



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ,
ПАТЕНТАМ И ТОВАРНЫМ ЗНАКАМ

(12) **ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ**

(21), (22) Заявка: 2006138603/04, 07.04.2005

(30) Конвенционный приоритет:
07.04.2004 US 60/560,410

(43) Дата публикации заявки: 20.05.2008 Бюл. № 14

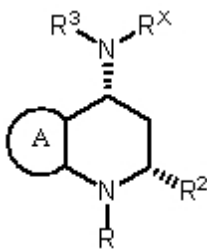
(85) Дата перевода заявки РСТ на национальную фазу:
07.11.2006(86) Заявка РСТ:
US 2005/011643 (07.04.2005)(87) Публикация РСТ:
WO 2005/100321 (27.10.2005)

Адрес для переписки:
129010, Москва, ул. Б.Спасская, 25, стр.3,
ООО "Юридическая фирма Городисский и
Партнеры", пат.пов. Г.Б. Егоровой, рег.№ 513

(71) Заявитель(и):
МИЛЛЕННИУМ ФАРМАСЬЮТИКАЛЗ, ИНК. (US)(72) Автор(ы):
ГХОШ Шомир (US),
ЭЛДЕР Эми М. (US),
КАРСОН Кеннет Г. (US),
СПРОТТ Кевин Т. (US),
ХАРРИСОН Син Дж. (US),
ХИКС Фредерик А. (US),
РЕНУ Кристелль С. (US),
РЕЙНОЛДС Доминик (US)(54) **АНТАГОНИСТЫ РЕЦЕПТОРА PGD2 ДЛЯ ЛЕЧЕНИЯ ВОСПАЛИТЕЛЬНЫХ ЗАБОЛЕВАНИЙ**

(57) Формула изобретения

1. Соединение формулы I-A



I-A

или его фармацевтически приемлемая соль,

где кольцо А является необязательно замещенным моноциклическим ароматическим;

R представляет собой $-X_1-R^1$; R^X представляет собой $-X_2-R^4$; X_1 и X_2 , каждый, независимо, представляют собой $-S(O)_2-$, $-C(O)-$ или $-C(O)NH-$; R^1 представляет собой

А) ароматическую группу или гетероароматическую группу, имеющую 5-6 атомов кольца, конденсированную с моноциклическим неароматическим гетероциклическим кольцом или моноциклическим ароматическим или гетероароматическим кольцом, где неароматическое гетероциклическое кольцо, ароматическое кольцо или гетероароматическое кольцо необязательно замещены; или

В) ароматическую группу или гетероароматическую группу, имеющую 5-6 атомов кольца,

замещенную i) $T^1-V-T-R^Y$; ii) $T^1-V-T-M-R^Y$ или iii) $V-R^9$, где R^9 представляет собой необязательно замещенную неароматическую карбоциклическую или гетероциклическую группу;

и где ароматическая или гетероароматическая группа, имеющая 5-6 атомов кольца, необязательно дополнительно замещена 1-2 независимо выбранными группами, представленными R^Z ;

каждый R^Z независимо выбран из галогена, галогеналкила, R^0 , $-OR^0$, $-O(\text{галогеналкил})$, $-SR^0$, $-NO_2$, $-CN$, $-N(R^1)_2$, $-NR^1CO_2R^0$, $-NR^1C(O)R^0$, $-NR^1NR^1C(O)R^0$, $-N(R^1)C(O)N(R^1)_2$, $-NR^1NR^1C(O)N(R^1)_2$, $-NR^1NR^1CO_2R^0$, $-C(O)C(O)R^0$, $-C(O)CH_2C(O)R^0$, $-CO_2R^0$, $-C(O)R^0$, $-C(O)N(R^0)_2$, $-OC(O)R^0$, $-OC(O)N(R^0)_2$, $-S(O)_2R^0$, $-SO_2N(R^1)_2$, $-S(O)R^0$, $-NR^1SO_2N(R^1)_2$, $-NR^1SO_2R^0$, $-C(=S)N(R^1)_2$ и $-C(=NH)N(R^1)_2$;

каждый R^1 независимо представляет собой водород, алкил, $-C(O)OR^0$, $S(O)_2R^0$ или $-C(O)R^0$;

каждый R^0 независимо представляет собой водород или алкильную группу, неароматическую гетероциклическую группу или ароматическую группу и алкил, неароматическая гетероциклическая группа и ароматическая группа, представленные R^0 , необязательно замещены одной или несколькими независимо выбранными группами, представленными $R^\#$;

$R^\#$ представляет собой R^+ , OR^+ , $-O(\text{галогеналкил})$, $-SR^+$, $-NO_2$, $-CN$, $-N(R^+)_2$, $-NHCO_2R^+$, $-NHC(O)R^+$, $-NHNHC(O)R^+$, $-NHC(O)N(R^+)_2$, $-NHNHC(O)N(R^+)_2$, $-NHNHCO_2R^+$, $-C(O)C(O)R^+$, $-C(O)CH_2C(O)R^+$, $-CO_2R^+$, $-C(O)R^+$, $-C(O)N(R^+)_2$, $-OC(O)R^+$, $-OC(O)N(R^+)_2$, $-S(O)_2R^+$, $-SO_2N(R^+)_2$, $-S(O)R^+$, $-NHSO_2N(R^+)_2$, $-NHSO_2R^+$, $-C(=S)N(R^+)_2$ или $-C(=NH)N(R^+)_2$;

R^+ представляет собой $-H$, C_1-C_3 алкильную группу, моноциклическую гетероарильную группу, неароматическую гетероциклическую группу или фенильную группу, необязательно замещенные алкилом, галогеналкилом, алкокси, галогеналкокси, галогеном, $-CN$, $-NO_2$, амином, алкиламином или диалкиламином; или $-N(R^+)_2$ представляет собой неароматическую гетероциклическую группу, при условии, что неароматические гетероциклические группы, представленные R^+ и $-N(R^+)_2$, которые содержат вторичный кольцевой амин, необязательно ацилированы или алкилированы;

V представляет собой ковалентную связь, $-O-$, $-C(O)-$, $-N(R^1)-$, $-S-$, $-S(O)-$, $-C(O)NR^5-$, $-NR^5C(O)-$, $-S(O)_2NR^5-$, $-NR^5S(O)_2-$ или $-S(O)_2-$;

T представляет собой C_{1-10} прямую алкиленовую цепь;

T^1 представляет собой ковалентную связь или C_{1-10} прямую алкиленовую цепь, где T и T^1 вместе содержат не более 10 атомов углерода, и где T и T^1 необязательно и независимо замещены на любом одном или нескольких способных к замещению атомах углерода галогеном, алкилом, гем-диалкилом, гем-дигалогеном, галогеналкилом, алкокси, галогеналкокси, спироциклоалкилом, необязательно M -замещенной азотсодержащей спиронеароматической гетероциклической группой, O -содержащей спиронеароматической гетероциклической группой, амином, алкиламином, диалкиламином, алкокси или гидроксиллом;

M представляет собой необязательно замещенную группу, выбранную из моноциклической ароматической, гетероароматической, моноциклической неароматической карбоциклической или гетероциклической группы;

R^Y представляет собой $-C(O)OR^5$, $-C(O)R^5$, $-OC(O)R^5$, $-C(O)N(R^5)_2$, $-NR^5C(O)R^5$, $-NR^5C(O)OR^5$, $-S(O)_2R^5$, $-S(O)_2COR^5$, $-S(O)_2N(R^5)_2$, $-NR^5S(O)_2R^5$, $-NR^5S(O)_2R^5$, $S(O)_2OR^5$, $-S(O)OR^5$, $-S(O)R^5$, $-SR^5$, $-C(O)NR^5S(O)_2R^5$, $-CN$, $-NR^5C(O)N(R^5)_2$, $-OC(O)N(R^5)_2$, $-N(R^5)_2$, $-OR^5$, необязательно замещенную неароматическую гетероциклическую группу или необязательно замещенную гетероарильную группу;

при условии, что T представляет собой C_{2-10} , когда V представляет собой ковалентную связь, и T представляет собой C_{2-10} , когда V представляет собой $-O-$, $-S-$ или $-N(R^1)-$, и R^Y представляет собой $-CN$, $-OH$, $-SH$, $-N(R^5)_2$;

каждый R⁵ независимо представляет собой -H, алкил, галогеналкил, гидроксипропионил, карбоксипропионил, -C(O)OCH₂C₆H₅, S(O)₂CH₃, -C(O)OH, -C(O)OMe, -C(O)OEt, C(O)NH₂, бензил, пирролидинил, морфолинил, или -N(R⁵)₂ представляет собой азотсодержащую неароматическую гетероциклическую группу;

R² представляет собой C₁₋₃ алкил;

R³ представляет собой необязательно замещенную моноциклическую или бициклическую группу, выбранную из ароматической, гетероароматической, неароматической карбоциклической или неароматической гетероциклической группы; и

R⁴ представляет собой необязательно замещенный C₁₋₆алкил, C₁₋₄гидроксипропионил или необязательно замещенный C₃₋₆циклоалкил,

при условии, что соединение формулы I-A не представляет собой:

(±)-*цис*-N-[1-(1H-индол-2-карбонил)-2-метил-1,2,3,4-тетрагидрохинолин-4-ил]-N-фенилпропионамид; (±)-*цис*-N-[1-(бензофуран-2-карбонил)-2-метил-1,2,3,4-тетрагидрохинолин-4-ил]-N-фенилпропионамид; этиловый эфир (±)-*цис*-{4-[2-метил-4-(фенилпропиониламино)-3,4-дигидро-2H-хинолин-1-карбонил]-феноксид}уксусной кислоты; (±)-*цис*-{4-[2-метил-4-(фенилпропиониламино)-3,4-дигидро-2H-хинолин-1-карбонил]-феноксид}уксусную кислоту; (±)-*цис*-N-[2-метил-1-[4-(2-морфолин-4-ил-этоксид)бензоил]-1,2,3,4-тетрагидрохинолин-4-ил]-N-фенилпропионамид; (±)-*цис*-N-[1-(4-карбамоилметоксибензоил)-2-метил-1,2,3,4-тетрагидрохинолин-4-ил]-N-фенилпропионамид; (±)-*цис*-N-[1-[4-(2-гидрокси-2-метилпропокси)бензоил]-2-метил-1,2,3,4-тетрагидрохинолин-4-ил]-N-фенилпропионамид; (±)-*цис*-N-[1-(4-диметилкарбамоилметоксибензоил)-2-метил-1,2,3,4-тетрагидрохинолин-4-ил]-N-фенилпропионамид; (±)-*цис*-N-[1-(бензо[b]тиофен-3-карбонил)-2-метил-1,2,3,4-тетрагидрохинолин-4-ил]-N-фенилацетамид; (±)-*цис*-N-[1-(бензо[b]тиофен-2-карбонил)-2-метил-1,2,3,4-тетрагидрохинолин-4-ил]-N-фенилпропионамид; (±)-*цис*-{4-[4-(ацетилфениламино)-2-метил-3,4-дигидро-2H-хинолин-1-карбонил]фениламино}уксусную кислоту; (±)-*цис*-N-[1-(1-изопропил-1H-бензотриазол-5-карбонил)-2-метил-1,2,3,4-тетрагидрохинолин-4-ил]-N-фенилпропионамид; этиловый эфир (±)-*цис*-4-[4-[2-метил-4-(фенилпропиониламино)-3,4-дигидро-2H-хинолин-1-карбонил]фенил]пиперидин-1-карбоновой кислоты; (±)-*цис*-N-[2-метил-1-(4-пиперидин-4-ил-бензоил)-1,2,3,4-тетрагидрохинолин-4-ил]-N-фенилпропионамид; (±)-*цис*-N-[1-[4-(1-ацетилпиперидин-4-ил)бензоил]-2-метил-1,2,3,4-тетрагидрохинолин-4-ил]-N-фенилпропионамид; (±)-*цис*-N-[1-[4-(1-этилпиперидин-4-ил)бензоил]-2-метил-1,2,3,4-тетрагидрохинолин-4-ил]-N-фенилпропионамид; (±)-*цис*-N-[2-метил-1-[4-(4-метилпиперазин-1-ил)бензоил]-1,2,3,4-тетрагидрохинолин-4-ил]-N-фенилпропионамид; (±)-*цис*-N-[2-метил-1-(4-метил-3,4-дигидро-2H-бензо[1,4]оксазин-7-карбонил)-1,2,3,4-тетрагидрохинолин-4-ил]-N-фенилпропионамид; (±)-*цис*-N-[2-Метил-1-(4-морфолин-4-ил-бензоил)-1,2,3,4-тетрагидрохинолин-4-ил]-N-фенилпропионамид; (±)-*цис*-N-[2-метил-1-(4-пирролидин-1-ил-бензоил)-1,2,3,4-тетрагидрохинолин-4-ил]-N-фенилпропионамид; метиловый эфир (±)-*цис*-2-[4-[4-(ацетилфениламино)-2-метил-3,4-дигидро-2H-хинолин-1-карбонил]фениламино]пропионовой кислоты; (±)-*цис*-2-[4-[4-(ацетилфениламино)-2-метил-3,4-дигидро-2H-хинолин-1-карбонил]-фениламино]пропионамид; (±)-*цис*-N-[1-(2,3-дигидробензо[1,4]диоксин-6-карбонил)-2-метил-1,2,3,4-тетрагидрохинолин-4-ил]-N-фенилпропионамид; (±)-*цис*-N-[1-(бензо[с]изоксазол-3-карбонил)-2-метил-1,2,3,4-тетрагидрохинолин-4-ил]-N-фенилпропионамид; этиловый эфир (±)-*цис*-4-(4-[4-[(4-хлорфенил)пропиониламино]-2-метил-3,4-дигидро-2H-хинолин-1-карбонил]феноксид)бутановой кислоты; (±)-*цис*-4-(4-[4-[(4-хлорфенил)пропиониламино]-2-метил-3,4-дигидро-2H-хинолин-1-карбонил]феноксид)бутановую кислоту; (±)-*цис*-N-(4-хлорфенил)-N-[2-метил-1-[4-(1H-тетразол-5-илметокси)бензоил]-1,2,3,4-тетрагидрохинолин-4-ил]-пропионамид; (±)-*цис*-N-(4-хлорфенил)-N-[1-[4-(3-гидрокси-2,2-диметилпропокси)бензоил]-2-метил-1,2,3,4-тетрагидрохинолин-4-ил]ацетамид; метиловый эфир (±)-*цис*-3-(4-[4-[ацетил-(4-хлорфенил)амино]-2-метил-3,4-дигидро-2H-хинолин-1-карбонил]феноксид)-2,2-

диметилпропионовой кислоты; (\pm)-*цис*-N-(4-хлорфенил)-N-[1-(4-циклопентилоксибензоил)-2-метил-1,2,3,4-тетрагидрохиолин-4-ил]ацетамид; (\pm)-*цис*-N-{1-[4-(4-ацетилпиперазин-1-ил)бензоил]-2-метил-1,2,3,4-тетрагидрохиолин-4-ил}-N-(4-хлорфенил)ацетамид; (2*S*,4*R*)-N-(4-хлорфенил)-N-[2-метил-1-(4-морфолин-4-ил-бензоил)-1,2,3,4-тетрагидрохиолин-4-ил]ацетамид; (2*S*,4*R*)-4-(4-{4-[ацетил-(4-хлорфенил)амино]-2-метил-3,4-дигидро-2Н-хиолин-1-карбонил}-фенокси)бутановую кислоту; (2*S*,4*R*)-N-(4-хлорфенил)-N-[2-метил-1-(6-морфолин-4-ил-пиридин-3-карбонил)-1,2,3,4-тетрагидрохиолин-4-ил]ацетамид; этиловый эфир (2*S*,4*R*)-4-(4-{4-[ацетил-(4-хлорфенил)амино]-2-метил-3,4-дигидро-2Н-хиолин-1-карбонил}фенокси)пиперидин-1-карбоновой кислоты; (2*S*,4*R*)-N-(4-хлорфенил)-N-{2-метил-1-[4-(2-морфолин-4-ил-этокси)бензоил]-1,2,3,4-тетрагидрохиолин-4-ил}ацетамид; (2*S*,4*R*)-4-(4-{4-[ацетил-(4-хлорфенил)амино]-2-метил-3,4-дигидро-2Н-хиолин-1-карбонил}фенокси)уксусную кислоту; (2*S*,4*R*)-N-(4-хлорфенил)-N-{2-метил-1-[4-(1Н-тетразол-5-илметокси)бензоил]-1,2,3,4-тетрагидрохиолин-4-ил}ацетамид; (2*S*,4*R*)-N-{1-[4-(1-ацетилпиперидин-4-илокси)бензоил]-2-метил-1,2,3,4-тетрагидрохиолин-4-ил}-N-(4-хлорфенил)ацетамид; (2*S*,4*R*)-N-(4-хлорфенил)-N-{2-метил-1-[4-(пиридин-4-илметокси)бензоил]-1,2,3,4-тетрагидрохиолин-4-ил}ацетамид; (2*S*,4*R*)-4-(3-{4-[ацетил-(4-хлорфенил)амино]-2-метил-3,4-дигидро-2Н-хиолин-1-карбонил}фенокси)бутановую кислоту; этиловый эфир (2*S*,4*R*)-4-(4-{4-[ацетил-(4-хлорфенил)амино]-2-метил-3,4-дигидро-2Н-хиолин-1-карбонил}-фенил)пиперидин-1-карбоновой кислоты; (2*S*,4*R*)-N-(4-хлорфенил)-N-[2-метил-1-(4-пирролидин-1-илбензоил)-1,2,3,4-тетрагидрохиолин-4-ил]ацетамид; (2*S*,4*R*)-N-(4-хлорфенил)-N-[1-(1-изопропил-1Н-бензотриазол-5-карбонил)-2-метил-1,2,3,4-тетрагидрохиолин-4-ил]ацетамид; (2*S*,4*R*)-3-(4-{4-[ацетил-(4-хлорфенил)амино]-2-метил-3,4-дигидро-2Н-хиолин-1-карбонил}-фенил)пропионовую кислоту; (2*S*,4*R*)-3-(4-{4-[ацетил-(4-хлорфенил)амино]-2-метил-3,4-дигидро-2Н-хиолин-1-карбонил}-фенил)акриловую кислоту; N-{(2*S*,4*R*)-1-[4-(1-ацетилпиперидин-4-ил)бензоил]-2-метил-1,2,3,4-тетрагидрохиолин-4-ил}-N-фенилпропанамид; N-{(2*R*,4*S*)-1-[4-(1-ацетилпиперидин-4-ил)бензоил]-2-метил-1,2,3,4-тетрагидрохиолин-4-ил}-N-фенилпропанамид; N-[(2*S*,4*R*)-2-метил-1-(4-морфолин-4-илбензоил)-1,2,3,4-тетрагидрохиолин-4-ил]-N-фенилпропанамид; N-[(2*R*,4*S*)-2-метил-1-(4-морфолин-4-илбензоил)-1,2,3,4-тетрагидрохиолин-4-ил]-N-фенилпропанамид; N-[(2*S*,4*R*)-1-[4-(1-ацетилпиперидин-4-ил)бензоил]-2-метил-1,2,3,4-тетрагидрохиолин-4-ил]-N-фенилпропанамид; N-[(2*R*,4*S*)-1-[4-(1-ацетилпиперидин-4-ил)бензоил]-2-метил-1,2,3,4-тетрагидрохиолин-4-ил]-N-фенилпропанамид; N-[(2*S*,4*R*)-1-[4-(1-ацетилпиперидин-4-ил)бензоил]-2-метил-1,2,3,4-тетрагидрохиолин-4-ил]-N-(4-хлорфенил)ацетамид; 4-[[[(2*S*,4*R*)-4-[ацетил(4-хлорфенил)амино]-2-метил-3,4-дигидрохиолин-1(2Н)-ил]карбонил}фенокси)бутановую кислоту; N-[(2*S*,4*R*)-1-[4-(2-амино-2-оксоэтокси)бензоил]-2-метил-1,2,3,4-тетрагидрохиолин-4-ил]-N-(4-хлорфенил)ацетамид; этил 4-(4-[[[(2*S*,4*R*)-4-[ацетил(4-хлорфенил)амино]-2-метил-3,4-дигидрохиолин-1(2Н)-ил]карбонил}фенил]-3,6-дигидропиридин-1(2Н)карбоксилат; N-[(2*S*,4*R*)-1-(1,3-бензодиоксол-5-илкарбонил)-2-метил-1,2,3,4-тетрагидрохиолин-4-ил]-N-фенилацетамид; N-[(2*S*,4*R*)-2-метил-1-[(3-метил-1-бензофуран-2-ил)карбонил]-1,2,3,4-тетрагидрохиолин-4-ил]-N-фенилацетамид; 4-(4-[[[(2*S*,4*R*)-4-[ацетил(4-хлорфенил)амино]-2-метил-3,4-дигидрохиолин-1(2Н)-ил]карбонил}фенокси)-N-этилбутанамид; N-(4-хлорфенил)-N-[(2*S*,4*R*)-1-(3-этил-4-фторбензоил)-2-метил-1,2,3,4-тетрагидрохиолин-4-ил]ацетамид; 4-(4-[[[(2*S*,4*R*)-4-[ацетил(4-хлорфенил)амино]-2-метил-3,4-дигидрохиолин-1(2Н)-ил]карбонил}фенокси)-2,2-диметилбутанамид; N-(4-хлорфенил)-N-[(2*S*,4*R*)-2-метил-1-[4-(4-оксо-4-пирролидин-1-илбутокси)бензоил]-1,2,3,4-тетрагидрохиолин-4-ил]ацетамид; 4-(4-[[[(2*S*,4*R*)-4-[ацетил(4-хлорфенил)амино]-2-метил-3,4-дигидрохиолин-1(2Н)-ил]карбонил}фенокси)бутанамид; 4-(4-[[[(2*S*,4*R*)-4-[ацетил(4-хлорфенил)амино]-2-метил-3,4-дигидрохиолин-1(2Н)-ил]карбонил}фенокси)-N-(метилсульфонил)бутанамид; этил 4-(4-[[[(2*S*,4*R*)-4-[ацетил(4-хлорфенил)амино]-2-метил-3,4-дигидрохиолин-1(2Н)-ил]карбонил}фенокси)бутанамид; 4-(4-[[[(2*S*,4*R*)-4-[ацетил(4-хлорфенил)амино]-2-метил-3,4-дигидрохиолин-1(2Н)-ил]карбонил}фенокси)-N-гидроксиданамид; N-(4-хлорфенил)-N-[(2*S*,4*R*)-1-[4-(3-цианопропокси)бензоил]-2-метил-1,2,3,4-тетрагидрохиолин-4-ил]ацетамид; N-(4-хлорфенил)-N-[(2*S*,4*R*)-2-метил-1-[4-[3-(1,2,4-оксадиазол-5-ил)пропокси]бензоил]-1,2,3,4-тетрагидрохиолин-4-ил]ацетамид; 3-

(4-[[2S,4R)-4-[ацетил(4-хлорфенил)амино]-2-метил-3,4-дигидрохинолин-1(2H)-ил]карбонил]фенокси)пропанамид; N-[(2S,4R)-1-[4-(3-аминопропокси)бензоил]-2-метил-1,2,3,4-тетрагидрохинолин-4-ил]-N-(4-хлорфенил)ацетамид; N-[(2S,4R)-1-[4-(2-амино-2-оксоэтокси)бензоил]-2-метил-1,2,3,4-тетрагидрохинолин-4-ил]-N-(4-хлорфенил)ацетамид; N-(4-хлорфенил)-N-[(2S,4R)-2-метил-1-[4-[2-(метиламино)-2-оксоэтокси]бензоил]-1,2,3,4-тетрагидрохинолин-4-ил]ацетамид; 2-(4-[[2S,4R)-4-[ацетил(4-хлорфенил)амино]-2-метил-3,4-дигидрохинолин-1(2H)-ил]карбонил]фенокси)-N,N-диметилацетамид; N-(4-хлорфенил)-N-[(2S,4R)-2-метил-1-[4-(2-морфолин-4-ил-2-оксоэтокси)бензоил]-1,2,3,4-тетрагидрохинолин-4-ил]ацетамид; N-(4-хлорфенил)-N-[(2S,4R)-2-метил-1-[4-[2-(2-оксопирролидин-1-ил)этокси]бензоил]-1,2,3,4-тетрагидрохинолин-4-ил]ацетамид; N-(4-хлорфенил)-N-[(2S,4R)-1-[4-[2-(1H-имидазол-1-ил)этокси]бензоил]-2-метил-1,2,3,4-тетрагидрохинолин-4-ил]ацетамид; N-(4-хлорфенил)-N-[(2S,4R)-2-метил-1-[4-(2-пирролидин-1-ил)этокси]бензоил]-1,2,3,4-тетрагидрохинолин-4-ил]ацетамид; N-(4-хлорфенил)-N-[(2S,4R)-1-(2,3-дигидро-1-бензофуран-5-илкарбонил)-2-метил-1,2,3,4-тетрагидрохинолин-4-ил]ацетамид; N-(4-хлорфенил)-N-[(2S,4R)-2-метил-1-[4-(3-пирролидин-1-илпропокси)бензоил]-1,2,3,4-тетрагидрохинолин-4-ил]ацетамид; N-(4-хлорфенил)-N-[(2S,4R)-2-метил-1-[4-(3-морфолин-4-илпропокси)бензоил]-1,2,3,4-тетрагидрохинолин-4-ил]ацетамид; N-(4-хлорфенил)-N-[(2S,4R)-2-метил-1-[4-[(4-оксопентил)окси]бензоил]-1,2,3,4-тетрагидрохинолин-4-ил]ацетамид; N-(4-хлорфенил)-N-[(2S,4R)-1-[4-(3-гидрокси-3-метилбутоксид)бензоил]-2-метил-1,2,3,4-тетрагидрохинолин-4-ил]ацетамид; N-(4-хлорфенил)-N-[(2S,4R)-1-[4-[(4-гидрокси-4-метилпентил)окси]бензоил]-2-метил-1,2,3,4-тетрагидрохинолин-4-ил]ацетамид; N-(4-хлорфенил)-N-[(2S,4R)-1-[4-[(1-этилпиперидин-4-ил)метокси]бензоил]-2-метил-1,2,3,4-тетрагидрохинолин-4-ил]ацетамид; N-(4-хлорфенил)-N-[(2S,4R)-1-[4-[3-(1H-имидазол-1-ил)пропокси]бензоил]-2-метил-1,2,3,4-тетрагидрохинолин-4-ил]ацетамид; (2S,4R)-N-(4-хлорфенил)-N-[2-метил-1-(4-метил-3,4-дигидро-2H-бензо[1,4]оксазин-7-карбонил)-1,2,3,4-тетрагидрохинолин-4-ил]ацетамид; N-(4-хлорфенил)-N-[(2S,4R)-2-метил-1-[4-(4-метил-3,4-дигидро-2H-1,4-бензоксазин-6-ил)карбонил]-1,2,3,4-тетрагидрохинолин-4-ил]ацетамид; N-(4-хлорфенил)-N-[(2S,4R)-1-[4-(4-этилпиперазин-1-ил)бензоил]-2-метил-1,2,3,4-тетрагидрохинолин-4-ил]ацетамид; N-[(2S,4R)-1-[4-(4-ацетилпиперазин-1-ил)бензоил]-2-метил-1,2,3,4-тетрагидрохинолин-4-ил]-N-(4-хлорфенил)ацетамид; N-(4-хлорфенил)-N-[(2S,4R)-1-[4-(4-гликолоилпиперазин-1-ил)бензоил]-2-метил-1,2,3,4-тетрагидрохинолин-4-ил]ацетамид; N-(4-хлорфенил)-N-[(2S,4R)-2-метил-1-[4-(3-морфолин-4-илпроп-1-ип-1-ил)бензоил]-1,2,3,4-тетрагидрохинолин-4-ил]ацетамид; 4-(4-[[2S,4R)-4-[ацетил(4-хлорфенил)амино]-2-метил-3,4-дигидрохинолин-1(2H)-ил]карбонил]фенил)бут-3-иновую кислоту; N-[(2S,4R)-1-(1H-бензимидазол-2-илкарбонил)-2-метил-1,2,3,4-тетрагидрохинолин-4-ил]-N-(4-хлорфенил)ацетамид; N-[(2S,4R)-1-(1,3-бензотиазол-2-илкарбонил)-2-метил-1,2,3,4-тетрагидрохинолин-4-ил]-N-(4-хлорфенил)ацетамид; N-(4-хлорфенил)-N-[(2S,4R)-2-метил-1-[4-[(1-метил-1H-1,2,3-бензотриазол-5-ил)карбонил]-1,2,3,4-тетрагидрохинолин-4-ил]ацетамид; N-(4-хлорфенил)-N-[(2S,4R)-1-[4-[(1-изопропил-1H-бензимидазол-5-ил)карбонил]-2-метил-1,2,3,4-тетрагидрохинолин-4-ил]ацетамид; [4-(4-[[2S,4R)-4-[ацетил(4-хлорфенил)амино]-2-метил-3,4-дигидрохинолин-1(2H)-ил]карбонил]фенил)пиперазин-1-ил]уксусную кислоту; N-[(2S,4R)-1-[4-[4-(2-амино-2-оксоэтил)пиперазин-1-ил]бензоил]-2-метил-1,2,3,4-тетрагидрохинолин-4-ил]-N-(4-хлорфенил)ацетамид; 3-(4-[[2S,4R)-4-[ацетил(4-хлорфенил)амино]-2-метил-3,4-дигидрохинолин-1(2H)-ил]карбонил]фенокси)пропановую кислоту; 4-(4-[[2S,4R)-4-[ацетил(4-хлорфенил)амино]-2-метил-3,4-дигидрохинолин-1(2H)-ил]карбонил]фенокси)-2,2-диметилбутановую кислоту; {1-[4-[[2S,4R)-4-[ацетил(4-хлорфенил)амино]-2-метил-3,4-дигидрохинолин-1(2H)-ил]карбонил]фенокси)метил]циклопропил}уксусную кислоту; (2E)-4-(4-[[2S,4R)-4-[ацетил(4-хлорфенил)амино]-2-метил-3,4-дигидрохинолин-1(2H)-ил]карбонил]фенокси)бут-2-еновую кислоту; 3-(4-[[2S,4R)-4-[ацетил(4-хлорфенил)амино]-2-метил-3,4-дигидрохинолин-1(2H)-ил]карбонил]фенокси)-2,2-диметилпропановую кислоту; (2E)-4-(4-[[2S,4R)-4-[ацетил(4-хлорфенил)амино]-2-метил-3,4-дигидрохинолин-1(2H)-ил]карбонил]фенокси)-2-метилбут-2-еновую кислоту; N-(4-хлорфенил)-N-[(2S,4R)-2-метил-1-[4-(3-[[трифторметил]сульфонил]амино)пропокси]бензоил]-1,2,3,4-тетрагидрохинолин-4-ил]ацетамид; N-(4-хлорфенил)-N-

((2S,4R)-1-[[1-(2-гидроксиэтил)-2-метил-1H-бензимидазол-5-ил]карбонил]-2-метил-1,2,3,4-тетрагидрохиолин-4-ил)ацетамид; 5-[[[(2S,4R)-4-[ацетил(4-хлорфенил)амино]-2-метил-3,4-дигидрохиолин-1(2H)-ил]карбонил]-2-метил-1H-бензимидазол-1-ил]уксусную кислоту; 3-(5-[[[(2S,4R)-4-[ацетил(4-хлорфенил)амино]-2-метил-3,4-дигидрохиолин-1(2H)-ил]карбонил]-1H-1,2,3-бензотриазол-1-ил]пропановую кислоту; (2S,4R)-N-(4-хлорфенил)-N-[1-(1-изопропил-1H-индазол-5-карбонил)-2-метил-1,2,3,4-тетрагидрохиолин-4-ил]ацетамид; или (2S,4R)-N-(4-хлорфенил)-N-(2-метил-1-{4-[3-(1H-тетразол-5-ил)пропокси]бензоил}-1,2,3,4-тетрагидрохиолин-4-ил)ацетамид.

2. Соединение по п.1, где кольцо А является необязательно замещенным моноциклическим ароматическим;

R представляет собой $-X_1-R^1$;

R^X представляет собой $-X_2-R^4$;

X_1 и X_2 , каждый, независимо, представляют собой $-S(O)_2-$, $-C(O)-$ или $-C(O)NH-$;

R^1 представляет собой:

А) ароматическую группу или гетероароматическую группу, имеющую 5-6 атомов кольца, замещенные i) $T^1-V-T-R^Y$; ii) $T^1-V-T-M-R^Y$ или iii) $V-R^9$, где R^9 представляет собой необязательно замещенную неароматическую карбоциклическую или гетероциклическую группу;

и где ароматическая или гетероароматическая группа, представленная R^1 , необязательно далее замещена 1-2 независимо выбранными группами, представленными R^Z ; или

В) ароматическую группу или гетероароматическую группу имеющую 5-6 атомов кольца, конденсированные с моноциклическим неароматическим гетероциклическим кольцом или моноциклическим ароматическим кольцом, где неароматическое гетероциклическое кольцо или ароматическое кольцо необязательно замещены;

каждый R^Z независимо выбран из галогена,

галогеналкила, R^0 , $-OR^0$, $-O$ (галогеналкил), $-SR^0$, $-NO_2$, $-CN$, $-N(R^1)_2$, $-NR^1CO_2R^0$, $-NR^1C(O)R^0$, $-NR^1NR^1C(O)R^0$, $-N(R^1)C(O)N(R^1)_2$, $-NR^1NR^1C(O)N(R^1)_2$, $-NR^1NR^1CO_2R^0$, $-C(O)C(O)R^0$, $-C(O)CH_2C(O)R^0$, $-CO_2R^0$, $-C(O)R^0$, $-C(O)N(R^0)_2$, $-OC(O)R^0$, $-OC(O)N(R^0)_2$, $-S(O)_2R^0$, $-SO_2N(R^1)_2$, $-S(O)R^0$, $-NR^1SO_2N(R^1)_2$, $-NR^1SO_2R^0$, $-C(=S)N(R^1)_2$ и $-C(=NH)-N(R^1)_2$;

каждый R^1 независимо представляет собой водород, алкил, $-C(O)OR^0$, $S(O)_2R^0$ или $-C(O)R^0$;

каждый R^0 независимо представляет собой водород или алкильную группу, неароматическую гетероциклическую группу или ароматическую группу и алкил, неароматическая гетероциклическая группа и ароматическая группа, представленные R^0 , необязательно замещены одной или несколькими независимо выбранными группами, представленными $R^\#$;

$R^\#$ представляет собой R^+ , $-OR^+$, $-O$ (галогеналкил), $-SR^+$, $-NO_2$, $-CN$, $-N(R^+)_2$, $-NHCO_2R^+$, $-NHC(O)R^+$, $-NHNHC(O)R^+$, $-NHC(O)N(R^+)_2$, $-NHNHC(O)N(R^+)_2$, $-NHNHCO_2R^+$, $-C(O)C(O)R^+$, $-C(O)CH_2C(O)R^+$, $-CO_2R^+$, $-C(O)R^+$, $-C(O)N(R^+)_2$, $-OC(O)R^+$, $-OC(O)N(R^+)_2$, $-S(O)_2R^+$, $-SO_2N(R^+)_2$, $-S(O)R^+$, $-NHCO_2N(R^+)_2$, $-NHCO_2R^+$, $-C(=S)N(R^+)_2$ или $-C(=NH)-N(R^+)_2$;

R^+ представляет собой $-H$, C_1-C_3 алкильную группу, моноциклическую гетероарильную группу, неароматическую гетероциклическую группу или фенильную группу, необязательно замещенные алкилом, галогеналкилом, алкокси, галогеналкокси, галогеном, $-CN$, $-NO_2$, амином, алкиламином или диалкиламином; или $-N(R^+)_2$ представляет собой неароматическую гетероциклическую группу, при условии, что неароматические гетероциклические группы, представленные R^+ и $-N(R^+)_2$, которые содержат вторичный кольцевой амин, необязательно ацилированы или алкилированы;

R^Y представляет

собой $-C(O)OR^5$, $-C(O)R^5$, $-OC(O)R^5$, $-C(O)NR^5_2$, $-NR^5C(O)R^5$, $-NR^5C(O)OR^5$, $-S(O)_2R^5$, $-S(O)_2COR^5$, $-S(O)_2NR^5_2$, $-NR^5S(O)_2R^5$, $-NR^5S(O)_2R^5$, $S(O)_2OR^5$, $-S(O)OR^5$, $-S(O)R^5$, $-SR^5$, $-C(O)NR^5S(O)_2R^5$, $-CN$, $-NR^5C(O)NR^5_2$, $-OC(O)NR^5_2$, $-NR^5$

R^5 , $-OR^5$, необязательно замещенную неароматическую гетероциклическую группу или необязательно замещенную гетероарильную группу;

V представляет собой ковалентную связь, $-O-$, $-C(O)-$, $-N(R^1)-$, $-S-$, $-S(O)-$, $-C(O)NR^5-$, $-NR^5C(O)-$, $-S(O)_2NR^5-$, $-NR^5S(O)_2-$ или $-S(O)_2-$;

T представляет собой C_{1-10} прямую алкиленовую цепь; при условии, что T представляет собой C_{2-10} , когда V представляет собой ковалентную связь, и T представляет собой C_{2-10} , когда V представляет собой $-O-$, $-S-$ или $-N(R^1)-$, и R^Y представляет собой $-CN$, $-OH$, $-SH$, $-N(R^5)_2$;

T^1 представляет собой ковалентную связь или C_{1-10} прямую алкиленовую цепь, где T и T^1 вместе содержат не более 10 атомов углерода, и где T и T^1 необязательно и независимо замещены на любом одном или нескольких способных к замещению атомах углерода галогеном, алкилом, гем-диалкилом, гем-дигалогеном, галогеналкилом, алкокси, галогеналкокси, спироциклоалкилом, необязательно *N*-замещенной азотсодержащей спиронеароматической гетероциклической группой, O-содержащей спиронеароматической гетероциклической группой, амином, алкиламином, диалкиламином или гидроксиллом;

каждый R^5 независимо представляет собой $-H$, алкил, галогеналкил, гидроксилалкил, карбоксилалкил, $-C(O)OCH_2C_6H_5$, $S(O)_2CH_3$, $-C(O)OH$, $-C(O)OMe$, $-C(O)OEt$, $C(O)NH_2$, бензил, пирролидинил, морфолинил, или $-N(R^5)_2$ представляет собой азотсодержащую неароматическую гетероциклическую группу;

M представляет собой необязательно замещенную моноциклическую ароматическую, гетероароматическую или необязательно замещенную моноциклическую неароматическую карбоциклическую или гетероциклическую группу;

R^2 представляет собой C_{1-3} алкил;

R^3 представляет собой необязательно замещенную ароматическую группу, имеющую 5-6 атомов кольца; и

R^4 представляет собой C_{1-3} алкил или C_{1-3} гидроксилалкил.

3. Соединение по п.1, где кольцо A представляет собой необязательно замещенную фенильную группу;

R^2 представляет собой метил или этил;

R^3 представляет собой необязательно замещенную фенильную группу;

R^4 представляет собой метил, этил, гидроксиметил, гидроксипропил, циклопропил или изопропил; и

X_1 и X_2 представляют собой $-C(O)-$.

4. Соединение по п.2, где кольцо A представляет собой необязательно замещенную фенильную группу;

R^2 представляет собой метил или этил;

R^3 представляет собой необязательно замещенную фенильную группу;

R^4 представляет собой метил, этил, гидроксиметил или гидроксипропил; и

X_1 и X_2 представляют собой $-C(O)-$.

5. Соединение по п.3, где R^1 представляет собой фенильное кольцо, замещенное V- $T-R^Y$, и необязательно далее замещенное 1-2 независимо выбранными группами, представленными R^Z ;

V представляет собой ковалентную связь, $-O-$ или $-N(R^1)-$; и

T представляет собой C_{1-6} прямую алкиленовую цепь, необязательно замещенную на любом одном или нескольких способных к замещению атомах углерода галогеном, алкилом, гем-диалкилом, гем-дигалогеном, галогеналкилом, спироциклоалкилом, необязательно *N*-замещенной азотсодержащей спиронеароматической гетероциклической группой, O-содержащей спиронеароматической гетероциклической группой, амином, алкиламином, диалкиламином, алкокси или гидроксиллом.

6. Соединение по п.4, где R^1 представляет собой фенильное кольцо, замещенное V- $T-R^Y$, и, необязательно, далее замещено 1-2 независимо выбранными группами, представленными R^Z ;

V представляет собой ковалентную связь, -O- или -N(R')-; и

T представляет собой C₁₋₆ прямую алкиленовую цепь, необязательно замещенную на любом одном или нескольких способных к замещению атомах углерода галогеном, алкилом, гем-дилакилом, гем-дигалогеном, галогеналкилом, спироциклоалкилом, необязательно M-замещенной азотсодержащей спиронеароматической гетероциклической группой, амином, алкиламином, диалкиламином или гидроксилом.

7. Соединение по п.5 или 6, где R^Y представляет собой -C(O)OR⁵, -C(O)N(R⁵)₂, -NR⁵C(O)R⁵, -NR⁵C(O)OR⁵, -S(O)₂N(R⁵)₂, -NR⁵S(O)₂R⁵, -OR⁵, -CN, -NR⁵C(O)N(R⁵)₂, -N(R⁵)₂, необязательно замещенную неароматическую гетероциклическую группу, представленную R⁷, или необязательно замещенную гетероарильную группу, представленную R⁸;

R⁷ представляет собой необязательно замещенную группу, выбранную из пиперидинонила, оксазолидинонила, оксазолидинонила, тиазолидинонила, тетрагидрофуранила, тетрагидропиранила, тиазолидинонила, тетрагидротиофена, морфолинила тиоморфолинила, имидазолидинонила, имидазолидинонила, диоксанила, диоксоланила, дитиоланила, пирролидинонила, пирролидинонила, пиперазинила или пиперидинонила; и

R⁸ представляет собой необязательно замещенную группу, выбранную из фуранила, тетразолила, оксазолила, изоксазолила, оксадиазолила, пирролила, пиразолила, пиридинонила, пиримидила, тиазолила, тиенила или имидазолила.

8. Соединение по п.7, где R³ представляет собой фенильную группу, необязательно замещенную одной или несколькими независимо выбранными группами, представленными R¹¹; и

каждый R¹¹ независимо выбран из галогена, галогеналкила, R⁰, -OR⁰, -O(галогеналкил), -SR⁰, 3,4-метилendiокси, 3,4-этилендиокси, -NO₂, -CN, -N(R')₂, -NR'CO₂R⁰, -NR'C(O)R⁰, -NR'NR'C(O)R⁰, -N(R')C(O)N(R')₂, -NR'NR'C(O)N(R')₂, -NR'NR'CO₂R⁰, -C(O)C(O)R⁰, -C(O)CH₂C(O)R⁰, -CO₂R⁰, -C(O)R⁰, -C(O)N(R⁰)₂, -OC(O)R⁰, -OC(O)N(R⁰)₂, -S(O)₂R⁰, -SO₂N(R')₂, -S(O)R⁰, -NR'SO₂N(R')₂, -NR'SO₂R⁰, -C(=S)N(R')₂, -(CH₂)₁₋₄CO₂R⁰, -O(CH₂)₁₋₄CO₂R⁰, -(CH₂)₁₋₄CON(R⁰)₂, -O(CH₂)₁₋₄CON(R⁰)₂, -(CH₂)₀₋₃(C(CH₃)₂)CO₂R⁰, -O(CH₂)₀₋₃(C(CH₃)₂)CO₂R⁰, -(CH₂)₀₋₃(C(CH₃)₂)CON(R⁰)₂, -O(CH₂)₀₋₃(C(CH₃)₂)CON(R⁰)₂, или -C(=NH)-N(R')₂.

9. Соединение по п.7, где R³ представляет собой фенильную группу, необязательно замещенную одной или несколькими независимо выбранными группами, представленными R¹¹; и

каждый R¹¹ независимо выбран из галогена, галогеналкила, R⁰, -OR⁰, -O(галогеналкил), -SR⁰, 3,4-метилendiокси, 3,4-этилендиокси, -NO₂, -CN, -N(R')₂, -NR'CO₂R⁰, -NR'C(O)R⁰, -NR'NR'C(O)R⁰, -N(R')C(O)N(R')₂, -NR'NR'C(O)N(R')₂, -NR'NR'CO₂R⁰, -C(O)C(O)R⁰, -C(O)CH₂C(O)R⁰, -CO₂R⁰, -C(O)R⁰, -C(O)N(R⁰)₂, -OC(O)R⁰, -OC(O)N(R⁰)₂, -S(O)₂R⁰, -SO₂N(R')₂, -S(O)R⁰, -NR'SO₂N(R')₂, -NR'SO₂R⁰, -C(=S)N(R')₂ или -C(=NH)-N(R')₂.

10. Соединение по п.9, где R^Y представляет собой -C(O)OR⁵, -C(O)N(R⁵)₂, -NR⁵C(O)R⁵, -NR⁵C(O)OR⁵, -S(O)₂N(R⁵)₂, -NR⁵S(O)₂R⁵, -NR⁵C(O)N(R⁵)₂, -OH, необязательно замещенную неароматическую гетероциклическую группу, представленную R⁷ или необязательно замещенную гетероарильную группу, представленную R⁸;

каждый R⁵ независимо представляет собой H или алкил, или N(R⁵)₂ представляет собой азотсодержащую неароматическую гетероциклическую группу;

R⁷ представляет собой необязательно замещенную группу, выбранную из пиперидинонила, морфолинила, имидазолидинонила, пирролидинонила, пирролидинонила, пиперазинила или пиперидинонила;

R⁸ представляет собой необязательно замещенную группу, выбранную из тетразолила, оксазолила, оксадиазолила пирролила, пиразолила, пиридинонила или имидазолила;

V представляет собой ковалентную связь или -O-; и

T представляет собой C₁₋₅ прямую алкиленовую цепь, необязательно замещенную на атоме углерода, смежном с R^Y, галогеном, алкилом, гем-диалкилом, гем-дигалогеном, галогеналкилом, спироциклоалкилом, необязательно N-замещенной азотсодержащей спиронеароматической гетероциклической группой, амином, диалкиламином, алкокси или гидроксиллом.

11. Соединение по п.9, где V представляет собой -O-.

12. Соединение по п.9, где V представляет собой ковалентную связь и T представляет собой C₁₋₅ прямую алкиленовую цепь, замещенную на атоме углерода, смежном с R^Y, алкилом, гем-диалкилом, галогеналкилом, спироциклоалкилом или необязательно N-замещенной азотсодержащей спиронеароматической гетероциклической группой.

13. Соединение по п.10, где кольцо A представляет собой фенильную группу, необязательно замещенную в шестом и седьмом положениях R¹⁴;

каждый R¹⁴ независимо представляет собой галоген, галогеналкил, R^o, -OR^o, -O(галогеналкил), -SR^o, -NO₂, -CN, -N(R')₂, -NR'CO₂R^o, -NR'C(O)R^o, -NR'NR'C(O)R^o, -N(R')C(O)N(R')₂, -NR'NR'C(O)N(R')₂, -NR'NR'CO₂R^o, -C(O)C(O)R^o, -C(O)CH₂C(O)R^o, -CO₂R^o, -C(O)R^o, -C(O)N(R^o)₂, -OC(O)R^o, -OC(O)N(R^o)₂, -S(O)₂R^o, -SO₂N(R')₂, -S(O)R^o, -NR'SO₂N(R')₂, -NR'SO₂R^o, -C(=S)N(R')₂, и -C(=NH)-N(R')₂, (CH₂)_nCO₂R^o, -O(CH₂)_nCO₂R^o, -(CH₂)_nOH, -(CH₂)_nOH, -(CH₂)_nC(O)N(R^o)₂, или -O(CH₂)_nC(O)N(R^o)₂;

n представляет собой целое число от 1 до 4;

R¹ представляет собой фенильное кольцо, замещенное в мета - или параположениях V-T-R^Y, и, необязательно, далее замещенное 1-2 независимо выбранными группами, представленными R^Z;

каждый R^Z независимо выбран из галогена, галогеналкила, -R^o, -OR^o, -O(галогеналкил), -CO₂R^o, -NR'SO₂R^o, -C(O)R^o, -C(O)N(R^o)₂, -OC(O)R^o, и -OC(O)N(R^o)₂;

каждый R¹¹ независимо представляет собой заместитель, выбранный из галогена, галогеналкила, -R^o, -OR^o, -O(галогеналкил), 3,4-метилendiокси, 3,4-этилendiокси, -CO₂R^o, -C(O)R^o, -N(R')₂, -NR'SO₂R^o, -C(O)N(R^o)₂, -OC(O)R^o, и -OC(O)N(R^o)₂;

каждый R' независимо представляет собой H или алкил; и

каждый R^o независимо представляет собой водород, галогеналкил или алкильную группу.

14. Соединение по п.13, где R^Y представляет собой -C(O)OR⁵, -C(O)N(R⁵)₂, -OH, N-морфолинил, 2-морфолинил, 3-морфолинил, N-замещенный 2-морфолинил, N-замещенный 3-морфолинил, N-имидазолидинил, 2-имидазолидинил, 4-имидазолидинил, 5-имидазолидинил, N-замещенную 2-имидазолидинил, N'-замещенную N-имидазолидинил, N-замещенную 4-имидазолидинил, N-замещенную 5-имидазолидинил, N-имидазолидинонил, 4-имидазолидинонил, 5-имидазолидинонил, N-замещенный 4-имидазолидинонил, N-замещенный 5-имидазолидинонил, N-пирролидинил, 2-пирролидинил, 3-пирролидинил, N-замещенный 2-пирролидинил, N-замещенный 3-пирролидинил, N-пирролидин-2-онил, 3-пирролидин-2-онил, 4-пирролидин-2-онил, 5-пирролидин-2-онил, N-замещенный 3-пирролидин-2-онил, N-замещенный 4-пирролидин-2-онил, N-замещенный 5-пирролидин-2-онил, N-пирролидин-3-онил, 2-пирролидин-3-онил, 4-пирролидин-3-онил, 5-пирролидин-3-онил, N-замещенный 2-пирролидин-3-онил, N-замещенный 4-пирролидин-3-онил, N-замещенный 5-пирролидин-3-онил, N-пиперидинил, 2-пиперидинил, 3-пиперидинил, 4-пиперидинил, N-замещенный 2-пиперидинил, N-замещенный 3-пиперидинил, N-замещенный 4-пиперидинил, N-пиперидин-2-онил, 3-пиперидин-2-онил, 4-пиперидин-2-онил, 5-пиперидин-2-онил, 6-пиперидин-2-онил, N-замещенный 3-пиперидин-

2-онил, *N*-замещенный 4-пиперидин-2-онил, *N*-замещенный 5-пиперидин-2-онил, *N*-замещенный 6-пиперидин-2-онил, *N*-пиперидин-3-онил, 2-пиперидин-3-онил, 4-пиперидин-3-онил, 5-пиперидин-3-онил, 6-пиперидин-3-онил, *N*-замещенный 2-пиперидин-3-онил, *N*-замещенный 4-пиперидин-3-онил, *N*-замещенный 5-пиперидин-3-онил, *N*-замещенный 6-пиперидин-3-онил, *N*-пиперидин-4-онил, 2-пиперидин-4-онил, 3-пиперидин-4-онил, 5-пиперидин-4-онил, 6-пиперидин-4-онил, *N*-замещенный 2-пиперидин-4-онил, *N*-замещенный 3-пиперидин-4-онил, *N*-замещенный 5-пиперидин-4-онил, *N*-замещенный 6-пиперидин-4-онил, *N*-пиперазинил, 2-пиперазинил, *N'*-замещенный *N*-пиперазинил, *N*-замещенный 2-пиперазинил, фуранил, *N*-тетразолил, 5-тетразолил, *N*-замещенный 5-тетразолил, 4-(1,2,3)оксадиазолил, 5-(1,2,3)оксадиазолил, 3-(1,2,4)оксадиазолил, 5-(1,2,4)оксадиазолил, 3-(1,2,5)оксадиазолил, 4-(1,2,5)оксадиазолил, 2-(1,3,4)оксадиазолил, 5-(1,3,4)оксадиазолил, *N*-пирролил, 2-пирролил, 3-пирролил, *N*-замещенный 2-пирролил, *N*-замещенный 3-пирролил, *N*-пиразолил, 3-пиразолил, 4-пиразолил, 5-пиразолил, *N*-замещенный 3-пиразолил, *N*-замещенный 4-пиразолил, *N*-замещенный 5-пиразолил, 2-пиридинил, 3-пиридинил, 4-пиридинил, *N*-имидазолил, 2-имидазолил, 4-имидазолил, 5-имидазолил; *N*-замещенный 2-имидазолил, *N*-замещенный 4-имидазолил или *N*-замещенный 5-имидазолил;

V представляет собой -O-; и

T представляет собой C₁₋₃ прямую алкиленовую цепь, замещенную на атоме углерода, смежном с R^Y, фтором, метилом, гем-диметилом, гем-дифтором, фторметилом, спироциклопропилом, спироциклобутилом, необязательно *N*-замещенным спироазетидинилом, необязательно *N*-замещенным спироазиридинилом, необязательно *N*-замещенным спиропирролидинилом, необязательно *N*-замещенным спиропиперидинилом, амином, метиламином, диметиламином или гидроксилом.

15. Соединение по п.14, где каждый R^Z независимо выбран из галогена, галогеналкила, -R^o, -OR^o, и -O(галогеналкил);

R³ представляет собой фенильную группу, необязательно замещенную в мета- или параположении одной или несколькими независимо выбранными группами, представленными R¹¹; и

каждый R¹¹ независимо представляет собой заместитель, выбранный из галогена, галогеналкила, -R^o, -OR^o, -N(R')₂, -NR'SO₂R^o и -O(галогеналкил).

16. Соединение по п.15, где R^Y представляет собой -C(O)OR⁵, -C(O)N(R⁵)₂, -OH, *N*-тетразолил, 5-тетразолил, *N*-замещенный 5-тетразолил, *N*-имидазолил, 2-имидазолил, 4-имидазолил, 5-имидазолил; *N*-замещенный 2-имидазолил, *N*-замещенный 4-имидазолил, или *N*-замещенный 5-имидазолил; и

R⁵ представляет собой -H, метил или этил.

17. Соединение по п.16, где

кольцо A представляет собой фенильную группу, необязательно замещенную в шестом или седьмом положениях R¹⁴;

каждый R¹⁴ независимо представляет собой галоген, R^o, -OR^o, -CO₂R^o, -C(O)R^o, -C(O)N(R^o)₂, -OC(O)R^o, -(CH₂)_nCO₂R^o, -O(CH₂)_nCO₂R^o, -NHCO₂R^o, -NHCOR^o, -CN, -NHC(O)N(R^o)₂, -(CH₂)_nOH, -O(CH₂)_nOH, -(CH₂)_nC(O)N(R^o)₂ или -O(CH₂)_nC(O)N(R^o)₂;

R¹ представляет собой фенильное кольцо, замещенное в параположении V-T-R^Y и, необязательно, далее замещенное в метаположении R^Z;

R^Z представляет собой хлор, фтор, бром, -OR^o или -R^o;

R³ представляет собой фенильную группу, необязательно замещенную в параположении R¹¹;

R¹¹ представляет собой хлор, фтор, бром, -OR^o, -N(R')₂, -NR'SO₂R^o или -R^o;

R' независимо представляет собой водород или C₁₋₃ алкильную группу; и

R^o независимо представляет собой водород, галогеналкил или C₁₋₃ алкильную группу.

18. Соединение по п.3, где R¹ представляет собой фенильное кольцо, замещенное

V-R⁹, где R⁹ представляет собой необязательно замещенную неароматическую карбоциклическую или гетероциклическую группу и, необязательно, далее замещенное 1-2 независимо выбранными группами, представленными R^Z.

19. Соединение по п.18, где

R³ представляет собой фенильную группу, необязательно замещенную одной или несколькими независимо выбранными группами, представленными R¹¹; и

каждый R¹¹ независимо выбран из галогена, галогеналкила, R⁰, -OR⁰, -O(галогеналкил), -SR⁰, 3,4-метилendiокси, 3,4-этилендиокси, -NO₂, -CN, -N(R')₂, -NR'CO₂R⁰, -NR'C(O)R⁰, -NR'NR'C(O)R⁰, -N(R')C(O)N(R')₂, -NR'NR'C(O)N(R')₂, -NR'NR'CO₂R⁰, -C(O)C(O)R⁰, -C(O)CH₂C(O)R⁰, -CO₂R⁰, -C(O)R⁰, -C(O)N(R⁰)₂, -OC(O)R⁰, -OC(O)N(R⁰)₂, -S(O)₂R⁰, -SO₂N(R')₂, -S(O)R⁰, -NR'SO₂N(R')₂, -NR'SO₂R⁰, -C(=S)N(R')₂, -(CH₂)₁₋₄CO₂R⁰, -O(CH₂)₁₋₄CO₂R⁰, -(CH₂)₁₋₄CON(R⁰)₂, -O(CH₂)₁₋₄CON(R⁰)₂, -(CH₂)₀₋₃(C(CH₃)₂)CO₂R⁰, -O(CH₂)₀₋₃(C(CH₃)₂)CO₂R⁰, -(CH₂)₀₋₃(C(CH₃)₂)CON(R⁰)₂, -O(CH₂)₀₋₃(C(CH₃)₂)CON(R⁰)₂ или -C(=NH)-N(R')₂.

20. Соединение по п.18, где R³ представляет собой фенильную группу, необязательно замещенную одной или несколькими независимо выбранными группами, представленными R¹¹; и

каждый R¹¹ независимо выбран из галогена, галогеналкила, R⁰, -OR⁰, -O(галогеналкил), -SR⁰, 3,4-метилendiокси, 3,4-этилендиокси, -NO₂, -CN, -N(R')₂, -NR'CO₂R⁰, -NR'C(O)R⁰, -NR'NR'C(O)R⁰, -N(R')C(O)N(R')₂, -NR'NR'C(O)N(R')₂, -NR'NR'CO₂R⁰, -C(O)C(O)R⁰, -C(O)CH₂C(O)R⁰, -CO₂R⁰, -C(O)R⁰, -C(O)N(R⁰)₂, -OC(O)R⁰, -OC(O)N(R⁰)₂, -S(O)₂R⁰, -SO₂N(R')₂, -S(O)R⁰, -NR'SO₂N(R')₂, -NR'SO₂R⁰, -C(=S)N(R')₂ или -C(=NH)-N(R')₂.

21. Соединение по п.19, где R⁹ представляет собой необязательно замещенные циклогексанил, оксазолидинил, оксазолидинонил, тиазолидинил, тетрагидрофуранил, тетрагидропиранил, тиазолидинил, тетрагидротриенил, морфолинил, тиоморфолинил, имидазолидинил, имидазолидинонил, диоксанил, диоксоланил, дитиоланил, пирролидинил, пирролидинонил, пиперазинил, изотиазолидинил S,S-диоксид, 1,2,5-тиадиазолидин S,S-диоксид или пиперидинил.

22. Соединение по п.20, где R⁹ представляет собой необязательно замещенные циклогексанил, оксазолидинил, оксазолидинонил, тиазолидинил, тетрагидрофуранил, тетрагидропиранил, тиазолидинил, тетрагидротриенил, морфолинил, тиоморфолинил, имидазолидинил, имидазолидинонил, диоксанил, диоксоланил, дитиоланил, пирролидинил, пирролидинонил, пиперазинил, изотиазолидинид S,S-диоксид или пиперидинил.

23. Соединение по п.18, где

кольцо А представляет собой фенильную группу, необязательно замещенную при в шестом или седьмом положениях R¹⁴;

каждый R¹⁴ независимо представляет собой галоген, галогеналкил, R⁰, -OR⁰, -O(галогеналкил), -SR⁰, -NO₂, -CN, -N(R')₂, -NR'CO₂R⁰, -NR'C(O)R⁰, -NR'NR'C(O)R⁰, -N(R')C(O)N(R')₂, -NR'NR'C(O)N(R')₂, -NR'NR'CO₂R⁰, -C(O)C(O)R⁰, -C(O)CH₂C(O)R⁰, -CO₂R⁰, -C(O)R⁰, -C(O)N(R⁰)₂, -OC(O)R⁰, -OC(O)N(R⁰)₂, -S(O)₂R⁰, -SO₂N(R')₂, -S(O)R⁰, -NR'SO₂N(R')₂, -NR'SO₂R⁰, -C(=S)N(R')₂, и -C(=NH)-N(R')₂, (CH₂)_nCO₂R⁰, -O(CH₂)_nCO₂R⁰, -(CH₂)_nOH, -(CH₂)_nOH, -(CH₂)_nC(O)N(R⁰)₂ или -O(CH₂)_nC(O)N(R⁰)₂;

n представляет собой целое число от 1 до 4;

R¹ представляет собой фенильное кольцо, замещенное в мета- или параположении неароматической карбоциклической или гетероциклической группой, представленной V-R⁹, и, необязательно, далее замещенное 1-2 независимо выбранными группами, представленными R^Z;

каждый R^Z независимо выбран из галогена, галогеналкила, -R⁰, -OR⁰, -O(галогеналкил), -CO₂R⁰, -NR'SO₂R⁰, -C(O)R⁰, -C(O)N(R⁰)₂

, -OC(O)R⁰ и -OC(O)N(R⁰)₂;

V представляет собой ковалентную связь или -O-;

R³ представляет собой фенильную группу, необязательно замещенную одной или несколькими независимо выбранными группами, представленными R¹¹; и каждый R¹¹ независимо выбран из галогена, галогеналкила, -R⁰, -OR⁰, -O(галогеналкил), 3,4-метилendiокси, 3,4-этилendiокси, -CO₂R⁰, -N(R')₂, -C(O)R⁰, -C(O)N(R⁰)₂, -NR'SO₂R⁰, -OC(O)R⁰ и -OC(O)N(R⁰)₂;

каждый R' независимо представляет собой H или алкил; и каждый R⁰ независимо представляет собой водород, галогеналкил или алкильную группу.

24. Соединение по п.23, где R⁹ представляет собой оксазолидинил, тиазолидинил, тетрагидрофуранил, морфолинил, имидазолидинил, имидазолидинонил, пирролидинил, пирролидинонил, пиперазинил, или пиперидинил, каждый необязательно замещенный алкилом, галогенидом, галогеналкилом, гидроксиалкилом, -C(O)OR¹², -C(O)R¹², -OC(O)R¹², -R¹²C(O)OR¹², -C(O)NR¹², -NR¹²C(O)R¹², -NR¹²C(O)OR¹², -S(O)₂R¹², -S(O)₂COR¹², -S(O)₂N(R¹²)₂, -S(O)₂OR¹², -S(O)OR¹², -OR¹², -SR¹², -CN, -NR¹²C(O)N(R¹²)₂, -OC(O)N(R¹²)₂, -(CH₂)_nCO₂H, -(CH₂)_nC(O)NR⁰, -(CH₂)_nC(CH₃)₂CO₂H, -(CH₂)_nC(CH₃)₂C(O)NR⁰ или -N(R¹²)₂;

n представляет собой целое число от 1 до 4; и

каждый R¹² независимо представляет собой -H, алкил, галогеналкил или гидроксиалкил.

25. Соединение по п.24, где каждый R^Z независимо выбран из галогена, галогеналкила, -R⁰, -OR⁰, и -O(галогеналкил);

R³ представляет собой фенильную группу, необязательно замещенную в мета- или параположении одной или несколькими независимо выбранными группами, представленными R¹¹; и

каждый R¹¹ независимо представляет собой заместитель, выбранный из галогена, галогеналкила, -R⁰, -OR⁰, -N(R')₂, -NR'SO₂R⁰ и -O(галогеналкил).

26. Соединение по п.25, где R⁹ представляет собой M-морфолинил, 2-морфолинил, 3-морфолинил, M-замещенный 2-морфолинил, M-замещенный 3-морфолинил, M-пирролидинил, 2-пирролидинил, 3-пирролидинил, M-замещенный 2-пирролидинил, M-замещенный 3-пирролидинил, M-пиперазинил, 2-пиперазинил, M'-замещенный M-пиперазинил, M-замещенный 2-пиперазинил, M-пиперидинил, 2-пиперидинил, 3-пиперидинил, 4-пиперидинил, M-замещенный 2-пиперидинил, M-замещенный 3-пиперидинил, M-замещенный 4-пиперидинил, каждый необязательно замещен на любом способном к замещению атоме углерода алкилом, галогенидом, галогеналкилом, гидроксиалкилом, -C(O)OR¹², -C(O)R¹², -OC(O)R¹² или -C(O)N(R¹²)₂, и где M-заместителями являются алкил, галогеналкил, гидроксиалкил, -C(O)OR¹², -C(O)R¹², -(CH₂)_nCO₂H, -(CH₂)_nC(O)NR⁰, -(CH₂)_nC(CH₃)₂CO₂H, -(CH₂)_nC(CH₃)₂C(O)NR⁰ или -C(O)N(R¹²)₂; и

n представляет собой целое число от 1 до 4.

27. Соединение по п.26, где

кольцо A представляет собой фенильную группу необязательно замещенную в шестом или седьмом положениях R¹⁴;

каждый R¹⁴ независимо представляет собой галоген, R⁰, -OR⁰, -CO₂R⁰, -C(O)R⁰, -C(O)N(R⁰)₂, -OC(O)R⁰, -(CH₂)_nCO₂R⁰, -O(CH₂)_nCO₂R⁰, -NHCO₂R⁰, -NHCOR⁰, -CN, -NHC(O)N(R⁰)₂, -(CH₂)_nOH, -O(CH₂)_nOH, -(CH₂)_nC(O)N(R⁰)₂ или -O(CH₂)_nC(O)N(R⁰)₂;

n представляет собой целое число от 1 до 4;

R¹ представляет собой фенильное кольцо, замещенное в параположении неароматической карбоциклической или гетероциклической группой, представленной V-R⁹, и необязательно далее замещенное в метаположении R^Z;

R^Z представляет собой хлор, фтор, бром, -OR⁰ или -R⁰;

R³ представляет собой фенильную группу, необязательно замещенную в пароположении R¹¹;

R¹¹ представляет собой хлор, фтор, бромид, -OR^o, -N(R')₂, -NR'SO₂R^o или -R^o;

R' независимо представляет собой водород или C₁₋₃ алкильную группу; и

R^o независимо представляет собой водород, галогеналкил или C₁₋₃ алкильную группу.

28. Соединение по п.27, где R⁹ представляет собой *M*-пиперидинил, 2-пиперидинил, 3-пиперидинил, 4-пиперидинил, *M*-замещенный 2-пиперидинил, *M*-замещенный 3-пиперидинил, *M*-замещенный 4-пиперидинил, *M*-пиперазинил, 2-пиперазинил, *M'*-замещенный *M*-пиперазинил или *M*-замещенный 2-пиперазинил, и необязательно замещен на любом способном к замещению атоме углерода хлором, фтором, бромом, метилом, этилом, -C(O)OR¹², -OC(O)R¹², -C(O)R¹² или C(O)NH₂, и где *M*-заместителями являются метил,

этил, -C(O)OR¹², -C(O)R¹², -(CH₂)_nCO₂H, -(CH₂)_nC(O)NR^o, -(CH₂)_nC(CH₃)₂CO₂H, -(CH₂)_nC(CH₃)₂C(O)NR^o или -C(O)NH₂;

n представляет собой целое число от 1 до 4; и

каждый R¹² независимо представляет собой -H, метил или этил.

29. Соединение по п.3, где

R¹ представляет собой фенильную группу, конденсированную с необязательным замещенным моноциклическим неароматическим гетероциклическим кольцом, представленным R¹⁰, или моноциклическим ароматическим кольцом, представленным R¹³.

30. Соединение по п.29, где

кольцо А представляет собой фенильную группу, необязательно замещенную в шестом или седьмом положениях R¹⁴;

каждый R¹⁴ независимо представляет собой галоген,

галогеналкил, R^o, -OR^o, -O(галогеналкил), -SR^o, -NO₂, -CN, -N(R')₂, -NR'CO₂R^o, -NR'C(O)R^o, -NR'NR'C(O)R^o, -N(R')C(O)N(R')₂, -NR'NR'C(O)N(R')₂, -NR'NR'CO₂R^o, -C(O)C(O)R^o, -C(O)CH₂C(O)R^o, -CO₂R^o, -C(O)R^o, -C(O)N(R^o)₂, -OC(O)R^o, -OC(O)N(R^o)₂, -S(O)₂R^o, -SO₂N(R')₂, -S(O)R^o, -NR'SO₂N(R')₂, -NR'SO₂R^o, -C(=S)N(R')₂, и -C(=NH)-N(R')₂,

(CH₂)_nCO₂R^o, -O(CH₂)_nCO₂R^o, -(CH₂)_nOH, -(CH₂)_nOH, -(CH₂)_nC(O)N(R^o)₂, -O(CH₂)_nC(O)N(R^o)₂;

n представляет собой целое число от 1 до 4;

R³ представляет собой фенильную группу, необязательно замещенную одной или несколькими независимо выбранными группами, представленными R¹¹; и

каждый R¹¹ независимо выбран из галогена,

галогеналкила, R^o, -OR^o, -O(галогеналкил), -SR^o, 3,4-метилendiокси, 3,4-этилендиокси, -NO₂, -CN, -N(R')₂, -NR'CO₂R^o, -NR'C(O)R^o, -NR'NR'C(O)R^o, -N(R')C(O)N(R')₂, -NR'NR'C(O)N(R')₂, -NR'NR'CO₂R^o, -C(O)C(O)R^o, -C(O)CH₂C(O)R^o, -CO₂R^o, -C(O)R^o, -C(O)N(R^o)₂, -OC(O)R^o, -OC(O)N(R^o)₂, -S(O)₂R^o, -SO₂N(R')₂, -S(O)R^o, -NR'SO₂N(R')₂, -NR'SO₂R^o, -C(=S)N(R')₂, -(CH₂)₁₋₄CO₂R^o, -O(CH₂)₁₋₄CO₂R^o, -(CH₂)₁₋₄CON(R^o)₂, -O(CH₂)₁₋₄CON(R^o)₂, -(CH₂)₀₋₃(C(CH₃)₂)CO₂R^o, -O(CH₂)₀₋₃(C(CH₃)₂)CO₂R^o, -(CH₂)₀₋₃(C(CH₃)₂)CON(R^o)₂, -O(CH₂)₀₋₃(C(CH₃)₂)CON(R^o)₂ или -C(=NH)-N(R')₂.

31. Соединение по п.29, где кольцо А представляет собой фенильную группу, необязательно замещенную в шестом или седьмом положениях R¹⁴;

каждый R¹⁴ независимо представляет собой галоген,

галогеналкил, R^o, -OR^o, -O(галогеналкил), -SR^o, -NO₂, -CN, -N(R')₂, -NR'CO₂R^o, -NR'C(O)R^o, -NR'NR'C(O)R^o, -N(R')C(O)N(R')₂, -NR'NR'C(O)N(R')₂, -NR'NR'CO₂R^o, -C(O)C(O)R^o, -C(O)CH₂C(O)R^o, -CO₂R^o, -C(O)R^o, -C(O)N(R^o)₂, -OC(O)R^o, -OC(O)N(R^o)₂, -S(O)₂R^o, -SO₂N(R')₂, -S(O)R^o, -NR'SO₂N(R')₂, -NR'SO₂R^o, -C(=S)N(R')₂, и -C(=NH)-N(R')₂,

(CH₂)_nCO₂R^o, -O(CH₂)_nCO₂R^o, -(CH₂)_nOH, -(CH₂)_nOH, -(CH₂)_nC(O)N(R^o)₂, -O(CH₂)_nC(O)N(R^o)₂;

n представляет собой целое число от 1 до 4;

R³ представляет собой фенильную группу, необязательно замещенную одной или несколькими независимо выбранными группами, представленными R¹¹; и

каждый R^{11} независимо выбран из галогена, галогеналкила, $-R^o$, $-OR^o$, $-O(\text{галогеналкил})$, $-SR^o$, 3,4-метилendiокси, 3,4-этилендиокси, $-NO_2$, $-CN$, $-N(R')_2$, $-NR'CO_2R^o$, $-NR'C(O)R^o$, $-NR'NR'C(O)R^o$, $-N(R')C(O)N(R')_2$, $-NR'NR'C(O)N(R')_2$, $-NR'NR'CO_2R^o$, $-C(O)C(O)R^o$, $-C(O)CH_2C(O)R^o$, $-CO_2R^o$, $-C(O)R^o$, $-C(O)N(R^o)_2$, $-OC(O)R^o$, $-OC(O)N(R^o)_2$, $-S(O)_2R^o$, $-SO_2N(R')_2$, $-S(O)R^o$, $-NR'SO_2N(R')_2$, $-NR'SO_2R^o$, $-C(=S)N(R')_2$ и $-C(=NH)-N(R')_2$.

32. Соединение по п.31, где R^{10} представляет собой оксазолидинил, оксазолидинонил, диоксоланил, тиазолидинил, тетрагидрофуранил, тетрагидропиранил, тетрагидротиопиранил, тетрагидротиенил, морфолинил, тиоморфолинил, имидазолидинил, имидазолидинонил, диоксанил, дитиоланил, пирролидинил, пиперазинил, пиперидинил, пиперидинил, тетрагидротиенил S,S-диоксид, тиоморфолинил S,S-диоксид или тетрагидротиопиранил S,S-диоксид, каждый из которых необязательно замещен; и

R^{13} представляет собой пиразолил, триазолил, имидазолил, фуранил, пирролил, тиенил, циклорентадиенил или тиенил S,S-диоксид, каждый из которых необязательно замещен.

33. Соединение по п.32, где R^3 представляет собой фенильную группу, необязательно замещенную одной или несколькими независимо выбранными группами, представленными R^{11} ;

каждый R^{11} независимо представляет собой заместитель, выбранный из галогена, галогеналкила, $-R^o$, $-OR^o$, $-O(\text{галогеналкил})$, 3,4-метилendiокси, 3,4-этилендиокси, $-CO_2R^o$, $-C(O)R^o$, $-N(R')_2$, $-C(O)N(R^o)_2$, $-OC(O)R^o$, $-NR'SO_2R^o$ и $-OC(O)N(R^o)_2$;

каждый R' независимо представляет собой H или алкил; и

каждый R^o независимо представляет собой водород, галогеналкил или алкильную группу.

34. Соединение по п.33, где R^{10} представляет собой тетрагидрофуранил, тетрагидропиранил, морфолинил, имидазолидинил, имидазолидинонил, пирролидинил, пиперазинил или пиперидинил, каждый из которых необязательно замещен на любом способном к замещению атоме углерода алкилом, галогеном, галогеналкилом, гидроксиалкилом, $-C(O)OR^{12}$, $-C(O)R^{12}$, $-OC(O)R^{12}$, $-R^{12}C(O)OR^{12}$, $-C(O)N(R^{12})_2$, $-NR^{12}C(O)R^{12}$, $-NR^{12}C(O)OR^{12}$, $-S(O)_2R^{12}$, $-S(O)_2COR^{12}$, $-S(O)_2N(R^{12})_2$, $-S(O)_2OR^{12}$, $-S(O)OR^{12}$, $-OR^{12}$, $-SR^{12}$, $-CN$, $-NR^{12}C(O)N(R^{12})_2$, $-OC(O)N(R^{12})_2$, $-N(R^{12})_2$, $-(CH_2)_{1-4}CO_2R^{12}$, $-O(CH_2)_{1-4}CO_2R^{12}$, $-(CH_2)_{1-4}CON(R^{12})_2$, $-O(CH_2)_{1-4}CON(R^{12})_2$, $-(CH_2)_{0-3}(C(CH_3)_2)CO_2R^{12}$, $-O(CH_2)_{0-3}(C(CH_3)_2)CO_2R^{12}$, $-(CH_2)_{0-3}(C(CH_3)_2)CON(R^{12})_2$ или $-O(CH_2)_{0-3}(C(CH_3)_2)CON(R^{12})_2$, и каждый из которых необязательно замещен на любом способном к замещению кольцевом атоме азота алкилом, галогеналкилом, гидроксиалкилом, $-C(O)OR^{12}$, $-C(O)R^{12}$, $-R^{12}C(O)OR^{12}$, $-C(O)N(R^{12})_2$;

R^{13} представляет собой триазолил, имидазолил, фуранил, пирролил, тиенил, каждый из которых необязательно замещен на любом способном к замещению кольцевом атоме углерода алкилом, галогеном, галогеналкилом, гидроксиалкилом, $-C(O)OR^{12}$, $-C(O)R^{12}$, $-OC(O)R^{12}$, $-C(O)OR^{12}$, $-C(O)N(R^{12})_2$, $-NR^{12}C(O)R^{12}$, $-NR^{12}C(O)OR^{12}$, $-S(O)_2R^{12}$, $-S(O)_2COR^{12}$, $-S(O)_2N(R^{12})_2$, $-S(O)_2OR^{12}$, $-S(O)OR^{12}$, $-OR^{12}$, $-SR^{12}$, $-CN$, $-NR^{12}C(O)N(R^{12})_2$, $-OC(O)N(R^{12})_2$, $-N(R^{12})_2$, $-(CH_2)_{1-4}CO_2R^{12}$, $-O(CH_2)_{1-4}CO_2R^{12}$, $-(CH_2)_{1-4}CON(R^{12})_2$, $-O(CH_2)_{1-4}CON(R^{12})_2$, $-(CH_2)_{0-3}(C(CH_3)_2)CO_2R^{12}$, $-O(CH_2)_{0-3}(C(CH_3)_2)CO_2R^{12}$, $-(CH_2)_{0-3}(C(CH_3)_2)CON(R^{12})_2$, или $-O(CH_2)_{0-3}(C(CH_3)_2)CON(R^{12})_2$, и каждый из которых необязательно замещен на любом способном к замещению кольцевом атоме азота алкилом, галогеналкилом, гидроксиалкилом, $-C(O)OR^{12}$, $-C(O)R^{12}$, $-R^{12}C(O)OR^{12}$, $-S(O)_2R^{12}$, $S(O)_2N(R^{12})_2$, $-C(O)N(R^{12})_2$; и

каждый R^{12} независимо представляет собой H, алкил, галогеналкил или гидроксиалкил.

35. Соединение по п.34, где R^3 представляет собой фенильную группу, необязательно замещенную в мета- или параположении одной или несколькими независимо выбранными группами, представленными R^{11} ; и

каждый R^{11} независимо представляет собой заместитель, выбранный из галогена, галогеналкила, $-R^o$, $-OR^o$, $-N(R^i)_2$, $-NR^iSO_2R^o$ и $-O(\text{галогеналкил})$.

36. Соединение по п.35, где R^{10} представляет собой пиперидинил, пиперазинил, диоксоланил, тетрагидрофуранил, или морфолинил, каждый необязательно замещен на любом способном к замещению атоме углерода алкилом, галогеном, галогеналкилом, гидроксиалкилом, $-C(O)OR^{12}$, $-C(O)R^{12}$, $-OC(O)R^{12}$ или $-C(O)N(R^{12})_2$, каждый необязательно замещен на любом способном к замещению атоме азота алкилом, галогеналкилом, гидроксиалкилом, $-C(O)OR^{12}$, $-C(O)R^{12}$ или $-C(O)N(R^{12})_2$; и

R^{13} представляет собой триазолил, имидазолил или пирролил каждый необязательно замещен на любом способном к замещению атоме углерода алкилом, галогеном, галогеналкилом, гидроксиалкилом, $-C(O)OR^{12}$, $-C(O)R^{12}$, $-OC(O)R^{12}$ или $-C(O)N(R^{12})_2$, и каждый необязательно замещен на способном к замещению атоме азота алкилом, галогеналкилом, гидроксиалкилом, $C(O)OR^{12}$, $-C(O)R^{12}$, $-R^{12}C(O)OR^{12}$, $-S(O)_2R^{12}$, $S(O)_2N(R^{12})_2$, $-C(O)N(R^{12})_2$.

37. Соединение по п.36, где

кольцо А представляет собой фенильную группу, необязательно замещенную в шестом или седьмом положениях R^{14} ;

каждый R^{14} независимо представляет собой галоген, R^o , $-OR^o$, $-CO_2R^o$, $-C(O)R^o$, $-CN$, $-C(O)N(R^o)_2$, $-OC(O)R^o$, $(CH_2)_nCO_2R^o$, $-O(CH_2)_nCO_2R^o$, $-NHSO_2R^o$, $-NHCOR^o$, $-NHC(O)NR^o$, $-(CH_2)_nOH$, $-O(CH_2)_nOH$, $-(CH_2)_nC(O)N(R^o)_2$ или $-O(CH_2)_nC(O)N(R^o)_2$;

n представляет собой целое число от 1 до 4;

R^3 представляет собой фенильную группу, необязательно замещенную в параположении R^{11} ;

R^{11} представляет собой хлор, фтор, бром, $-OR^o$, $-N(R^i)_2$, $-NR^iSO_2R^o$ или $-R^o$;

R^i независимо представляет собой водород или C_{1-3} алкильную группу; и

R^o независимо представляет собой водород, галогеналкил или C_{1-3} алкильную группу.

38. Соединение по п.37, где R^{10} представляет собой пиперидинил, пиперазинил или морфолинил и необязательно *N*-замещен метилом, этилом, изопропилом, $-C(O)OR^{12}$, $C(O)NH_2$ или $-C(O)R^{12}$;

R^{13} представляет собой триазолил и необязательно *N*-замещен метилом, этилом, $-C(O)OR^{12}$, $C(O)NH_2$ или $-C(O)R^{12}$; и

каждый R^{12} независимо представляет собой $-H$, метил или этил.

39. Соединение по п.29, где R^{10} представляет собой тетрагидрофуранил, тетрагидропиранил, морфолинил, имидазолидинил, имидазолидинонил, пирролидинил, пиперазинил или пиперидинил, каждый из которых необязательно замещен на любом способном к замещению кольцевом атоме углерода алкилом, галогеном, галогеналкилом, гидроксиалкилом, $-C(O)OR^{12}$, $-C(O)R^{12}$, $-OC(O)R^{12}$, $-R^{12}C(O)OR^{12}$, $-C(O)N(R^{12})_2$, $-NR^{12}C(O)R^{12}$, $-NR^{12}C(O)OR^{12}$, $-S(O)_2R^{12}$, $-S(O)_2COR^{12}$, $-S(O)_2N(R^{12})_2$, $-S(O)_2OR^{12}$, $-S(O)OR^{12}$, $-OR^{12}$, $-SR^{12}$, $-CN$, $-NR^{12}C(O)N(R^{12})_2$, $-OC(O)N(R^{12})_2$, $-N(R^{12})_2$, $-(CH_2)_{1-4}CO_2R^{12}$, $-O(CH_2)_{1-4}CO_2R^{12}$, $-(CH_2)_{1-4}CON(R^{12})_2$, $-O(CH_2)_{1-4}CON(R^{12})_2$, $-(CH_2)_{0-3}(C(CH_3)_2)CO_2R^{12}$, $-O(CH_2)_{0-3}(C(CH_3)_2)CO_2R^{12}$, $-(CH_2)_{0-3}(C(CH_3)_2)CON(R^{12})_2$ или $-O(CH_2)_{0-3}(C(CH_3)_2)CON(R^{12})_2$, каждый из которых необязательно замещен на любом способном к замещению кольцевом атоме азота алкилом, галогеналкилом,

гидроксиалкилом, $-C(O)OR^{12}$, $-C(O)R^{12}$, $-R^{12}C(O)OR^{12}$, $-C(O)N(R^{12})_2$;

каждый R^{12} независимо представляет собой H , алкил, галогеналкил или гидроксиалкил;

R^{13} представляет собой пиразолил, триазолил, имидазолил или пирролил, каждый из которых *N*-замещен T^2-R^{Y1} и необязательно далее замещен на одном или нескольких кольцевых атомах углерода алкилом, галогеном, галогеналкилом, гидроксиалкилом, $-C(O)OR^{12}$, $-C(O)R^{12}$, $-OC(O)R^{12}$, $-C(O)OR^{12}$, $-C(O)N(R^{12})_2$, $-NR^{12}C(O)R^{12}$, $-NR^{12}C(O)OR^{12}$, $-S(O)_2R^{12}$, $-S(O)_2COR^{12}$, $-S(O)_2N(R^{12})_2$, $-S(O)_2OR^{12}$, $-S(O)OR^{12}$, $-OR^{12}$, $-SR^{12}$

, -CN, -NR¹²C(O)N(R¹²)₂, -OC(O)N(R¹²)₂, -N(R¹²)₂, -(CH₂)₁₋₄CO₂R¹², -O(CH₂)₁₋₄CO₂R¹², -(CH₂)₁₋₄CON(R¹²)₂, -O(CH₂)₁₋₄CON(R¹²)₂, -(CH₂)₀₋₃(C(CH₃)₂)CO₂R¹², -O(CH₂)₀₋₃(C(CH₃)₂)CO₂R¹², -(CH₂)₀₋₃(C(CH₃)₂)CON(R¹²)₂ или -O(CH₂)₀₋₃(C(CH₃)₂)CON(R¹²)₂;

T² представляет собой C₁₋₆ прямую алкиленовую цепь, необязательно замещенную на любом одном или нескольких любом способных к замещению атомах углерода галогеном, алкилом, гем-диалкилом, гем-дигалогеном, галогеналкилом, спироциклоалкилом, необязательно *N*-замещенной азотсодержащей спиронеароматической гетероциклической группой, O-содержащей спиронеароматической гетероциклической группой, амином, алкиламином, диалкиламином или гидроксиллом;

R^{Y1} представляет собой -C(O)OR⁵, -C(O)N(R⁵)₂, -NR⁵C(O)R⁵, -NR⁵C(O)OR⁵, -S(O)₂N(R⁵)₂, -NR⁵S(O)₂R⁵, -OR⁵, -CN, -NR⁵C(O)N(R⁵)₂, -N(R⁵)₂, необязательно замещенную неароматическую гетероциклическую группу, представленную R⁷, или необязательно замещенную гетероарильную группу, представленную R⁸;

R⁷ представляет собой необязательно замещенный пиперидинил, оксазолидинил, оксазолидинил, тиазолидинил, тетрагидрофуранил, тетрагидропиранил, тиазолидинил, тетрагидротиофен, морфолинил, тиоморфолинил, имидазолидинил, имидазолидинонил, диоксанил, диоксоланил, дитиоланил, пирролидинил, пирролидинонил, пиперазинил или пиперидинил; и

R⁸ представляет собой необязательно замещенные фуранил, тетразолил, оксазолил, изоксазолил, оксадиазолил, пирролил, пиразолил, пиридинил, пиримидил, тиазолил, тиенил или имидазолил.

40. Соединение по п.39, где кольцо А представляет собой фенильную группу, необязательно замещенную в шестом или седьмом положениях R¹⁴;

каждый R¹⁴ независимо представляет собой галоген, галогеналкил, R⁰, -OR⁰, -O(галогеналкил), -SR⁰, -NO₂, -CN, -N(R')₂, -NR'CO₂R⁰, -NR'C(O)R⁰, -NR'NR'C(O)R⁰, -N(R')C(O)N(R')₂, -NR'NR'C(O)N(R')₂, -NR'NR'CO₂R⁰, -C(O)C(O)R⁰, -C(O)CH₂C(O)R⁰, -CO₂R⁰, -C(O)R⁰, -C(O)N(R⁰)₂, -OC(O)R⁰, -OC(O)N(R⁰)₂, -S(O)₂R⁰, -SO₂N(R')₂, -S(O)R⁰, -NR'SO₂N(R')₂, -NR'SO₂R⁰, -C(=S)N(R')₂, -C(=NH)-N(R')₂, (CH₂)_nCO₂R⁰, -O(CH₂)_nCO₂R⁰, -(CH₂)_nOH, -(CH₂)_nOH, -(CH₂)_nC(O)N(R⁰)₂ или -O(CH₂)_nC(O)N(R⁰)₂;

n представляет собой целое число от 1 до 4;

R³ представляет собой фенильную группу, необязательно замещенную одной или несколькими независимо выбранными группами, представленными R¹¹; и

каждый R¹¹ независимо выбран из галогена, галогеналкила, R⁰, -OR⁰, -O(галогеналкил), -SR⁰, 3,4-метилендиокси, 3,4-этилендиокси, -NO₂, -CN, -N(R')₂, -NR'CO₂R⁰, -NR'C(O)R⁰, -NR'NR'C(O)R⁰, -N(R')C(O)N(R')₂, -NR'NR'C(O)N(R')₂, -NR'NR'CO₂R⁰, -C(O)C(O)R⁰, -C(O)CH₂C(O)R⁰, -CO₂R⁰, -C(O)R⁰, -C(O)N(R⁰)₂, -OC(O)R⁰, -OC(O)N(R⁰)₂, -S(O)₂R⁰, -SO₂N(R')₂, -S(O)R⁰, -NR'SO₂N(R')₂, -NR'SO₂R⁰, -C(=S)N(R')₂, -(CH₂)₁₋₄CO₂R⁰, -O(CH₂)₁₋₄CO₂R⁰, -(CH₂)₁₋₄CON(R⁰)₂, -O(CH₂)₁₋₄CON(R⁰)₂, -(CH₂)₀₋₃(C(CH₃)₂)CO₂R⁰, -O(CH₂)₀₋₃(C(CH₃)₂)CO₂R⁰, -(CH₂)₀₋₃(C(CH₃)₂)CON(R⁰)₂, -O(CH₂)₀₋₃(C(CH₃)₂)CON(R⁰)₂ или -C(=NH)-N(R')₂.

41. Соединение по п.40, где

R³ представляет собой фенильную группу, необязательно замещенную одной или несколькими независимо выбранными группами, представленными R¹¹;

каждый R¹¹ независимо представляет собой заместитель, выбранный из галогена, галогеналкила, -R⁰, -OR⁰, -O(галогеналкил), 3,4-метилендиокси, 3,4-этилендиокси, -CO₂R⁰, -C(O)R⁰, -N(R')₂, -C(O)N(R⁰)₂, -OC(O)R⁰, -NR'SO₂R⁰ и -OC(O)N(R⁰)₂;

каждый R' независимо представляет собой H или алкил; и

каждый R⁰ независимо представляет собой водород, галогеналкил или алкильную группу.

42. Соединение по п.41, где R^{Y1} представляет собой $-C(O)OR^5$, $-C(O)N(R^5)_2$, $-NR^5C(O)R^5$, $-NR^5C(O)OR^5$, $-S(O)_2N(R^5)_2$, $-NR^5S(O)_2R^5$, $-NR^5C(O)N(R^5)_2$, $-OH$, необязательно замещенную неароматическую гетероциклическую группу, представленную R^7 , или необязательно замещенную гетероарильную группу, представленную R^8 ;

каждый R^5 независимо представляет собой H или алкил, или $N(R^5)_2$ представляет собой азотсодержащую неароматическую гетероциклическую группу;

R^7 представляет собой пиперидинил, морфолинил, имидазолидинил, пирролидинил, пирролидинонил, пиперазинил или пиперидинил;

R^8 представляет собой тетразолил, оксазолил, оксадиазолил, пирролил, пиразолил, пиридинил или имидазолил;

T^2 представляет собой C_{1-5} прямую алкиленовую цепь, необязательно замещенную на атоме углерода, смежном с R^Y , галогеном, алкилом, гем-диалкилом, гем-дигалогеном, галогеналкилом, спироциклоалкилом, необязательно *M*-замещенной азотсодержащей спиронеароматической гетероциклической группой, амином, диалкиламином или гидроксилом;

группа, представленная R^{10} , представляет собой морфолинил, тиоморфолинил, имидазолидинил, имидазолидинонил, пирролидинил, пиперазинил или пиперидинил, каждый из которых *M*-замещен T^2-R^{Y1} и далее необязательно замещен на любом способном к замещению кольцевом атоме углерода алкилом, галогеном, галогеналкилом, гидроксиалкилом, $-C(O)OR^{12}$, $-C(O)R^{12}$, $-OC(O)R^{12}$, $-C(O)OR^{12-}$, $-C(O)N(R^{12})_2$, $-NR^{12}C(O)R^{12}$, $-NR^{12}C(O)OR^{12}$, $-S(O)_2R^{12}$, $-S(O)_2COR^{12}$, $-S(O)_2N(R^{12})_2$, $-S(O)_2OR^{12}$, $-S(O)OR^{12}$, $-OR^{12}$, $-SR^{12}$, $-CN$, $-NR^{12}C(O)N(R^{12})_2$, $-OC(O)N(R^{12})_2$, $-N(R^{12})_2$, $-(CH_2)_{1-4}CO_2R^{12}$, $-O(CH_2)_{1-4}CO_2R^{12}$, $-(CH_2)_{1-4}CON(R^{12})_2$, $-O(CH_2)_{1-4}CON(R^{12})_2$, $-(CH_2)_{0-3}(C(CH_3)_2)CO_2R^{12}$, $-O(CH_2)_{0-3}(C(CH_3)_2)CO_2R^{12}$, $-(CH_2)_{0-3}(C(CH_3)_2)CON(R^{12})_2$ или $-O(CH_2)_{0-3}(C(CH_3)_2)CON(R^{12})_2$; и

группа, представленная R^{13} , представляет собой триазолил, имидазолил или пирролил, каждый из которых *M*-замещен T^2-R^{Y1} и далее необязательно замещен на любом способном к замещению кольцевом атоме углерода алкилом, галогеном, галогеналкилом, гидроксиалкилом, $-C(O)OR^{12}$, $-C(O)R^{12}$, $-OC(O)R^{12}$, $-C(O)OR^{12-}$, $-C(O)N(R^{12})_2$, $-NR^{12}C(O)R^{12}$, $-NR^{12}C(O)OR^{12}$, $-S(O)_2R^{12}$, $-S(O)_2COR^{12}$, $-S(O)_2N(R^{12})_2$, $-S(O)_2OR^{12}$, $-S(O)OR^{12}$, $-OR^{12}$, $-SR^{12}$, $-CN$, $-NR^{12}C(O)N(R^{12})_2$, $-OC(O)N(R^{12})_2$, $-N(R^{12})_2$, $-(CH_2)_{1-4}CO_2R^{12}$, $-O(CH_2)_{1-4}CO_2R^{12}$, $-(CH_2)_{1-4}CON(R^{12})_2$, $-O(CH_2)_{1-4}CON(R^{12})_2$, $-(CH_2)_{0-3}(C(CH_3)_2)CO_2R^{12}$, $-O(CH_2)_{0-3}(C(CH_3)_2)CO_2R^{12}$, $-(CH_2)_{0-3}(C(CH_3)_2)CON(R^{12})_2$ или $-O(CH_2)_{0-3}(C(CH_3)_2)CON(R^{12})_2$.

43. Соединение по п.42, где R^3 представляет собой фенильную группу, необязательно замещенную в мета- или параположении одной или несколькими независимо выбранными группами, представленными R^{11} ; и

каждый R^{11} независимо представляет собой заместитель, выбранный из галогена, галогеналкила, $-R^0$, $-OR^0$, $-N(R^0)_2$, $-NR^0SO_2R^0$ и $-O$ (галогеналкил).

44. Соединение по п.43 где R^{Y1} представляет собой $-C(O)OR^5$, $-C(O)N(R^5)_2$, $-OH$, *M*-морфолинил, 2-морфолинил, 3-морфолинил, *M*-замещенный 2-морфолинил, *M*-замещенный 3-морфолинил, *M*-имидазолидинил, 2-имидазолидинил, 4-имидазолидинил, 5-имидазолидинил, *M*-замещенный 2-имидазолидинил, *N*²-замещенный *M*-имидазолидинил, *M*-замещенный 4-имидазолидинил, *M*-замещенный 5-имидазолидинил, *M*-имидазолидинонил, 4-имидазолидинонил, 5-имидазолидинонил, *M*-замещенный 4-имидазолидинонил, *M*-замещенный 5-имидазолидинонил, *M*-пирролидинил, 2-пирролидинил, 3-пирролидинил, *M*-замещенный 2-пирролидинил, *M*-замещенный 3-пирролидинил, *M*-пирролидин-2-онил, 3-пирролидин-2-онил, 4-пирролидин-2-онил, 5-пирролидин-2-онил, *M*-замещенный 3-пирролидин-2-онил, *M*-замещенный 4-пирролидин-2-онил, *M*-замещенный 5-пирролидин-2-онил, *M*-пирролидин-3-онил, 2-пирролидин-3-онил, 4-пирролидин-3-онил, 5-пирролидин-3-

онил, *N*-замещенный 2-пирролидин-3-онил *N*-замещенный 4-пирролидин-3-онил, *N*-замещенный 5-пирролидин-3-онил, *N*-пиперидинил, 2-пиперидинил, 3-пиперидинил, 4-пиперидинил, *N*-замещенный 2-пиперидинил, *N*-замещенный 3-пиперидинил, *N*-замещенный 4-пиперидинил, *N*-пиперидин-2-онил, 3-пиперидин-2-онил, 4-пиперидин-2-онил, 5-пиперидин-2-онил, 6-пиперидин-2-онил, *N*-замещенный 3-пиперидин-2-онил, *N*-замещенный 4-пиперидин-2-онил, *N*-замещенный 5-пиперидин-2-онил, *N*-замещенный 6-пиперидин-2-онил, *N*-пиперидин-3-онил, 2-пиперидин-3-онил, 4-пиперидин-3-онил, 5-пиперидин-3-онил, 6-пиперидин-3-онил, *N*-замещенный 2-пиперидин-3-онил, *N*-замещенный 4-пиперидин-3-онил, *N*-замещенный 5-пиперидин-3-онил, *N*-замещенный 6-пиперидин-3-онил, *N*-пиперидин-4-онил, 2-пиперидин-4-онил, 3-пиперидин-4-онил, 5-пиперидин-4-онил, 6-пиперидин-4-онил, *N*-замещенный 2-пиперидин-4-онил, *N*-замещенный 3-пиперидин-4-онил, *N*-замещенный 5-пиперидин-4-онил, *N*-замещенный 6-пиперидин-4-онил, *N*-пиперазинил, 2-пиперазинил, *N'*-замещенный *N*-пиперазинил, *N*-замещенный 2-пиперазинил, фуранил, *N*-тетразолил, 5-тетразолил, *N*-замещенный 5-тетразолил, 4-(1,2,3)оксадиазолил, 5-(1,2,3)оксадиазолил, 3-(1,2,4)оксадиазолил, 5-(1,2,4)оксадиазолил, 3-(1,2,5)оксадиазолил, 4-(1,2,5)оксадиазолил, 2-(1,3,4)оксадиазолил, 5-(1,3,4)оксадиазолил, *N*-пирролил, 2-пирролил, 3-пирролил, *N*-замещенный 2-пирролил, *N*-замещенный 3-пирролил, *N*-пиразолил, 3-пиразолил, 4-пиразолил, 5-пиразолил, *N*-замещенный 3-пиразолил, *N*-замещенный 4-пиразолил, *N*-замещенный 5-пиразолил, 2-пиридинил, 3-пиридинил, 4-пиридинил, *N*-имидазолил, 2-имидазолил, 4-имидазолил, 5-имидазолил; *N*-замещенный 2-имидазолил, *N*-замещенный 4-имидазолил или *N*-замещенный 5-имидазолил;

T^2 представляет собой C_{1-4} прямую алкиленовую цепь, замещенную фтором, метилом, гем-диметилом, гем-дифтором фторметилом, спироциклопропилом, спироциклобутилом, необязательно *N*-замещенным спироазетидинилом, необязательно *N*-замещенным спироазиридинилом, необязательно *N*-замещенным спиропирролидинилом, необязательно

N-замещенным спиропиперидинилом, амином, метиламином, диметиламиномом или гидроксиломом;

группа, представленная R^{10} , представляет собой морфолинил, пирролидинил, пиперазинил или пиперидинил, каждый из которых *N*-замещен T^2-R^{Y1} , и далее необязательно замещен на любом способном к замещению атоме углерода алкилом, галогеном, галогеналкилом, гидроксиалкилом, $-C(O)OR^{12}$, $-C(O)R^{12}$, $-OC(O)R^{12}$; и

группа, представленная R^{13} , представляет собой имидазолил или пирролил, каждый из которых *N*-замещен T^2-R^{Y1} , и далее необязательно замещен на любом способном к замещению атоме углерода алкилом, галогенидом, галогеналкилом, гидроксиалкилом, $-C(O)OR^{12}$, $-C(O)R^{12}$, $-OC(O)R^{12}$ или $-C(O)N(R^{12})_2$, и каждый необязательно замещен на любом способном к замещению атоме азота алкилом, галогеналкилом, гидроксиалкилом, $C(O)OR^{12}$, $-C(O)R^{12}$, $-R^{12}C(O)OR^{12}$, $-S(O)_2R^{12}$, $S(O)_2N(R^{12})_2$, $-C(O)N(R^{12})_2$.

45. Соединение по п.44, где кольцо А представляет собой фенильную группу, необязательно замещенную в шестом или седьмом положениях R^{14} ;

каждый R^{14} независимо представляет собой галоген, R^o , $-OR^o$, $-CO_2R^o$, $-C(O)R^o$, $-CN$, $-C(O)N(R^o)_2$, $-OC(O)R^o$, $-(CH_2)_nCO_2R^o$, $-O(CH_2)_nCO_2R^o$, $-NHCO_2R^o$, $-NHCOR^o$, $-NHC(O)N(R^o)_2$, $-(CH_2)_nOH$, $O(CH_2)_nOH$, $-(CH_2)_nC(O)N(R^o)_2$, или $-O(CH_2)_nC(O)N(R^o)_2$;

n представляет собой целое число от 1 до 4;

R^3 представляет собой фенильную группу, необязательно замещенную в параположении R^{11} ;

R^{11} представляет собой хлор, фтор, бром, $-OR^o$, $-N(R^o)$, $-NR^oSO_2R^o$ или $-R^o$;

R^o независимо представляет собой водород или C_{1-3} алкильную группу; и

R^o независимо представляет собой водород, галогеналкил или C_{1-3} алкильную группу.

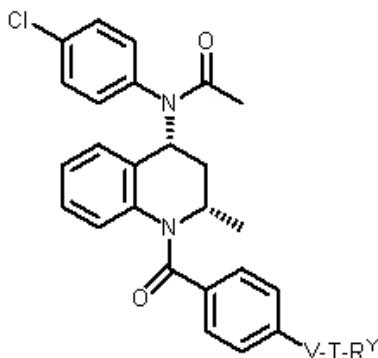
46. Соединение по п.45, где R^{Y1} представляет

собой $-C(O)OR^5$, $-C(O)N(R^5)_2$, $-OH$, *N*-тетразолил, 5-тетразолил, *N*-замещенный 5-тетразолил, *N*-имидазолил, 2-имидазолил, 4-имидазолил, 5-имидазолил; *N*-замещенную 2-имидазолил, *N*-замещенный 4-имидазолил или *N*-замещенную 5-имидазолил;

группа, представленная R^{10} , представляет собой пиперидинил, пиперазинил или морфолинил, *N*-замещенные T^2-R^{Y1} , и далее необязательно замещенные на атоме углерода, в альфа положении по отношению к атому азота метилом или гем-диметилом; и

группа, представленная R^{13} , представляет собой триазолил, *N*-замещенный T^2-R^{Y1} , и далее необязательно замещенные на атоме углерода, в альфа положении по отношению к атому азота метилом.

47. Соединение, представленное следующей структурной формулой



или его фармацевтически приемлемая соль,

где *V* представляет собой ковалентную связь или $-O-$;

T представляет собой незамещенную прямую цепь C_{1-10} алкилена;

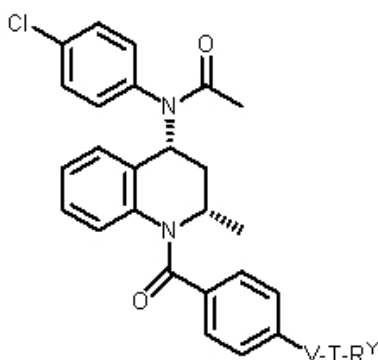
R^Y представляет

собой $-C(O)OR^5$, $-C(O)R^5$, $-OC(O)R^5$, $-C(O)N(R^5)_2$, $-NR^5C(O)R^5$, $-NR^5C(O)OR^5$, $-S(O)_2R^5$, $-S(O)_2COR^5$, $-S(O)_2N(R^5)_2$, $-NR^5S(O)_2$, $-NR^5S(O)_2R^5$,

$S(O)_2OR^5$, $-S(O)OR^5$, $-SR^5$, $-C(O)NR^5S(O)_2R^5$, $-CN$, $-NR^5C(O)N(R^5)_2$, $-OC(O)N(R^5)_2$, $-N(R^5)_2$, $-OR^5$, необязательно замещенную неароматическую гетероциклическую группу или необязательно замещенную гетероарильную группу;

каждый R^5 независимо представляет собой H , алкил, галогеналкил, гидроксиалкил, карбоксиалкил, $-C(O)OCH_2C_6H_5$, $S(O)_2CH_3$, $-C(O)OH$, $-C(O)OMe$, $-C(O)OEt$, $C(O)NH_2$, бензил, пирролидинил, морфолинил, или $-N(R^5)_2$ представляет собой азотсодержащую неароматическую гетероциклическую группу.

48. Соединение, представленное следующей структурной формулой



или его фармацевтически приемлемая соль,

где *V* представляет собой ковалентную связь или $-O-$;

T представляет собой прямую цепь C_{1-10} алкилена, замещенную алкилом, гем-диалкилом, галогеналкилом, спироциклоалкилом или необязательно *N*-замещенной азотсодержащей спироароматической гетероциклической группой;

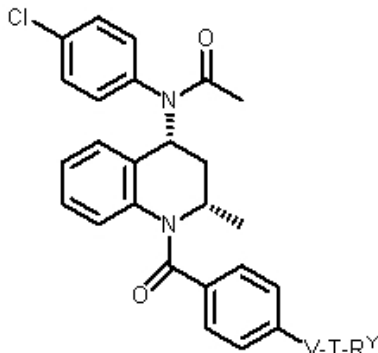
R^Y представляет

собой $-C(O)OR^5$, $-C(O)R^5$, $-OC(O)R^5$, $-C(O)N(R^5)_2$, $-NR^5C(O)R^5$, $-NR^5C(O)OR^5$, $-S(O)_2R^5$, $-S(O)_2COR^5$, $-S(O)_2N(R^5)_2$, $-NR^5S(O)_2$, $-NR^5S(O)_2R^5$,

$S(O)_2OR^5$, $-S(O)OR^5$, $-SR^5$, $-C(O)NR^5S(O)_2R^5$, $-CN$, $-NR^5C(O)N(R^5)_2$, $-OC(O)N(R^5)_2$, $-N(R^5)_2$, $-OR^5$, необязательно замещенную неароматическую гетероциклическую группу или необязательно замещенную гетероарильную группу; и

каждый R^5 независимо представляет собой H, алкил, галогеналкил, гидроксиалкил, карбоксиалкил, $-C(O)OCH_2C_6H_5$, $S(O)_2CH_3$, $-C(O)OH$, $-C(O)OMe$, $-C(O)OEt$, $C(O)NH_2$, бензил, пирролидинил, морфолинил, или $-N(R^5)_2$ представляет собой необязательно замещенную азотсодержащую неароматическую гетероциклическую группу.

49. Соединение, представленное следующей структурной формулой



или его фармацевтически приемлемая соль,
где V представляет собой -O-;

T представляет собой прямую цепь C_{1-10} алкилена, необязательно замещенную на любом одном или нескольких способных к замещению атомов углерода галогеном, алкилом, гем-диалкилом, гем-дигалогеном, галогеналкилом, алкокси, галогеналкокси, спироциклоалкилом, необязательно N-замещенной азотсодержащей спиронеароматической гетероциклической группой, амином, алкиламином, диалкиламином или гидроксиллом;

R^Y представляет

собой $-C(O)OR^5$, $-C(O)R^5$, $-OC(O)R^5$, $-C(O)N(R^5)_2$, $-NR^5C(O)R^5$, $-NR^5C(O)OR^5$, $-S(O)_2R^5$, $-S(O)_2COR^5$, $-S(O)_2N(R^5)_2$, $-NR^5S(O)_2$, $-NR^5S(O)_2R^5$, $S(O)_2OR^5$, $-S(O)OR^5$, $-SR^5$, $-C(O)NR^5S(O)_2R^5$, $-CN$, $-NR^5C(O)N(R^5)_2$, $-OC(O)N(R^5)_2$, $-N(R^5)_2$, $-OR^5$, необязательно замещенную неароматическую гетероциклическую группу или необязательно замещенную гетероарильную группу; и

каждый R^5 независимо представляет собой H, алкил, галогеналкил, гидроксиалкил, карбоксиалкил, $-C(O)OCH_2C_6H_5$, $S(O)_2CH_3$, $-C(O)OH$, $-C(O)OMe$, $-C(O)OEt$, $C(O)NH_2$, бензил, пирролидинил, морфолинил, или $-N(R^5)_2$ представляет собой необязательно замещенную азотсодержащую неароматическую гетероциклическую группу.

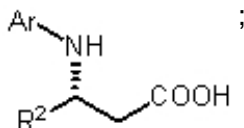
50. Фармацевтическая композиция, содержащая фармацевтически приемлемый носитель или разбавитель и соединение по п. 1, 2, 47, 48 или 49.

51. Способ лечения воспалительного заболевания, нарушения или симптома у пациента при необходимости лечения, предусматривающий стадию введения пациенту эффективного количества соединения, представленного соединением по п.1, 2, 47, 48 или 49.

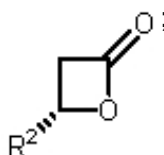
52. Способ по п.5, где воспалительным заболеванием, нарушением или симптомом является аллергический ринит, ревматоидный артрит, хроническое обструктивное заболевание легких, атопический дерматит или аллергическая астма.

53. Способ по п.51, где воспалительным заболеванием, нарушением или симптомом является аллергический ринит или аллергическая астма.

54. Способ получения соединения А, представленного следующей структурной формулой



включающий стадию взаимодействия Ar-NH_2 с



где Ar представляет собой необязательно замещенную моноциклическую ароматическую группу и R^2 представляет собой C_1 - C_3 алкил.

55. Способ по п.54, где Ar представляет собой необязательно замещенную фенильную группу и R^2 представляет собой метил или этил.

56. Способ по п.55 где Ar представляет собой фенильную группу, необязательно замещенную в мета- или параположении R^{14} ;

каждый R^{14} независимо представляет собой галоген, циано, R^0 , $-\text{OR}^{30}$, $-\text{CO}_2\text{R}^{31}$, $-\text{C}(\text{O})\text{R}^0$, $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^x)_2$, $-\text{OC}(\text{O})\text{R}^0$, $(\text{CH}_2)_n\text{CO}_2\text{R}^{31}$, $\text{O}(\text{CH}_2)_n\text{CO}_2\text{R}^{31}$, $\text{NH}\text{SO}_2\text{R}^0$, $\text{NHC}(\text{O})\text{NR}^x_2$, $(\text{CH}_2)_n\text{OR}^{30}$, $\text{O}(\text{CH}_2)_n\text{OR}^{30}$, $(\text{CH}_2)_n\text{C}(\text{O})\text{NR}^0_2$, $\text{O}(\text{CH}_2)_n\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^x)_2$;

n представляет собой целое число от 1 до 4;

R^0 независимо представляет собой водород, C_1 - C_3 галогеналкил или C_{1-3} алкильную группу;

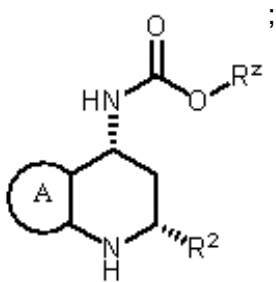
один R^x представляет собой H или C_1 - C_3 алкил, и другой представляет собой аминозащитную группу;

R^{30} представляет собой спиртовую защитную группу; и

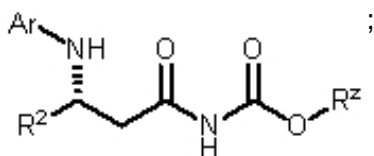
R^{31} представляет собой защитную группу карбоновой кислоты.

57. Способ по п.56, где Ar представляет собой фенильную группу.

58. Способ получения соединения А, представленного следующей структурной формулой



из исходного соединения, представленного следующей структурной формулой



включающий стадию восстановления карбониламидной группы исходного соединения с образованием промежуточного соединения и затем циклизацию промежуточного соединения с образованием целевого соединения, где $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^z$ представляет собой амидозащитную группу.

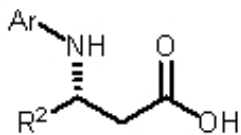
59. Способ по п.58, где R^z представляет собой замещенную или незамещенную алкильную группу, аллильную группу или ароматическую группу.

60. Способ по п.59, где карбониламидную группу исходного соединения восстанавливают путем взаимодействия исходного соединения натрия боргидридом и кислотой Льюиса и промежуточное соединение циклизуют в присутствии кислоты.

61. Способ по п.60, где Ar представляет собой необязательно замещенную фенильную группу и R^2 представляет собой метил или этил.

62. Способ по п.60, где R^z представляет собой бензил, метил, этил, аллил, 2,2,2-трихлорметил, 2,2,2-трихлортретбутил, третбутил или флуоренилметил.

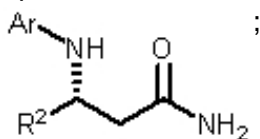
63. Способ по п.58 где исходное соединение получают амидированием аминокислоты с помощью $\text{H}_2\text{NC}(\text{O})\text{OR}^z$, где указанная аминокислота представлена следующей структурной формулой



64. Способ по п.63, где указанное амидирование проводят путем взаимодействия аминокислоты с активирующим карбоновую кислоту реагентом с образованием активированного промежуточного соединения и далее путем взаимодействия активированного промежуточного соединения с $\text{H}_2\text{NC(O)OR}^Z$.

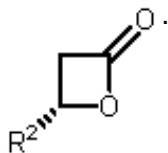
65. Способ по п.64, где активирующим карбоновую кислоту реагентом является карбонилдиимдазол.

66. Способ по п.63, где указанное амидирование проводят путем взаимодействия аминокислоты с активирующим карбоновую кислоту реагентом с образованием активированного промежуточного соединения и далее путем взаимодействия активированного промежуточного соединения с NH_3 или его функциональным эквивалентом с образованием карбоксамидного промежуточного соединения, представленного следующей структурной формулой



взаимодействием карбоксамидного промежуточного соединения с X-C(O)OR^Z , где X представляет собой удаляемую группу.

67. Способ по п.63, где аминокислоту получают путем взаимодействием Ar-NH_2 с



68. Способ по п.67, где Ar представляет собой необязательно замещенную фенильную группу и R^2 представляет собой метил или этил.

69. Способ по п.68, где Ar представляет собой фенильную группу, необязательно замещенную в шестом или седьмом положениях R^{14} ;

каждый R^{14} независимо представляет собой галоген, циано, R^0 , $-\text{OR}^{30}$, $-\text{CO}_2\text{R}^{31}$, $-\text{C(O)R}^0$, $-\text{C(O)N(R}^X)_2$, $-\text{OC(O)R}^0$, $(\text{CH}_2)_n\text{CO}_2\text{R}^{31}$, $\text{O}(\text{CH}_2)_n\text{CO}_2\text{R}^{31}$, NHSO_2R^0 , $\text{NHC(O)N(R}^X)_2$, $(\text{CH}_2)_n\text{OR}^{30}$, $\text{O}(\text{CH}_2)_n\text{OR}^{30}$, $(\text{CH}_2)_n\text{C(O)N(R}^X)_2$, $\text{O}(\text{CH}_2)_n\text{C(O)N(R}^X)_2$; n представляет собой целое число от 1 до 4;

R^0 независимо представляет собой водород, C_{1-3} галогеналкильную группу или C_{1-3} алкильную группу;

один R^X представляет собой H или $\text{C}_1\text{-C}_3$ алкил и другой представляет собой аминозащитную группу;

R^{30} представляет собой спиртовую защитную группу; и

R^{31} представляет собой защитную группу карбоновой кислоты.

70.Способ по п.69, где Ar представляет собой фенильную группу.