути заміщені у фенільному кільці 1-3 групами, що обрані з групи, що містить карбамоїльну групу, яка може мати 1 або 2 групи, обрані з групи, що містить алкоксиалкільну групу алкокси частина якої - це лінійна або розгалужена алкокси група, що має 1-6 атомів вуглецю та алкільна частина якої - це лінійна або розгалужена алкільна група, що має 1-6 атомів вуглецю та лінійна або розгалужена алкільна група, що має 1-6 атомів вуглецю; алкоксикарбонільна група, алкокси частина якої - це лінійна або розгалужена алкокси група, що має 1-6 атомів вуглецю; карбокси групу; ціано групу; фенільну групу; атом галогену; лінійну або розгалужену алкільну групу, що має 1-6 атомів вуглецю, яка може мати 1-3 атоми галогенів як замісники; лінійну або розгалужену алкокси групу, що має 1-6 атомів вуглецю, яка може мати 1-3 атоми галогенів як замісники; бензоїльну групу яка може мати 1-3 атоми галогенів як замісники у фенільному кільці; фенілалкільну групу, яка може мати 1-3 атоми галогенів як замісники у фенільному кільці та алкільна частина якої - це лінійна або розгалужена алкільна група, що має 1-6 атомів вуглецю, та гідроксильну групу, як от фенільна, 2-метилфенільна, 3-метилфенільна, 4-метилфенільна, 2-етилфенільна, 3-етилфенільна, 4-етилфенільна, 4-ізопропилфенільна, 3-бутилфенільна, 4-пентилфенільна, 4-гексилфенільна, 3,4-диметилфенільна, 3,4-диетилфенільна, 2,4-диметилфенільна, 2,3-диметилфенільна, 2,5-диметилфенільна, 2,6-диметилфенільна, 3,4,5-триметилфенільна, 2-метоксифенільна, 3-метоксифенільна, 4-метоксифенільна, 2-етоксифенільна, 3-етоксифенільна, 4-етоксифенільна, 4-ізопропоксифенільна, 3-бутоксифенільна, 4-пентилоксифенільна, 4-гексилоксифенільна, 3,4-диметоксифенільна, 3,4-диетоксифенільна, 2,4-диметоксифенільна, 2,5-диметоксифенільна, 2,6-диметоксифенільна, 3,4,5-триметоксифенільна, 2-трифторметоксифенільна, 3-

трифторметоксифенільна, 4-  
 трифторметоксифенільна, 2-  
 (бромметокси)фенільна, 3-(2-  
 хлоретокси)фенільна, 4-(2,3-  
 дихлорпропокси)фенільна, 4-(4-  
 фторбутоксифенільна, 3-(5-  
 хлорпентилокси)фенільна, 4-(5-  
 бромгексилокси)фенільна, 4-(5,6-  
 дибромгексилокси)фенільна, 3,4-  
 ди(трифторметокси)фенільна, 3,4-ди(4,4,4-  
 трихлорбутоксифенільна, 2,4-ди(3-хлор-2-  
 метоксипропил)фенільна, 2,5-ди(3-  
 хлорпропокси)фенільна, 2,6-ди(2,2,2-  
 трифторетокси)фенільна, 3,4,5-  
 три(трифторметокси)фенільна, 4-(2,2,2-  
 трихлоретокси)фенільна, 2-метил-4-  
 трифторметоксифенільна, 3-етил-4-  
 трихлорметоксифенільна, 2-метокси-4-  
 трифторметоксифенільна, 3-етокси-4-  
 трихлорметоксифенільна, 2-  
 трифторметилфенільна, 3-  
 трифторметилфенільна, 4-  
 трифторметилфенільна, 2-(бромметил)фенільна,  
 3-(2-хлоретил)фенільна, 4-(2,3-  
 дихлорпропил)фенільна, 4-(4-  
 фторбутил)фенільна, 3-(5-хлорпентил)фенільна,  
 4-(5-бромгексил)фенільна, 4-(5,6-  
 дибромгексил)фенільна, 3,4-  
 ди(трифторметил)фенільна, 3,4-ди(4,4,4-  
 трихлорбутил)фенільна, 2,4-ди(3-хлор-2-  
 метилпропил)фенільна, 2,5-ди(3-  
 хлорпропил)фенільна, 2,6-ди(2,2,2-  
 трифторетил)фенільна, 3,4,5-  
 три(трифторметил)фенільна, 4-(2,2,2-  
 трихлоретил)фенільна, 2-метил-4-  
 трифторметилфенільна, 3-етил-4-  
 трихлорметилфенільна, 2-  
 метоксикарбонілфенільна, 3-  
 метоксикарбонілфенільна, 4-  
 метоксикарбонілфенільна, 2-  
 етоксикарбонілфенільна, 3-  
 етоксикарбонілфенільна, 4-  
 етоксикарбонілфенільна, 4-  
 ізопропоксикарбонілфенільна, 3-  
 бутоксикарбонілфенільна, 4-трет-  
 бутоксикарбонілфенільна, 4-  
 пентилоксикарбонілфенільна, 4-  
 гексилоксикарбонілфенільна, 3,4-  
 диметоксикарбонілфенільна, 3,4-  
 диетоксикарбонілфенільна, 2,4-  
 диметоксикарбонілфенільна, 2,5-  
 диетоксикарбонілфенільна, 2,6-  
 диметоксикарбонілфенільна, 3,4,5-  
 триетоксикарбонілфенільна, 2-ціанофенільна, 3-  
 ціанофенільна, 4-ціанофенільна, 3,4-  
 диціанофенільна, 3,5-диціанофенільна, 2,4-  
 диціанофенільна, 2,5-диціанофенільна, 2,6-  
 диціанофенільна, 3,4,5-триціанофенільна, 2-  
 фенілфенільна, 3-фенілфенільна, 4-  
 фенілфенільна, 3,4-дифенілфенільна, 3,5-  
 дифенілфенільна, 2,4-дифенілфенільна, 2,5-  
 дифенілфенільна, 2,6-дифенілфенільна, 3,4,5-  
 трифенілфенільна, 2-хлорфенільна, 3-  
 хлорфенільна, 4-хлорфенільна, 2,3-  
 дихлорфенільна, 2,4-дихлорфенільна, 2,5-

дихлорфенільна, 3,4-дихлорфенільна, 2,6-  
 дихлорфенільна, 3,5-дихлорфенільна, 2,4,6-  
 трихлорфенільна, 2-фторфенільна, 3-  
 фторфенільна, 4-фторфенільна, 2,5-  
 дифторфенільна, 2,4-дифторфенільна, 3,4-  
 дифторфенільна, 3,5-дифторфенільна, 2,6-  
 дифторфенільна, 2,4,6-трифторфенільна, 2-  
 бромфенільна, 3-бромфенільна, 4-бромфенільна,  
 2-йодфенільна, 3-йодфенільна, 4-йодфенільна,  
 2,3-дибромфенільна, 2,4-дийодфенільна, 2-  
 гідроксифенільна, 3-гідроксифенільна, 4-  
 гідроксифенільна, 3,4-дигідроксифенільна, 3,5-  
 дигідроксифенільна, 2,4-дигідроксифенільна, 2,5-  
 дигідроксифенільна, 2,6-дигідроксифенільна,  
 3,4,5-тригідроксифенільна, 3-бензилфенільна, 2-  
 (2-фенілетил)фенільна, 4-(1-фенілетил)фенільна,  
 2-(3-фенілпропил)фенільна, 3-(4-  
 фенілбутил)фенільна, 4-(5-фенілпентил)фенільна,  
 2-(6-фенілгексил)фенільна, 4-(1,1-диметил-2-  
 фенілетил)фенільна, 3-(2-метил-3-  
 фенілпропил)фенільна, 2-(4-  
 фторбензил)фенільна, 2-метил-5-хлорфенільна, 2-  
 метокси-5-хлорфенільна, 4-(4-  
 фторбензоїл)фенільна, 4-(4-  
 фторбензил)фенільна, 3-(2-хлорбензил)фенільна,  
 4-(3-хлорбензил)фенільна, 2-(4-  
 хлорбензил)фенільна, 3-[2-(4-  
 фторфеніл)етил]фенільна, 4-[2-(4-  
 хлорфеніл)етил]фенільна, 2-(3,4-  
 дибромбензил)фенільна, 3-(3,4-  
 дийодбензил)фенільна, 4-(2,4-  
 дифторбензил)фенільна, 2-(2,5-  
 дихлорбензил)фенільна, 3-(2,6-  
 дихлорбензил)фенільна, 4-(3,4,5-  
 трифторбензил)фенільна, 2-[3-(4-  
 хлорфеніл)пропил]фенільна, 3-[1-(2-  
 бромфеніл)етил]фенільна, 4-[4-(3-  
 фторфеніл)бутил]фенільна, 2-[5-(4-  
 йодфеніл)пентил]фенільна, 3-[6-(4-  
 хлорфеніл)гексил]фенільна, 2-[1,1-диметил-2-(3-  
 фторфеніл)етил]фенільна, 4-[2-метил-3-(4-  
 хлорфеніл)пропил]фенільна, 2,4-  
 дибензилфенільна, 2,4,6-трибензилфенільна, 2-  
 хлор-4-ціанофенільна, 3-гідрокси-4-  
 фенілфенільна, 3-етоксикарбоніл-2-  
 бензоїлфенільна, 2-бензил-4-метил-6-  
 метоксифенільна, 4-[(2-  
 метоксиетил)карбамоїл]фенільна, 3-(N-етил-N-  
 ізопропилкарбамоїл)фенільна, 4-  
 диметилкарбамоїлфенільна, 2-карбоксифенільна,  
 3-карбоксифенільна, та 4-карбоксифенільна групи.  
 [0271]

Прикладами фенільної групи, що має нижчу алкілендіоксигрупу у якості замісника у фенільному кільці, є фенільні групи, що мають лінійну або розгалужену алкілендіокси групу, що має 1-4 атоми вуглецю у якості замісника у фенільному кільці, як от 3,4-метилендіоксифенільна, 3,4-триметилендіоксифенільна, 2,3-етилендіоксифенільна, 2,3-тетраметилендіоксифенільна, 2,3-метилендіоксифенільна, 3,4-метилендіоксифенільна, та 2,3-триметилендіоксифенільна групи.

Прикладами феніл нижчої алкокси групи, яка може бути заміщена у фенільному кільці 1-3 групами, що обрані з групи, що містить атом галогену, нижчу алکیلну групу, яка може мати атом галогену у якості замісника, та нижчу алкокси групу, яка може мати атом галогену у якості замісника є, додатково до вищеописаної феніл нижчої алкокси групи, фенілалкокси група, яка може бути заміщена у фенільному кільці 1-3 групами, що обрані з групи, що містить атом галогену, лінійну або розгалужену алکیلну групу, що має 1-6 атомів вуглецю, яка може мати 1-3 атоми галогенів як замісники, та лінійну або розгалужену алкокси групу, що має 1-6 атомів вуглецю, яка може мати 1-3 атоми галогенів як замісники, та алкокси частина якої - це лінійна або розгалужена алкокси група, що має 1-6 атомів вуглецю, як от 2,5-дифторбензилокси, 2,4-дифторбензилокси, 3,4-дифторбензилокси, 3,5-дифторбензилокси, 2,6-дифторбензилокси, 3-трифторметилбензилокси, 2-трифторметилбензилокси, 4-трифторметилбензилокси, 3,4-диметоксибензилокси, 3,5-диметоксибензилокси, 2-хлорбензилокси, 3-хлорбензилокси, 4-хлорбензилокси, 2-метилбензилокси, 3-метилбензилокси, 4-метилбензилокси, 3,4-диметилбензилокси, 2,3-диметилбензилокси, 2-метоксибензилокси, 3-метоксибензилокси, 4-метоксибензилокси, 2,3-дихлорбензилокси, 2,4-дихлорбензилокси, 2,5-дихлорбензилокси, 3,4-дихлорбензилокси, 2,6-дихлорбензилокси, 4-фторбензилокси, 3-фторбензилокси, 2-фторбензилокси, 3-трифторметоксибензилокси, 4-трифторметоксибензилокси, 2-трифторметоксибензилокси, 4-трет-бутилбензилокси, 4-етилбензилокси, 4-ізопропилбензилокси, 4-метокси-3-хлорбензилокси, 2-(4-метоксифенільна)етокси, 2-(4-фторфеніл)етокси, 2-(4-хлорфеніл)етокси, 2-(3-метоксифенільна)етокси, 2-(4-метилфенільна)етокси, 3-метил-4-хлорбензилокси, 4-(4-метоксифенільна)бутокси, 2-(4-метилфенільна)етокси, 4-трет-бутоксибензилокси, 3-хлор-6-метоксибензилокси, 4-метокси-3-

метилбензилокси, 2-(2-фторфеніл)етокси, 1-(3-бромфеніл)етокси, 3-(4-йодфеніл)пропокси, 4-(2-бромфеніл)бутокси, 5-(3-хлорфеніл)пентилокси, 6-(4-бромфеніл)гексилокси, 1,1-диметил-2-(2,4-дихлорфеніл)етокси, 2-метил-3-(2,4,6-трифторфеніл)пропокси, 2-(2-етилфеніл)етокси, 1-(3-пропилфеніл)етокси, 3-(4-бутилфеніл)пропокси, 4-(2-пентилфеніл)бутокси, 5-(3-гексилфеніл)пентилокси, 6-(4-трифторметилфеніл)гексилокси, 1,1-диметил-2-(2,4-диметилфеніл)етокси, 2-метил-3-[2,4,6-три(трифторметил)феніл]пропокси, 2-(2-етоксифеніл)етокси, 1-(3-пропоксифеніл)етокси, 3-(4-бутоксифеніл)пропокси, 4-(2-пентилоксифеніл)бутокси, 5-(3-гексилоксифеніл)пентилокси, 6-(4-трифторметоксифеніл)гексилокси, 1,1-диметил-2-(2,4-диметоксифеніл)етокси, та 2-метил-3-[2,4,6-три(трифторметокси)феніл]пропокси групи.

[0275]

Прикладами 1,2,3,4-тетрагідронафтил заміщеної нижчої алкільної групи, яка може мати 1-5 нижчі алкільні групи як замісники у 1,2,3,4-тетрагідронафталеновому кільці, є 1,2,3,4-тетрагідронафтил заміщені алкільні групи, які можуть мати 1-5 лінійні або розгалужені алкільні групи, що мають 1-6 атомів вуглецю як замісники у 1,2,3,4-тетрагідронафталеновому кільці, та алкільна частина яких - це лінійна або розгалужена алкільна група, що має 1-6 атомів вуглецю, як от (1,2,5 або 6-)1,2,3,4-тетрагідронафтилметильна, 2-[(1,2,5 або 6-)1,2,3,4-тетрагідронафтил]етильна, 1-[(1,2,5 або 6-)1,2,3,4-тетрагідронафтил]етильна, 3-[(1,2,5 або 6-)1,2,3,4-тетрагідронафтил]пропильна, 4-[(1,2,5 або 6-)1,2,3,4-тетрагідронафтил]бутильна, 5-[(1,2,5 або 6-)1,2,3,4-тетрагідронафтил]пентильна, 6-[(1,2,5 або 6-)1,2,3,4-тетрагідронафтил]гексильна, 1,1-диметил-2-[(1,2,5 або 6-)1,2,3,4-тетрагідронафтил]етильна, 2-метил-3-[(1,2,5 або 6-)1,2,3,4-тетрагідронафтил]пропильна, 1,1,4,4-тетраметил(2,3,5 або 6-)1,2,3,4-тетрагідронафтилметильна, 1,1,4,4,5-пентаметил(2,3,6,7 або 8-)1,2,3,4-тетрагідронафтилметильна, 1,4,4-триметил(2,3,5,6,7 або 8-)1,2,3,4-тетрагідронафтилметильна, 5,6-диметил(2,3,7 або 8-)1,2,3,4-тетрагідронафтилметильна, 2-[1-метил-(1,2,3,4,5,6,7 або 8-)1,2,3,4-тетрагідронафтил]етильна, 1-[2-етил-(1,2,3,4,5,6,7 або 8-)1,2,3,4-тетрагідронафтил]етильна, 3-[3-пропил-(1,2,3,4,5,6,7 або 8-)1,2,3,4-тетрагідронафтил]пропильна, 4-[4-бутил-(1,2,3,4,5,6,7 або 8-)1,2,3,4-тетрагідронафтил]бутильна, 5-[5-пентил-(1,2,3,4,6,7 або 8-)1,2,3,4-тетрагідронафтил]пентильна, 6-[6-гексил-(1,2,3,4,5,7 або 8-)1,2,3,4-тетрагідронафтил]гексильна, 1,1-диметил-2-[1,7-диметил-(1,2,3,4,5,6 або 8-)1,2,3,4-тетрагідронафтил]етильна, та 2-метил-3-[1,1,4-триметил-(2,3,4,5,6,7 або 8-)1,2,3,4-тетрагідронафтил]пропильна групи.

[0276]

Прикладами піперидинільної групи, яка може

мати 1-3 нижчі алкільні групи як замісники у піперидиновому кільці, є піперидинільна група, яка може мати 1-3 лінійні або розгалужені алкільні групи, що мають 1-6 атомів вуглецю як замісники у піперидиновому кільці, як от (1,2, 3 або 4-)піперидинільна, 1-метил-(2,3 або 4-)піперидинільна, 1-етил-(2,3 або 4-)піперидинільна, 1-пропил-(2,3 або 4-)піперидинільна, 1-ізопропил-(2,3 або 4-)піперидинільна, 1-ізобутил-(2,3 або 4-)піперидинільна, 1-трет-бутил-(2,3 або 4-)піперидинільна, 1-пентил-(2,3 або 4-)піперидинільна, 1-гексил-(2,3 або 4-)піперидинільна, 1,2-диметил-(3,4, 5 або 6-)піперидинільна, та 1,2,6-триметил-(3,4 або 5-)піперидинільна групи.

[0277]

Прикладами хіноліл нижчої алкільної групи є хінолілалкільні групи, алкільна частина яких - це лінійна або розгалужена алкільна група, що має 1-6 атомів вуглецю, як от (2,3, 4,5, 6,7 або 8-)хінолілметильна, 2-[(2,3, 4,5, 6,7 або 8-)хіноліл]етильна, 1-[(2,3, 4,5, 6,7 або 8-)хіноліл]етильна, 3-[(2,3, 4,5, 6,7 або 8-)хіноліл]пропильна, 4-[(2,3, 4,5, 6,7 або 8-)хіноліл]бутильна, 5-[(2,3, 4,5, 6,7 або 8-)хіноліл]пентильна, та 6-[(2,3, 4,5, 6,7 або 8-)хіноліл]гексильна групи.

[0278]

Прикладами 1,2,3,4-тетразоліл нижчої алкільної групи, яка може мати, у тетразольному кільці, замісник обраний з групи, що містить нижчу алкільну групу та фенільну групу нижчого алкілу, є 1,2,3,4-тетразолілалкільні групи, алкільна частина яких - це лінійна або розгалужена алкільна група, що має 1-6 атомів вуглецю та яка може мати, у тетразольному кільці, замісник обраний з групи, що містить лінійну або розгалужену алкільну групу, що має 1-6 атомів вуглецю та феніл алкільну групу, алкільна частина якої - це лінійна або розгалужена алкільна група, що має 1-6 атомів вуглецю, як от [(1 або 5-)1,2,3,4-тетразоліл]метильна, 2-[(1 або 5-)1,2,3,4-тетразоліл]етильна, 1-[(1 або 5-)1,2,3,4-тетразоліл]етильна, 3-[(1 або 5-)1,2,3,4-тетразоліл]пропильна, 4-[(1 або 5-)1,2,3,4-тетразоліл]бутильна, 5-[(1 або 5-)1,2,3,4-тетразоліл]пентильна, 6-[(1 або 5-)1,2,3,4-тетразоліл]гексильна, 5-[1-метил-5-(1,2,3,4-тетразоліл)]пентильна, 6-[1-метил-5-(1,2,3,4-тетразоліл)]гексильна, 5-метил-1-(1,2,3,4-тетразоліл)метильна, 2-[5-етил-1-(1,2,3,4-тетразоліл)]гексильна, 1,1-диметил-2-[(1 або 5-)1,2,3,4-тетразоліл]етильна, 2-метил-3-[(1 або 5-)1,2,3,4-тетразоліл]пропильна, [1-метил-5-(1,2,3,4-тетразоліл)]метильна, [1-етил-5-(1,2,3,4-тетразоліл)]метильна, 2-[1-пропил-5-(1,2,3,4-тетразоліл)]етильна, 1-[1-бутил-5-(1,2,3,4-тетразоліл)]етильна, 3-[1-пентил-5-(1,2,3,4-тетразоліл)]пропильна, 3-[5-пропил-1-(1,2,3,4-тетразоліл)]пропильна, 4-[5-бутил-1-(1,2,3,4-тетразоліл)]бутильна, 5-[5-пентил-1-(1,2,3,4-тетразоліл)]пентильна, 6-[5-гексил-1-(1,2,3,4-тетразоліл)]гексильна, [1-етил-5-(1,2,3,4-тетразоліл)]метильна, [1-бензил-5-(1,2,3,4-

тетразоліл)]метильна, 1-[(2-фенілетил)-5-(1,2,3,4-тетразоліл)]метильна, 2-[1-(3-фенілпропил)-5-(1,2,3,4-тетразоліл)]етильна, 1-[1-(4-фенілбутил)-5-(1,2,3,4-тетразоліл)]етильна, 3-[1-(5-фенілпентил)-5-(1,2,3,4-тетразоліл)]пропильна, 4-[1-(6-фенілгексил)-5-(1,2,3,4-тетразоліл)]бутильна, 5-[1-(1,1-диметил-2-фенілетил)-5-(1,2,3,4-тетразоліл)]метильна, 6-[1-(2-метил-3-фенілпропил)-5-(1,2,3,4-тетразоліл)]гексильна, 5-бензил-1-(1,2,3,4-тетразоліл)метильна, 2-[5-(1-фенілетил)-1-(1,2,3,4-тетразоліл)]етильна, 3-[5-(3-фенілпропил)-1-(1,2,3,4-тетразоліл)]пропильна, 4-[5-(4-фенілбутил)-1-(1,2,3,4-тетразоліл)]бутильна, 5-[5-(5-фенілпентил)-1-(1,2,3,4-тетразоліл)]пентильна, та 6-[5-(6-фенілгексил)-1-(1,2,3,4-тетразоліл)]гексильна групи.

[0279]

Прикладами тіазоліл нижчої алкільної групи, яка може мати фенільну групу у якості замісника у тіазольному кільці, є тіазолілалкільні групи, які можуть мати 1 або 2 фенільні групи як замісники у тіазольному кільці та алкільна частина яких - це лінійна або розгалужена алкільна група, що має 1-6 атомів вуглецю, як от [(2,4 або 5-)тіазоліл]метильна, 2-[(2,4 або 5-)тіазоліл]етильна, 1-[(2,4 або 5-)тіазоліл]етильна, 3-[(2,4 або 5-)тіазоліл]пропильна, 4-[(2,4 або 5-)тіазоліл]бутильна, 5-[(2,4 або 5-)тіазоліл]пентильна, 6-[(2,4 або 5-)тіазоліл]гексильна, 1,1-диметил-2-[(2,4 або 5-)тіазоліл]етильна, 2-метил-3-[(2,4 або 5-)тіазоліл]пропильна, [2-феніл-(4 або 5-)тіазоліл]метильна, 2-[4-феніл-(2 або 5-)тіазоліл]етильна, 1-[5-феніл-(2 або 4-)тіазоліл]етильна, 3-[2-феніл-(2 або 5-)тіазоліл]пропильна, 4-(2,4-дифеніл-5-тіазоліл)бутильна, 5-(2,5-дифеніл-4-тіазоліл)пентильна, 6-(4,5-дифеніл-2-тіазоліл)гексильна, 1,1-диметил-2-[2-феніл-(4 або 5-)тіазоліл]етильна, 2-метил-3-[4-феніл-(2 або 5-)тіазоліл]пропильна, [4-феніл-(2 або 5-)тіазоліл]метильна, [5-феніл-(2 або 4-)тіазоліл]метильна, (2,4-дифеніл-5-тіазоліл)метильна, (2,5-дифеніл-4-тіазоліл)метильна, та (4,5-дифеніл-2-тіазоліл)метильна групи.

[0280]

Прикладами бензоїл нижчої алкільної групи, яка може мати, у фенільному кільці, 1-3 замісники обрані з групи, що містить нижчу алкокси групу та атом галогену, є бензоїлалкільні групи які можуть мати, у фенільному кільці, 1-3 замісники обрані з групи, що містить лінійну або розгалужену алкокси групу, що має 1-6 атомів вуглецю та атом галогену та алкільна частина яких - це лінійна або розгалужена алкільна група, що має 1-6 атомів вуглецю, як от бензоїлметильна, 2-бензоїлетильна, 1-бензоїлетильна, 3-бензоїлпропильна, 4-бензоїлбутильна, 5-бензоїлпентильна, 6-бензоїлгексильна, 1,1-диметил-2-бензоїлетильна, 2-метил-3-бензоїлпропильна, 4-фторбензоїлметильна, 2-хлорбензоїлметильна, 3-хлорбензоїлметильна, 4-хлорбензоїлметильна, 2-(4-фторбензоїл)етильна, 3,4-

дибромбензоїлметильна, 3,4-дийодбензоїлметильна, 2,4-дифторбензоїлметильна, 2,5-дихлорбензоїлметильна, 2,6-дихлорбензоїлметильна, 3,4,5-трифторбензоїлметильна, 3-(4-хлорбензоїл)пропильна, 1-(2-бромбензоїл)етильна, 4-(3-фторбензоїл)бутильна, 5-(4-йодбензоїл)пентильна, 6-(4-хлорбензоїл)гексильна, 1,1-диметил-2-(3-фторбензоїл)етильна, 2-метил-3-(4-хлорбензоїл)пропильна, 2-метоксибензоїлметильна, 2-(3-метоксибензоїл)етильна, 2-(4-метоксибензоїл)етильна, 4-метоксибензоїлметильна, 1-(2-етоксибензоїл)етильна, 3-(3-етоксибензоїл)пропильна, 4-(4-етоксибензоїл)бутильна, 5-(4-ізопропоксибензоїл)пентильна, 6-(3-бутоксibenзоїл)гексильна, 1,1-диметил-2-(4-пентилоксибензоїл)етильна, 2-метил-3-(4-гексилоксибензоїл)пропильна, 3,4-диметоксибензоїлметильна, 3,4-диетоксибензоїлметильна, 2,4-диметоксибензоїлметильна, 2,5-диметоксибензоїлметильна, 2,6-диметоксибензоїлметильна, 3,4,5-триметоксибензоїлметильна, 2-хлор-4-метоксибензоїлметильна, та 3-фтор-5-етоксибензоїлметильна групи.

[0281]

Прикладами піперидиніл нижчої алкільної групи, яка може мати нижчу алкільну групу у якості замісника у піперидиновому кільці, є піперидинілалкільні групи, яка можуть мати 1-3 лінійні або розгалужені алкільні групи, що мають 1-6 атомів вуглецю як замісники у піперидиновому кільці та алкільна частина яких - це лінійна або розгалужена алкільна група, що має 1-6 атомів вуглецю, як от [(1,2, 3 або 4-)піперидиніл]метильна, 2-[(1,2,3 або 4-)піперидиніл]етильна, 1-[(1,2,3 або 4-)піперидиніл]етильна, 3-[(1,2, 3 або 4-)піперидиніл]пропильна, 4-[(1,2, 3 або 4-)піперидиніл]бутильна, 5-[(1,2, 3 або 4-)піперидиніл]пентильна, 6-[(1,2, 3 або 4-)піперидиніл]гексильна, 1,1-диметил-2-[(1,2,3 або 4-)піперидиніл]етильна, 2-метил-3-[(1,2,3 або 4-)піперидиніл]пропильна, [1-метил-(2,3 або 4-)піперидиніл]метильна, 2-[1-етил-(2,3 або 4-)піперидиніл]етильна, 1-[4-пропил-(1,2 або 3-)піперидиніл]етильна, 3-[3-ізопропил-(1,2, 4,5 або 6-)піперидиніл]пропильна, 4-[2-бутил-(1,3, 4,5 або 6-)піперидиніл]бутильна, 5-[1-ізобутил-(2,3 або 4-)піперидиніл]пентильна, 6-[1-трет-бутил-(2,3 або 4-)піперидиніл]гексильна, 1,1-диметил-2-[4-пентил-(1,2 або 3-)піперидиніл]етильна, 2-метил-3-[1-гексил-(2,3 або 4-)піперидиніл]пропильна, [1,2-диметил-(3,4,5 або 6-)піперидиніл]метильна, та [1,2,6-триметил-(3,4 або 5-)піперидиніл]метильна групи.

[0282]

Прикладами імідазолільної групи, яка може мати 1-3 фенільні групи як замісники у



імідазольному кільці, є імідазольні групи, які можуть мати 1-3 фенільні групи як замісники у імідазольному кільці, як от (1,2, 4 або 5-)імідазольна, 1-феніл-(2,4 або 5-)імідазольна, 2-феніл-(1,4 або 5-)імідазольна, 4-феніл-(1,2 або 5-)імідазольна, 5-феніл-(1,2 або 4-)імідазольна, 1,2-дифеніл-(4 або 5-)імідазольна, 2,4-дифеніл-(1 або 5-)імідазольна, 4,5-дифеніл-(1 або 2-)імідазольна, 2,5-дифеніл-(1 або 4-)імідазольна, та 2,4,5-трифеніл-1-імідазольна групи.

[0283]

Прикладами бензімідазольної групи, яка може мати 1-3 нижчі алкільні групи як замісники у бензімідазольному кільці, є бензімідазольна група, яка може мати 1-3 лінійні або розгалужені алкільні групи, що мають 1-6 атомів вуглецю як замісники у бензімідазольному кільці, як от (1,2, 4,5,6 або 7-)бензімідазольна, 1-метил-(2,4,5,6 або 7-)бензімідазольна, 2-етил-(1,4,5,6 або 7-)бензімідазольна, 4-пропил-(1,2,5,6 або 7-)бензімідазольна, 5-бутил-(1,2,4,6 або 7-)бензімідазольна, 6-пентил-(1,2,4,5 або 7-)бензімідазольна, 7-гексил-(1,2,4,5 або 6-)бензімідазольна, 1-етил-(2,4,5,6 або 7-)бензімідазольна, 1-бутил-(2,4,5,6 або 7-)бензімідазольна, 1-ізопропил-(1,2,4,5, 6 або 7-)бензімідазольна, 1,2-диметил-(4,5, 6 або 7-)бензімідазольна, 1-метил-4-етил-(2,5,6 або 7-)бензімідазольна, 1-пропил-5-метил-(2,4,6 або 7-)бензімідазольна, та 1,2,5-триметил-(2,4,5,6 або 7-)бензімідазольна групи.

[0284]

Прикладами піридил нижчої алкокси групи є піридилалкокси групи, алкільна частина яких - це лінійна або розгалужена алкільна група, що має 1-6 атомів вуглецю, як от (2,3 або 4-)піридилметокси, 2-[(2,3 або 4-)піридил]етокси, 1-[(2,3 або 4-)піридил]етокси, 3-[(2,3 або 4-)піридил]пропокси, 4-[(2,3 або 4-)піридил]бутокси, 1-1-диметил-2-[(2,3 або 4-)піридил]етокси, 5-[(2,3 або 4-)піридил]пентилокси, 6-[(2,3 або 4-)піридил]гексилокси, 1-[(2,3 або 4-)піридил]ізопропокси, та 2-метил-3-[(2,3 або 4-)піридил]пропокси групи.

[0285]

Прикладами 1,2,3,4-тетрагідрокіноліл нижчої алкільної групи, яка може мати оксо групу у якості замісника у тетрагідрокіноліновому кільці, є 1,2,3,4-тетрагідрокінолілалкільні групи, які можуть мати 1 або 2 оксо групи як замісники у тетрагідрокіноліновому кільці та алкільна частина яких - це лінійна або розгалужена алкільна група, що має 1-6 атомів вуглецю, як от (1,2,3,4,5,6,7 або 8-)1,2,3,4-тетрагідрокінолілметильна, 2-[(1,2,3,4,5,6,7 або 8-)1,2,3,4-тетрагідрокіноліл]етильна, 1-[(1,2,3,4,5,6,7 або 8-)1,2,3,4-тетрагідрокіноліл]етильна, 3-[(1,2,3,4,5,6,7 або 8-)1,2,3,4-тетрагідрокіноліл]пропильна, 4-[(1,2,3,4,5,6,7 або 8-)1,2,3,4-тетрагідрокіноліл]бутильна, 5-[(1,2,3,4,5,6,7 або 8-)1,2,3,4-тетрагідрокіноліл]пентильна, 6-[(1,2,3,4,5,6,7 або 8-)1,2,3,4-тетрагідрокіноліл]гексильна, 1,1-диметил-2-[(1,2,3,4,5,6,7 або 8-)1,2,3,4-тетрагідрокіноліл]етильна, 2-метил-3-[(1,2,3,4,5,6,7

або 8-)1,2,3,4-тетрагідрокіноліл]пропильна, [2-оксо-(1,3,4,5,6,7 або 8-)1,2,3,4-тетрагідрокіноліл]метильна, [4-оксо-(1,2,3,5,6,7 або 8-)1,2,3,4-тетрагідрокіноліл]метильна, [2,4-диоксо-(1,3,5,6,7 або 8-)1,2,3,4-тетрагідрокіноліл]метильна, 2-[2-оксо-(1,3,4,5,6,7 або 8-)1,2,3,4-тетрагідрокіноліл]етильна, 3-[4-оксо-(1,2,3,5,6,7 або 8-)1,2,3,4-тетрагідрокіноліл]пропильна, 4-[2,4-диоксо-(1,3,5,6,7 або 8-)1,2,3,4-тетрагідрокіноліл]бутильна, 5-[2-оксо-(1,3,4,5,6,7 або 8-)1,2,3,4-тетрагідрокіноліл]пентильна, та 6-[4-оксо-(1,2,3,5,6,7 або 8-)1,2,3,4-тетрагідрокіноліл]гексильна групи.

[0286]

Прикладами 1,3,4-оксадіазоліл нижчої алкільної групи, яка може мати оксо групу у якості замісника у 1,3,4-оксадіазольному кільці, є 1,3,4-оксадіазолілалкільні групи, які можуть мати оксо групу у якості замісника у 1,3,4-оксадіазольному кільці та алкільна частина яких - це лінійна або розгалужена алкільна група, що має 1-6 атомів вуглецю, як от (2 або 5-)1,3,4-оксадіазолілметильна, 2-[(2 або 5-)1,3,4-оксадіазоліл]етильна, 1-[(2 або 5-)1,3,4-оксадіазоліл]етильна, 3-[(2 або 5-)1,3,4-оксадіазоліл]пропильна, 4-[(2 або 5-)1,3,4-оксадіазоліл]бутильна, 5-[(2 або 5-)1,3,4-оксадіазоліл]пентильна, 6-[(2 або 5-)1,3,4-оксадіазоліл]гексильна, 1,1-диметил-2-[(2 або 5-)1,3,4-оксадіазоліл]етильна, 2-метил-3-[(2 або 5-)1,3,4-оксадіазоліл]пропильна, 2-оксо-[(3 або 5-)1,3,4-оксадіазоліл]метильна, 5-оксо-[(2 або 3-)1,3,4-оксадіазоліл]метильна, 2-[2-оксо-(3 або 5-)1,3,4-оксадіазоліл]етильна, 1-[5-оксо-(2 або 3-)1,3,4-оксадіазоліл]етильна, 3-[(2 або 5-)1,3,4-оксадіазоліл]пропильна, 4-[2-оксо(3 або 5-)1,3,4-оксадіазоліл]бутильна, 5-[5-оксо(2 або 3-)1,3,4-оксадіазоліл]пентильна, 6-[2-оксо(3 або 5-)1,3,4-оксадіазоліл]гексильна, 1,1-диметил-2-[5-оксо(2 або 3-)1,3,4-оксадіазоліл]етильна, та 2-метил-3-[2-оксо(3 або 5-)1,3,4-оксадіазоліл]пропильна групи.

[0287]

Прикладами тієніл нижчої алкільної групи є тієнілалкільні групи, алкільна частина яких - це лінійна або розгалужена алкільна група, що має 1-6 атомів вуглецю, як от (2 або 3-)тієнілметильна, 2-[(2 або 3-)тієніл]етильна, 1-[(2 або 3-)тієніл]етильна, 3-[(2 або 3-)тієніл]пропильна, 4-[(2 або 3-)тієніл]бутильна, 5-[(2 або 3-)тієніл]пентильна, 6-[(2 або 3-)тієніл]гексильна, 1,1-диметил-2-[(2 або 3-)тієніл]етильна, та 2-метил-3-[(2 або 3-)тієніл]пропильна групи.

[0288]

Прикладами піримідинілкарбонільної групи, яка може мати оксо групу у якості замісника у піримідиновому кільці, є піримідинілкарбонільні групи, які можуть мати 1-3 оксо групи як замісники у піримідиновому кільці, як от (2,3,4 або 6-)піримідинілкарбоніл, 2,6-диоксо-(1,3,4 або 5-)піримідинілкарбоніл, 2-оксо-(1,3,4,5 або 6-)піримідинілкарбоніл, 6-оксо-(1,2,3,4 або 5-)піримідинілкарбоніл, 4-оксо-(1,2,3,5 або 6-)піримідинілкарбоніл, 2,4-диоксо-(1,3,4 або 6-)піримідинілкарбоніл, та 2,4,6-триоксо-(1,3 або 5-)

піримідинілкарбонільні групи.

[0289]

Прикладами нижчої алкокси нижчої алкокси групи є лінійна або розгалужена алкокси групи, що має 1-6 атомів вуглецю, яка може мати лінійну або розгалужену алкокси групи, що має 1-6 атомів вуглецю у якості замісника, як от метоксиметокси, 1-етоксидетокси, 2-метоксидетокси, 2-пропоксидетокси, 3-ізопропоксидетокси, 4-бутоксидетокси, 5-пентилоксидетокси, 6-гексилоксидетокси, 1,1-диметил-2-метоксидетокси, 2-метил-3-етоксидетокси, та 3-метоксидетокси групи.

[0290]

Прикладами нижчої алкоксикарбоніл нижчої алкокси групи є алкоксикарбонілалкокси групи, дві алкокси частини яких - це лінійна або розгалужена алкокси групи, що мають 1-6 атомів вуглецю, як от метоксикарбонілметокси, етоксикарбонілметокси, 2-метоксикарбонілметокси, 2-етоксикарбонілметокси, 1-етоксикарбонілметокси, 3-метоксикарбонілметокси, 3-етоксикарбонілметокси, 4-етоксикарбонілметокси, 5-ізопропоксикарбонілметокси, 6-пропоксикарбонілметокси, 1,1-диметил-2-бутоксикарбонілметокси, 2-метил-3-трет-бутоксикарбонілметокси, 2-пентилоксикарбонілметокси, та 6-гексилоксикарбонілметокси групи.

[0291]

Прикладами карбокси нижчої алкокси групи є карбоксиалкокси групи, алкокси частина яких - це лінійна або розгалужена алкокси групи, що мають 1-6 атомів вуглецю, як от карбоксидетокси, 2-карбоксидетокси, 1-карбоксидетокси, 3-карбоксидетокси, 4-карбоксидетокси, 5-карбоксидетокси, 6-карбоксидетокси, 1,1-диметил-2-карбоксидетокси, та 2-метил-3-карбоксидетокси групи.

[0292]

Прикладами фенокси нижчої алканойльної групи є феноксиалканойльні групи, алканойльна частина яких - це лінійна або розгалужена алканойльна група, що має 2-6 атомів вуглецю, як от 2-феноксиацетильна, 3-феноксипропіонильна, 2-феноксипропіонильна, 4-феноксибутирильна, 5-феноксипентанойльна, 6-феноксигексанойльна, 2,2-диметил-2-феноксипропіонильна, та 2-метил-3-феноксипропіонильна групи.

[0293]

Прикладами 1,2,3,4-тетрагідроксикарбонільної групи, яка може мати оксо групу у якості замісника у тетрагідроксикарбонільній групі, є 1,2,3,4-тетрагідроксикарбонільні групи, які можуть мати 1 або 2 оксо групи як замісники у тетрагідроксикарбонільній групі, як от [(1,3,4,5,6,7 або 8-)-1,2,3,4-тетрагідроксикарбонільна, [2-оксо-(1,3,4,5,6,7 або 8-)-1,2,3,4-тетрагідроксикарбонільна, [4-оксо-(1,2,3,5,6,7 або 8-)-1,2,3,4-тетрагідроксикарбонільна, та [2,4-диоксо-(1,3,5,6,7 або 8-)-1,2,3,4-тетрагідроксикарбонільна групи.

[0294]

Прикладами 1,2,3,4-тетрагідроксикарбонільної

групи, яка може мати оксо групу у якості замісника у тетрагідроксикарбонільній групі, є 1,2,3,4-тетрагідроксикарбонільні групи, які можуть мати 1 або 2 оксо групи як замісники у тетрагідроксикарбонільній групі, як от (1,2,3,4,5,6,7 або 8-)-1,2,3,4-тетрагідроксикарбонільна, 2-оксо-(1,3,4,5,6,7 або 8-)-1,2,3,4-тетрагідроксикарбонільна, 4-оксо-(1,2,3,5,6,7 або 8-)-1,2,3,4-тетрагідроксикарбонільна, та 2,4-диоксо-(1,3,5,6,7 або 8-)-1,2,3,4-тетрагідроксикарбонільна групи.

[0295]

Прикладами аміно групи, яка може мати нижчу алкоксикарбонільну групу у якості замісника, є аміно групи, які можуть мати алкоксикарбонільну групу, алкокси частина якої - це лінійна або розгалужена алкокси група, що має 1-6 атомів вуглецю, як от аміно, метоксикарбоніламіно, етоксикарбоніламіно, пропоксикарбоніламіно, ізопропоксикарбоніламіно, бутоксикарбоніламіно, трет-бутоксикарбоніламіно, пентилоксикарбоніламіно, та 6-гексилоксикарбоніламіно групи.

[0296]

Прикладами бензоїльної групи, яка може мати 1-3 нижчі алкокси групи як замісники у фенільному кільці, є бензоїльні групи, які можуть мати 1-3 лінійні або розгалужені алкокси групи, що мають 1-6 атомів вуглецю як замісники у фенільному кільці, як от бензоїльна, 2-метоксибензоїльна, 3-метоксибензоїльна, 4-метоксибензоїльна, 2-етоксибензоїльна, 3-етоксибензоїльна, 4-етоксибензоїльна, 4-ізопропоксибензоїльна, 3-бутоксикарбоніламіно, 4-пентилоксибензоїльна, 4-гексилоксибензоїльна, 3,4-диметоксибензоїльна, 3,4-диетоксибензоїльна, 2,4-диметоксибензоїльна, 2,5-диметоксибензоїльна, 2,6-диметоксибензоїльна, та 3,4,5-триметоксибензоїльна групи.

[0297]

Прикладами нижчої алкільної групи, яка має 1 або 2 фенілі, яка може мати, у фенільному кільці, 1-3 замісники обрані з групи, що містить нижчу алкоксикарбонільну групу, ціано групу, нітро групу, фенільну групу, атом галогену, нижчу алкільну групу, яка може мати атом галогену у якості замісника, нижчу алкокси групу, яка може мати атом галогену у якості замісника, та нижчу алкіліогрупу є, додатково до вищеописаних феніл нижчих алкільних груп, лінійна або розгалужена алкільні групи, які мають 1-6 атомів вуглецю та 1-2 фенілі, які можуть мати, у фенільному кільці, 1-3 замісники обрані з групи, що містить алкоксикарбонільну групу, алкокси частина якої - це лінійна або розгалужена алкокси група, що має 1-6 атомів вуглецю, ціано групу, нітро групу, фенільну групу, атом галогену, лінійну або розгалужену алкільну групу, що має 1-6 атомів вуглецю, яка може мати 1-3 атоми галогенів як замісники, лінійну або розгалужену алкокси групу, що має 1-6 атомів вуглецю, яка може мати 1-3 атоми галогенів як замісники, та лінійну або розгалужену алкілію групу, що має 1-6 атомів вуглецю, як от 1,1-дифенілметильна, 1,1-ди(4-фторфеніл)метильна, 1-феніл-1-(4-метоксифеніл)метильна, 3,3-дифенілпропіл, 2,5-дифторбензил, 2,4-дифторбензил, 3,4-

дифторбензильна, 3,5-дифторбензильна, 2,6-  
 дифторбензильна, 3-трифторметилбензильна, 2-  
 трифторметилбензильна, 4-  
 трифторметилбензильна, 3,4-  
 диметоксибензильна, 3,5-диметоксибензильна, 2-  
 хлорбензильна, 3-хлорбензильна, 4-  
 хлорбензильна, 2-метилбензильна, 3-  
 метилбензильна, 4-метилбензильна, 3,4-  
 диметилбензильна, 2,3-диметилбензильна, 2-  
 метоксибензильна, 3-метоксибензильна, 4-  
 ціанобензильна, 2-ціанобензильна, 3-  
 ціанобензильна, 4-метоксибензильна, 2,3-  
 дихлорбензильна, 2,4-дихлорбензильна, 2,5-  
 дихлорбензильна, 3,4-дихлорбензильна, 2,6-  
 дихлорбензильна, 4-фторбензильна, 3-  
 фторбензильна, 2-фторбензильна, 4-  
 нітробензильна, 3-нітробензильна, 2-  
 нітробензильна, 3-трифторметоксибензильна, 4-  
 трифторметоксибензильна, 2-  
 трифторметоксибензильна, 4-  
 метоксикарбонілбензильна, 3-  
 метоксикарбонілбензильна, 4-трет-  
 бутилбензильна, 4-етилбензильна, 4-  
 ізопропилбензильна, 4-метокси-3-хлорбензильна,  
 2-(4-метоксифеніл)етильна, 2-(4-  
 фторфеніл)етильна, 2-(4-хлорфеніл)етильна, 2-(3-  
 метоксифеніл)етильна, 2-(4-  
 метильнафеніл)етильна, 4-фенілбензильна, 3,3-  
 дифенілпропил, 3-метильна-4-нітробензильна, 4-  
 (4-метоксифеніл)бутильна, 2-(4-  
 метильнафеніл)етильна, 4-трет-  
 бутоксикарбонілбензильна, 3-хлор-6-  
 метоксибензильна, 4-нітро-3-метильнабензильна,  
 4-трет-бутирилбензильна, 2-(2-  
 етоксикарбонілфеніл)етильна, 1-(3-  
 пропоксикарбонілфеніл)етильна, 3-(4-  
 пентилоксикарбонілфеніл)пропильна, 4-(3-  
 гексилоксикарбонілфеніл)бутильна, 5-(3,4-  
 диметоксикарбонілфеніл)пентильна, 6-(3,4,5-  
 диетоксикарбонілфеніл)гексильна, 1,1-  
 диметильна-2-(4-бутоксикарбонілфеніл)етильна,  
 2-метильна-3-(4-метоксикарбонілфеніл)пропильна,  
 2-(2-ціанофеніл)етильна, 1-(3-ціанофеніл)етильна,  
 3-(4-ціанофеніл)пропильна, 4-(2-  
 ціанофеніл)бутильна, 5-(3-ціанофеніл)пентильна,  
 6-(4-ціанофеніл)гексильна, 1,1-диметильна-2-(2,4-  
 диціанофеніл)етильна, 2-метильна-3-(2,4,6-  
 триціанофеніл)пропильна, 2-(2-  
 нітрофеніл)етильна, 1-(3-нітрофеніл)етильна, 3-(4-  
 нітрофеніл)пропильна, 4-(2-нітрофеніл)бутильна,  
 5-(3-нітрофеніл)пентильна, 6-(4-  
 нітрофеніл)гексильна, 1,1-диметильна-2-(2,4-  
 динітрофеніл)етильна, 2-метильна-3-(2,4,6-  
 тринітрофеніл)пропильна, 2-(2-  
 фенілфеніл)етильна, 1-(3-фенілфеніл)етильна, 3-  
 (4-фенілфеніл)пропильна, 4-(2-  
 фенілфеніл)бутильна, 5-(3-фенілфеніл)пентильна,  
 6-(4-фенілфеніл)гексильна, 1,1-диметильна-2-(2,4-  
 дифенілфеніл)етильна, 2-метильна-3-(2,4,6-  
 трифенілфеніл)пропильна, 2-(2-  
 фторфеніл)етильна, 1-(3-бромфеніл)етильна, 3-(4-  
 йодфеніл)пропильна, 4-(2-бромфеніл)бутильна, 5-  
 (3-хлорфеніл)пентильна, 6-(4-  
 бромфеніл)гексильна, 1,1-диметильна-2-(2,4-  
 дихлорфеніл)етильна, 2-метильна-3-(2,4,6-

трифторфеніл)пропильна, 2-(2-  
 етилфеніл)етильна, 1-(3-пропилфеніл)етильна, 3-  
 (4-бутилфеніл)пропильна, 4-(2-  
 пентилфеніл)бутильна, 5-(3-  
 гексилфеніл)пентильна, 6-(4-  
 трифторметилфеніл)гексильна, 1,1-диметил-2-  
 (2,4-диметилфеніл)етильна, 2-метил-3-[2,4,6-  
 три(трифторметил)феніл]пропильна, 2-(2-  
 етоксифеніл)етильна, 1-(3-  
 пропоксифеніл)етильна, 3-(4-  
 бутоксифеніл)пропильна, 4-(2-  
 пентилоксифеніл)бутильна, 5-(3-  
 гексилоксифеніл)пентильна, 6-(4-  
 трифторметоксифеніл)гексильна, 1,1-диметил-2-  
 (2,4-диметоксифеніл)етильна, 2-метил-3-[2,4,6-  
 три(трифторметокси)феніл]пропильна, 2-  
 метилтіобензильна, 3-метилтіобензильна, 4-  
 метилтіобензильна, 3,4-диметилтіобензильна, 2,3-  
 диметилтіобензильна, 2-(2-етилтіофеніл)етильна,  
 2-(4-метилтіофеніл)етильна, 1-(3-  
 пропилтіофеніл)етильна, 3-(4-  
 бутилтіофеніл)пропильна, 4-(2-  
 пентилтіофеніл)бутильна, 5-(3-  
 гексилтіофеніл)пентильна, 6-(4-  
 метилтіофеніл)гексильна, 1,1-диметил-2-(2,4-  
 диметилтіофеніл)етильна, 2-метил-3-[2,4,6-  
 триметилтіофеніл]пропильна, 2-метил-4-  
 ціанобензильна, 3-етокси-4-  
 етоксикарбонілбензильна, 4-феніл-3-  
 нітробензильна, 3-фтор-4-метоксибензильна, 4-  
 трифторметил-3-ціанобензильна, та 3-  
 трифторметокси-3-фторбензильна групи.

[0298]

Прикладами фенільної групи, яка може мати, у фенільному кільці, 1-3 групи, обрані з групи, що містить нижчу алкокси групу, яка може мати атом галогену у якості замісника та нижчу алкілну групу, яка може мати атом галогену у якості замісника, є фенільні групи, які можуть мати, у фенільному кільці, 1-3 групи, обрані з групи, що містить лінійну або розгалужену алкокси групу, що має 1-6 атомів вуглецю, яка може мати 1-3 атом галогенів як замісники та лінійну або розгалужену алкілну групу, що має 1-6 атомів вуглецю та яка може мати 1-3 атом галогенів як замісники, як от фенільна, 2-метилфенільна, 3-метилфенільна, 4-метилфенільна, 2-етилфенільна, 3-етилфенільна, 4-етилфенільна, 4-ізопропилфенільна, 3-бутилфенільна, 4-пентилфенільна, 4-гексилфенільна, 3,4-диметилфенільна, 3,4-диетилфенільна, 2,4-диметилфенільна, 2,5-диметилфенільна, 2,6-диметилфенільна, 3,4,5-триметилфенільна, 2-метоксифенільна, 3-метоксифенільна, 4-метоксифенільна, 2-етоксифенільна, 3-етоксифенільна, 4-етоксифенільна, 4-ізопропоксифенільна, 3-бутоксифенільна, 4-пентилоксифенільна, 4-гексилоксифенільна, 3,4-диметоксифенільна, 3,4-диетоксифенільна, 2,4-диметоксифенільна, 2,5-диметоксифенільна, 2,6-диметоксифенільна, 3,4,5-триметоксифенільна, 2-трифторметоксифенільна, 3-трифторметоксифенільна, 4-трифторметоксифенільна, 2-(бромметокси)фенільна, 3-(2-хлоретокси)фенільна, 4-(2,3-

Прикладами тетрагідрофурил нижчої алкільної групи, яка може мати гідроксильну групу у якості замісника у нижчій алкільній групі, є тетрагідрофурилалкільні групи, які можуть мати гідроксильну групу у якості замісника у нижчій алкільній групі та алкільна частина яких - це лінійна або розгалужена алкільна група, що має 1-6 атомів вуглецю, як от [(2 або 3-)тетрагідрофурил]метильна, 2-[(2 або 3-)тетрагідрофурил]етильна, 1-[(2 або 3-)тетрагідрофурил]етильна, 3-[(2 або 3-)тетрагідрофурил]пропильна, 4-[(2 або 3-)тетрагідрофурил]бутильна, 5-[(2 або 3-)тетрагідрофурил]пентильна, 6-[(2 або 3-)тетрагідрофурил]гексильна, 1,1-диметил-2-[(2 або 3-)тетрагідрофурил]етильна, 2-метил-3-[(2 або 3-)тетрагідрофурил]пропильна, 1-гідрокси-1-[(2 або 3-)тетрагідрофурил]метильна, 2-гідрокси-2-[(2 або 3-)тетрагідрофурил]етильна, 2-гідрокси-1-[(2 або 3-)тетрагідрофурил]етильна, 3-гідрокси-3-[(2 або 3-)тетрагідрофурил]пропильна, 4-гідрокси-4-[(2 або 3-)тетрагідрофурил]бутильна, 5-гідрокси-5-[(2 або

3-)тетрагідрофурил]пентильна, 6-гідрокси-6-[(2 або 3-)тетрагідрофурил]гексильна, 2-гідрокси-1,1-диметил-2-[(2 або 3-)тетрагідрофурил]етильна, та 3-гідрокси-2-метил-3-[(2 або 3-)тетрагідрофурил]пропильна групи.

[0302]

Прикладами фенокси нижчої алкільної групи, яка може мати, у фенільному кільці, 1-3 замісники обрані з групи, що містить нижчу алкільну групу та нітро групу є, додатково до вищеописаної фенокси нижчих алкільних груп, феноксиалкільні групи, які можуть мати, у фенільному кільці, 1-3 замісники, обрані з групи, що містить лінійну або розгалужену алкільну групу, що має 1-6 атомів вуглецю та нітро групу та алкільна частина якої - це лінійна або розгалужена алкільна група, що має 1-6 атомів вуглецю, як от 2-метилфеноксиметильна, 3-метилфеноксиметильна, 4-метилфеноксиметильна, 3,4-диметилфеноксиметильна, 2,3-диметилфеноксиметильна, 3,4,5-триметилфеноксиметильна, 2-(2-етилфенокси)етильна, 2-(3-метилфенокси)етильна, 2-(4-метилфенокси)етильна, 1-(3-пропилфенокси)етильна, 3-(4-бутилфенокси)пропильна, 4-(2-пентилфенокси)бутильна, 5-(3-гексилфенокси)пентильна, 6-(4-метилфенокси)гексильна, 1,1-диметил-2-(2,4-диметилфенокси)етильна, 2-метил-3-(2,4,6-триметилфенокси)пропильна, 2-(4-нітро-3-метилфенокси)етильна, 4-нітрофеноксиметильна, 3-нітрофеноксиметильна, 2-нітрофеноксиметильна, 2-(2-нітрофенокси)етильна, 2-(4-нітрофенокси)етильна, 1-(3-нітрофенокси)етильна, 3-(4-нітрофенокси)пропильна, 4-(2-нітрофенокси)бутильна, 5-(3-нітрофенокси)пентильна, 6-(4-нітрофенокси)гексильна, 1,1-диметил-2-(2,4-динітрофенокси)етильна, та 2-метил-3-(2,4,6-тринітрофенокси)пропильна групи.

[0303]

Прикладами феніл нижчої алканойльної групи є фенілалкоанойльні групи алканойльна частина яких - це лінійна або розгалужена алканойльна група, що має 2-6 атомів вуглецю, як от 2-фенілацетильна, 3-фенілпропіонільна, 2-фенілпропіонільна, 4-фенілбутирильна, 5-фенілпентаноїльна, 6-фенілгексаноїльна, 2,2-диметил-3-фенілпропіонільна, та 2-метил-3-фенілпропіонільна групи.

Прикладами фенільної групи, яка може мати, у фенільному кільці, 1-3 замісники обрані з групи, що містить атом галогену та нижчу алкільну групу, яка може мати атом галогену, є фенільні групи, які можуть мати, у фенільному кільці, 1-3 замісники, обрані з групи, що містить атом галогену та лінійну або розгалужену алкільну групу, що має 1-6 атомів вуглецю, яка може мати 1-3 атоми галогенів, як от фенільна, 3,4-дифторфенільна, 2-фторфенільна, 3-бромфенільна, 4-йодфенільна, 4-метилфенільна, 2-метилфенільна, 3-метилфенільна, 2-етилфенільна, 3-етилфенільна,

4-етилфенільна, 4-ізопропилфенільна, 3-бутилфенільна, 4-пентилфенільна, 4-гексилфенільна, 3,4-диметилфенільна, 3,4-диетилфенільна, 2,4-диметилфенільна, 2,5-диметилфенільна, 2,6-диметилфенільна, 3,4,5-триметилфенільна, 2-трифторметилфенільна, 3-трифторметилфенільна, 4-трифторметилфенільна, 2-(бромметил)фенільна, 3-(2-хлоретил)фенільна, 4-(2,3-дихлорпропил)фенільна, 4-(4-фторбутил)фенільна, 3-(5-хлорпентил)фенільна, 4-(5-бромгексил)фенільна, 4-(5,6-дибромгексил)фенільна, 3,4-ди(трифторметил)фенільна, 3,4-ди(4,4,4-трихлорбутил)фенільна, 2,4-ди(3-хлор-2-метилпропил)фенільна, 2,5-ди(3-хлорпропил)фенільна, 2,6-ди(2,2,2-трифторетил)фенільна, 3,4,5-три(трифторметил)фенільна, 4-(2,2,2-трихлоретил)фенільна, 2-метил-4-трифторметилфенільна, 3-етил-4-трихлорметилфенільна, 2-хлор-4-трифторметилфенільна, 3-етил-4-фторфенільна, 3-фтор-4-трихлорметилфенільна, 2-метил-3-трифторметил-4-трифторметилфенільна, 3-фторфенільна, 4-фторфенільна, 2-бромфенільна, 4-бромфенільна, 2-йодфенільна, 3-йодфенільна, 2,3-дибромфенільна, 2,4-дийодфенільна, 2,5-дифторфенільна, 2,6-дихлорфенільна, 2,4,6-трихлорфенільна, 2,4-дифторфенільна, 3,5-дифторфенільна, 2,6-дифторфенільна, 2-хлорфенільна, 3-хлорфенільна, 4-хлорфенільна, 2,3-дихлорфенільна, 2,4-дихлорфенільна, 2,5-дихлорфенільна, 3,4-дихлорфенільна, 2,6-дихлорфенільна, 3,5-дихлорфенільна, 2,4,6-трифторфенільна, та 2,4-дифторфенільна групи.

[0304]

Прикладами 5-7-членна насиченої гетероциклічної групи, утвореної взаємним зв'язуванням  $R^{20}$  та  $R^{21}$ ,  $R^{22}$  та  $R^{23}$ ,  $R^{26}$  та  $R^{27}$ ,  $R^{29}$  та  $R^{30}$  або  $R^{32}$  та  $R^{33}$  разом з атомами азоту зв'язують їх, за допомогою або без атому азоту, атому кисню або атому сірки, є пірролідинільна, піперидинільна, піперазинільна, морфоліно, тіоморфоліно, та гомопіперазинільна групи.

[0305]

Прикладами фенокси нижчої алкільної групи, яка може мати, у фенільному кільці, нижчу алкільну групу у якості замісника є, додатково до вищеописаної фенокси нижчих алкільних груп, феноксиалкільні групи, які можуть мати, у фенільному кільці, 1-3 лінійні або розгалужені алкільні групи, що мають 1-6 атомів вуглецю як замісники та алкільна частина яких - це лінійна або розгалужена алкільна група, що має 1-6 атомів вуглецю, як от 2-метилфеноксиметильна, 3-метилфеноксиметильна, 4-метилфеноксиметильна, 3,4-диметилфеноксиметильна, 2,3-диметилфеноксиметильна, 3,4,5-триметилфеноксиметильна, 2-(2-етилфенокси)етильна, 2-(4-метилфенокси)етильна, 1-(3-пропилфенокси)етильна, 3-(4-бутилфенокси)пропильна, 4-(2-

пентилфенокси)бутильна, 5-(3-гексилфенокси)пентильна, 6-(4-метилфенокси)гексильна, 1,1-диметил-2-(2,4-диметилфенокси)етильна, та 2-метил-3-(2,4,6-триметилфенокси)пропильна групи.

Сполука, представлена загальною формулою (1) або її солі, є більш переважними, де

$X_1$  представляє атом азоту або групу  $-CH=$ ,

$R^1$  представляє групу  $-Z-R^6$ ,

$Z$  представляє групу  $-N(R^8)-B-$ , групу  $-B-N(R^8)-$ , групу  $-B_0-O-$  або групу  $-N(R^{9a})-CO-N-(R^{9b})-$ ,

$R^8$  представляє атом водню, нижчу алкільну групу, що може мати нижчу алкокси групу у якості замісника, нижчу алканойльну групу, нижчу алкілсульфонільну групу або фенільну групу нижчого алкілу,

$B$  представляє групу  $-CO-$  або нижчу алкіленову групу,

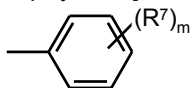
$B_0$  представляє нижчу алкіленову групу,

$R^{9a}$  представляє атом водню або нижчу алкільну групу,

$R^{9b}$  представляє атом водню або нижчу алкільну групу,

$R^6$  представляє групу

[Формула 58]



$R^7$  представляє атом галогену або нижчу алкільну групу, що може мати атом галогену у якості замісника,

$m$  представляє ціле від 1 або 2 (коли  $m$  представляє 2, два  $R^7$  можуть бути ідентичними або різними) та

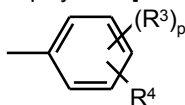
$R^2$  представляє атом водню, атом галогену, або нижчу алкільну групу,

$Y$  представляє групу  $-O-$ , або групу  $-N(R^5)-$ ,

$R^5$  представляє атом водню, або нижчу алкільну групу,

$A$  представляє групу

[Формула 59]



$p$  представляє 1 або 2,

$R^3$  представляє атом водню, нижчу алкокси групу, атом галогену, або нижчу алкільну групу, що може мати атом галогену у якості замісника,

$R^4$  представляє групу  $-(T)_1-N(R^{14})R^{15}$ ,

$T$  представляє групу  $-N(R^{17})-B_3-CO-$ , групу  $-B_4-CO-$ , або групу  $-CO-$ ,

$R^{17}$  представляє атом водню, або нижчу алкільну групу,

$B_3$  представляє нижчу алкіленову групу,

$B_4$  представляє нижчу алкіленову групу, або нижчу алкіленову групу, що може мати гідроксильну групу у якості замісника,

$1$  представляє 0 або 1,

$R^{14}$  представляє атом водню або алкільну групу, що може мати гідроксильну групу у якості замісника,

$R^{15}$  представляє (36a) піперазиніл-заміщену оксалільну групу, що може мати 1-3 групи, обрані з

групи, що містить фенільну групу нижчого алкілу (що може мати 1-3 групи, обрані з групи, що містить нижчу алкілендіоксигрупу та нижчу алкокси групу у якості замісника(ів) у фенільному кільці) та піридил нижчу алкільну групу у якості замісника(ів) у піперазиновому кільці,

$R^{14}$  та  $R^{15}$ , разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, утворюють гетероциклічну групу яка є піперидинільною або піперазинільною групою, де гетероциклічне кільце може бути заміщене групою, що обрана з групи, що містить (28) феніл-заміщену нижчу алкільну групу, що може бути заміщена групою, у фенільному кільці, обраною з групи, що містить нижчу алканойльну групу, аміно групу що може мати нижчу алканойльну групу у якості замісника, нижчу алкоксикарбонільну групу, ціано групу, нітро групу, фенільну групу, атом галогену, нижчу алкільну групу, що може мати атом галогену у якості замісника, нижчу алкокси групу, що може мати атом галогену у якості замісника, феніл нижчу алкокси групу, гідроксильну групу, та нижчу алкілендіоксигрупу (49) групу  $-(B_{12}CO)t-N(R^{20})R^{21}$ , або (84) групу  $-(O-B_{15})s-CO-N(R^{26})R^{27}$ ,

$B_{12}$  представляє нижчу алкіленову групу,

$t$  представляє 0 або 1,

$R^{20}$  та  $R^{21}$ , разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, утворюють насичену гетероциклічну групу, яка є піперидинільною або піперазинільною групою яка, у гетероциклічному кільці, може бути заміщена фенільною групою нижчого алкілу, що може мати нижчу алкілендіоксигрупу у якості замісника у фенільному кільці,

$B_{15}$  представляє нижчу алкіленову групу,

$s$  представляє 0 або 1,

$R^{26}$  та  $R^{27}$  можуть бути ідентичними або різними та кожний представляє атом водню, нижчу алкільну групу, фенільну групу нижчого алкілу, або імідазоліл нижчу алкільну групу, та  $R^{26}$  та  $R^{27}$ , разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, можуть приєднуватись один до одного, безпосередньо або за допомогою атому азоту, атому кисню, або атому сірки утворюючи 5- - 7-членне насичене гетероциклічне кільце, (де гетероциклічне кільце може бути заміщене 1-3 феніл нижчими алкільними групами, що можуть мати нижчу алкілендіоксигрупу у фенільному кільці).

Наприклад, сполука представлена загальною формулою (1) або її солі є також більш переважними, де  $X_1$  представляє атом азоту,

$R^1$  представляє групу  $-Z-R^6$ ,

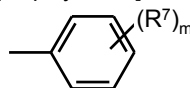
$Z$  представляє групу  $-N(R^8)-B-$ ,

$R^8$  представляє атом водню, або нижчу алкільну групу, що може мати нижчу алкокси групу у якості замісника,

$B$  представляє групу  $-CO-$ ,

$R^6$  представляє групу

[Формула 60]



$R^7$  представляє атом галогену або нижчу

алкілну групу, що може мати атом галогену у якості замісника,

$m$  представляє ціле від 1 або 2 (коли  $m$  представляє 2, два  $R^7$  можуть бути ідентичними або різними) та

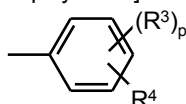
$R^2$  представляє атом водню,

$Y$  представляє групу  $-O-$ , або групу  $-N(R^5)-$ ,

$R^5$  представляє атом водню, або нижчу алкілну групу,

$A$  представляє групу

[Формула 61]



$p$  представляє 1 або 2,

$R^3$  представляє атом водню, нижчу алкокси групу, атом галогену, або нижчу алкілну групу, що може мати атом галогену у якості замісника,

$R^4$  представляє групу  $-(T)_1-N(R^{14})R^{15}$ ,

$T$  представляє групу  $-N(R^{17})-B_3-CO-$ , групу  $-B_4-CO-$ , або групу  $-CO-$ ,

$R^{17}$  представляє атом водню, або нижчу алкілну групу,

$B_3$  представляє нижчу алкіленову групу,

$B_4$  представляє нижчу алкіленову групу, що може мати гідроксильну групу у якості замісника,

$1$  представляє 0 або 1,

$R^{14}$  та  $R^{15}$ , разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, утворюють гетероциклічну групу, яка є піперидинільною або піперазинільною групою, що, у гетероциклічному кільці, може бути заміщена (28) феніл-заміщеною нижчою алкільною групою, що може бути заміщена нижчою алкілендіоксигрупою у фенільному кільці.

Іще більш переважним прикладом є сполука, представлена загальною формулою (1) або її солі, де

$X_1$  представляє атом азоту,

$R^1$  представляє групу  $-Z-R^6$ ,

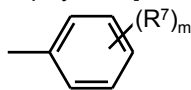
$Z$  представляє групу  $-N(R^8)-B-$ ,

$R^8$  представляє атом водню, або нижчу алкілну групу, що може мати нижчу алкокси групу у якості замісника,

$B$  представляє групу  $-CO-$ ,

$R^6$  представляє групу

[Формула 62]



$R^7$  представляє атом галогену або нижчу алкілну групу, що може мати атом галогену у якості замісника,

$m$  представляє ціле з 1 або 2 (коли  $m$  представляє 2, два  $R^7$  можуть бути ідентичними або різними) та

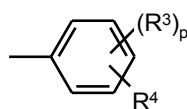
$R^2$  представляє атом водню,

$Y$  представляє групу  $-O-$ , або групу  $-N(R^5)-$ ,

$R^5$  представляє атом водню, або нижчу алкілну групу,

$A$  представляє групу

[Формула 63]



$p$  представляє 1 або 2,

$R^3$  представляє атом водню, нижчу алкокси групу, атом галогену, або нижчу алкілну групу, що може мати атом галогену у якості замісника,

$R^4$  представляє групу  $-(T)_1-N(R^{14})R^{15}$ ,

$R^{17}$  представляє атом водню, або нижчу алкілну групу,

$B_3$  представляє нижчу алкіленову групу,

$B_4$  представляє нижчу алкіленову групу, що може мати гідроксильну групу у якості замісника,

$1$  представляє 0,

$R^{14}$  та  $R^{15}$ , разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, утворюють гетероциклічну групу, яка є піперидинільною або піперазинільною групою, де, у гетероциклічному кільці, один замісник може бути присутній який обраний з групи, що містить (49) групу  $-(B_{12}CO)t-N(R^{20})R^{21}$ , та (84) групу  $-(O-B_{15})s-CO-N(R^{26})R^{27}$ ,

$B_{12}$  представляє нижчу алкіленову групу,

$t$  представляє 0 або 1,

$R^{20}$  та  $R^{21}$ , разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, утворюють насичену гетероциклічну групу, яка є піперазинова або піперидинова

де, у гетероциклічному кільці, один замісник може бути присутній, який є фенільна група нижчого алкілу, що може мати нижчу алкілендіоксигрупу у якості замісника у фенільному кільці,

$B_{15}$  представляє нижчу алкіленову групу,

$s$  представляє 0 або 1,

$R^{26}$  та  $R^{27}$ , разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, зв'язують один з іншим, безпосередньо або за допомогою атому кисню або атому азоту, утворюючи 6-членне насичене гетероциклічне кільце (де гетероциклічна кільце може бути заміщене 1-3 феніл нижчими алкільними групами, що можуть мати нижчу алкілендіоксигрупу у якості замісника у фенільному кільці).

[0306]

Ароматична сполука (1) або її солі що містяться у інгібіторі активації STAT3/5 за даним винаходом включає в себе стереоізомер, оптичний ізомер та сольват (гідрат, етанолат, тощо).

[0307]

Серед ароматичних сполук (1), сполука, що має основну групу, може легко реагувати зі звичайною фармакологічно прийнятною кислотою, утворюючи сіль. Прикладами такої кислоти є мінеральні кислоти, як от соляна кислота, бромисто-воднева кислота, азотна кислота, сірчана кислота, та фосфорна кислота, та органічні кислоти, як от метансульфонова кислота, р-толуолсульфонова кислота, оцтова кислота, лимонна кислота, винна кислота, малеїнова кислота, фумарова кислота, маленова кислота, та молочна кислота.

[0308]

Серед ароматичних сполук (1), сполука, що має кислотну групу, може легко реагувати зі

звичайною фармакологічно прийнятною основною сполукою, утворюючи сіль. Прикладами такої солі є сіль натрію, сіль калію, та сіль кальцію.

[0309]

Ароматична сполука (1) або її солі можуть бути одержані таким же шляхом, як у WO2006/014012.

[0310]

Далі буде описана лікарська композиція, що містить ароматичну сполуку (1) або її солі у якості діючого інгредієнту.

[0311]

Лікарську композицію одержують шляхом надання ароматичній сполуці (1) або її солі форми фармацевтичного препарату, та більш точно, одержують з використанням розчинника або наповнювача, як от наповнювач, експандера, зв'язуючої речовини, зволожувача, дезінтегранта, поверхнево-активної речовини, або мастила.

[0312]

Форма такої лікарської композиції може бути обрана з-поміж різних форм в залежності від терапевтичної цілі, та звичайні форми являють собою таблетки, пілюлі, порошки, рідини, суспензії, емульсії, гранули, капсули, супозиторії, та ін'єкції (рідини, суспензії).

[0313]

Носій, застосований при формуванні таблетки, може бути обраний з-поміж широкого ряду звичайних носіїв. Прикладами носія є наповнювачі, як от лактоза, сахароза, хлорид натрію, глюкоза, сечовина, крохмаль, карбонат кальцію, каолін, та кристалічна целюлоза, в'язучі як от вода, етанол, пропанол, простий сироп, розчин глюкози, розчин крохмалю, розчин желатину, карбоксиметилцелюлоза, шелак, метилцелюлоза, фосфат калію, та полівінілпірролідон, дезінтегранти, як от сушений крохмаль, аргінат натрію, порошок агару, порошок ламінарану, гідрокарбонат натрію, карбонат кальцію, складний ефір жирної кислоти поліоксиетилен сорбітану, лаурил сульфат натрію, моногліцерид стеаринової кислоти, крохмаль, та лактоза, анти-дезінтегранти, як от сахароза, стеарин, масло какао, та гідрогенована олія, підсилювачі поглинання, як от основа четвертинного амонію та лаурил сульфат натрію, зволожуючі засоби, як от гліцерин та крохмаль, адсорбенти, як от крохмаль, лактоза, каолін, бентоніт, та колоїдний силікат, та мастила, як от очищений тальк, стеарат, порошок борної кислоти, та поліетилен гліколь.

[0314]

Крім того, таблетки може бути покриті звичайним шляхом, як необхідно. Прикладами покриття таблетки є покриті цукром таблетки, покриті желатином таблетки, таблетки з кишковорозчинним покриттям, таблетки з плівковим покриттям, або двох- або багатопшарові таблетки.

[0315]

Носії, що застосовані у формуванні пілюлі, можуть бути обрані з-поміж широкого ряду звичайних відомих носіїв. Прикладами носіїв є наповнювачі, як от глюкоза, лактоза, крохмаль, масло какао, гідрогенована рослинна олія, каолін, та тальк, в'язучі, як от порошок гуїмарабіку,

порошок трагаканту, желатин, та етанол, та дезінтегранти як от ламінаран та агар.

[0316]

Носії, застосовані у формуванні супозиторіїв, можуть бути обрані з-поміж широкого ряду звичайних відомих носіїв. Прикладами носіїв є поліетилен гліколь, масло какао, вищі спирти, складні ефіри вищих спиртів, желатин, та напівсинтетичні гліцерида.

[0317]

Коли рідину, емульсію та суспензію готують як препарат для ін'єкцій, їх переважно стерилізують та перевіряють на предмет ізотонічності з кров'ю. Розчинники, застосовані в утворенні цих препаратів рідини, емульсії та суспензії, можуть бути обрані з-поміж широкого ряду відомих звичайних розчинників. Прикладами розчинників є вода, етанол, пропилен гліколь, етоксильований ізостеариловий спирт, поліоксильований ізостеариловий спирт, та складний ефір жирної кислоти поліоксиетилен сорбітану. У цьому випадку, лікарські композиції можуть містити хлорид натрію, глюкозу або гліцерин у істотній кількості для приготування ізотонічних розчинів. Також можуть міститися звичайні солюбілізатори, буферні речовини, анальгетики, та тому подібні, і, у разі необхідності, барвники, консерванти, спеції, смакові добавки, підсолоджувачі і тому подібні, або інші фармацевтичні продукти.

[0318]

Хоча кількість ароматичної сполуки (1) або її солі, що міститься у лікарській композиції, не має особливих обмежень та може бути відповідно обрана з-поміж широкого ряду сполук. Переважним є вміст ароматичної сполуки (1) або її солі у кількості 1-70 мас % у лікарській композиції.

[0319]

Спосіб введення лікарської композиції згідно з даним винаходом не має особливих обмежень. Лікарська композиція може бути введена способом, визначеним в залежності від форм лікарської композиції, віку та статі пацієнта, серйозності захворювання та інших факторів. Наприклад, таблетки, пілюлі, рідини, суспензії, емульсії, гранули та капсули вводять орально. Композиції для ін'єкцій вводять окремо або змішуванням зі звичайними рідкими замісниками, як от розчин глюкози або розчин аміно кислоти, внутрішньовенно або, у разі необхідності, окремо застосовують внутрішньом'язово, інтрадермально, підшкірно або внутрішньочеревно. Супозиторії застосовують ректально.

[0320]

Дозування вищевказаної лікарської композиції відповідно залежить від застосування, статі, віку пацієнта, та серйозності захворювання, та інших умов. Звичайно, застосовують один раз або декілька разів у день по 0.001-100 мг на кг (маси тіла) у день, переважно 0.001-50 мг на кг (маси тіла) у день.

[0321]

Оскільки вище описане дозування залежить від різних умов, дозування може бути менше ніж нижча межа вищеописаного інтервалу або більше



ніж вища межа вищеописаного інтервалу.

[0322]

Ароматична сполука (1) або її солі у даному винаході мають інгібувальну дію щодо активації STAT3/5 та корисні як інгібітор активації STAT3/5.

[0323]

Ароматична сполука (1) або її солі мають інгібувальну дію щодо активації STAT3 та тому корисні як ліки для попередження або лікування аутоімунних захворювань, діабету, інфекцій, центральних захворювань, захворювань, пов'язаних з раком або псоріазу.

[0324]

Прикладами аутоімунних захворювань є аутоімунна дискразія крові (наприклад, гемолітична анемія, апластична анемія та ідіопатична тромбоцитопенія), ревматизм, системна червона вовчанка, поліхондрія, склеродермія, гранулематоз Вегенера, дерматоміозит, хронічний активний гепатит, суворі міастенія, синдром Стівенса-Джонсона, спонтанний синдром мальбасорбції, запальовальні захворювання кишківника (наприклад, виразковий коліт та Хвороба Крона), ендокринна офтальмопатія, захворювання Грейвса, саркоїдоз, множинний склероз, первинний жовчний цироз печінки, початковий напад діабету (діабет типу I), увеїт (фронтальний та задній увеїт), кератокон'юктивіт сухих очей, весняний кератокон'юктивіт, псоріатичний артрит, гломерулонефрит (з наявністю та без симптомів нефрозу, як от ідіопатичний нефрозний синдром або маломодифікована нефропатія).

[0325]

Стосовно центральних захворювань, може бути вказана Хвороба Альцгеймера.

[0326]

Стосовно захворювань, асоційованих з раком, може бути вказана кахексія.

[0327]

Стосовно інфекцій, можуть бути вказані інфекція вірусу гепатиту С (HCV) та інфекція вірусу герпесу асоційованого із саркомою Капоші (KSHV).

Крім того, сполука за даним винаходом має інгібувальну дію щодо активації STAT5 та є корисною як інгібітор активації STAT5, в особливості як попереджувальний або лікувальний засіб при аутоімунних захворюваннях, алергіях, запальованнях, гіперпролактинемія та подібні до вищевказаного.

[0328]

У даному винаході, ароматична сполука (1) або її солі можуть бути корисні у поєднанні з іншим інгібітором активації STAT3, інгібітором активності STAT3, імунодепресивний засіб, антизапальний, терапевтичний засіб при діабеті, терапевтичний засіб при інфекційних захворюваннях, терапевтичний засіб при центральних захворюваннях, терапевтичний засіб при захворюваннях, асоційованих з раком, терапевтичний засіб при псоріазі, антипухлинний засіб, та засіб подавлення фіброзу.

[0329]

Посилання на патенти, патентні заявки та Джерела інформації цитовані у даному винаході

включені в даний опис.

[Приклад 1]

[0330]

Ефективність тестової сполуки у кількості STAT3, активованого у ядрі клітин Нер G2 після стимуляції IL-6

1) Культура

Після того, як клітини Нер G2 промивають з PBS (-) двічі, їх промивають один раз з розчином трипсин/EDTA та відщеплюють використовуючи розчин трипсин/EDTA. Клітини центрифугують та суспендують у середовищі з додаванням антибіотиків (середовище MEM (10 % FBS + антибіотик (100 U/мл пеніцилін + 100 мкг/мл стрептоміцин)). Потім рахують кількість клітин, клітини висівають у 12-лункову пробірку з щільністю  $1.2 \times 10^5$  клітин/1мл на лунку.

Через два дні після висівання, культурне середовище замінюють на 1 мл безантибіотикового медкультурного середовища (MEM середовище(10 %FBS)).

2) Додавання тестової сполуки

Через два дні після заміни середовища, додають тестову сполуку таким чином, щоб одержати концентрацію 0, 1, 10 та 100 нМ.

Через три години після додання тестової сполуки, додають IL-6 (кодовий №KTS102S, виробник Kamakura Techno Science Inc.) при кінцевій концентрації 0 або 500 нг/мл.

Через п'ять хвилин після додання IL-6, виконують екстракцію з використанням Nuclear Extraction Kit (кодовий № 40410, виробник Active Motif Inc.)

3) Екстракція ядерних фракцій

Супернатант клітин видаляють всмоктуванням. Клітини промивають 1 мл охолодженої на кризі PBS з вмістом інгібітору фосфатази (в подальшому, інгібітор PBS/фосфатаза) та супернатант клітин знову видаляють всмоктуванням.

Клітини збирають скребком для клітин у 0.6 мл охолоджених на кризі інгібіторів PBS/фосфатаза та розділяють у охолоджені на кризі 1.5 мл мікропробірки.

Потім мікропробірки центрифугують при 4°C та співвідношенні 400 × г 5 хвилин, супернатант видаляють.

Клітини ресуспендують у 0.2 мл гіпотонічного буферу за допомогою піпетки вгору та вниз декілька разів та витримують на кризі 15 хвилин.

До цієї суспензії додають 10 мкл м'якого засобу та піддають вихруванню 10 секунд. Потім виконують центрифугування при 4°C та співвідношенні 20,400 × г 30 секунд, супернатант видаляють.

До одержаних клітин додають 50 мкл Повного буферу Лізіса. Суспензію капають з піпетки, піддають вихруванню 10 секунд та струшують на кризі 30 хвилин.

Після вихрування 30 секунд суспензію центрифугують при 4°C та співвідношенні 20,400 × г 10 хвилин.

Цей супернатант розділяють у охолоджені на кризі 1.5 мл мікропробірки та зберігають при -80°C.

4) DNA зв'язування вимірюють за допомогою

комплекту TransAM STAT3 (кодовий №. 45196, виробник Active Motif Inc.)

До кожної з лунок пробірки ELISA додають 30 мкл буферу повного зв'язування та 20 мкл зразка (екстракт з ядер).

Позитивний контроль: 10 мкл ядерного екстракту Нер G2 (2.5 мг/мл) розводять у 40 мкл повного буферу Лізіса (10 мкг/20 мкл). Розчин готують при 5,2.5,1.25,0.625 та 0.313 мкг/20 мкл шляхом послідовного середньоповільного розведення, а 20 мкл розчину додають до кожної лунки.

Пуста лунка: додають 20 мкл повного буферу Лізіса.

Після запечатування пробірки її легко струшують при кімнатній температурі протягом 1 години, потім тричі промивають з 200 мкл промивального буферу.  
[0331]

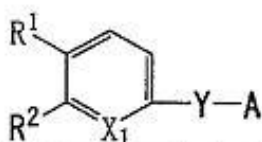
Додають 100 мкл антитілу STAT3 і запечатують пробірку. Потім, пробірку легко струшують при кімнатній температурі. Через 1 годину пробірку тричі промивають з 200 мкл промивального буферу. Після промивання додають 100 мкл HRP-зв'язаного антитіла. Пробірку запечатують, легко струшують при кімнатній температурі 1 годину, потім чотири рази промивають 200 мкл промивального буферу.

Після цього додають 100 мкл проявляючого розчину доводять до кімнатної температури, та пробірку інкубують 2-10 хвилин у захищеному від світла місці. Після підтвердження розвитку кольору, додають 100 мкл зупиняючого розчину та регулюють оптичну щільність при 450 нм та 630 нм протягом 5 хвилин.

5) Результати тестових сполук, зазначених у таблиці 1 нижче, наведені у таблиці 2.

Таблиця 1

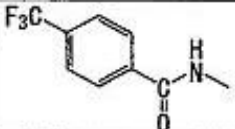
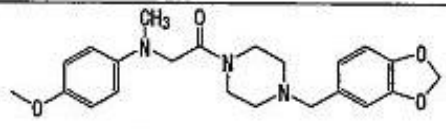
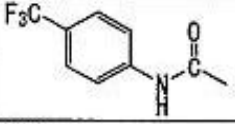
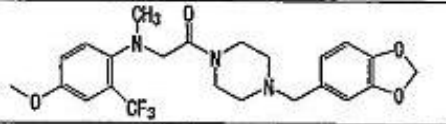
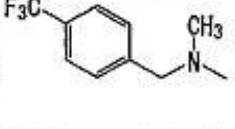
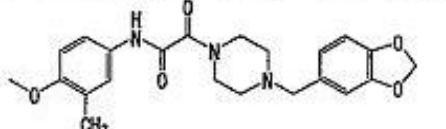
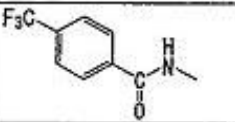
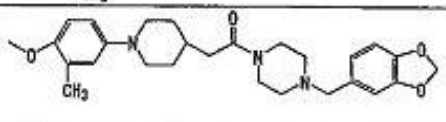
Тестові сполуки



Тестова сполука № ( )*	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X <sub>1</sub>	-Y-A
1 (Ex. 582)		H-	N	
2 (Ex. 1039)		H-	N	
3 (Ex. 322)		H-	N	
4 (Ex 1503)		H-	N	

Продовження таблиці 1

## Тестові сполуки

5 (Ex. 1049)		H <sup>-</sup>	CH	
6 (Ex. 940)		H <sup>-</sup>	N	
7 (Ex. 2228)		H <sup>-</sup>	N	
8 (Ex. 1202)		H <sup>-</sup>	N	

Таблиця 2

## Результати

Тестова сполука №.	IC <sub>50</sub> (нм)
1	< 150
2	< 150
3	< 150
4	< 150
5	< 150
6	< 150
7	< 150
8	< 150

[Приклад 2]

[0333]

Дія тестової сполуки на подавлення фосфориляції STAT3

(1) Клітини

Висівання клітин

Після того, як клітини Нер G2 промивають з PBS (-) двічі, їх промивають та видалають за допомогою трипсин/EDTA і потім видалають за допомогою трипсин/EDTA. Клітини центрифугують та суспендують у середовищі з додаванням антибіотиків (MEM середовище (10 % FBS + антибіотик (100U/мл пеніцилін + 100 мкг/мл стрептоміцин))). Після підрахування кількості клітин, їх висівають у 6-чарункову пробірку у співвідношенні  $2.4 \times 10^5$ /2мл на лунку.

Через два дні середовище з додаванням антибіотиків замінюють на середовище без додавання антибіотиків (MEM середовище (10 %FBS)).

Обробка клітин лікарським засобом

Через два дні після видалення середовища, додають тестову сполуку так, щоб одержати

концентрацію 0,1, 10 та 100 нм.

Через три години після додання тестової сполуки додають IL-6 (Кодовий №. KTS102S, виробник Kamakura Techno Science Inc.) так, щоб одержати концентрацію 100 нг/мл.

Одержання клітин

Через п'ять хвилин після додавання IL-6 клітини промивають з охолодженим PBS (-) двічі, та знімають з пробірки за допомогою скрібка. Клітини збирають у 1.5 мл мікропробірку за допомогою PBS (-). Клітини, зібрані у 1.5 мл мікропробірку центрифугують та видалають супернатант. Клітини, зібрані у 1.5 мл мікропробірку, зберігають при криогенній температурі у криогенному холодильнику до застосування.

Лізис - обробка

До заморожених клітин додають буфер RIPA. Заморожені клітини суспендують з використанням 1 мл спринцівки з 26G × 1/2 ін'єкційною голкою та розчину суспензії дають постояти у крижаній воді 30-60 хвилин. Розчин суспензії клітин центрифугують та супернатант (лізат клітин) переводять у нову пробірку. Лізат клітин, зібраний у пробірку, зберігають при криогенній температурі у криогенному холодильнику до використання.

Вимірювання концентрації протеїну

Кількість протеїну кожного лізату клітин вимірюють у відповідності з доданим протоколом BCA комплексу реагентів дослідження протеїнів.

(2) Вестерн-блоттінг аналіз

PAGE (електрофорез)

Після того, як кількість протеїну кожного лізату клітин встановилась на однаковому рівні, виконують денатурувальну обробку в умовах відновлювання. Після того, як застосовані зразки та молекулярний маркер - поліакриламід гель, виконують електрофорез.

Блоттінг

Після завершення електрофорезу, гель врівноважують з розчином для застосування у перетворенні.

Протеїни, виявлені на гелі поліакриламіді, переносять на PVDF (дифтористий полівініліден) плівку за допомогою переміщувального апарату напівсухого типу.

Блокування/промивання

Після промивання PVDF плівки, її замочують у блокуючому буфері (5 % BSA) для проведення блокування.

первинні антитіла (фосфо-STAT3 (Ser727) Антитіла або фосфо-STAT3 (Tyr705) Антитіла)

Блокована PVDF плівка реагує з первинними антитілами.

Вторинні антитіла (Анти-кролячі-IgG HRP-зв'язані Антитіла)/промивання

Після промивання, PVDF плівка реагує з HRP міченими антитілами.

Визначення розповсюдження кольору за допомогою ECL

Після промивання PVDF плівки, колір проявляється з використанням ECL Вестерн-блоттінг реагентів, а флуоресценція визначається LAS-3000.

Згідно з вищевказаним способом, вимірюється дія тестової сполуки на подавлення фосфорилзації STAT3.

[Приклад 3]

[0334]

Дія тестової сполуки на викликану пролактином активацію STAT5 у клітинах 22Rv1

1) Культура

Після того, як клітини 22Rv1, що зберігались при кріотемпературі, субкультивують принаймні двічі, їх піддають випробуванню. Після культивування до злиття, клітини промивають з D-PBS (-). Потім, їх відділяють з використанням розчину трипсин/EDTA та суспендують у середовищі (RPMI-1640 середовище (10 % FBS + антибіотики (100U/мл пеніцилін + 100 мкг/мл стрептоміцин)). Розчин суспензії клітин центрифугують при  $150 \times g$ , 5 хвилин при 20-25°C, супернатант видаляють та кульки ресуспендують у середовищі. Беруть розчин, кратний суспензії клітин, та мертві клітини мітять трипановим синім. Кількість життєздатних клітин рахують гемоцитометром. Розчин суспензії клітин готують так, щоб він містив  $2 \times 10^5$  клітин/мл, та клітини висівають у 12 лункову пробірку у співвідношенні  $2 \times 10^5$  клітин/мл на лунку. Клітини вирощують у інкубаторі CO<sub>2</sub> (5 % CO<sub>2</sub>, 37°C).

2) Додавання тестової сполуки

Через два дні після висівання додають тестову сполуку так, щоб одержати концентрацію 0 та 1000 нМ.

Через три години після додавання тестової сполуки, додають рекомбінантний людський пролактин (rhPRL, R&D systems Inc.) так, щоб одержати концентрацію 0 або 250 нг/мл.

3) Екстракція фракцій цитоплазми

Через п'ятнадцять хвилин після додавання пролактину виконують екстракцію за допомогою комплексу Nuclear Extract Kit (кодовий № 40410,

виробник Active Motif Inc.). За 15 хвилин після додавання пролактину, супернатант видаляють та негайно зупиняють стимуляцію пролактину додаванням 1 мл крижаного інгібітору PBS/фосфатази. Після аспірації 1 мл крижаного інгібітора PBS/фосфатази, додають 0.6 мл крижаного інгібітора PBS/фосфатази та центрифугують при  $200 \times g$ , 5 хвилин при 4 °C.

Після видалення супернатант додають 0.2 мл гіпотонічного буферу та суспендують. Після проведення суспендування на кризі 15 хвилин додають 10 мкл м'якого засобу. Після перемішування розчину, його центрифугують при  $14,000 \times g$ , одну хвилину при 4°C. Одержаний супернатант (фракції цитоплазми) розділяють на три крижані 96-лункові пробірки, та зберігають у морозильнику при -80°C.

4) Вимірювання активованого STAT5

Вимірювання проводять із застосуванням реагенту TransAM<sup>TM</sup> STAT family kit. Більш детально, у кожному з лунок пробірки ELISA TransAM<sup>TM</sup> STAT family kit, додають 30 мкл буферу повного зв'язування, та потім додають 20 мкл фракцій цитоплазми. Як зразок для калібровочної кривої, 12 мкл посилюючого зразка клітинних ядерних фракцій (Nb2 ядерна фракція (пролактин-стимульована, 2.5 мкг/мл)) TransAM<sup>TM</sup> STAT family kit розчиняють у 48 мкл повного буферу Лізіса (до 10 мкг/20 мкл), та далі серійно розчиняють у половині - готують розчини 5,2.5,1.25,0.625,0.313, та 0.156 мкг/20 мкл. Додають 20 мкл кожного розчину на лунку. У чисту лунку додають 20 мкл повного буферу Лізіса. Після додавання зразка, пробірку запечатують та легко струшують при кімнатній температурі одну годину. Після цього, пробірку тричі промивають з 200 мкл промивального буферу. Далі, додають 100 мкл антитіл STAT5B, запечатують та інкубують при кімнатній температурі без перемішування. Через одну годину, пробірку тричі промивають з 200 мкл промивального буферу. Додають 100 мкл пероксидази із хрому (HRP)-зв'язаних антитіл, запечатують та інкубують при кімнатній температурі без перемішування. Через одну годину, пробірку чотири рази промивають 200 мкл промивального буферу та додають 100 мкл проявляючого розчину. Пробірку інкубують 2-10 хвилин у захищеному від сонця місці. Після підтвердження розвитку кольору додають 100 мкл зупиняючого розчину. Одразу ж після цього, визначають поглинання при 450 нм (вимірювання довжини хвилі) та 630 нм (посилальна довжина хвилі) з використанням тарільчатого апарату.

Кількість фосфорилуючих димерів STAT5B оцінюють, базуючись на калібраційній кривій. Далі, вираховують співвідношення (T/C %) кількості фосфорилуючих димерів STAT5B у присутності кожного з лікарських засобів відносно того, що у відсутності лікарських засобів. Результати тестових сполук, наведених у Таблиці 1, показані у Таблиці 3.

[0335]

Таблиця 3

Тестова сполука №		T/C %
Об'єкт (DMSO)	0	100
1	1000 нм	<30
2	1000 нм	<30
3	1000 нм	<30
4	1000 нм	<30
5	1000 нм	<30
6	1000 нм	<30
7	1000 нм	<30
8	1000 нм	<30

[0336]

[Приклад 4]

Дія тестової сполуки на модель коліту викликаного декстраном сульфату натрію (DSS)

1. Викликання коліту завдяки DSS

Самиць мишей C57BL/6J Jms Slc попередньо підрощують протягом тижня, потім мишей розбивають на групи відповідно до ваги тіла (BW) миші на день групування та відповідно з багаточисловою випадковою вибіркою.

DSS (Lot No, 4556J, MP Biomedicals) розчиняють у дистильованій воді Otsuka і готують 4 % розчин DSS. Мишам дають пити 4 % розчин DSS без обмежень протягом 7 днів від наступного дня (день 2) після початку введення для викликання коліту.

2. Введення тестової сполуки та розчинника

Базуючись на вазі тіла перед введенням розчину DSS (день 1) та останній вазі тіла після введення розчину DSS, розчин вводять орально кожний раз по 10 мл/кг один раз на день.

Доза тестової сполуки становить 300 мг/кг.

Розчин введення готують суспендуванням тестової сполуки у 5 % розчину гуміарабіку так, щоб вміст тестової сполуки був у концентрації 30 мг/мл.

3. Розтин

Розтин виконують на 8 день.

4. Збирання крові

Кров збирають із задньої брюшинної порожнистої вени під анестезією диетил етером, потім її негайно переносять у BD Microtainer®

(Nippon Becton, Dickinson and Company), змішують перекодуванням у Micro-Tina та дають відстоятися на кризі. Micro-Tina центрифугують із застосуванням охолоджувальної центрифуги (HITACHI CF9RX, T3S51rotor) при 4°C та 2,150 × г протягом 20 хвилин для одержання плазми гепарину. Розподілену плазму зберігають при криогенній температурі у морозильнику (-80°C) до її застосування у вимірюваннях.

5. Збір органів

Після розрізу задньої брюшинної vena cava при анестезії з диетилом мишу вбивають витіканням крові, селезінку видаляють. Вагу селезінки електронними силовими вагами. Товсту кишку негайно видаляють для вимірювання довжини кишківника та оцінки скорочення кишківника.

6. Пункти вимірювання

Вага тіла

Вагу тіла вимірюють у 1 день (день групування), 3, 5, 7 та 8 (день розтину) електронними силовими вагами.

Базуючись на масі тіла у 1 день (день групування) та 8 день (день розтину), розраховують зміну ваги тіла.

Вага селезінки

Вагу мокрої селезінки вимірюють електронними силовими вагами.

Додатково, із результатів вимірювання ваги селезінки, вираховують співвідношення (T/C %) ваги селезінки відповідно до середньої ваги селезінки контрольної групи та коефіцієнт інгібування приросту ваги селезінки (IR %).

Довжина кишківника

Довжину товстого кишківника вимірюють вагами.

Додатково, із результатів вимірювання довжини кишківника, вираховують співвідношення (T/C%) довжини кишківника відносно до середньої довжини кишківника контрольної групи та коефіцієнт інгібування скорочення кишківника (IR%).

Результати тестової сполуки наведені у Таблиці 4.

Таблиця 4

Тестова сполука №	Коефіцієнт інгібування приросту ваги селезінки IR (%)
9 (Приклад 305 у WO2006/014012)	>40
10 (Приклад 1105 у WO2006/014012)	>40
11 (Приклад 1503 у WO2006/014012)	>40